

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-122457-00011-0000

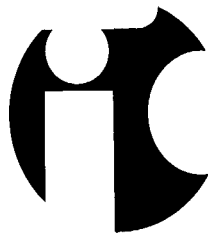
Fecha: 2014-12-09 17:12:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 95

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 14-270781-00000-0000

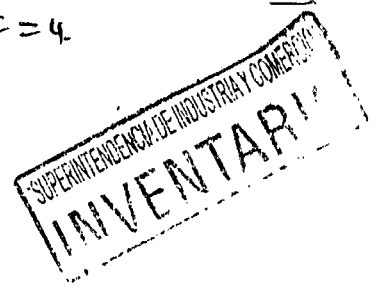
Fecha: 2014-12-09 17:12:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 95



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

T=F=4.



DELEGATURA DE PROPIEDAD INDUSTRIAL

División de Nuevas Creaciones

**SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION**

21. EXPEDIENTE No. _____

54. TÍTULO N-BENZIL CARBOXAMIDAS
HETEROCÍCLICAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL _____

71. SOLICITANTE BAYER INTELLECTUAL P.

DOMICILIO MONHEIM ALEMANIA.

74. APODERADO ALVARO CORREA.

22. BOGOTÁ, D.C., 9 DE DICIEMBRE 2014



No. 13-122457-00011-0000

Fecha: 2014-12-09 17:12:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 65



No. 14-270781-00000-0000

Fecha: 2014-12-09 17:12:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 65

DIRECCIÓN DE NUEVAS CREACIONES
CONVERSIÓN, DIVISIÓN Y FUSIÓN DE SOLICITUDES

1. Identificación del Trámite

☐

Conversión

☒

División

☐

Fusión

☒

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☐

Registro de Diseño Industrial

☐

Esquema de Trazado de Circuitos Integrados

2. Datos del solicitante

Persona Natural

☐

Persona Jurídica

☒

BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH

Nombre o denominación / Nombre o razón social

Nombre del representante legal

Tipo de empresa

Micro

☐

Pequeña

☐

Mediana

☐

Otra

☒

Documento de identificación:

☐

C.C.

☐

C.E.

☐

NIT

☐

Otro

Número

Nacionalidad/País de constitución	Dirección del titular	Ciudad
Alemania	Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789	Monheim
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
alvaro.correa@bakermckenzie.com	3762211	6341500

☐

Autorizo expresamente a la Superintendencia de Industria y Comercio para que todas las comunicaciones sean enviadas a través de la dirección de correo electrónico

3. Datos del apoderado:

Correa Ordoñez, Alvaro

79.143.366

20.281

Apellidos y Nombre

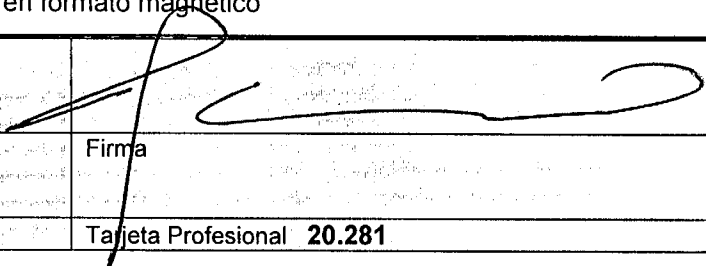
Documento de identificación

Tarjeta profesional

Dirección y domicilio		Ciudad
AV. 82 No. 10 62 Piso 6		Bogotá
Dirección electrónica	No. Fax	Número telefónico
alvaro.correa@bakermckenzie.com	3762211	6341500

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de Propiedad Industrial, sírvase indicar el número de su radicación o protocolo de poder general

2

4. Datos del trámite		
CONVERSION Expediente _____ _____ _____ De: _____ A: _____	DIVISION Expediente 13.122.457 De: _____ A: _____	FUSION Expediente _____ _____ _____ De: _____ A: _____
5. Comprobante de Pago No. 14-120236 Fecha 11/11/2014		
6. Anexos ☒ Comprobante de pago de la tasa para la presentación de la corrección y/o modificación ☒ Poder, si fuere el caso con el que se acredita la representación ☐ Número de documento que ordena la comisión o fusión o división ☒ Documento que contiene la conversión, división o fusión de la solicitud ☒ Copia de la solicitud y sus anexos en formato magnético		
7. Firma		
Alvaro Correa Ordoñez		
Nombre y apellidos	Firma	
C.C. 79.143.366	Tarjeta Profesional 20.281	

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800.176.089-2

-/-

2014/055

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

RECIBO DE CAJA

No. 14 - 120236

Bogotá D.C., Noviembre 11 de 2014 - 16:42:02

RECIBIDO DE : BAKER

NI 900.532.339

*** Soporte del Pago ***

TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	VR. PAGO
CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	596597540	11/11/2014	134.252.000.00

*** Conceptos Pagados ***

CANT	RENTISTICO	CONCEPTO	Vr. UNDITARIO	Vr. CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1603 INVOCAR LA NOTORIEDAD DENTRO DE UN TRAMITE DE OPOSICION	464.000.00	464.000.00
				\$464.000.00

SON: **CUATROCIENTOS SESENTA Y CUATRO MIL PESOS MONEDA CORRIENTE***

Responsable: _____

Recibo de Caja Aplicado al Expediente No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 14-270781- -00000-0000

Fecha: 2014-12-09 17:12:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 5

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-122457- -00011-0000

Fecha: 2014-12-09 17:12:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 5

Sede Centro: Carrera 13 No. 27 - 00 Pisos 3,4,5 y 10 Bogotá, D.C. - Colombia

Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co Conmutador: (571) 5870000 Fax: (571) 5870284 Línea: 018000-910165 Call Center: (571) 6513240

, Noviembre 11 de 2014 - 16:42:19

 PLANILLA DE RADICACIÓN - DIGITALIZACIÓN DIARIA RELACIÓN DE ANEXOS		
Dependencia: 2020	Fecha: <u>14</u> / <u>12</u> / <u>9</u> AAAA MM DD	Recorrido:
Tipo de Radicación: Entrada: ☐ Salida: ☐ Traslado: ☐ Convenio: ☐		Planilla:
Radicador:		

ID	No. Radicación	Consecutivo	Item
1	13-122467	011	
2	14 270781	0	
3			
4			
5			
6			
7			
8			
9			
10			
11			
12			
13			
14			
15			
16			
17			

Item	Unidad de Conservación
1	Bolsa
2	Caja
3	Libro
4	Sobre
5	Tomo
6	Otro
Item	Soporte Documental
7	CD ✓
8	Disquete
9	DVD
10	Folleto
11	Foto
12	Periódico
13	Plano
14	Publicación Periódica
15	USB
16	Otro

Observaciones:

El cd anexo contiene:
 4 archivos en formato PDF, los cuales
 son procesados y subidos al sistema

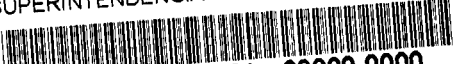
[Signature]
 ADMA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 13-122457-00011-0000
Fecha: 2014-12-09 17:12:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 851 DIVISIONAL Folios: 8 5

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 14-270781-00000-0000
Fecha: 2014-12-09 17:12:25 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 8 5

ONES

36/00

PATENTE DE INVENCION ☐

MOD

☐	Indicación que se solicita una patente.
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Descripción de la invención
☐	Dibujos de ser estos pertinentes
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas (De ser el caso formato de descuento)
Completa ☐	Incompleta ☐

PATENTE DE INVENCION PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD PCT ☐ Art.33 Decisión 486/00, Circular Única

☒	Indicación que se solicita una PCT
☒	Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)
☐	Dibujos de ser estos pertinentes
☒	Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)
Completa ☒	Incompleta ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐ (Art. 119 Decisión 486/00)

☐	Indicación que se solicita Diseño industrial
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Representación gráfica y fotográfica del Diseño industrial o muestra del material que incorpora el diseño
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas
Completa ☐	Incompleta ☐

ESQUEMA DE TRAZADO ☐ (Art. 92 Decisión 486/00)

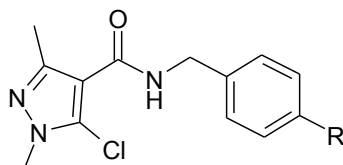
☐	Indicación que se solicita un esquema de trazado
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Representación gráfica de un esquema de trazado
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas
Completa ☐	Incompleta ☐

N-BENCIL CARBOXAMIDAS HETEROCÍCLICAS

DESCRIPCIÓN

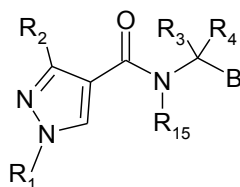
La presente invención se refiere a derivados de N-bencil carboxamidas heterocíclicas o a sus derivados de tiocarboxamidas, a su proceso de preparación, a su utilización como agentes fungicidas, particularmente en forma de composiciones, y a métodos para el control de hongos fitopatógenos, principalmente de plantas, que utilizan estos compuestos o composiciones.

En la publicación J. Korean Agric. Chem. Soc. (1992), 35(2), 87-91 [CAN 117:207009] se abarcan genéricamente algunas amidas fungicidas en la fórmula siguiente:



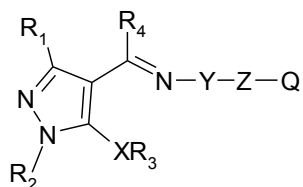
en donde R puede representar un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro, un grupo metilo o un grupo metoxi. Sin embargo, en estos documentos no se describe ni se sugiere ningún tal derivado en donde el sustituyente en posición 3 del grupo pirazolilo puede representar un grupo dihalogenometilo. Además, en este documento no se describe ni se sugiere ningún compuesto que incluya un grupo alquilo, un grupo alcoxi o un grupo cicloalquilo(C₄-C₇) unido al átomo de nitrógeno del resto carboxamida.

En la solicitud de patente internacional WO-2009/024342 se describen algunos derivados de amidas del ácido pirazol-4-carboxílico fungicidas en una amplia descripción de numerosos compuestos de la fórmula siguiente:



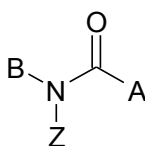
en donde R₁ puede representar un grupo alquilo, R₂ puede representar a grupo halogenoalquilo, R₁₅ puede representar un átomo de hidrógeno o un grupo ciclopropilo, R₃ o R₄ pueden representar diversos sustituyentes entre los que se encuentran un grupo alquilo, un grupo haloalquilo y similares, y B puede representar un grupo fenilo, un grupo naftilo o un sistema de anillo mono o bicíclico. Sin embargo, en este documento no se describe ni se sugiere ningún tal derivado en donde el sustituyente en posición 5 del grupo pirazolilo pueda representar un átomo de halógeno. Además, en este documento no se describe ni se sugiere ningún compuesto que incluya un grupo alquilo, un grupo alcoxi o un grupo cicloalquilo(C₄-C₇) unido al átomo de nitrógeno del resto carboxamida.

En la solicitud de patente CN1188764 se describen genéricamente algunos derivados de pirazol fungicidas en una amplia descripción de numerosos compuestos de la fórmula siguiente:



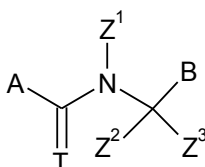
en donde R_1 o R_2 puede representar un grupo alquilo o a grupo halogenoalquilo, X puede representar un enlace directo, R_3 puede representar diversos sustituyentes entre los que se encuentra un átomo de cloro, R_4 puede representar diversos sustituyentes entre los que se encuentra un átomo de oxígeno o de azufre, Y y Z pueden representar un enlace directo, y Q puede representar diversos grupos entre los que se encuentra un grupo bencilo sustituido. Sin embargo, en este documento no se describe ni se sugiere ningún compuesto que incluya un grupo alquilo, un grupo alcoxi o un grupo cicloalquilo (C_4-C_7) unido al átomo de nitrógeno del resto carboxamida. Además, no hay una descripción explícita ni se sugiere en este documento seleccionar cualquier tal derivado en el que el grupo pirazolilo puede representar un 1-metil-3-(difluoro o dicloro)metil-5-(cloro o fluoro)-4-pirazolilo.

En las solicitudes internacionales de patente WO-2006/120224 y WO-2007/087906, se abarcan genéricamente algunos derivados de amida en una amplia descripción de numerosos compuestos de la fórmula siguiente:



en donde A puede representar a un grupo heterocíclico unido por carbo, parcialmente saturado o insaturado, de 5 miembros, que puede estar sustituido, Z puede representar un grupo cicloalquilo sustituido o sin sustituir y B puede representar un grupo bencilo sustituido o sin sustituir o un grupo 2-piridilmetileno sin sustituir. Sin embargo, en estos documentos no se describe ni se sugiere ningún compuesto que incluya un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo o un grupo alcoxi unido al átomo de nitrógeno del resto carboxamida. Además, no hay una descripción explícita ni se sugiere seleccionar en estos documentos cualquier tal derivado en el que A pueda representar un grupo 1-metil-3-(difluoro o dicloro)metil-5-(cloro o fluoro)-4-pirazolilo.

En la solicitud internacional de patente WO-2009/016221, se abarcan genéricamente algunos derivados de amida en una amplia descripción de numerosos compuestos de la fórmula siguiente:

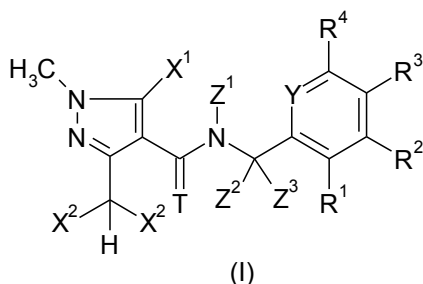


en donde A puede representar un grupo heterocíclico unido por carbo, parcialmente saturado o insaturado, de 5 miembros, que puede estar sustituido, T puede ser O o S, Z^1 puede representar un grupo cicloalquilo sustituido o sin sustituir, Z^2 y Z^3 pueden representar un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_8) entre otros grupos, y B puede representar un grupo naftilo o un grupo heteroaromático

bicíclico. Sin embargo, en este documento no se describe ni se sugiere ningún compuesto que incluya un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo o un grupo alcoxi unido al átomo de nitrógeno del resto carboxamida. Además, en este documento no se describe ni se sugiere ningún compuesto en donde B se vaya a reemplazar con un grupo fenilo o un grupo 2-piridilo. Además, en este documento no hay una descripción explícita ni se sugiere seleccionar cualquier tal derivado en el que A pueda representar un grupo 1-metil-3-(difluoro o dicloro)metil-5-(cloro o fluoro)-4-pirazolilo.

Siempre es de gran interés en el campo de la agricultura, el uso de nuevos compuestos pesticidas con objeto de evitar el desarrollo de cepas resistentes a los ingredientes activos o luchar contra ellas. Es también de gran interés el uso de nuevos compuestos que sean más activos que los ya conocidos, con objeto de reducir las cantidades de compuesto activo que se han de utilizar, manteniendo al mismo tiempo una eficacia al menos equivalente a la de los compuestos ya conocidos. Ahora se ha encontrado una nueva familia de compuestos que poseen los efectos o las ventajas mencionadas anteriormente.

Por consiguiente, la presente invención provee derivados fórmula (I)



en la que

- Y representa CR⁵ o N;
- T representa O o S;
- X¹ y X², que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de cloro o de flúor;
- Z¹ representa un átomo de hidrógeno, alquilo(C₁-C₈) sustituido o no sustituido; alcoxi(C₁-C₈) sustituido o sin sustituir; alquenilo(C₂-C₈) sustituido o sin sustituir; alquinilo(C₂-C₈) sustituido o sin sustituir; cicloalquilo(C₄-C₇) sustituido o sin sustituir; cicloalquil(C₃-C₇)-alquilo(C₁-C₈) sustituido o sin sustituir; 3-oxetanilo sustituido o sin sustituir; o 3-tietanilo sustituido o sin sustituir;
- Z² y Z³, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; alquilo(C₁-C₈) sustituido o sin sustituir; alquenilo(C₂-C₈) sustituido o sin sustituir; alquinilo(C₂-C₈) sustituido o sin sustituir; ciano; isonitrilo; nitro; un átomo de halógeno; alcoxi(C₁-C₈) sustituido o sin sustituir; alqueniloxi(C₂-C₈) sustituido o sin sustituir; alquiniloxi(C₂-C₈) sustituido o sin sustituir; cicloalquilo(C₃-C₇) sustituido o sin sustituir;

alquil(C₁-C₈)-sulfanilo sustituido o sin sustituir; alquil(C₁-C₈)-sulfonilo sustituido o sin sustituir; alquil(C₁-C₈)-sulfinilo sustituido o sin sustituir; amino; alquil(C₁-C₈)-amino sustituido o sin sustituir; dialquil(C₁-C₈)-amino sustituido o sin sustituir; alcoxi(C₁-C₈)-carbonilo sustituido o sin sustituir; alquil(C₁-C₈)-carbamoílo sustituido o sin sustituir; dialquil(C₁-C₈)-carbamoílo sustituido o sin sustituir; o N-alquilo(C₁-C₈)-alcoxi(C₁-C₈)-carbamoílo sustituido o sin sustituir;

o

Z³ y R¹ junto con los átomos consecutivos a los que están unidos forman un carbo- o heterociclo parcialmente saturado, de 5, 6 ó 7 miembros, sustituido o sin sustituir que comprende hasta 3 heteroátomos y Z² es como se describe en la presente memoria; o

Z² y Z³ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un cicloalquilo(C₃-C₇) sustituido o sin sustituir;

- R¹, R², R³, R⁴ y R⁵, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; nitro; ciano; isonitrilo; hidroxilo; sulfanilo; amino; pentafluoro-λ⁶-sulfanilo; alquilo(C₁-C₈) sustituido o sin sustituir; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C₁-C₈)-amino sustituido o sin sustituir; dialquil(C₁-C₈)-amino sustituido o sin sustituir; alcoxi(C₁-C₈) sustituido o sin sustituir; halogenoalcoxi(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C₁-C₈)-alquilo(C₁-C₈); alquil(C₁-C₈)-sulfanilo sustituido o sin sustituir; halogenoalquil (C₁-C₈)sulfanilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquenilo(C₂-C₈) sustituido o sin sustituir; halogenoalquenilo(C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquinilo(C₂-C₈) sustituido o sin sustituir; halogenoalquinilo(C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alqueniloxi(C₂-C₈) sustituido o sin sustituir; halogenoalqueniloxi(C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquiniloxi(C₂-C₈) sustituido o sin sustituir; halogenoalquiniloxi(C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo(C₃-C₇) sustituido o sin sustituir; halogenocicloalquilo(C₃-C₇) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquil(C₃-C₇)-alquilo(C₁-C₈) sustituido o sin sustituir; cicloalquil(C₃-C₇)-alquenilo(C₂-C₈) sustituido o sin sustituir; cicloalquil(C₃-C₇)-alquinilo(C₂-C₈) sustituido o sin sustituir; cicloalquil(C₃-C₇)-cicloalquilo(C₃-C₇)-sustituido o sin sustituir; cicloalquil(C₃-C₇)-alquilo(C₁-C₈) sustituido o sin sustituir; formilo; formiloxi; formilamino; carboxi; carbamoílo; N-hidroxicarbamoílo; carbamato; alquil(C₁-C₈)hidroxiimino; alquil(C₁-C₈)-carbonilo sustituido o sin sustituir; halogenoalquil (C₁-C₈)carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C₁-C₈)-carbamoílo sustituido o sin sustituir; dialquil(C₁-C₈)-carbamoílo sustituido o sin sustituir; N-(sustituido o sin sustituir alquiloxi(C₁-C₈))carbamoílo; alcoxi(C₁-C₈)-carbamoílo sustituido o sin sustituir; N-(sustituido o sin sustituir alquilo(C₁-C₈))- (sustituido o sin sustituir alcoxi(C₁-C₈))-carbamoílo; alcoxi(C₁-C₈)-carbonilo sustituido o sin sustituir; halogenoalcoxi (C₁-C₈)carbonilo que comprende hasta 9

átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquilamino(C₁-C₈)-carbonilo sustituido o sin sustituir; dialquilamino(C₁-C₈)-carbonilo sustituido o sin sustituir; alquil(C₁-C₈)-carboniloxi sustituido o sin sustituir; halogenoalquil (C₁-C₈)carboniloxi que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C₁-C₈)-carbonilamino sustituido o sin sustituir; halogenoalquil (C₁-C₈)carbonilamino que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C₁-C₈)-aminocarboniloxi sustituido o sin sustituir; dialquil(C₁-C₈)-aminocarboniloxi sustituido o sin sustituir; alquilo(C₁-C₈)-carboniloxi sustituido o sin sustituir; alquil(C₁-C₈)-sulfinilo sustituido o sin sustituir; halogenoalquil(C₁-C₈)sulfinilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C₁-C₈)-sulfonilo sustituido o sin sustituir; halogenoalquil(C₁-C₈)sulfonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C₁-C₈)-imino sustituido o sin sustituir; (alcoxi(C₁-C₈)-imino)-alquilo(C₁-C₈); (alqueniloxi(C₁-C₈)-imino)-alquilo(C₁-C₈) sustituido o sin sustituir; (alquinil C₁-C₈-oxiimino)-alquilo(C₁-C₈); un (bencilloxiimino)-alquilo(C₁-C₈); tri(alquil(C₁-C₈) sustituido o sin sustituir)sililo; tri(alquil-C₁-C₈)sililo-alquilo(C₁-C₈) sustituido o sin sustituir; benciloxi que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilsulfanilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilamino que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; arilo que puede estar sustituido por hasta 7 grupos Q; ariloxi que puede estar sustituido por hasta 7 grupos Q; arilamino que puede estar sustituido por hasta 7 grupos Q; arilsulfanilo que puede estar sustituido por hasta 7 grupos Q; arilalquilo(C₁-C₈) que puede estar sustituido por hasta 7 grupos Q; aril-alquenilo(C₂-C₈) que puede estar sustituido con hasta 7 grupos Q; aril-alquinilo(C₂-C₈) que puede estar sustituido con hasta 7 grupos Q; piridinilo que puede estar sustituido por hasta 4 grupos Q; piridiniloxi que puede estar sustituido por hasta 4 grupos Q; aril-cicloalquilo(C₃-C₇) que puede estar sustituido con hasta 7 grupos Q; o

Dos sustituyentes vecinos R junto con los átomos de carbono consecutivos a los que están unidos forman un carbo- o hetero-ciclo saturado de 5 ó 6 miembros sustituido o sin sustituir que comprende hasta 3 heteroátomos y los otros sustituyentes R son como se describen en la presente memoria; o

- R¹ y Z³ junto con los átomos consecutivos a los que están unidos forman un carbo- o hetero-ciclo parcialmente saturado, de 5, 6 ó 7 miembros, sustituido o sin sustituir que comprende hasta 3 heteroátomos y R² a R⁵ son como se describen en la presente memoria;

- Q, que puede ser igual o diferente, representa un átomo de halógeno; ciano; nitro; alquilo(C₁-C₈); alcoxi(C₁-C₈); alquil(C₁-C₈)sulfanilo; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; halogenoalcoxi(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; trialquil(C₁-C₈)sililo o trialquil(C₁-C₈)sililo-alquilo(C₁-C₈);

así como sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloides y sus isómeros ópticamente activos o geométricos.

a menos que se indique otra cosa, un grupo o un sustituyente que está sustituido de acuerdo con la invención puede estar sustituido con uno o más de los siguientes grupos o átomos: un átomo de halógeno; nitro; hidroxilo; ciano; isonitrilo; amino; tio; un grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanilo; formilo; formiloxi; formilamino; carbamoilo; N-hidroxicarbamoilo; carbamato; alquil(C₁-C₆)hidroxiimino; alquilo(C₁-C₈); un tri(alquil (C₁-C₈))sililo; cicloalquilo(C₃-C₈); halogenoalquilo(C₁-C₈) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; un halogenocicloalquilo(C₃-C₈) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alquenilo(C₂-C₈); alquinilo(C₂-C₈); alqueniloxi C₂-C₈; alquiniloxi(C₂-C₈); alquil(C₁-C₈)amino; alquil di(C₁-C₈)amino; alcoxi C₁-C₈; halogenoalcoxi-C₁-C₈ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alquil(C₁-C₈)sulfanilo; halógenoalquil(C₁-C₈)-sulfanilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alqueniloxi(C₂-C₈); halogenoalqueniloxi(C₁-C₈) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alquiniloxi(C₃-C₈); halógenoalquiniloxi(C₃-C₈) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alquil(C₁-C₈)carbonilo; halogenoalquil(C₁-C₈)-carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alquil(C₁-C₈)carbamoilo; dialquil(C₁-C₈)carbamoilo; N-alquil(C₁-C₈)oxicarbamoilo; alcoxi(C₁-C₈)carbamoilo; N-alquil(C₁-C₈)-alcoxi(C₁-C₈)carbamoilo; alcoxi(C₁-C₈)carbonilo; halogenoalcoxi(C₁-C₈)-carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alquil (C₁-C₈)carboniloxi; halogenoalquil(C₁-C₈)-carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alquil(C₁-C₈)carbonilamino; halógenoalquil(C₁-C₈)-carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alquil(C₁-C₈)aminocarboniloxi; dialquil(C₁-C₈) aminocarboniloxi; alquil(C₁-C₈)-oxicarboniloxi; alquil(C₁-C₈)sulfanilo; halógenoalquil(C₁-C₈)-sulfanilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alquilsulfanilo(C₁-C₈); halogenoalquil(C₁-C₈)-sulfanilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alquil(C₁-C₈)-sulfonilo; halógenoalquil(C₁-C₈)-sulfonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; alquil(C₁-C₈)-aminosulfamoilo; dialquil(C₁-C₈)-aminosulfamoilo; (alcoxi(C₁-C₆)-imino)-alquilo(C₁-C₆); (alqueniloxi(C₁-C₆)-imino)-alquilo(C₁-C₆); (alquiniloxi(C₁-C₆)-imino)-alquilo(C₁-C₆); 2-oxopirrolidin-1-ilo; alquil(C₁-C₆)-benciloxiimino; alcioxialquilo(C₁-C₈); halogenoalcioxialquilo(C₁-C₈) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; benciloxi; bencilsulfanilo; bencilamino; ariloxi; arilsulfanilo o arilamino.

Cualquiera de los compuestos de acuerdo con la invención puede existir en forma de uno o más estereoisómeros dependiendo del número de unidades estereogénicas (como se define por las reglas de la IUPAC) en el compuesto. Por lo tanto, la invención se refiere de la misma manera a todos los estereoisómeros, y a las mezclas de todos los estereoisómeros posibles, en todas las proporciones. Los estereoisómeros se pueden separar conforme a los métodos que se conocen *per se* por el experto en la materia.

Conforme a la invención, se usan en general las expresiones genéricas siguientes, con los siguientes significados:

- halógeno significa: flúor, cloro, bromo o yodo;
- heteroátomo puede ser nitrógeno, oxígeno o azufre;
- cualquier grupo alquilo, alquenilo o alquinilo puede ser lineal o ramificado;
- el término "arilo" significa fenilo o naftilo, sustituido opcionalmente;

- en el caso de un grupo amino o el resto amino de cualquier grupo que comprende amino, sustituido con dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes, los dos sustituyentes junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un grupo heterociclilo, preferiblemente un grupo heterociclilo de 5- a 7 miembros, que puede estar sustituido o que puede incluir otros heteroátomos, por ejemplo un grupo morfolino o piperidinilo.

Los compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Y representa CR⁵.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Y representa N.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que T representa O.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención son aquellos en los que X¹ representa un átomo de flúor.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención son aquellos en los que X² representa un átomo de flúor.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención son aquellos en los que Z¹ representa un átomo de hidrógeno.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Z¹ representa un metilo o un etilo.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención son aquellos en los que Z¹ representa un ciclobutilo sin sustituir.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención son aquellos en los que Z² y Z³ representan independientemente un átomo de hidrógeno o un metilo.

Los compuestos más preferidos de fórmula (I) de acuerdo con la invención son aquellos en los que Z² representa un átomo de hidrógeno y Z³ representa un átomo de hidrógeno o un metilo.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R¹, R², R³, R⁴ y R⁵, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo(C₁-C₈) sustituido o sin sustituir; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo(C₃-C₇) sustituido o sin sustituir; tri(alquil(C₁-C₈))sililo; o un alquil(C₁-C₈)-sulfanilo sustituido o sin sustituir.

Los compuestos más preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que el sustituyente R^1 representa un átomo de halógeno; alquilo(C_1-C_8); halogenoalquilo(C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo(C_3-C_7); tri(alquilo(C_1-C_8))sililo o halogenoalquil(C_1-C_8)sulfanilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes.

Otros compuestos más preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que los sustituyentes R^1 y R^5 , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de halógeno; alquilo(C_1-C_8); halogenoalquilo C_1-C_8 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo(C_3-C_7); tri(alquilo(C_1-C_8))sililo o halogenoalquil(C_1-C_8)sulfanilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes.

Las preferencias mencionadas anteriormente con respecto a los sustituyentes de los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención pueden combinarse de diversas maneras, bien individual, parcial o completamente. Estas combinaciones de características preferidas proporcionan de esta manera subclases de compuestos de acuerdo con la invención. Los ejemplos de dichas subclases de compuestos preferidos de acuerdo con la invención pueden combinar:

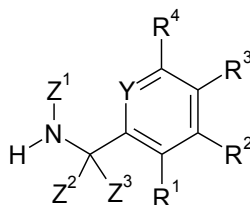
- características preferidas de T con características preferidas de uno o más de X^1 , X^2 , Y, Z^1 a Z^3 , y/o R^1 a R^5 ;
- características preferidas de X^1 con características preferidas de uno o más de T, X^2 , Y, Z^1 a Z^3 , y/o R^1 a R^5 ;
- características preferidas de X^2 con características preferidas de uno o más de T, X^1 , Y, Z^1 a Z^3 , y/o R^1 a R^5 ;
- características preferidas de Y con características preferidas de uno o más de T, X^1 , X^2 , Z^1 a Z^3 , y/o R^1 a R^5 ;
- características preferidas de Z^1 con características preferidas de uno o más de T, X^1 , X^2 , Y, Z^2 , Z^3 , y/o R^1 a R^5 ;
- características preferidas de Z^2 con características preferidas de uno o más de T, X^1 , X^2 , Y, Z^1 , Z^3 , y/o R^1 a R^5 ;
- características preferidas de Z^3 con características preferidas de uno o más de T, X^1 , X^2 , Y, Z^1 , Z^2 , y/o R^1 a R^5 ;
- características preferidas de R^1 con características preferidas de uno o más de T, X^1 , X^2 , Y, Z^1 a Z^3 , y/o R^2 a R^5 ;
- características preferidas de R^2 con características preferidas de uno o más de T, X^1 , X^2 , Y, Z^1 a Z^3 , R^1 , y/o R^3 a R^5 ;
- características preferidas de R^3 con características preferidas de uno o más de T, X^1 , X^2 , Y, Z^1 a Z^3 , R^1 , R^2 , R^4 , y/o R^5 ;
- características preferidas de R^4 con características preferidas de uno o más de T, X^1 , X^2 , Y, Z^1 a Z^3 , R^1 a R^3 , y/o R^5 ;

- características preferidas de R^5 con características preferidas de uno o más de T, X^1 , X^2 , Y, Z^1 a Z^3 , y/o R^1 a R^4 ;

-

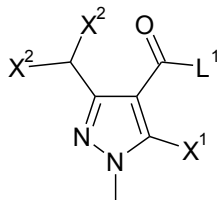
En estas combinaciones de características preferidas de los sustituyentes de los compuestos según la invención, dichas características preferidas pueden también seleccionarse entre las características más preferidas de cada uno de T, X^1 , X^2 , Y, Z^1 a Z^3 , y R^1 a R^5 ; para formar subclases aún más preferidas de compuestos de acuerdo con la invención.

La presente invención también se refiere a un proceso para la preparación del compuesto de fórmula (I). Así, según un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un proceso P1 para la preparación del compuesto de fórmula general (I) como se define en la presente memoria y en la que T representa O y que comprende la reacción de un derivado de amina N-sustituida de fórmula (II) o una de sus sales :



(II)

en donde Z^1 , Z^2 , Z^3 , Y, R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se definen en la presente memoria; con un derivado de ácido carboxílico de fórmula (III):



(III)

en donde X^1 y X^2 son como se definen en la presente memoria y L^1 representa un grupo saliente seleccionado de la lista que consiste en un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, $-OR^a$, $-OC(=O)R^a$, siendo R^a un grupo alquilo (C_1 - C_6) sustituido o sin sustituir, un haloalquilo (C_1 - C_6) sustituido o sin sustituir, un bencilo, un 4-metoxibencilo o un grupo pentafluorofenilo; en presencia de un catalizador y en presencia de un agente de condensación en el caso en que L^1 represente un grupo hidroxilo, y en presencia de un ligante ácido en el caso en que L^1 represente un átomo de halógeno.

Los derivados de amina N-sustituidas de fórmula (II) son conocidas o se pueden preparar por procesos conocidos tales como aminación reductora de aldehídos o cetonas (Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters (2006), 16, 2014), o reducción de iminas (Tetrahedron (2005), 61, 11689), o sustitución nucleófila de un halógeno, mesilato o tosilato (Journal of Medicinal Chemistry (2002), 45, 3887).

Los derivados de ácido carboxílico de fórmula (III) se pueden preparar según el proceso P2.

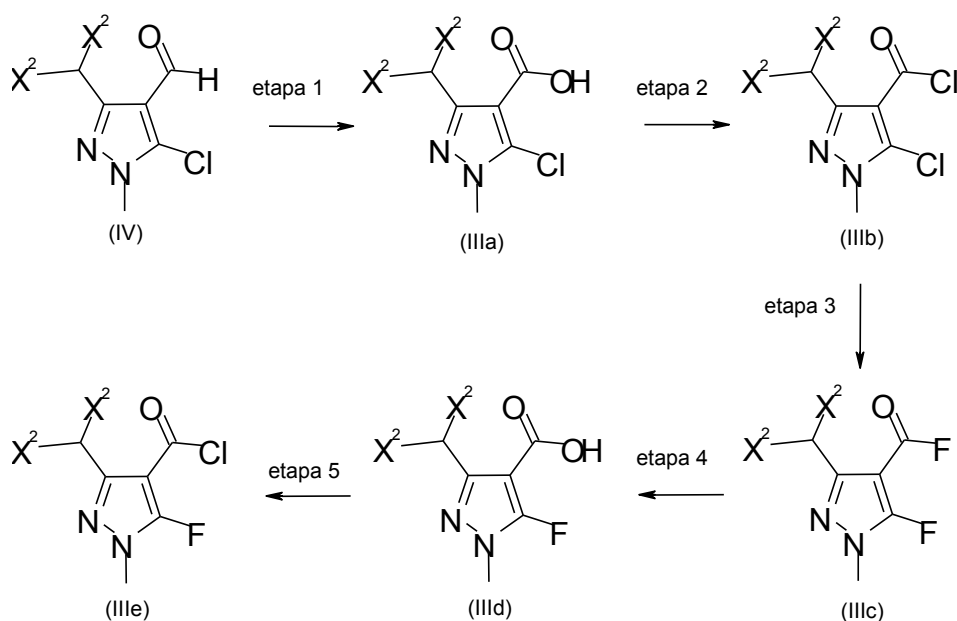
En caso en que L^1 represente un grupo hidroxilo, el proceso según la presente invención se lleva a cabo en presencia de un agente de condensación. Los agentes de condensación adecuados se puede seleccionar de la lista no limitante que consiste en un formador de haluros ácidos, tal como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxido tricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; un formador de anhídridos, tal como cloroformiato de etilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de isobutilo o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas, tales como N,N'-diciohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes de condensación habituales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonil-diimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano, cloruro de 4-(4,6-dimetoxi[1.3.5]-triazin-2-il)-4-metilmorfolinio hidrato, hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidino fosfonio o anhídrido propanofosfórico (T3P).

El proceso de acuerdo con la presente invención se lleva a cabo en presencia de un catalizador. El catalizador adecuado se puede seleccionar de la lista que consiste en 4-dimetil-aminopiridina, 1-hidroxibenzotriazol o dimetilformamida.

En el caso en que L^1 represente un átomo de halógeno, el proceso según la presente invención se realiza en presencia de un ligante ácido. Los ligantes ácidos adecuados para llevar a cabo el proceso P1 según la invención son, en cada caso, todas las bases inorgánicas y orgánicas habituales para dichas reacciones. Se da preferencia a la utilización de metales alcalinotérreos, hidruros de metales alcalinos, hidróxidos de metales alcalinos o alcóxidos de metales alcalinos, tales como hidróxido sódico, hidruro sódico, hidróxido de calcio, hidróxido potásico, terc-butóxido potásico u otro hidróxido de amonio, carbonatos de metales alcalinos, tales como carbonato de cesio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico, acetatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, tales como acetato sódico, acetato potásico, acetato de calcio y también aminas terciarias, tal como trimetilamina, trietilamina, diisopropiletilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, piridina, N-metilpiperidina, N,N-dimetil-aminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

También es posible trabajar en ausencia de un agente de condensación adicional o usar un exceso de componente amino, de manera que actúe simultáneamente como agente ligante ácido.

Según un aspecto adicional de acuerdo con la presente invención, se proporciona un proceso P2 para la preparación de derivados de ácido carboxílico de fórmula (III) en el que T representa O, y se ilustra según el siguiente esquema de reacción:



proceso P2

en donde X^2 es como se ha definido en la presente memoria;

- 5 Se conoce el 5-cloro-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carbaldehído de la solicitud de patente WO-2004/014138 (ejemplo de referencia 35).

La etapa 1 del proceso P2 se realiza en presencia de un oxidante y, si es apropiado, en presencia de un disolvente.

- 10 Las etapas 2 y 5 del proceso P2 se realizan en presencia de un haluro de ácido y, si es apropiado, en presencia de un disolvente.

La etapa 3 del proceso P2 se realiza en presencia de un agente de fluoración y, si es apropiado, en presencia de un disolvente.

- 15 La etapa 4 del proceso P2 se realiza en presencia de un ácido o una base y, si es apropiado, en presencia de un disolvente.

Los oxidantes adecuados para llevar a cabo la etapa 1 del proceso P2 según la invención son en cada caso todos los oxidantes orgánicos o inorgánicos que son habituales para tales reacciones. Se da preferencia al uso de permanganato de benciltrietilamonio, bromo, cloro, ácido m-cloroperbenzoico, ácido crómico, óxido de cromo (VI), peróxido de hidrógeno, peróxido de hidrógeno-trifluoruro de boro, peróxido de hidrógeno-urea, 2-hidroxiperoxihexafluoro-2-propanol; Iodo, catalizador oxígeno-platino, ácido perbenzoico, nitrato de peroxiacetilo, permanganato de potasio, rutenato de potasio, dicromato de piridinio, óxido de rutenio (VIII), óxido de plata (I), óxido de plata (II), nitrito de plata, clorito de sodio, hipoclorito de sodio o 2,2,6,6-tetrametilpiperidin-1-oxilo.

25

Los haluros de ácido adecuados para llevar a cabo las etapas 2 y 5 del proceso P2 según la invención son en cada caso todos los haluros de ácido orgánicos o inorgánicos que son habituales para tales reacciones. Se da preferencia al uso particularmente de fosgeno, tricloruro fosforoso,

pentacloruro fosforoso, óxido-tricloruro fosforoso, cloruro de tionilo o tetracloruro de carbono-trifenilfosfina.

5 Los agentes de fluoración adecuados para llevar a cabo la etapa 3 del proceso P2 según la invención son en cada caso todos los agentes de fluoración que son habituales para tales reacciones. Se da preferencia al uso de fluoruro de cesio, fluoruro de potasio, fluoruro de potasio-difluoruro de calcio, o fluoruro de tetrabutilamonio.

10 Cuando se llevan a cabo las etapas 1 a 5 del proceso P2 según la invención, las temperaturas de reacción pueden variar independientemente dentro de un intervalo relativamente grande. Generalmente, los procesos según la invención se realizan a temperaturas entre 0°C y 160°C, preferentemente entre 10°C y 120°C. Una forma de controlar la temperatura en los procesos de acuerdo con la invención es usar tecnología de microondas.

15 Las etapas 1 a 5 del proceso P2 según la invención se realizan generalmente independientemente a presión atmosférica. Sin embargo, en cada caso, es también posible trabajar a presión elevada o reducida.

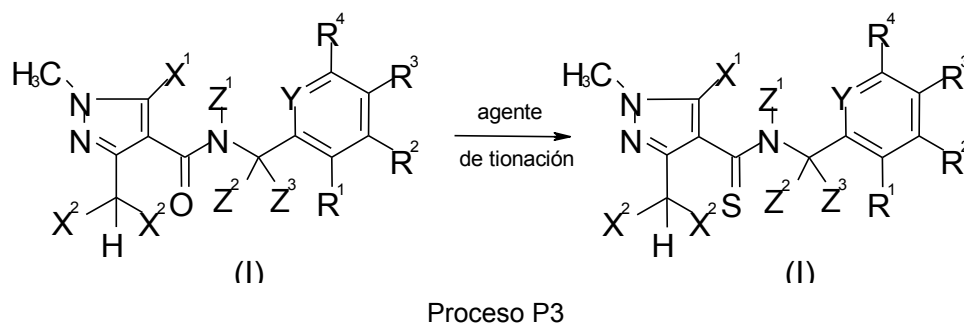
20 Cuando se realiza la etapa 1 del proceso P2 según la invención, generalmente se emplea un mol o una cantidad en exceso del oxidante por mol de aldehído de fórmula (IV). También es posible emplear los componentes de la reacción en otras proporciones.

25 Cuando se llevan a cabo las etapas 2 y 5 del proceso P2 de acuerdo con la invención, generalmente se emplea un mol o una cantidad en exceso del haluro de ácido por mol de ácido de fórmula (IIIa) o (IIIb). También es posible emplear los componentes de la reacción en otras proporciones.

30 Cuando se realiza la etapa 3 del proceso P2 de acuerdo con la invención, generalmente se emplea un mol o una cantidad en exceso del agente de fluoración por mol de cloruro de ácido (IIIb). También es posible emplear los componentes de la reacción en otras proporciones.

35 Cuando se realiza la etapa 4 del proceso P2 de acuerdo con la invención, generalmente se emplea un mol o una cantidad en exceso de ácido o base por mol de fluoruro de ácido (IIIc). También es posible emplear los componentes de la reacción en otras proporciones.

Según un aspecto adicional de acuerdo con la invención, se proporciona un proceso P3 para la preparación de un compuesto de fórmula (I) en donde T representa S, partiendo de un compuesto de fórmula (I) en donde T representa O e ilustrado según el esquema de reacción siguiente :



en la que X^1 , X^2 , Z^1 , Z^2 , Z^3 , Y , R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se definen en la presente memoria, en la presencia opcional de una cantidad catalítica o estequiométrica o en exceso, de una base tal como una base inorgánica o una orgánica. Se da preferencia a utilizar carbonatos de metales alcalinos, tales como el carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico; bases heterocíclicas aromáticas, tales como piridina, picolina, lutidina, colidina; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-aminopiridina o N-metilpiperidina.

El proceso P3 según la invención se realiza en presencia de un agente de tionación.

Los derivados de amida de fórmula (I) de partida se pueden preparar de acuerdo con el proceso P1.

Los agentes de tionación adecuados para llevar a cabo el proceso P3 según la invención pueden ser azufre (S), ácido sulfhídrico (H_2S), sulfuro de sodio (Na_2S), hidrosulfuro de sodio ($NaHS$), trisulfuro de boro (B_2S_3), sulfuro de bis (dietilaluminio) ($(AlEt_2)_2S$), sulfuro de amonio ($(NH_4)_2S$), pentasulfuro fosforoso (P_2S_5), reactivo de Lawesson (2,4-disulfuro de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,2,3,4-ditiadifosfenato) o un agente de tionación soportado por un polímero tal como se describe en Journal of the Chemical Society, Perkin 1, (2001), 358.

El tratamiento se realiza por métodos habituales. En general, se trata con agua la mezcla de reacción y se separa la fase orgánica y, después de secar, se concentra a presión reducida. Si procede, el residuo restante puede liberarse por los métodos habituales, tal como la cromatografía, la recrystalización o destilación, de cualquier impureza que pueda todavía estar presente.

El compuesto de acuerdo con la presente invención puede prepararse de acuerdo con los procesos generales de preparación descritos anteriormente. Debe entenderse sin embargo que, basándose en su conocimiento general y en las publicaciones disponibles, el experto en la materia será capaz de adaptar este método de acuerdo con las características de cada uno de los compuestos que se desean sintetizar.

En un aspecto adicional, la presente invención también se refiere a una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz y no fitotóxica de un compuesto activo de fórmula (I).

La expresión "cantidad eficaz y no fitotóxica" significa una cantidad de la composición acorde con la invención que es suficiente para controlar o destruir los hongos presentes o con tendencia a aparecer en la arena del cultivo, y que no supone ningún síntoma apreciable de fitotoxicidad para dichos cultivos. Dicha cantidad puede variar en un amplio intervalo dependiendo del hongo que se vaya a combatir, el tipo de cultivo, las condiciones climáticas y los compuestos incluidos en la composición fungicida de acuerdo con la invención. Esta cantidad se puede determinar por ensayos en campo sistemáticos, que están dentro de las cualidades de un experto en la técnica.

Así, de acuerdo con la invención, se proporciona una composición fungicida que comprende, como ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I), como se defina en la presente memoria y un soporte, vehículo o carga aceptable desde el punto de vista agrícola.

Según la presente invención, el término "soporte" indica un compuesto orgánico o inorgánico, natural o sintético, con el que se combina o asocia el compuesto de fórmula (I) para hacerlo más fácilmente aplicable, fundamentalmente sobre las partes de la planta. Así, este soporte es generalmente inerte y debería ser aceptable desde el punto de vista agrícola. El soporte puede ser un sólido o un líquido. Los ejemplos de soportes adecuados incluyen arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, agua, alcoholes, en particular butanol, disolventes orgánicos, aceites minerales y vegetales y derivados de los mismos. También se pueden usar mezclas de tales soportes.

La composición de acuerdo con la invención puede comprender también componentes adicionales. En particular, la composición puede comprender además un tensioactivo. El tensioactivo puede ser un emulsionante, un agente de dispersión o un agente humectante de tipo iónico o no iónico o una mezcla de dichos tensioactivos. Se puede hacer mención, por ejemplo, de sales de ácidos poliacrílicos, sales de ácidos lignosulfónicos, sales de ácidos fenolsulfónicos o naftalenosulfónicos, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (en particular alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácidos sulfosuccínicos, derivados de taurina (en particular tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polioxietilados, ésteres de ácidos grasos de polioles y derivados de los compuestos anteriores que contienen funciones sulfato, sulfonato y fosfato. La presencia de al menos un tensioactivo es por lo general esencial cuando el compuesto activo y/o el soporte inerte son insolubles en agua, y cuando el agente vector para la aplicación es agua. Preferiblemente, el contenido en tensioactivo puede estar comprendido entre 5% y 40% en peso de la composición.

Opcionalmente, también se pueden incluir otros componentes, por ej., coloides protectores, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, agentes de penetración, estabilizantes, agentes secuestrantes. De manera más general, los compuestos activos se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido, que cumpla con las técnicas de formulación usuales.

En general, la composición de acuerdo con la invención puede contener de 0,05 a 99% en peso de compuesto activo, preferiblemente, de 10 a 70% en peso.

Las composiciones de acuerdo con la invención se pueden utilizar en diversas formas, tales como:

5 dispensador de aerosol, suspensión en cápsulas, concentrado para fumigación en frío, polvo de espolvoreo, concentrado emulsionable, emulsión de aceite en agua, emulsión de agua en aceite, granulados encapsulados, granulados finos, concentrado fluido para el tratamiento de semillas, gas (a presión), producto generador de gas, granulados, concentrado para fumigación en caliente, macrogranulados, microgranulados, polvo dispersable en aceite, concentrado fluido miscible en aceite,

10 líquido miscible en aceite, pasta, bastoncillos vegetales, polvo para tratamiento de semillas en seco, semillas recubiertas de pesticida, concentrado soluble, polvo soluble, disolución para el tratamiento de semillas, concentrado en suspensión (concentrado fluido), líquido en volumen ultrabajo (vub), suspensión en volumen ultrabajo (vub), granulado o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento en suspensión, granulados o comprimidos solubles en agua,

15 polvo soluble en agua para el tratamiento de semillas y polvo humectable. Estas composiciones incluyen no sólo composiciones que están listas para ser aplicadas a la planta o semilla a tratar por medio de un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo de atomización o de espolvoreo, sino también las composiciones comerciales concentradas que han de diluirse antes de la aplicación al cultivo.

20 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden mezclarse también con una o más sustancias activas insecticidas, fungicidas, bactericidas, atrayentes, acaricidas o feromonas u otros compuestos con actividad biológica. Las mezclas así obtenidas tienen normalmente un espectro de actividad ampliado. Las mezclas con otros compuestos fungicidas son particularmente ventajosas.

25 Se pueden seleccionar ejemplos de fungicidas de mezcla asociados adecuados en las siguientes listas:

(1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1.1) aldimorf (1704-28-5), (1.2) azaconazol (60207-31-0), (1.3) bitertanol (55179-31-2), (1.4) bromuconazol (116255-48-2), (1.5) ciproconazol (113096-99-4), (1.6) diclobutrazol (75736-33-3), (1.7) difenoconazol (119446-68-3), (1.8) diniconazol (83657-24-3), (1.9) diniconazol-M (83657-18-5), (1.10) dodemorf (1593-77-7), (1.11) acetato de dodemorf (31717-87-0), (1.12) epoxiconazol (106325-08-0), (1.13) etaconazol (60207-93-4), (1.14) fenarimol (60168-88-9), (1.15) fenbuconazol (114369-43-6), (1.16) fenhexamida (126833-17-8), (1.17) fenpropidina (67306-00-7), (1.18) fenpropimorf (67306-03-0), (1.19) fluquinconazol (136426-54-5),

30 (1.20) lurprimidol (56425-91-3), (1.21) flusilazol (85509-19-9), (1.22) flutriafol (76674-21-0), (1.23) furconazol (112839-33-5), (1.24) furconazol-cis (112839-32-4), (1.25) hexaconazol (79983-71-4), (1.26) imazalilo (60534-80-7), (1.27) sulfato de imazalilo (58594-72-2), (1.28) imibenconazol (86598-92-7), (1.29) ipconazol (125225-28-7), (1.30) metconazol (125116-23-6), (1.31) miclobutanilo (88671-89-0), (1.32) naftifina (65472-88-0), (1.33) nuarimol (63284-71-9), (1.34) oxpoconazol (174212-12-5),

40 (1.35) paclobutrazol (76738-62-0), (1.36) pefurazoato (101903-30-4), (1.37) penconazol (66246-88-6),

(1.38) piperlina (3478-94-2), (1.39) procloraz (67747-09-5), (1.40) propiconazol (60207-90-1), (1.41) protioconazol (178928-70-6), (1.42) piributicarb (88678-67-5), (1.43) pirifenox (88283-41-4), (1.44) quinconazol (103970-75-8), (1.45) simeconazol (149508-90-7), (1.46) spiroxamina (118134-30-8), (1.47) tebuconazol (107534-96-3), (1.48) terbinafina (91161-71-6), (1.49) tetraconazol (112281-77-3), (1.50) triadimefon (43121-43-3), (1.51) triadimenol (89482-17-7), (1.52) tridemorf (81412-43-3), (1.53) triflumizol (68694-11-1), (1.54) triforina (26644-46-2), (1.55) triticonazol (131983-72-7), (1.56) uniconazol (83657-22-1), (1.57) uniconazol-p (83657-17-4), (1.58) viniconazol (77174-66-4), (1.59) voriconazol (137234-62-9), (1.60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol (129586-32-9), (1.61) 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo (110323-95-0), (1.62) N'-{5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.63) N-etil-N-metil-N'-{2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}imidoformamida y (1.64) O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il] 1H-imidazol-1-carbotioato (111226-71-2).

(2) inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II, por ejemplo (2.1) bixafeno (581809-46-3), (2.2) boscalida (188425-85-6), (2.3) carboxina (5234-68-4), (2.4) diflumetorim (130339-07-0), (2.5) fenfuram (24691-80-3), (2.6) fluopiram (658066-35-4), (2.7) flutolanilo (66332-96-5), (2.8) fluxapiraxad (907204-31-3), (2.9) furametpir (123572-88-3), (2.10) furmeciclox (60568-05-0), (2.11) isopirazam (mezcla de racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS y racemato ante-epimérico 1RS,4SR,9SR) (881685-58-1), (2.12) isopirazam (racemato ante-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.13) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), (2.14) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2.15) isopirazam (racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2.16) isopirazam (racemato sin-epimérico 1R,4S,9R), (2.17) isopirazam (racemato sin-epimérico 1S,4R,9S), (2.18) mepronilo (55814-41-0), (2.19) oxicarboxina (5259-88-1), (2.20) penflufen (494793-67-8), (2.21) pentiopirad (183675-82-3), (2.22) sedaxano (874967-67-6), (2.23) tifulzamida (130000-40-7), (2.24) 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.25) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.26) 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.27) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (1092400-95-7) (WO 2008148570), (2.28) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]fenil)etil]quinazolin-4-amina (1210070-84-0) (WO2010025451), (2.29) N-[9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y (2.31) N-[(1R,4S)-9-(diclorometilen)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.

(3) inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III, por ejemplo (3.1) ametotradina (865318-97-4), (3.2) amisulbrom (348635-87-0), (3.3) azoxistrobina (131860-33-8), (3.4) ciazofamida (120116-88-3), (3.5) coumetoxistrobina (850881-30-0), (3.6) coumoxistrobina (850881-70-8), (3.7) dimoxistrobina (141600-52-4), (3.8) enestroburin (238410-11-2) (WO 2004/058723), (3.9) famoxadona (131807-57-3) (WO 2004/058723), (3.10) fenamidona (161326-34-7) (WO 2004/058723), (3.11)

fenoxistrobina (918162-02-4), (3.12) fluoxastrobina (361377-29-9) (WO 2004/058723), (3.13) kresoxim-metilo (143390-89-0) (WO 2004/058723), (3.14) metominostrobin (133408-50-1) (WO 2004/058723), (3.15) orisastrobina (189892-69-1) (WO 2004/058723), (3.16) picoxistrobina (117428-22-5) (WO 2004/058723), (3.17) piraclostrobina (175013-18-0) (WO 2004/058723), (3.18) pirametostrobin (915410-70-7) (WO 2004/058723), (3.19) piraxistrobina (862588-11-2) (WO 2004/058723), (3.20) piribencarb (799247-52-2) (WO 2004/058723), (3.21) triclopiricarb (902760-40-1), (3.22) trifloxistrobina (141517-21-7) (WO 2004/058723), (3.23) (2E)-2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida (WO 2004/058723), (3.24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil)etanamida (WO 2004/058723), (3.25) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-{2-[(E)-({1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi}imino)metil]fenil}etanamida (158169-73-4), (3.26) (2E)-2-{2-[[[(1E)-1-(3-[[1-(E)-1-fluoro-2-feniletetil]oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida (326896-28-0), (3.27) (2E)-2-{2-[[[(2E,3E)-4-(2,6-diclorofenil)but-3-en-2-iliden]amino]oxi]metil]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (3.28) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida (119899-14-8), (3.29) 5-metoxi-2-metil-4-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (3.30) (2E)-2-{2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]sulfanil]metil]fenil}-3-metoxiprop-2-enoato de metilo (149601-03-6), (3.31) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxibenzamida (226551-21-9), (3.32) 2-{2-[[2,5-dimetilfenoxi]metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida (173662-97-0) y (3.33) (2R)-2-{2-[[2,5-dimetilfenoxi]metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida (394657-24-0).

(4) Inhibidores de la mitosis y la división celular, por ejemplo (4.1) benomilo (17804-35-2), (4.2) carbendazim (10605-21-7), (4.3) clorfenazol (3574-96-7), (4.4) dietofencarb (87130-20-9), (4.5) etaboxam (162650-77-3), (4.6) fluopicolida (239110-15-7), (4.7) fuberidazol (3878-19-1), (4.8) pencicuron (66063-05-6), (4.9) tiabendazol (148-79-8), (4.10) tiofanato-metilo (23564-05-8), (4.11) tiofanato (23564-06-9), (4.12) zoxamida (156052-68-5), (4.13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (214706-53-3) and (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina (1002756-87-7).

(5) Compuestos capaces de tener una acción multisitio, como por ejemplo (5.1) mezcla bordeaux (8011-63-0), (5.2) captafol (2425-06-1), (5.3) captan (133-06-2) (WO 02/12172), (5.4) clorotalonilo (1897-45-6), (5.5) hidróxido de cobre (20427-59-2), (5.6) naftenato de cobre (1338-02-9), (5.7) óxido de cobre (1317-39-1), (5.8) oxiclورو de cobre (1332-40-7), (5.9) sulfato de cobre(2+) (7758-98-7), (5.10) diclofluanid (1085-98-9), (5.11) ditianon (3347-22-6), (5.12) dodina (2439-10-3), (5.13) dodina base libre, (5.14) ferbam (14484-64-1), (5.15) fluorofolpet (719-96-0), (5.16) folpet (133-07-3), (5.17) guazatina (108173-90-6), (5.18) acetato de guazatina, (5.19) iminoctadina (13516-27-3), (5.20) albesilato de iminoctadina (169202-06-6), (5.21) triacetato de iminoctadina (57520-17-9), (5.22) mancozeb (53988-93-5), (5.23) mancozeb (8018-01-7), (5.24) maneb (12427-38-2), (5.25) metiram (9006-42-2), (5.26) metiram zinc (9006-42-2), (5.27) oxina-cobre (10380-28-6), (5.28) propamidina (104-32-5), (5.29) propineb (12071-83-9), (5.30) azufre y preparaciones de azufre que incluyen

polisulfuro de calcio (7704-34-9), (5.31) tiram (137-26-8), (5.32) tolilfluánida (731-27-1), (5.33) zineb (12122-67-7) y (5.34) ziram (137-30-4).

(6) Compuestos capaces de inducir una respuesta del hospedante, por ejemplo (6.1) acibenzolar-S-metilo (135158-54-2), (6.2) isotianilo (224049-04-1), (6.3) probenazol (27605-76-1) y (6.4) tiadinilo (223580-51-6).

(7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácido y/o proteína, por ejemplo (7.1) andoprim (23951-85-1), (7.2) blasticidina-S (2079-00-7), (7.3) ciprodinilo (121552-61-2), (7.4) kasugamicina (6980-18-3), (7.5) hidrocloreto de kasugamicina hidratado (19408-46-9), (7.6) mepanipirim (110235-47-7), (7.7) pirimetanilo (53112-28-0) y (7.8) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (861647-32-7) (WO2005070917).

(8) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo (8.1) acetato de fentina (900-95-8), (8.2) cloruro de fentina (639-58-7), (8.3) hidróxido de fentina (76-87-9) y (8.4) siltiofam (175217-20-6).

(9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, por ejemplo (9.1) bentiavalicarb (177406-68-7), (9.2) dimetomorf (110488-70-5), (9.3) flumorf (211867-47-9), (9.4) iprovalicarb (140923-17-7), (9.5) mandipropamida (374726-62-2), (9.6) polioxinas (11113-80-7), (9.7) polioxorim (22976-86-9), (9.8) validamicina A (37248-47-8) y (9.9) valifenalato (283159-94-4; 283159-90-0).

(10) Inhibidores de la síntesis de la membrana y lípidos, por ejemplo (10.1) bifenilo (92-52-4), (10.2) cloroneb (2675-77-6), (10.3) dicloran (99-30-9), (10.4) edifenfos (17109-49-8), (10.5) etridiazol (2593-15-9), (10.6) iodocarb (55406-53-6), (10.7) iprobenfos (26087-47-8), (10.8) isoprotiolano (50512-35-1), (10.9) propamocarb (25606-41-1), (10.10) hidrocloreto de propamocarb (25606-41-1), (10.11) protiocarb (19622-08-3), (10.12) pirazofos (13457-18-6), (10.13) quintozeno (82-68-8), (10.14) tecnazeno (117-18-0) y (10.15) tolclofos-metilo (57018-04-9).

(11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo (11.1) carpropamida (104030-54-8), (11.2) diclocimet (139920-32-4), (11.3) fenoxanilo (115852-48-7), (11.4) ftalida (27355-22-2), (11.5) piroquilon (57369-32-1), (11.6) triciclazol (41814-78-2) y (11.7) {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbamato de 2,2,2-trifluoroetilo (851524-22-6) (WO2005042474).

(12) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos, por ejemplo (12.1) benalaxilo (71626-11-4), (12.2) benalaxilo-M (kiralaxilo) (98243-83-5), (12.3) bupirimato (41483-43-6), (12.4) clozilacon (67932-85-8), (12.5) dimetirimol (5221-53-4), (12.6) etirimol (23947-60-6), (12.7) furalaxilo (57646-30-7), (12.8) himexazol (10004-44-1), (12.9) metalaxilo (57837-19-1), (12.10) metalaxilo-M (mefenoxam) (70630-17-0), (12.11) ofurace (58810-48-3), (12.12) oxadixilo (77732-09-3) y (12.13) ácido oxolínico (14698-29-4).

(13) Inhibidores de la señal de transducción, por ejemplo (13.1) clozolinato (84332-86-5), (13.2) fempiclonilo (74738-17-3), (13.3) fludioxonilo (131341-86-1), (13.4) iprodiona (36734-19-7), (13.5) procimidona (32809-16-8), (13.6) quinoxifeno (124495-18-7) y (13.7) vinclozolin (50471-44-8).

5 (14) Compuestos capaces de actuar como un desacoplador, por ejemplo (14.1) binapacril (485-31-4), (14.2) dinocap (131-72-6), (14.3) ferimzone (89269-64-7), (14.4) fluazinam (79622-59-6) y (14.5) meptildinocap (131-72-6).

(15) Compuestos adicionales, por ejemplo (15.1) bentiazol (21564-17-0), (15.2) betoxazina (163269-30-5), (15.3) capsimicina (70694-08-5), (15.4) carvone (99-49-0), (15.5) quinometionato (2439-01-2),
 10 (15.6) piriofenona (clazafenona) (688046-61-9), (15.7) cufraneb (11096-18-7), (15.8) ciflufenamida (180409-60-3), (15.9) cimoxanilo (57966-95-7), (15.10) ciprosulfamida (221667-31-8), (15.11) dazomet (533-74-4), (15.12) debacarb (62732-91-6), (15.13) diclorofen (97-23-4), (15.14) diclomezina (62865-36-5), (15.15) difenzoquat (49866-87-7), (15.16) metilsulfato de difenzoquat (43222-48-6),
 15 (15.17) difenilamina (122-39-4), (15.18) ecomate, (15.19) fenpirazamina (473798-59-3), (15.20) flumetover (154025-04-4), (15.21) fluoroimida (41205-21-4), (15.22) flusulfamida (106917-52-6), (15.23) flutianilo (304900-25-2), (15.24) fosetil-aluminio (39148-24-8), (15.25) fosetil-calcio, (15.26) fosetil-sodio (39148-16-8), (15.27) hexaclorobenceno (118-74-1), (15.28) irumamicina (81604-73-1), (15.29) metasulfocarb (66952-49-6), (15.30) isotiocianato de metilo (556-61-6), (15.31) metrafenona
 20 (220899-03-6), (15.32) mildiomicina (67527-71-3), (15.33) natamicina (7681-93-8), (15.34) dimetilditiocarbamato de níquel (15521-65-0), (15.35) nitrotal-isopropilo (10552-74-6), (15.36) octilions (26530-20-1), (15.37) oxamocarb (917242-12-7), (15.38) oxfentiin (34407-87-9), (15.39) pentaclorofenol y sales (87-86-5), (15.40) fenotrina, (15.41) ácido fosforos y sus sales (13598-36-2), (15.42) propamocarb-fosetilato, (15.43) propanosina-sodio (88498-02-6), (15.44) proquinazida
 25 (189278-12-4), (15.45) pirimorf (868390-90-3), (15.45e) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona (1231776-28-5), (15.45z) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona (1231776-29-6), (15.46) pirrolnitrina (1018-71-9) (EP-A 1 559 320), (15.47) tebufloquin (376645-78-2), (15.48) tecloftalam (76280-91-6), (15.49) tolinafenida (304911-98-6), (15.50) triazóxido (72459-58-6), (15.51) triclāmida (70193-21-4), (15.52) zarilāmida (84527-51-5),
 30 (15.53) 2-metilpropanoato de (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-[(isobutiriloxy)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il)carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo (517875-34-2) (WO2003035617), (15.54) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (1003319-79-6) (WO 2008013622), (15.55) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-
 35 pirazol-1-il]etanona (1003319-80-9) (WO 2008013622), (15.56) 1-(4-{4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (1003318-67-9) (WO 2008013622), (15.57) 1H-imidazol-1-carboxilato de 1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ilo (111227-17-9), (15.58) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina (13108-52-6), (15.59) 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona (221451-58-7), (15.60) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.61) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-

il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (1003316-53-7) (WO 2008013622), (15.62) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona (1003316-54-8) (WO 2008013622), (15.63) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}etanona (1003316-51-5) (WO 2008013622), (15.64) 2-butoxi-6-iodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15.65) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, (15.66) 2-fenilfenol y sales (90-43-7), (15.67) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina (861647-85-0) (WO2005070917), (15.68) 3,4,5-tricloropiridina-2,6-dicarbonitrilo (17824-85-0), (15.69) 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-1,2-oxazolidin-3-il]piridina, (15.70) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.71) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (15.72) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.73) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofen-2-sulfonohidrazida (134-31-6), (15.74) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina (1174376-11-4) (WO2009094442), (15.75) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina (1174376-25-0) (WO2009094442), (15.76) 5-metil-6-octil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, (15.77) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilprop-2-enoato de metilo, (15.78) N'-(4-{[3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il]oxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.79) N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.80) N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.81) N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloropiridin-3-carboxamida, (15.82) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloropiridin-3-carboxamida, (15.83) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-iodopiridin-3-carboxamida, (15.84) N-{(E)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-fenilacetamida (221201-92-9), (15.85) N-{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-fenilacetamida (221201-92-9), (15.86) N'-{4-{[3-terc-butil-4-ciano-1,2-tiazol-5-il]oxi}-2-cloro-5-metilfenil}-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.87) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida (922514-49-6) (WO 2007014290), (15.88) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida (922514-07-6) (WO 2007014290), (15.89) N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida (922514-48-5) (WO 2007014290), (15.90) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metiliden]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de pentilo, (15.91) ácido fenazin-1-carboxílico, (15.92) quinolin-8-ol (134-31-6), (15.93) sulfato de quinolin-8-ol (2:1) (134-31-6) y (15.94) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metiliden]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de terc-butilo.

(16) Compuestos adicionales, por ejemplo (16.1) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.2) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.3) N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.4) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.5) N-(2',5'-difluorobifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (16.6) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida (conocido de WO 2004/058723), (16.7) 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida (conocido de WO

- 2004/058723), (16.8) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida (conocido de WO 2004/058723), (16.9) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (conocido de WO 2004/058723), (16.10) N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (conocido de WO 2004/058723), (16.11) 3-(difluorometil)-
- 5 N-(4'-etinilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (conocido de WO 2004/058723), (16.12) N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (conocido de WO 2004/058723), (16.13) 2-cloro-N-(4'-etinilbifenil-2-il)piridin-3-carboxamida (conocido de WO 2004/058723), (16.14) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida (conocido de WO 2004/058723), (16.15) 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida (conocido de WO
- 10 2004/058723), (16.16) 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (conocido de WO 2004/058723), (16.17) 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida (conocido de WO 2004/058723), (16.18) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (conocido de WO
- 15 2004/058723), (16.19) 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (conocido de WO 2004/058723), (16.20) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida (conocido de WO 2004/058723), (16.21) (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona (conocido de EP-A 1 559 320), (16.22) N-[2-(4-{[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi}-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonil)valinamida (220706-93-4),
- 20 (16.23) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butanoico y (16.24) but-3-in-1-il {6-[[{(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino}oxi)metil]piridin-2-il}carbamato.

Todas la denominadas parejas de mezcla de las clases (1) a (16) pueden, si sus grupos funcionales lo permiten, formar opcionalmente sales con bases o ácidos adecuados.

- 25 Ejemplos de compañeros de mezcla bactericidas, insecticidas, acaricidas o nematocidas adecuados se pueden seleccionar de las listas siguientes:

Bactericidas:

- 30 bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilinona, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomicina, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Insecticidas/Acaricidas/Nematicidas:

(1) Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE), por ejemplo

- 35 carbamatos, por ej. Alanicarb, Aldicarb, Bendiocarb, Benfuracarb, Butocarboxim, Butoxicarboxim, Carbarilo, Carbofuran, Carbosulfan, Etiofencarb, Fenobucarb, Formetanato, Furatiocarb, Isoprocarb, Metiocarb, Metomilo, Metolcarb, Oxamilo, Pirimicarb, Propoxur, Tiodicarb, Tiofanox, Triazamato, Trimetacarb, XMC y Xililcarb; o

organofosfatoss, por ej. Acefato, Azametifos, Azinfos-etilo, Azinfos-metilo, Cadusafos, Cloretoxifos, Clorfenvinfos, Clormefos, Clorpirifos, Clorpirifos-metilo, Coumafos, Cianofos, Demeton-S-metilo, Diazinon, Diclorvos/DDVP, Dicrotofos, Dimetoato, Dimetilovinfos, Disulfoton, EPN, Etion, Etoprofos, Famfur, Fenamifos, Fenitrothion, Fention, Fostiazato, Heptenofos, Imiciafos, Isofenfos, O-
 5 (metoxiaminotio-fosforil)salicilato de isopropilo, Isoxation, Malation, Mecarbam, Metamidofos, Metidation, Mevinfos, Monocrotofos, Naled, Ometoato, oxidemeton-metilo, Paration, Paration-metilo, Fentoato, Forato, Fosalona, Fosmet, Fosfamidon, Foxim, Pirimifos-metilo, Profenofos, Propetamfos, Protiofos, Piraclofos, Piridafention, Quinalfos, Sulfotep, Tebupirimfos, Temefos, Terbufos, Tetraclorvinfos, Tiometon, Triazofos, Triclorfon y Vamidotion.

10 (2) Antagonistas de los canales de cloruro regulados por GABA, por ejemplo

ciclodien organocloros, p. ej. Clordane y Endosulfan; o

fenilpirazoles (fiproles), p. ej. Etiprol y Fipronilo.

(3) Moduladores de los canales del sodio/bloqueadores de los canales del sodio dependientes del voltaje, por ejemplo

15 piretroides, p. ej. Acrinatrin, Aletrin, d-cis-trans Aletrin, d-trans Aletrin, Bifentrin, Bioaletrin, isómero Bioaletrin S-ciclopentenilo, Bioresmetrin, cicloprotrin, Ciflutrin, beta-Ciflutrin, Cihalotrin, lambda-Cihalotrin, gamma-Cihalotrin, Cipermetrin, alfa-Cipermetrin, beta-Cipermetrin, teta-Cipermetrin, zeta-Cipermetrin, Cifenotrin [isómeros (1R)-trans], Deltametrin, Empentrin [isómeros (EZ)-(1R)], Esfenvalerato, Etofenprox, Fenpropatrin, Fenvalerato, Flucitrinato, Flumetrin, tau-Fluvalinato, Halfenprox, Imiprotrin, Kadetrin,
 20 Permetrin, Fenotrin [isómero (1R)-trans), Praletrin, Piretrina (piretrum), Resmetrin, Silafluofen, Teflutrin, Tetrametrin, Tetrametrin [isómeros (1R)], Tralometrin y Transflutrin; o

DDT; o Metoxiclor.

(4) Agonistas del receptor nicotínico de la acetilcolina (nAChR), por ejemplo

neonicotinoides, p. ej. Acetamiprid, Clotianidin, Dinotefuran, Imidacloprid, Nitenpiram, Tiacloprid y
 25 Tiametoxam; o

Nicotina.

(5) Activadores alostéricos del receptor nicotínico de la acetilcolina (nAChR), por ejemplo

espinosinas, p. ej. Spinetoram y Spinosad.

(6) Activadores del canal de cloruro, por ejemplo

30 avermectinas/milbemicinas, p. ej. Abamectina, benzoato de emamectina, Lepimectina y Milbemectina.

(7) Mímicos de la hormona juvenil, por ejemplo

análogos de la hormona juvenil, p. ej. Hidropreno, Kinopreno, y Metopreno; o

Fenoxicarb; o Piriproxifen.

(8) Inhibidores misceláneos no específicos (multi-sitio), por ejemplo

haluros de alquilo, p. ej. bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o

5 cloropicrin; o fluoruro de sulfurilo; o Borax; o tártaro emético.

(9) Bloqueante de alimentación selectivo de homopteran, p. ej. Pimetrozina; o Flonicamida.

(10) Inhibidores del crecimiento de los ácaros, p. ej. Clofentezina, Hexitiazox y Diflovidazin; o

Etoxazol.

10 (11) Destructor microbiano de las membranas del intestino medio del insecto, p. ej. *Bacillus thuringiensis* subespecie israelensis, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie aizawai, *Bacillus thuringiensis* subespecie kurstaki, *Bacillus thuringiensis* subespecie tenebrionis, y proteínas de cultivo BT: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.

(12) Inhibidores de la ATP sintasa mitocondrial, por ejemplo Diafentiuron; o

acaricidas de organoestaño, p. ej. Azociclotina, Cihexatina y óxido de Fenbutatina; o

15 Propargita; o Tetradifon.

(13) desacopladores de la fosforilación vía destrucción del gradiente de protones, por ejemplo Clorfenapir, DNOC y Sulfuramida.

(14) bloqueadores del canal del receptor nicotínico de la acetilcolina (nAChR), por ejemplo Bensultap, hidrocloreto de Cartap, Tiociclam y Tiosultap-sodio.

20 (15) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, por ejemplo Bistrifluron, Clorfluazuron, Diflubenzuron, Flucicloxuron, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Lufenuron, Novaluron, Noviflumuron, Teflubenzuron y Triflumuron.

(16) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, por ejemplo Buprofezin.

(17) alteradores de la muda, por ejemplo Ciromazina.

25 (18) agonistas de los receptores de la ecdisona, por ejemplo Cromafenozida, Halofenozida, Metoxifenozida y Tebufenozida.

(19) Agonistas del receptor de la octopamina, por ejemplo Amitraz.

(20) Inhibidores del transporte electrónico del complejo III mitocondrial, por ejemplo Hydrametilonon; o Acequinocilo; o Fluacripirim.

(21) Inhibidores del transporte electrónico del complejo I mitocondrial, por ejemplo

acaricidas METI, p. ej. Fenazaquina, Fenpiroximato, Pirimidifen, Piridaben, Tebufenpirad y Tolfenpirad;

5 o

Rotenona (Derris).

(22) Bloqueadores de los canales el sodio dependientes del voltaje, p. ej. Indoxacarb; o Metaflumizona.

(23) Inhibidores de la acetil CoA carboxilasa, por ejemplo

derivados de ácidos tetrónicos y tetrámicos, p. ej. Espirodiclofeno, Espiromesifeno y Espirotetramato.

10 (24) Inhibidores del transporte electrónico del complejo IV mitocondrial, por ejemplo

fosfinas, p. ej. fosfuro de Aluminio, fosfuro de Calcio, Fosfina, y fosfuro de Zinc; o

Cianuro.

(25) Inhibidores del transporte electrónico del complejo II mitocondrial, por ejemplo Cienopirafen.

(28) Moduladores del receptor de la rianodina, por ejemplo

15 diamidas, p. ej. Clorantraniliprol y Flubendiamida.

Otros ingredientes activos con modo de acción desconocido o incierto, por ejemplo Amidoflumet, Azadiractina, Benclotiaz, Benzoximato, Bifenazato, Bromopropilato, Quinometionato, Criolita, Ciantraniliprol (Ciazipir), Ciflumetofen, Dicofo, Diflovidazina, Fluensulfona, Flufenerim, Flufiprol, Flupiram, Fufenozida, Imidaclozif, Iprodiona, Meperflutrin, Piridililo, Pirifluquinazon, Tetrametiloflutrin y

20 iodometano; productos adicionales basados en Bacillus firmus (que incluyen pero no se limitan a la cepa CNCM I-1582, tal como, por ejemplo, VOTIVO™, BioNem) o uno de los siguientes compuestos activos conocidos: 3-bromo-N-{2-bromo-4-cloro-6-[(1-ciclopropiletil)carbamoil]fenil}-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de WO2005/077934), 4-[[[(6-bromopiridin-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido de WO2007/115644), 4-[[[(6-fluoropiridin-3-il)metil](2,2-

25 difluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido de WO2007/115644), 4-[[[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido de WO2007/115644), 4-[[[(6-cloropiridin-3-il)metilo](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido de WO2007/115644), Flupiradifurona, 4-[[[(6-clor-5-fluoropiridin-3-il)metil](metil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido de WO2007/115643), 4-[[[(5,6-dicloropiridin-3-il)metil](2-fluoroetil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido de WO2007/115646), 4-[[[(6-cloro-5-

30 fluoropiridin-3-il)metilo](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido de WO2007/115643), 4-[[[(6-cloropiridin-3-il)metil](ciclopropil)amino]furan-2(5H)-ona (conocido de EP-A-0 539 588), 4-[[[(6-cloropiridin-

3-il)metil](metil)amino}furan-2(5H)-ona (conocido de EP-A-0 539 588), {[1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)oxido- λ^4 -sulfaniloiden}cianamida (conocido de WO2007/149134) y sus diaestereoismeros [(1R)-1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)oxido- λ^4 -sulfaniloiden}cianamida (A) y {[(1S)-1-(6-cloropiridin-3-il)etil](metil)oxido- λ^4 -sulfaniloiden}cianamida (B) (también conocido de WO2007/149134) así como

5 Sulfoxaflor y sus diaestereoismeros [(R)-metil(oxido){(1R)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniloiden]cianamida (A1) y [(S)-metil(oxido){(1S)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniloiden]cianamida (A2), referido como grupo de diaestereoismeros A (conocido de WO2010/074747, WO2010/074751), [(R)-metil(oxido){(1S)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -sulfaniloiden]cianamida (B1) y [(S)-metil(oxido){(1R)-1-[6-(trifluorometil)piridin-3-il]etil}- λ^4 -

10 sulfaniloiden]cianamida (B2), referido como grupo de diastereoismeros B (también conocido de WO2010/074747, WO2010/074751), and 11-(4-cloro-2,6-dimetilofenil)-12-hidroxi-1,4-dioxa-9-azadispiro[4.2.4.2]tetradec-11-en-10-ona (conocido de WO2006/089633), 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenil-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocido de WO2008/067911), 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinilo]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocido de WO2006/043635),

15 ciclopropanocarboxilato de (3S,4aR,12R,12aS,12bS)-3-[(ciclopropilcarbonil)oxi]-6,12-dihidroxi-4,12b-dimetil-11-oxo-9-(piridin-3-il)-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-2H,11H-benzo[f]pirano[4,3-b]cromen-4-il]metilo (conocido de WO2008/066153), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N,N-dimetilbencenosulfonamida (conocido de WO2006/056433), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N-metilobencenosulfonamida (conocido de WO2006/100288), 2-ciano-3-(difluorometoxi)-N-

20 etilobencenosulfonamida (conocido de WO2005/035486), 1,1-dióxido de 4-(difluorometoxi)-N-etil-N-metil-1,2-benzotiazol-3-amina (conocido de WO2007/057407), N-[1-(2,3-dimetilfenil)-2-(3,5-dimetilfenil)etil]-4,5-dihidro-1,3-tiazol-2-amina (conocido de WO2008/104503), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluorospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il]}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocido de WO2003/106457), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocido de WO2009/049851),

25 carbonato de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il etilo (conocido de WO2009/049851), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilopiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocido de WO2004/099160), (2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)(3,3,3-trifluoropropil)malononitrilo (conocido de WO2005/063094), (2,2,3,3,4,4,5,5-octafluoropentil)(3,3,4,4,4-pentafluorobutil)malononitrilo (conocido de WO2005/063094), 8-[2-(ciclopropilmetoxi)-4-(trifluorometilo)fenoxi]-3-[6-(trifluorometil)piridazin-3-il]-3-

30 azabicyclo[3.2.1]octano (conocido de WO2007/040280), Flometoquin, PF1364 (CAS-Reg.No. 1204776-60-2) (conocido de JP2010/018586), 5-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (conocido de WO2007/075459), 5-[5-(2-cloropiridin-4-il)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (conocido de WO2007/075459), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-{2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroetil)amino]etil}benzamida (conocido de WO2005/085216), 4-{[(6-cloropiridin-3-il)metil](ciclopropil)amino}-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-{[(6-cloropiridin-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino}-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-{[(6-cloropiridin-3-il)metil](etil)amino}-1,3-oxazol-2(5H)-ona, 4-{[(6-cloropiridin-3-il)metil](metil)amino}-1,3-oxazol-2(5H)-ona (todo conocido de WO2010/005692), NNI-0711 (conocido de WO2002/096882), 1-acetil-N-[4-(1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-metoxipropan-2-il)-3-isobutilfenil]-N-isobutil-

40 3,5-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (conocido de WO2002/096882), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-

2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-cloro-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido de WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-etilhidrazincarboxilato de metilo (conocido de WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-metilhidrazinacarboxilato de metilo (conocido de WO2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)benzoil]-1,2-dietilhidrazincarboxilato de metilo (conocido de WO2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)benzoil]-2-etilhidrazincarboxilato de metilo (conocido de WO2005/085216), (5RS,7RS;5RS,7SR)-1-(6-cloro-3-piridilmetil)-1,2,3,5,6,7-hexahidro-7-metil-8-nitro-5-propoxiimidazo[1,2-a]piridina (conocido de WO2007/101369), 2-[6-[2-(5-fluoropiridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-il]pirimidina (conocido de WO2010/006713), 2-[6-[2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-il]pirimidina (conocido de WO2010/006713), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-ciano-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-[[5-(trifluorometil)-1H-tetrazol-1-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de WO2010/069502), 1-(3-cloropiridin-2-il)-N-[4-ciano-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-3-[[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de WO2010/069502), N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-ciano-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-[[5-(trifluorometil)-1H-tetrazol-1-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de WO2010/069502), N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-ciano-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-[[5-(trifluorometil)-2H-tetrazol-2-il]metil]-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de WO2010/069502), (1E)-N-[(6-cloropiridin-3-il)metilo]-N'-ciano-N-(2,2-difluoroetil)etanimidamida (conocido de WO2008/009360), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de CN102057925) y 2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)benzoil]-2-etil-1-metilhidrazincarboxilato de metilo (conocido de WO2011/049233).

También es posible una mezcla con otros compuestos activos conocidos tales como herbicidas, o con fertilizantes y reguladores del crecimiento, aseguradores o Semioquímicos.

Además, los compuestos de la fórmula (I) según la invención tienen también muy buena actividad antimicótica. Tienen un espectro de acción antimicótica muy amplio, en particular frente a dermatofitos y hongos que se reproducen por gemación, moho y hongos difásicos (por ejemplo frente a especies de *Candida* tales como *Candida albicans*, *Candida glabrata*) y *Epidermophyton floccosum*, especies de *Aspergillus* tales como *Aspergillus niger* y *Aspergillus fumigatus*, especies de *Trichophyton* tales como *Trichophyton mentagrophytes*, especies de *Microsporon* tales como *Microsporon canis* y *audouinii*. La enumeración de estos hongos no es una restricción de cualquiera que sea el espectro micótico contra el que se puede luchar y se proporciona solo con fines ilustrativos.

Los compuestos de fórmula (I) y la composición fungicida de acuerdo con la invención se pueden usar para combatir de forma terapéutica o preventiva los hongos fitopatógenos de las plantas o de los cultivos.

Por lo tanto, según otro aspecto de la invención, se proporciona un método para combatir, de forma terapéutica o preventiva, los hongos fitopatógenos de plantas o cultivos caracterizado por que se

aplica un compuesto de fórmula (I) o una composición fungicida de acuerdo con la invención a la semilla, a la planta, al fruto de la planta o al suelo en el que crece o en el que se desea que crezca la planta.

El método de tratamiento de acuerdo con la invención puede servir también para tratar material de propagación tal como tubérculos o rizomas, pero también semillas, plántulas o siembras de plántulas y plantas o siembras de plantas. Este método de tratamiento también puede ser útil para tratar raíces. El método de tratamiento de acuerdo con la invención también puede ser útil para tratar las partes aéreas de la planta tales como troncos, tallos o vástagos, hojas, flores y fruto de la planta en cuestión.

Según la invención se pueden tratar todas las plantas y las partes de las plantas. Por plantas se entiende todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas salvajes deseadas o no deseadas, plantas cultivadas y variedades de plantas (se puedan o no proteger por los derechos de variedades de plantas o del cultivador de plantas). Las plantas cultivadas y las variedades de plantas pueden ser plantas obtenidas por propagación convencional y métodos de cultivo que pueden ayudarse o estar complementados por uno o más métodos biotecnológicos, tales como el uso de haploides dobles, fusión de protoplastos, mutagénesis aleatoria y dirigida, marcadores moleculares o genéticos o por métodos de bioingeniería e ingeniería genética. Por partes de las plantas se entiende todas las partes y órganos de las plantas por encima del suelo y por debajo del suelo, tales como brotes, hojas, flores y raíces, de modo que también están listados por ejemplo, las hojas, agujas, tallos, ramas, flores, esporóforos, frutos y semillas, así como raíces, bulbos y rizomas. Los cultivos y el material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, esquejes, bulbos, rizomas, trepadoras y semillas, también pertenecen a las partes de las plantas.

Entre las plantas que se pueden proteger por el método según la invención, se pueden mencionar los cultivos extensivos principales como el maíz, soja, algodón, semillas oleaginosas de *Brassica* tal como *Brassica napus* (p. ej. canola), *Brassica rapa*, *B. juncea* (p. ej. mostaza) y *Brassica carinata*, arroz, trigo, remolacha azucarera, caña de azúcar, avena, centeno, cebada, mijo, triticale, lino, vid y diferentes frutas y verduras de diferentes taxones botánicos tales como *Rosaceae* sp. (por ejemplo frutas de pepitas tales como manzanas y peras, pero también frutas con hueso tales como albaricoques, cerezas, almendras y melocotones, bayas tales como fresas), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (por ejemplo bananeros y plantaciones de bananas), *Rubiaceae* sp. (por ejemplo café), *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (por ejemplo limones, naranjas y pomelos); *Solanaceae* sp. (por ejemplo tomates, patatas, pimientos, berenjenas), *Liliaceae* sp., *Compositae* sp. (por ejemplo lechuga, alcachofa y achicoria - incluyendo escarola, endivia o achicoria común), *Umbelliferae* sp. (por ejemplo zanahoria, perejil, apio y bulbo de apio), *Cucurbitaceae* sp. (por ejemplo pepino – incluyendo pepinillo, chayote, sandía, calabazas y melones), *Alliaceae* sp. (por ejemplo cebollas y puerros), *Cruciferae* sp. (por ejemplo, repollo, lombarda, brócoli, coliflor, coles de bruselas, pak choi, colirrábano, rábano, rábano picante, berro, col china), *Leguminosae* sp. (por ejemplo cacahuètes, guisantes y judías - tales como judías trepadoras y habas), *Chenopodiaceae* sp. (por ejemplo acelga, espinaca remolacha, espinaca, remolacha), *Malvaceae* (por ejemplo quimbombo), *Asparagaceae* (por ejemplo espárrago); cultivos

hortícolas y arbóreos; plantas ornamentales; así como los homólogos genéticamente modificados de estos cultivos.

El método de tratamiento de acuerdo con la invención puede utilizarse en el tratamiento de organismos modificados genéticamente (GMO), por ejemplo, plantas o semillas. Las plantas modificadas genéticamente (o plantas transgénicas) son plantas en las que se ha integrado de manera estable un gen heterólogo en el genoma. La expresión “gen heterólogo” significa esencialmente un gen que se proporciona o construye fuera de la planta y que cuando se introduce en el genoma nuclear, cloroplástico o mitocondrial proporciona a la planta transformada nuevas o mejoradas propiedades agronómicas u otras propiedades mediante la expresión de una proteína o polipéptido de interés o disminuyendo o silenciando otro u otros genes que están presentes en la planta (usando, por ejemplo, tecnología antisentido, tecnología de cosupresión o interferencia de ARN – tecnología ARNi). Un gen heterólogo que está localizado en el genoma también se denomina un transgén. Un transgén que está definido por su particular localización en el genoma de la planta se denomina un evento de transformación o transgénico.

Dependiendo de la especie de planta o de la variedad de la planta cultivada, su localización y sus condiciones de crecimiento (suelos, clima, periodo de vegetación, dieta), el tratamiento de acuerdo con la invención también puede producir efectos superaditivos (“sinérgicos”). Así, por ejemplo, son posibles relaciones de aplicación reducidas y/o una ampliación del espectro de actividad y/o un incremento de la actividad de los compuestos y composiciones activos que pueden utilizarse de acuerdo con la invención, mejor crecimiento de la planta, tolerancia incrementada a temperaturas altas o bajas, tolerancia incrementada a la sequía o al agua o al contenido en sal del suelo, incremento en el rendimiento de la floración, recolección más fácil, maduración acelerada, rendimientos de cosecha mayores, , frutos más grandes, mayor altura de la planta, color de la hoja más verde, floración temprana, mayor calidad y/o valor nutricional más alto de los productos cosechados, mayor concentración de azúcar en los frutos, mejor estabilidad en el almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados, lo que supera los efectos que eran de esperar.

Con determinadas relaciones de aplicación, las combinaciones del compuesto activo de acuerdo con la invención también pueden tener un efecto reforzador en las plantas. Por consiguiente, también pueden ser adecuadas para movilizar el sistema de defensas de la planta frente al ataque de microorganismos indeseados. Esta puede ser, si resulta apropiado, una de las razones de la actividad incrementada de las combinaciones de acuerdo con la invención, por ejemplo, frente a hongos. Las sustancias fortificantes de plantas (que inducen resistencia) se entiende que, en el presente contexto, son aquellas sustancias o combinaciones de sustancias que son capaces de estimular el sistema de defensas de dichas plantas de forma que cuando posteriormente se inoculan microorganismos no deseados, las plantas tratadas presentan un grado de resistencia sustancial a esos microorganismos. En el presente caso, los microorganismos no deseados se entiende que son hongos fitopatógenos, bacterias y virus. Así, las sustancias de acuerdo con la invención pueden emplearse para proteger a las plantas frente al ataque de los patógenos mencionados anteriormente en un periodo de tiempo determinado después del tratamiento. El periodo de tiempo en el que se produce la protección se extiende generalmente de 1 a 10 días, preferiblemente de 1 a 7 días, después del tratamiento de las plantas con los compuestos activos.

Las plantas y las variedades de plantas cultivadas que se tratan preferiblemente de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que tienen material genético que proporciona características útiles particularmente ventajosas a estas plantas (ya sean obtenidas por reproducción y/o por medios biotecnológicos).

- 5 Las plantas y las variedades de plantas cultivadas que preferiblemente también se tratan de acuerdo con la invención son resistentes frente a uno o más estreses bióticos, es decir, dichas plantas muestran una mejor defensa frente a plagas animales y microbianas, tales como frente a nematodos, insectos, ácaros, hongos, bacterias virus y/o viroides fitopatógenos.

Ejemplos de plantas resistentes a nematodos se describen en las solicitudes de patente Nos
 10 11/765.491, 11/765.494, 10/926.819, 10/782.020, 12/032.479, 10/783.417, 10/782.096, 11/657.964, 12/192.904, 11/396.808, 12/166.253, 12/166.239, 12/166.124, 12/166.209, 11/762.886, 12/364.335, 11/763.947, 12/252.453, 12/209.354, 12/491.396 o 12/497.221.

Las plantas y las variedades de plantas cultivadas que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son aquellas plantas que son resistentes a uno o más estreses abióticos. Las condiciones
 15 de estrés abiótico pueden incluir, por ejemplo, sequía, exposición a bajas temperaturas, exposición al calor, estrés osmótico, inundación, salinidad del suelo incrementada, exposición a minerales incrementada, exposición a ozono, exposición a mucha luz, disponibilidad limitada de nutrientes nitrogenados, disponibilidad limitada de nutrientes de fósforo, falta de sombra.

Las plantas y las variedades de plantas cultivadas que también pueden tratarse de acuerdo con la
 20 invención, son aquellas plantas caracterizadas por unas características de rendimiento incrementadas. El rendimiento incrementado en dichas plantas puede ser el resultado, por ejemplo, de una mejora de la fisiología de la planta, crecimiento y desarrollo, tal como eficacia en el uso del agua, eficacia en la retención del agua, utilización mejorada del nitrógeno, asimilación incrementada del carbono, fotosíntesis mejorada, eficacia incrementada de la germinación y maduración acelerada. El
 25 rendimiento puede verse afectado además por una arquitectura mejorada de la planta (en condiciones de estrés y sin estrés), incluyendo, pero sin limitarse a floración temprana, control de la floración para la producción de semillas híbridas, vigor de la siembra, tamaño de la planta, número y distancia de los entrenudos, crecimiento de la raíz, tamaño de la semilla, tamaño del fruto, tamaño de la vaina, número de vainas o espigas, número de semillas por vaina o espiga, masa de semillas,
 30 relleno incrementado de las semillas, dispersión reducida de las semillas, dehiscencia reducida de la vaina y resistencia a la caída. Las características de rendimiento adicionales incluyen composición de las semillas, tales como contenido en carbohidratos, contenido en proteínas, contenido en aceite y composición del aceite, valor nutricional, reducción de compuestos anti-nutricionales, procesabilidad mejorada y mejor estabilidad en el almacenamiento.

35 Ejemplos de plantas con las características anteriormente mencionadas se listan de forma no exhaustiva en la Tabla A.

Las plantas que pueden tratarse según la invención son plantas híbridas que ya expresan la característica de heterosis o vigor híbrido que generalmente da como resultado un mayor rendimiento,
 40 vigor, salud y resistencia frente al estrés biótico y abiótico. Dichas plantas se obtienen típicamente

cruzando una línea parental macho estéril endogámica (la hembra parental) con otra línea parental macho fértil endogámica (el macho parental). La semilla híbrida se cosecha típicamente a partir de las plantas macho estériles y se vende a los cultivadores. Las plantas macho estériles pueden producirse a veces (por ejemplo, en el maíz) por castración, es decir, por la eliminación mecánica de los órganos reproductores masculinos (o flores macho) pero, típicamente, la esterilidad de los machos es el resultado de determinantes genéticos en el genoma de la planta. En este caso, y especialmente cuando la semilla es el producto deseado para cosecharse de las plantas híbridas es típicamente útil asegurarse de que se ha restaurado completamente la fertilidad de los machos en las plantas híbridas. Esto puede conseguirse asegurando que los machos parentales tienen los genes de restauración de la fertilidad apropiados que son capaces de restaurar la fertilidad de los machos en las plantas híbridas que contienen los determinantes genéticos responsables de la esterilidad de los machos. Los determinantes genéticos para la esterilidad de los machos pueden estar localizados en el citoplasma. Los ejemplos de esterilidad citoplásmica de los machos (CMS) se describieron, por ejemplo, en especies de Brassica (documentos WO 92/05251, WO 95/09910, WO 98/27806, WO 05/002324, WO 06/021972 y US 6.229.072). Sin embargo, los determinantes genéticos para la esterilidad de los machos también pueden estar localizados en el genoma nuclear. Las plantas macho estériles también pueden obtenerse mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética. Un medio particularmente útil para obtener plantas macho estériles se describe en el documento WO 89/10396 en el que, por ejemplo, una ribonucleasa tal como barnasa se expresa selectivamente en las células del tapetum en los estambres. La fertilidad puede restaurarse entonces mediante la expresión en las células del tapetum de un inhibidor de ribonucleasa tal como barstar (por ejemplo, WO 91/02069).

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (obtenidas mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas tolerantes a los herbicidas, es decir, plantas que se han hecho tolerantes a uno o más herbicidas dados. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dicha tolerancia a herbicidas.

Las plantas resistentes a herbicidas son, por ejemplo, plantas tolerantes a glifosato, es decir, plantas que se han hecho tolerantes al herbicida glifosato o a las sales del mismo. Las plantas pueden hacerse tolerantes a glifosato mediante diferentes medios. Por ejemplo, las plantas tolerantes a glifosato pueden obtenerse mediante la transformación de la planta con un gen que codifica la enzima 5-enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintasa (EPSPS). Los ejemplos de dichos genes de EPSPS son el gen AroA (mutante CT7) de la bacteria *Salmonella typhimurium* (Comai et al., Science 1983, 221, 370-371), el gen CP4 de la bacteria *Agrobacterium* sp. (Barry et al., Curr. Topics Plant Physiol. 1992, 7, 139-145), los genes que codifican una EPSPS de petunia (Shah et al., Science 1986, 233, 478-481), una EPSPS de tomate (Gasser et al., J. Biol. Chem. 1988, 263, 4280-4289), o una EPSPS de eleusina (documento WO 2001/66704). También puede ser un EPSPS mutado como se describe en por ejemplo EP 0837944, WO 00/66746, WO 00/66747 o WO02/26995. Las plantas tolerantes a glifosato también pueden obtenerse mediante la expresión de un gen que codifica una enzima

glifosato óxido-reductasa como se describe en las patentes de EE.UU. 5.776.760 y 5.463.175. Las plantas tolerantes a glifosato también pueden obtenerse mediante la expresión de un gen que codifica una enzima glifosato acetil transferasa como se describe, por ejemplo, en los documentos WO 02/36782, WO 03/092360, WO 05/012515 y WO 07/024782. Las plantas tolerantes a glifosato

5 también pueden obtenerse mediante la selección de plantas que contienen mutaciones naturales de los genes mencionados anteriormente, como se describe, por ejemplo, en los documentos WO 01/024615 o WO 03/013226. Las plantas que expresan genes EPSPS que confieren tolerancia al glifosato se describen por ejemplo en las solicitudes de patente de EE.UU. n° 11/517.991, 10/739.610, 12/139.408, 12/352.532, 11/312.866, 11/315.678, 12/421.292, 11/400.598, 11/651.752, 11/681.285,

10 11/605.824, 12/468.205, 11/760.570, 11/762.526, 11/769.327, 11/769.255, 11/943801 o 12/362.774. Las plantas que comprenden otros genes que confieren tolerancia al glifosato, tales como genes descarboxilasa se describen por ejemplo en las solicitudes de patente de EE.UU. 11/588.811, 11/185.342, 12/364.724, 11/185.560 o 12/423.926.

15 Otras plantas resistentes a herbicidas son, por ejemplo, las plantas que se hacen tolerantes a herbicidas mediante la inhibición de la enzima glutamina sintasa, tal como bialafos, fosfinotricina o glufosinato. Tales plantas se pueden obtener mediante expresión de una enzima que destoxifica el herbicida o una enzima glutamina sintasa mutante que es resistente a la inhibición, descrita por

20 ejemplo en la solicitud de patente de EE.UU. n° 11/760.602. Una de dichas enzimas destoxificantes eficaces es una enzima que codifica una fosfinotricin acetiltransferasa (tal como la proteína bar o pat de especies de *Streptomyces*). Se describen plantas que expresan un fosfinotricin acetiltransferasa, por ejemplo, en las patentes de EE.UU. n° 5.561.236; 5.648.477; 5.646.024; 5.273.894; 5.637.489; 5.276.268; 5.739.082; 5.908.810 y 7.112.665.

Las plantas tolerantes a herbicidas adicionales también son plantas que se hacen tolerantes a los

25 herbicidas mediante la inhibición de la enzima hidroxifenilpiruvatodioxigenasa (HPPD). Las hidroxifenilpiruvatodioxigenasas son enzimas que catalizan la reacción en la que la para-hidroxifenilpiruvato (HPP) se transforma en homogentisato. Las plantas tolerantes a los inhibidores HPPD se pueden transformar con un gen que codifica una enzima HPPD que se produce de forma natural, o un gen que codifica una enzima HPPD mutada o quimérica como se describe en

30 WO 96/38567, WO 99/24585, WO 99/24586, WO 2009/144079, WO 2002/046387 o US 6.768.044. La tolerancia a inhibidores de HPPD también puede obtenerse mediante la transformación de plantas con genes que codifican determinadas enzimas que permiten la formación de homogentisato a pesar de la inhibición de la enzima HPPD nativa por el inhibidor de HPPD. Dichas plantas y genes se describen en los documentos WO 99/34008 y WO 02/36787. La tolerancia de las plantas a los

35 inhibidores de HPPD también se puede mejorar transformando las plantas con un gen que codifica una enzima que tiene actividad pefenato deshidrogenasa (PDH) además de un gen que codifica una enzima tolerante a HPPD, como se describe en el documento de patente WO 2004/024928. Además, las plantas se pueden hacer más tolerantes a herbicidas inhibidores de HPPD mediante adición a su genoma de un gen que codifica una enzima capaz de metabolizar o degradar inhibidores de HPPD,

tales como las enzimas CYP450 mostradas en el documento de patente WO 2007/103567 y WO 2008/150473.

Aún más, las plantas tolerantes a herbicidas son plantas que se hacen tolerantes a inhibidores de la acetolactato sintasa (ALS). Los inhibidores de ALS conocidos incluyen, por ejemplo, los herbicidas de tipo sulfonilurea, imidazolinona, triazolopirimidinas, pirimidiniloxi(tio)benzoatos, y/o sulfonilaminocarboniltriaolinona. Se sabe que diferentes mutaciones en la enzima ALS (también conocida como acetohidroxiácido sintasa, AHAS) confieren tolerancia a diferentes herbicidas y grupos de herbicidas, como describen, por ejemplo, Tranel y Wright (2002, Weed Science 50:700-712), pero también en las patentes de EE.UU. n° 5.605.011, 5.378.824, 5.141.870 y 5.013.659. La producción de plantas tolerantes a la sulfonilurea y de plantas tolerantes a la imidazolinona se describe en las patentes de EE.UU. n° 5.605.011; 5.013.659; 5.141.870; 5.767.361; 5.731.180; 5.304.732; 4.761.373; 5.331.107; 5.928.937; y 5.378.824; y en la publicación internacional WO 96/33270. Se describen también otras plantas tolerantes a la imidazolinona, por ejemplo, en los documentos WO 2004/040012, WO 2004/106529, WO 2005/020673, WO 2005/093093, WO 2006/007373, WO 2006/015376, WO 2006/024351 y WO 2006/060634. También se describen otras plantas tolerantes a sulfonilurea- e imidazolinona en, por ejemplo, WO 07/024782 y la Solicitud de Patente de EE. UU. No 61/288958.

Otras plantas tolerantes a imidazolinona y/o sulfonilurea pueden obtenerse mediante mutagénesis inducida, selección en cultivos celulares en presencia del herbicida o cultivo de mutación como se describe, por ejemplo para sojas en la patente de EE.UU. 5.084.082, para arroz en WO 97/41218, para remolacha azucarera en la patente de EE.UU. 5.773.702 y WO 99/057965, para lechuga en la patente de EE.UU. 5.198.599, o para girasol en WO 01/065922.

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (obtenidas mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas transgénicas resistentes a insectos, es decir, plantas que se han hecho resistentes al ataque de determinados insectos diana. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dicha resistencia a insectos.

Una “planta transgénica resistente a insectos”, tal y como se utiliza en la presente memoria, incluye cualquier planta que contenga al menos un transgén que comprende una secuencia codificante que codifica:

- 1) una proteína cristalina insecticida de *Bacillus turingiensis* o una parte insecticida de la misma, tal como las proteínas cristalinas insecticidas listadas por Crickmore et al. (1998, *Microbiology y Molecular Biology Reviews*, 62: 807-813), actualizado por Crickmore et al. (2005) en la nomenclatura de toxinas *Bacillus turingiensis*, en internet en: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/), o sus partes insecticidas, por ejemplo, proteínas de las clases de proteínas Cry, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1B, Cry1C, Cry1D, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Aa, o Cry3Bb o sus partes insecticidas (por ejemplo documentos de

patente EP 1999141 y WO 2007/107302), o tales proteínas codificadas por genes sintéticos como por ejemplo las descritas en la solicitud de patente de EE.UU. nº 12/249.016; o

2) una proteína cristalina de *Bacillus thuringiensis* o una parte de la misma que es insecticida en presencia de una segunda proteína cristalina de *Bacillus thuringiensis* o una parte de la misma, tal como la toxina binaria constituida por las proteínas cristalinas Cry34 y Cry35 (Moellenbeck et al., 2001, Nat. Biotechnol. 19: 668-72; Schnepf et al. 2006, Applied Environ. Microbiol. 71, 1765-1774) o la toxina binaria constituida por las proteínas Cry1A o Cry1F y las proteínas Cry2Aa o Cry2Ab o Cry2Ae (solicitud de patente de EE.UU. nº 12/214.022 y EP 08010791.5); o

3) una proteína híbrida insecticida que comprende partes de diferentes proteínas cristalinas insecticidas de *Bacillus thuringiensis*, tal como un híbrido de las proteínas de 1) anterior o un híbrido de las proteínas de 2) anterior, por ejemplo, la proteína Cry1A.105, producida por el maíz transgénico MON98034 (documento WO 2007/027777); o

4) una proteína de uno cualquiera de 1) a 3) anteriores en la que algunos aminoácidos, particularmente de 1 a 10, se han sustituido por otro aminoácido para obtener una mayor actividad insecticida frente a especies de insecto diana, y/o para expandir la gama de especies de insectos diana afectadas, y/o debido a los cambios introducidos en el ADN codificante durante la clonación o transformación, tal como la proteína Cry3Bb1 en los maíces transgénicos MON863 o MON88017, o la proteína Cry3A en el maíz transgénico MIR604; o

5) una proteína insecticida secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, o una parte de ésta insecticida, tal como las proteínas vegetativas insecticidas (VIP) listadas en: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, por ejemplo, proteínas de la clase de proteínas VIP3Aa; o

6) una proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus* que es insecticida en presencia de una segunda proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *B. cereus*, tal como la toxina binaria constituida por las proteínas VIP1A y VIP2A (WO 94/21795); o

7) una proteína insecticida híbrida que comprende partes de diferentes proteínas secretadas de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, tal como un híbrido de las proteínas de 1) anterior o un híbrido de las proteínas de 2) anterior; o

8) una proteína de uno cualquiera de 5) a 7) anteriores en la que algunos aminoácidos, particularmente de 1 a 10, se han sustituido por otros aminoácidos para obtener una mayor actividad insecticida frente a especies de insecto diana, y/o para expandir la variedad de especies de insectos diana afectadas, y/o debido a los cambios introducidos en el ADN codificante durante la clonación o transformación (aunque todavía codifica una proteína insecticida), tal como la proteína VIP3Aa en el algodón transgénico COT102; o

9) una proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus* que es insecticida en presencia de una proteína cristalina de *Bacillus thuringiensis*, tal como la toxina binaria constituida por VIP3 y Cry1A o Cry1F (solicitud de patente de EE.UU. nº 61/126083 y 61/195019), o la toxina binaria constituida por la proteína VIP3 y las proteínas Cry2Aa o Cry2Ab o Cry2Ae (solicitud de patente de EE.UU. nº 12/214.022 y EP 08010791.5).

10) una proteína de 9) anterior en la que algunos aminoácidos, en particular de 1 a 10, se han sustituido por otros aminoácidos para obtener una mayor actividad insecticida frente a una especie de insecto diana, y/o para expandir la gama de especies de insecto diana afectadas, y/o debido a los cambios introducidos en el ADN codificante durante la clonación o transformación (aunque todavía codifica una proteína insecticida)

Por supuesto, una planta transgénica resistente a insectos, tal y como se utiliza en la presente memoria, también incluye cualquier planta que comprende una combinación de los genes que codifican las proteínas de una cualquiera de las clases anteriores 1 a 10. En una realización, una planta resistente a insectos contiene más de un transgén que codifica una proteína de una cualquiera de las clases anteriores 1 a 10, para expandir la variedad de especies de insectos diana afectadas cuando se utilizan diferentes proteínas dirigidas a diferentes especies de insectos diana, o para retrasar el desarrollo de la resistencia a insectos en las plantas usando diferentes proteínas insecticidas para las mismas especies de insectos diana pero que tienen un modo de acción diferente, tal como la unión a diferentes sitios de unión del receptor en el insecto.

Una “planta transgénica resistente a insectos”, como se usa en la presente memoria, incluye además cualquier planta que contiene al menos un transgén que comprende una secuencia que tras expresión produce un ARN bicatenario que tras ingestión por una plaga de insectos de plantas, inhibe el crecimiento de esta plaga de insectos, como se describe p. ej. en los documentos de patente WO 2007/080126, WO 2006/129204, WO 2007/074405, WO 2007/080127 y WO 2007/035650.

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (obtenidas mediante métodos de biotecnología de plantas tal como ingeniería genética) que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son tolerantes a estreses abióticos. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dicha resistencia al estrés. Las plantas tolerantes al estrés particularmente útiles incluyen:

1) plantas que contienen un transgén capaz de reducir la expresión y/o la actividad del gen de la poli(ADP-ribosa)polimerasa (PARP) en las células de la planta o en las plantas como se describe en los documentos WO 00/04173, WO/2006/045633, EP 04077984.5 o EP 06009836.5.

2) plantas que contienen un transgén que potencia la tolerancia al estrés, capaz de reducir la expresión y/o la actividad de los genes que codifican PARP de las plantas o de las células de las plantas, como se describe, por ejemplo, en el documento WO 2004/090140.

3) plantas que contienen un transgén que potencia la tolerancia al estrés que codifica una enzima funcional de la planta de la ruta de síntesis natural del dinucleótido de nicotinamida y adenina, incluyendo nicotinamidasa, nicotinato fosforribosiltransferasa, ácido nicotínico-mononucleótido de adenil transferasa, dinucleótido de nicotinamida y adenina sintetasa o nicotinamida fosforribosiltransferasa, como se describe p. ej., en los documentos EP 04077624.7, WO 2006/133827, PCT/EP07/002433, EP 1999263 o WO 2007/107326.

Las plantas o variedades de plantas cultivadas (obtenidas mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse de acuerdo con la invención, muestran una cantidad, calidad y/o estabilidad en el almacenamiento alteradas del producto cosechado y/o propiedades alteradas de los ingredientes específicos del producto cosechado tales como:

1) plantas transgénicas que sintetizan un almidón modificado, que presenta cambios en sus características fisicoquímicas, en particular en el contenido en amilosa o en la relación amilosa/amilopectina, el grado de ramificación, la longitud media de la cadena, la distribución de la cadena lateral, el comportamiento viscoso, la fuerza de gelificación, el tamaño del grano del almidón y/o la morfología del grano del almidón, en comparación con el almidón sintetizado en células de plantas o plantas de tipo salvaje, de manera que es más adecuado para aplicaciones especiales. Dichas plantas transgénicas que sintetizan un almidón modificado se describen, por ejemplo, en los documentos EP 0571427, WO 95/04826, EP 0719338, WO 96/15248, WO 96/19581, WO 96/27674, WO 97/11188, WO 97/26362, WO 97/32985, WO 97/42328, WO 97/44472, WO 97/45545, WO 98/27212, WO 98/40503, WO99/58688, WO 99/58690, WO 99/58654, WO 00/08184, WO 00/08185, WO 00/08175, WO 00/28052, WO 00/77229, WO 01/12782, WO 01/12826, WO 02/101059, WO 03/071860, WO 2004/056999, WO 2005/030942, WO 2005/030941, WO 2005/095632, WO 2005/095617, WO 2005/095619, WO 2005/095618, WO 2005/123927, WO 2006/018319, WO 2006/103107, WO 2006/108702, WO 2007/009823, WO 00/22140, WO 2006/063862, WO 2006/072603, WO 02/034923, EP 06090134.5, EP 06090228.5, EP 06090227.7, EP 07090007.1, EP 07090009.7, WO 01/14569, WO 02/79410, WO 03/33540, WO 2004/078983, WO 01/19975, WO 95/26407, WO 96/34968, WO 98/20145, WO 99/12950, WO 99/66050, WO 99/53072, US 6,734,341, WO 00/11192, WO 98/22604, WO 98/32326, WO 01/98509, WO 01/98509, WO 2005/002359, US 5.824.790, US 6.013.861, WO 94/04693, WO 94/09144, WO 94/11520, WO 95/35026, WO 97/20936

2) plantas transgénicas que sintetizan polímeros de carbohidratos distintos del almidón o que sintetizan polímeros de carbohidratos distintos del almidón con propiedades alteradas en comparación con plantas de tipo salvaje sin modificación genética. Los ejemplos son plantas que producen polifruktosa, en especial del tipo inulina y levano, como se describe en los documentos EP 0663956, WO 96/01904, WO 96/21023, WO 98/39460 y WO 99/24593, plantas que producen alfa-1,4-glucanos como se describe en los documentos WO 95/31553, US 2002031826, US 6.284.479, US 5.712.107, WO 97/47806, WO 97/47807, WO 97/47808 y WO 00/14249, plantas que producen alfa-1,4-glucanos alfa-1,6 ramificados, como se describe en el documento WO 00/73422, plantas que producen alternano, como se describe en los documentos p. ej. WO 00/47727, WO 00/73422, EP 06077301.7, US 5.908.975 y EP 0728213,

3) plantas transgénicas que producen hialuronano, como se describe, por ejemplo, en los documentos WO 2006/032538, WO 2007/039314, WO 2007/039315, WO 2007/039316, JP 2006304779 y WO 2005/012529.

4) plantas transgénicas o plantas híbridas, tales como cebollas con características tales como "alto contenido en sólidos solubles", "baja amargura" (LP) y/o "conservación larga" (LS), como se describe en la solicitud de patente de EE.UU. n° 12/020.360 y 61/054.026.

5 Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (que pueden obtenerse mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas, tales como plantas de algodón, con características alteradas de la fibra. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dichas características alteradas de la fibra e incluyen:

- 10 a) Plantas, tales como plantas de algodón, que contienen una forma alterada de los genes de la celulosa sintasa como se describe en el documento WO 98/00549
- b) Plantas, tales como plantas de algodón, que contienen una forma alterada de los ácidos nucleicos homólogos de rsw2 o rsw3 como se describe en el documento WO 2004/053219
- 15 c) Plantas, tales como plantas de algodón, que tienen una expresión incrementada de la sacarosa fosfato sintasa como se describe en el documento WO 01/17333
- d) Plantas, tales como plantas de algodón, que tienen una expresión incrementada de la sacarosa sintasa como se describe en el documento WO 02/45485
- e) Plantas, tales como plantas de algodón, en las que está alterado el tiempo apertura de
20 los plasmodesmos en la base de las células de fibras, p. ej., mediante la regulación negativa de la β -1,3-glucanasa selectiva de fibra como se describe en el documento WO 2005/017157, o como se describe en el documento EP 08075514.3 o la solicitud de patente de EE.UU. n° 61/128.938
- f) Plantas, tales como plantas de algodón, que tienen fibras con reactividad alterada, p. ej.,
25 por la expresión del gen de la N-acetilglucosaminatransferasa incluyendo los genes de nodC y quitina sintasa como se describe en los documentos WO 2006/136351

30 Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (que pueden obtenerse mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse de acuerdo con la invención son plantas, tales como colza o plantas Brassica relacionadas, con unas características alteradas del perfil oleoso. Dichas plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante selección de plantas que contienen una mutación que proporciona dichas características de perfil oleoso alteradas e incluyen:

- 35 a) Plantas, tales como plantas de colza, que producen aceite que tiene un contenido alto en ácido oleico como se describe, por ejemplo, en los documentos US 5.969.169, US 5.840.946 o US 6.323.392 o US 6.063.947
- b) Plantas, tales como plantas de colza, que producen aceite que tiene un contenido bajo en ácido linolénico como se describe en los documentos US 6.270.828, US 6.169.190 o US 5.965.755.
- 40 c) Plantas tales como plantas de colza, que producen aceite que tiene un nivel bajo de

ácidos grasos como se describe por ejemplo en la patente de EE.UU. nº 5.434.283 o en la solicitud de patente de EE.UU. nº 12/668303

Las plantas o las variedades de plantas cultivadas (que pueden obtenerse mediante métodos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también pueden tratarse según la invención son plantas, tales como colza o plantas Brassica relacionadas, con unas características alteradas de rotura de las semillas. Dichas plantas se pueden obtener por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que imparte dichas características alteradas de rotura de las semillas, e incluyen plantas tales como plantas de colza con rotura de las semillas retrasada o reducida, como se describe en la solicitud de patente de EE.UU. nº 61/135.230 y en las solicitudes internacionales WO09/068313 y WO10/006732.

Las plantas transgénicas particularmente útiles que se pueden tratar según la invención, son plantas que contienen transformaciones transgénicas o combinaciones de transformaciones transgénicas, que son objeto de demanda para el estado no regulado, en los Estados Unidos de América, al Servicio de inspección de Salud de Animales y Plantas (APHIS) del Departamento de Agricultura de Estados Unidos (USDA), si dichas demandas se han concedido o están todavía pendientes. En cualquier momento, esta información está disponible en APHIS (4700 River Road Riverdale, MD 20737, USA), por ejemplo en su sitio de internet (URL http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html). En la fecha de presentación de esta solicitud, las solicitudes de no regulación que estaban en tramitación ante APHIS o que habían sido concedidas por APHIS eran las que estaban listadas en la tabla B que contiene la información siguiente:

- Solicitud: el número de identificación de la solicitud. Las descripciones técnicas de los eventos de transformación se pueden encontrar en los documentos de solicitud individual que se pueden obtener de APHIS, por ejemplo en la página web de APHIS, con referencia a este número de petición. Estas descripciones se incorporan a la presente memoria por referencia.
- Extensión de Solicitud: referencia a una solicitud previa para la que se ha pedido una ampliación.
- Institución: el nombre de la entidad a la que se envía la petición.
- Artículo regulado: la especie de planta implicada.
- Fenotipo transgénico: la característica conferida a las plantas por el evento de transformación.
- Línea o evento de transformación: el nombre del evento o eventos (a veces también designado como línea o líneas) para las que se solicita una no regulación.
- documentos APHIS: diversos documentos publicados por APHIS con relación a la Solicitud y que pueden ser solicitados a APHIS.

Las plantas adicionales particularmente útiles que contienen una transformación transgénica o combinaciones de transformaciones transgénicas están listadas, por ejemplo, en la base de datos de

diferentes agencias reguladoras nacionales o regionales (véase por ejemplo http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx y <http://www.agbios.com/dbase.php>).

- 5 Las plantas adicionales particularmente transgénicas incluyen plantas que contienen un transgén en una posición neutra o beneficiosa desde un punto de vista agronómico como se describe en cualquiera de las publicaciones listadas en la Tabla C.

Tabla A

Característica	Referencia	
Eficiencia en el uso del agua	WO 2000/073475	
Eficiencia en el uso del nitrógeno	WO 1995/009911	WO 2007/076115
	WO 1997/030163	WO 2005/103270
	WO 2007/092704	WO 2002/002776
Fotosíntesis mejorada	WO 2008/056915	WO 2004/101751
Resistencia a nematodos	WO 1995/020669	WO 2003/033651
	WO 2001/051627	WO 1999/060141
	WO 2008/139334	WO 1998/012335
	WO 2008/095972	WO 1996/030517
	WO 2006/085966	WO 1993/018170
Dehiscencia reducida de la vaina	WO 2006/009649	WO 1997/013865
	WO 2004/113542	WO 1996/030529
	WO 1999/015680	WO 1994/023043
	WO 1999/000502	
Resistencia a áfidos	WO 2006/125065	WO 2008/067043
	WO 1997/046080	WO 2004/072109
Resistencia a Sclerotinia	WO 2006/135717	WO 2005/000007
	WO 2006/055851	WO 2002/099385
	WO 2005/090578	WO 2002/061043
Resistencia a Botrytis	WO 2006/046861	WO 2002/085105
Resistencia a Bremia	US 20070022496	WO 2004/049786
	WO 2000/063432	
Resistencia a Erwinia	WO 2004/049786	
Resistencia a Closterovirus	WO 2007/073167	WO 2002/022836
	WO 2007/053015	
Tolerancia al estrés (que incluye tolerancia a la sequía)	WO 2010/019838	WO2008/002480
	WO 2009/049110	WO2005/033318
Resistencia al Tobamovirus	WO 2006/038794	

Tabla B

Peticiones de Estado no Regulado concedido o en Tramitación por APHIS a partir del 31 de Marzo de 2010

Observación: Para obtener la lista más actualizada de Cultivos que ya no están Regulados, por favor mire en el Estado Actual de Peticiones. Esta lista se actualiza automáticamente y refleja todas las peticiones recibidas por APHIS hasta la fecha, incluyendo las peticiones en tramitación, retiradas o aprobadas.

Abreviaturas:

CMV-virus del mosaico del pepino; CPB-escarabajo colorado de la patata; PLRV- virus de enrollamiento de la hoja de la patata; PRSV-virus de mancha anular de la papaya; PVY-virus Y de la patata; WMV2- virus del mosaico de la sandía 2 ZYMV-virus del mosaico amarillo del calabacín

Peticiones en tramitación de Estado no Regulado					
Documentos del Solicitante					
Petición	Extensión del Número de Petición ***	Institución	Artículo Regulado	Fenotipo Transgénico	Línea o evento de transformación:
10-070-01p		Virginia Tech	Cacahuete	Resistente al tizón Sclerotinia	N70, P39, y W171
09-349-01p		Dow AgroSciences	Soja	Tolerante a Herbicida	DAS-68416-4
09-328-01p		Bayer CropScience	Soja	Tolerante a Herbicida	FG72
09-233-01p		Dow	Maíz	Tolerante a Herbicida	DAS-40278-9
09-201-01p		Monsanto	Soja		MON-87705-6
09-183-01p		Monsanto	Soja		MON-87769
09-082-01p		Monsanto	Soja	Resistente a Lepidopteran	MON 87701
09-063-01p		Stine Seed	Maíz	Tolerante a Glifosato	HCEM485
09-055-01p		Monsanto	Maíz	Tolerante a la sequía	MON 87460
09-015-01p		BASF Plant Science, LLC	Soja	Tolerante a Herbicida	BPS-CV127-9 Soja
08-366-01p		ArborGen	Eucalipto	Tolerante a la congelación, Fertilidad alterada	ARB-FTE1-08
08-340-01p		Bayer	Algodón	Tolerante a Glufosinato, Resistente a los Insectos	T304-40XGHB119
08-338-01p		Pioneer	Maíz	Macho estéril, Fertilidad Restaurada, Marcador Visual	DP-32138-1
08-315-01p		Florigene	Rosa	Color de Flor Alterado	IFD-52401-4 y IFD-52901-9
07-253-01p		Syngenta	Maíz	Resistente a Lepidopteran	MIR-162 Maíz
07-108-01p		Syngenta	Algodón	Resistente a Lepidopteran	COT67B
06-354-01p		Pioneer	Soja	Ácido oleico elevado	DP-305423-1
05-280-01p		Syngenta	Maíz	Alfa-amilasa termo-estable	3272
04-110-01p		Monsanto & Forage Genetics	Alfalfa	Tolerante a Glifosato	J101, J163
03-104-01p		Monsanto & Scotts	Agrostis	Tolerante a Glifosato	ASR368
Peticiones Concedidas de Estado no Regulado					
Documentos del Solicitante					

Petición	Extensión del Número de Petición ***	Institución	Artículo Regulado	Fenotipo Transgénico	Línea o evento de transformación:
07-152-01p		Pioneer	Maíz	tolerante a glifosato & Imidazolinona	DP-098140-6
04-337-01p		Universidad de Florida	Papaya	Resistente al virus de la mancha anular de la Papaya	X17-2
06-332-01p		Bayer CropScience	Algodón	Tolerante a Glifosato	GHB614
06-298-01p		Monsanto	Maíz	Resistente al barrenador europeo del maíz	MON 89034
06-271-01p		Pioneer	Soja	Tolerante a glifosato & acetolactato sintasa	356043 (DP-356Ø43-5)
06-234-01p	98-329-01p	Bayer CropScience	Arroz	Tolerante a fosfinotricina	LLRICE601
06-178-01p		Monsanto	Soja	Tolerante a Glifosato	MON 89788
04-362-01p		Syngenta	Maíz	Protegido del gusano de la raíz del maíz	MIR604
04-264-01p		ARS	Ciruela	Resistente al virus de la viruela de la ciruela	C5
04-229-01p		Monsanto	Maíz	Lisina elevada	LY038
04-125-01p		Monsanto	Maíz	Resistente al gusano de la raíz del maíz	88017
04-086-01p		Monsanto	Algodón	Tolerante a Glifosato	MON 88913
03-353-01p		Dow	Maíz	Resistente al gusano de la raíz del maíz	59122
03-323-01p		Monsanto	Remolach a azucarera	Tolerante a Glifosato	H7-1
03-181-01p	00-136-01p	Dow	Maíz	Resistente a Lepidópteros & tolerante a Fosfinotricina	TC-6275
03-155-01p		Syngenta	Algodón	Resistente a Lepidopteran	COT 102
03-036-01p		Mycogen/Dow	Algodón	Resistente a Lepidopteran	281-24-236
03-036-02p		Mycogen/Dow	Algodón	Resistente a Lepidopteran	3006-210-23
02-042-01p		Aventis	Algodón	Tolerante a Fosfinotricina	LLCotton25
01-324-01p	98-216-01p	Monsanto	Colza	Tolerante a Glifosato	RT200

01-206-01p	98-278-01p	Aventis	Colza	Tolerante a fosfinotricina & control de polinización	MS1 & RF1/RF2
01-206-02p	97-205-01p	Aventis	Colza	Tolerante a fosfinotricina	Topas 19/2
01-137-01p		Monsanto	Maíz	Resistente al gusano de la raíz del maíz	MON 863
01-121-01p		Vector	Tabaco	Nicotina reducida	Vector 21-41
00-342-01p		Monsanto	Algodón	Resistente a Lepidopteran	Suceso Algodón 15985
00-136-01p		Mycogen c/o Dow & Pioneer	Maíz	Resistente a Lepidópteros & tolerante a Fosfinotricina	Lino 1507
00-011-01p	97-099-01p	Monsanto	Maíz	Tolerante a Glifosato	NK603
99-173-01p	97-204-01p	Monsanto	Patata	Resistente a PLRV & CPB	RBMT22-82
98-349-01p	95-228-01p	AgrEvo	Maíz	Tolerante a Fosfinotricina y Macho estéril	MS6
98-335-01p		U. de Saskatchewan	Lino	Tolerante a residuos del suelo de herbicida de sulfonil urea	CDC Triffid
98-329-01p		AgrEvo	Arroz	Tolerante a fosfinotricina	LLRICE06, LLRICE62
98-278-01p		AgrEvo	Colza	Tolerante a fosfinotricina & control de polinización	MS8 & RF3
98-238-01p		AgrEvo	Soja	Tolerante a fosfinotricina	GU262
98-216-01p		Monsanto	Colza	Tolerante a Glifosato	RT73
98-173-01p		Novartis Seeds & Monsanto	Remolach at	Tolerante a Glifosato	GTSB77
98-014-01p	96-068-01p	AgrEvo	Soja	Tolerante a fosfinotricina	A5547-127
97-342-01p		Pioneer	Maíz	Macho estéril & Tolerante a Fosfinotricina	676, 678, 680
97-339-01p		Monsanto	Patata	Resistente a CPB & PVY	RBMT15-101, SEMT15-02, SEMT15-15
97-336-01p		AgrEvo	Remolach at	Tolerante a fosfinotricina	T-120-7
97-287-01p		Monsanto	Tomate	Resistente a Lepidopteran	5345
97-265-01p		AgrEvo	Maíz	Tolerante a Fosfinotricina & resistente a Lep.	CBH-351
97-205-01p		AgrEvo	Colza	Tolerante a fosfinotricina	T45

97-204-01p		Monsanto	Patata	Resistente a CPB & PLRV	RBMT21-129 & RBMT21-350
97-148-01p		Bejo	Cichorium intybus	Macho estéril	RM3-3, RM3-4, RM3-6
97-099-01p		Monsanto	Maíz	Tolerante a Glifosato	GA21
97-013-01p		Calgene	Algodón	Tolerante a Bromoxinilo & resistente a Lepidópteros	Sucesos 31807 & 31808
97-008-01p		Du Pont	Soja	Perfil oleoso alterado	G94-1, G94-19, G-168
96-317-01p		Monsanto	Maíz	Tolerante a glifosato & resistente a ECB	MON802
96-291-01p		DeKalb	Maíz	Resistente al barrenador europeo del maíz	DBT418
96-248-01p	92-196-01p	Calgene	Tomate	Fruto de maduración alterada	1 línea FLAVRSAVR adicional
96-068-01p		AgrEvo	Soja	Tolerante a fosfinotricina	W62, W98, A2704-12, A2704-21, A5547-35
96-051-01p		Cornell U	Papaya	Resistente a PRSV	55-1, 63-1
96-017-01p	95-093-01p	Monsanto	Maíz	Resistente al barrenador europeo del maíz	MON809 & MON810
95-352-01p		Asgrow	Calabacín	Resistente a CMV, ZYMV, WMV2	CZW-3
95-338-01p		Monsanto	Patata	Resistente a CPB	SBT02-5 & -7, ATBT04-6 & -27, -30, -31, -36
95-324-01p		Agritope	Tomate	Fruto de maduración alterada	35 1 N
95-256-01p		Du Pont	Algodón	Tolerante a sulfonilurea	19-51a
95-228-01p		Plant Genetic Systems	Maíz	Macho estéril	MS3
95-195-01p		Northrup King	Maíz	Resistente al barrenador europeo del maíz	Bt11
95-179-01p	92-196-01p	Calgene	Tomate	Fruto de maduración alterada	2 líneas FLAVRSAVR adicionales
95-145-01p		DeKalb	Maíz	Tolerante a fosfinotricina	B16
95-093-01p		Monsanto	Maíz	Resistente a Lepidopteran	MON 80100
95-053-01p		Monsanto	Tomate	Fruto de maduración	8338

				alterada	
95-045-01p		Monsanto	Algodón	Tolerante a Glifosato	1445, 1698
95-030-01p	92-196-01p	Calgene	Tomate	Fruto de maduración alterada	20 líneas FLAVRSAVR adicionales
94-357-01p		AgrEvo	Maíz	Tolerante a fosfinotricina	T14, T25
94-319-01p		Ciba Seeds	Maíz	Resistente a Lepidopteran	Suceso 176
94-308-01p		Monsanto	Algodón	Resistente a Lepidopteran	531, 757, 1076
94-290-01p		Zeneca & Petoseed	Tomate	Nivel de poligalacturonasa en fruta disminuido	B, Da, F
94-257-01p		Monsanto	Patata	Resistente a coleópteros	BT6, BT10, BT12, BT16, BT17, BT18, BT23
94-230-01p	92-196-01p	Calgene	Tomate	Fruto de maduración alterada	9 líneas FLAVRSAVR adicionales
94-228-01p		DNA Plant Tech	Tomate	Fruto de maduración alterada	1345-4
94-227-01p	92-196-01p	Calgene	Tomate	Fruto de maduración alterada	Line N73 1436-111
94-090-01p		Calgene	Colza	Perfil oleoso alterado	pCGN3828-212/86-18 & 23
93-258-01p		Monsanto	Soja	Tolerante a Glifosato	40-3-2
93-196-01p		Calgene	Algodón	Tolerante a bromoxinilo	BXN
92-204-01p		Upjohn	Calabacín	Resistente a WMV2 & ZYMV	ZW-20
92-196-01p		Calgene	Tomate	Fruto de maduración alterada	FLAVR SAVR

*** Extensión del número de Petición: Bajo 7CFR 340.6(e) una persona puede solicitar que APHIS extienda una determinación de un estado no regulado a otros organismos basándose en su similitud del artículo previamente desregulado. Esta columna lista la petición previamente concedida de ese artículo desregulado.

**** EA Preliminar: La Evaluación Medioambiental inicialmente disponible para comentario Público antes de la finalización.

Tabla C

Especie de planta	Suceso	Característica	Referencia de patente
Maíz	✓-ZMGT32 (NK603)	Tolerancia a glifosato	US 2007-056056
Maíz	MIR604	Resistencia a insectos (Cry3a055)	EP 1 737 290
Maíz	LY038	Contenido de lisina elevado	US 7.157.281
Maíz	3272	Maíz auto procesado (alfa-amilasa)	US 2006-230473
Maíz	PV-ZMIR13 (MON863)	Resistencia a insectos (Cry3Bb)	US 2006-095986
Maíz	DAS-59122-7	Resistencia a insectos (Cry34Ab1/Cry35Ab1)	US 2006-070139
Maíz	TC1507	Resistencia a insectos (Cry1F)	US 7.435.807
Maíz	MON810	Resistencia a insectos (Cry1Ab)	US 2004-180373
Maíz	VIP1034	Resistencia a insectos	WO 03/052073
Maíz	B16	Resistencia a glufosinato	US 2003-126634
Maíz	GA21	Resistencia a glifosato	US 6.040.497
Maíz	GG25	Resistencia a glifosato	US 6.040.497
Maíz	GJ11	Resistencia a glifosato	US 6.040.497
Maíz	FI117	Resistencia a glifosato	US 6.040.497
Maíz	GAT-ZM1	Tolerancia a glufosinato	WO 01/51654
Maíz	MON87460	Tolerancia a la sequía	WO 2009/111263
Maíz	DP-098140-6	Tolerancia a glifosato/ tolerancia a inhibidor ALS	WO 2008/112019
Maíz	Suceso 1	Resistencia a Fusarium (tricoteceno 3-O-acetiltransferasa)	CA 2561992
Remolacha azucarera	T227-1	Tolerancia a glifosato	US 2004-117870
Remolacha azucarera	H7-1	Tolerancia a glifosato	WO 2004-074492
Soja	MON89788	Tolerancia a glifosato	US 2006-282915
Soja	A2704-12	Tolerancia a glufosinato	WO 2006/108674
Soja	A5547-35	Tolerancia a glufosinato	WO 2006/108675
Soja	DP-305423-1	Ácido oleico elevado / inhibidor de la tolerancia a ALS	WO 2008/054747
Arroz	GAT-OS2	Tolerancia a glufosinato	WO 01/83818
Arroz	GAT-OS3	Tolerancia a glufosinato	US 2008-289060

Arroz	PE-7	Resistencia a insectos (Cry1Ac)	WO 2008/114282
Colza	MS-B2	Esterilidad masculina	WO 01/31042
Colza	MS-BN1/RF-BN1	Esterilidad masculina/restablecimiento	WO 01/41558
Colza	RT73	Resistencia a glifosato	WO 02/36831
Algodón	CE43-67B	Resistencia a insectos (Cry1Ab)	WO 2006/128573
Algodón	CE46-02A	Resistencia a insectos (Cry1Ab)	WO 2006/128572
Algodón	CE44-69D	Resistencia a insectos (Cry1Ab)	WO 2006/128571
Algodón	1143-14A	Resistencia a insectos (Cry1Ab)	WO 2006/128569
Algodón	1143-51B	Resistencia a insectos (Cry1Ab)	WO 2006/128570
Algodón	T342-142	Resistencia a insectos (Cry1Ab)	WO 2006/128568
Algodón	Suceso 3006-210-23	Resistencia a insectos (Cry1Ac)	WO 2005/103266
Algodón	PV-GHGT07 (1445)	Tolerancia a glifosato	US 2004-148666
Algodón	MON88913	Tolerancia a glifosato	WO 2004/072235
Algodón	EE-GH3	Tolerancia a glifosato	WO 2007/017186
Algodón	T304-40	Resistencia a insectos (Cry1Ab)	WO2008/122406
Algodón	Cot202	Resistencia a insectos (VIP3)	US 2007-067868
Algodón	LLCotton25	Resistencia a glufosinato	WO 2007/017186
Algodón	EE-GH5	Resistencia a insectos (Cry1Ab)	WO 2008/122406
Algodón	Suceso 281-24-236	Resistencia a insectos (Cry1F)	WO 2005/103266
Algodón	Cot102	Resistencia a insectos (Vip3A)	US 2006-130175
Algodón	MON 15985	Resistencia a insectos (Cry1A/Cry2Ab)	US 2004-250317
Césped	Asr-368	Tolerancia a glifosato	US 2006-162007
Brinjal	EE-1	Resistencia a insectos (Cry1Ac)	WO 2007/091277

Entre las enfermedades de plantas o cultivos que pueden combatirse mediante el método de acuerdo con la invención, se pueden mencionar:

Enfermedades por mildiu tales como:

- 5 Enfermedades por *Blumeria*, producidas por ejemplo por *Blumeria graminis*;
 Enfermedades por *Podosphaera*, producidas por ejemplo por *Podosphaera leucotricha*;
 Enfermedades por *Sphaerotheca*, producidas por ejemplo por *Sphaerotheca fuliginea*;
 Enfermedades por *Uncinula*, producidas por ejemplo por *Uncinula necator*;

Enfermedades por roya, tales como:

- 10 Enfermedades por *Gymnosporangium*, producidas por ejemplo por *Gymnosporangium sabinae*;
 Enfermedades por *Hemileia*, producidas por ejemplo por *Hemileia vastatrix*;
 Enfermedades por *fakopsora*, producidas por ejemplo por *fakopsora pachyrhizi* o *fakopsora meibomiaae*;
 Enfermedades por *Puccinia*, producidas por ejemplo por *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* o
 15 *Puccinia striiformis*;

enfermedades por Uromyces, producidas por ejemplo por *Uromyces appendiculatus*;

Enfermedades por oomicetos, tales como:

Enfermedades por Albugo, producidas por ejemplo por *Albugo candida*;

Enfermedades por Bremia, producidas por ejemplo por *Bremia lactucae*;

5 Enfermedades por Peronospora, producidas por ejemplo por *Peronospora pisi* o *P. brassicae*;

Enfermedades por fytoftthora, producidas por ejemplo por *fytoftthora infestans*;

Enfermedades por Plasmopara, producidas por ejemplo por *Plasmopara viticola*;

Enfermedades por Pseudoperonospora, producidas por ejemplo por *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*;

10 Enfermedades por Pythium, producidas por ejemplo por *Pythium ultimum*;

Enfermedades por manchas foliares, enrojecimiento foliar y tizón foliar, tales como:

Enfermedades por Alternaria, producidas por ejemplo por *Alternaria solani*;

Enfermedades por Cercospora, producidas por ejemplo por *Cercospora beticola*;

Enfermedades por Cladosporium, producidas por ejemplo por *Cladosporium cucumerinum*;

15 Enfermedades por Cochliobolus, causadas por ejemplo por *Cochliobolus sativus* (en forma de conidio:

Conidiaform: Drechslera, Sin: Helminthosporium) o *Cochliobolus miyabeanus*;

Enfermedades por Colletotrichum, producidas por ejemplo por *Colletotrichum lindemuthianum*;

Enfermedades por cicloconium, producidas por ejemplo por *cicloconium oleaginum*;

20 Enfermedades por Diaporthe, producidas por ejemplo por *Diaporthe citri*;

Enfermedades por Elsinoe, producidas por ejemplo por *Elsinoe fawcettii*;

Enfermedades por Gloeosporium, producidas por ejemplo por *Gloeosporium laeticolor*;

Enfermedades por Glomerella, producidas por ejemplo por *Glomerella cingulata*;

Enfermedades por Guignardia, producidas por ejemplo por *Guignardia bidwelli*;

25 Enfermedades por Leptosphaeria, producidas por ejemplo por *Leptosphaeria maculans*; *Leptosphaeria nodorum*;

Enfermedades por Magnaporthe, producidas por ejemplo por *Magnaporthe grisea*;

Enfermedades por Mycosphaerella, producidas por ejemplo por *Mycosphaerella graminicola*; *Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;

30 Enfermedades por faeosfaeria, producidas por ejemplo por *faeosfaeria nodorum*;

Enfermedades por Pyrenophora, causadas por ejemplo por *Pyrenophora teres* o *Pyrenophora tritici repentis*;

Enfermedades por Ramularia, causadas por ejemplo por *Ramularia collo-cygni* o *Ramularia areola*;

Enfermedades por Rhynchosporium, producidas por ejemplo por *Rhynchosporium secalis*;

35 Enfermedades por Septoria, producidas por ejemplo por *Septoria apii* o *Septoria lycopersici*;

Enfermedades por Tyfula, producidas por ejemplo por *Tyfula incarnata*;

Enfermedades por Venturia, producidas por ejemplo por *Venturia inaequalis*;

Enfermedades de raíz, vaina y tallo, tales como

Enfermedades por Corticium, producidas por ejemplo por *Corticium graminarum*;

40 Enfermedades por Fusarium, producidas por ejemplo por *Fusarium oxysporum*;

Enfermedades por *Gaeumannomyces*, producidas por ejemplo por *Gaeumannomyces graminis*;

Enfermedades por *Rhizoctonia*, producidas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;

Enfermedades por *Sarocladium*, producidas por ejemplo por *Sarocladium oryzae*;

Enfermedades por *Sclerotium*, producidas por ejemplo por *Sclerotium oryzae*;

5 Enfermedades por *Tapesia*, producidas por ejemplo por *Tapesia acuformis*;

Enfermedades por *Thielaviopsis*, producidas por ejemplo por *Thielaviopsis basicola*;

Enfermedades de la mazorca y de la panícula, tales como:

Enfermedades por *Alternaria*, producidas por ejemplo por *Alternaria spp.*;

Enfermedades por *Aspergillus*, producidas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;

10 Enfermedades por *Cladosporium*, producidas por ejemplo por *Cladosporium spp.*;

Enfermedades por *Claviceps*, producidas por ejemplo por *Claviceps purpurea*;

Enfermedades por *Fusarium*, producidas por ejemplo por *Fusarium culmorum*;

Enfermedades por *Gibberella*, producidas por ejemplo por *Gibberella zeae*;

Enfermedades por *Monograpella*, producidas por ejemplo por *Monograpella nivalis*;

15 Enfermedades por carbón y tizón, tales como:

Enfermedades por *Sphacelotheca*, producidas por ejemplo por *Sphacelotheca reiliana*;

Enfermedades por *Tilletia*, producidas por ejemplo por *Tilletia caries*;

Enfermedades por *Urocystis*, producidas por ejemplo por *Urocystis occulta*;

Enfermedades por *Ustilago*, producidas por ejemplo por *Ustilago nuda*;

20 Enfermedades por podredumbre y moho de la fruta tales como:

Enfermedades por *Aspergillus*, producidas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;

Enfermedades por *Botrytis*, producidas por ejemplo por *Botrytis cinerea*;

Enfermedades por *Penicillium*, producidas por ejemplo por *Penicillium expansum*

Enfermedades por *Rhizopus*, producidas por ejemplo por *Rhizopus stolonifer*

25 Enfermedades por *Sclerotinia*, producidas por ejemplo por *Sclerotinia sclerotiorum*;

Enfermedades por *Verticillium*, producidas por ejemplo por *Verticillium albo-atrum*;

Enfermedades por podredumbre de las semillas y del suelo, moho, marchitez, roña y caída de almáciga :

Enfermedades por *Alternaria*, producidas por ejemplo *Alternaria brassicicola*

Enfermedades por *Afanomyces*, producidas por ejemplo por *Afanomyces euteiches*

30 Enfermedades por *Ascochyta*, producidas por ejemplo por *Ascochyta lentis*

Enfermedades por *Aspergillus*, producidas por ejemplo por *Aspergillus flavus*

Enfermedades por *Cladosporium*, producidas por ejemplo por *Cladosporium herbarum*

Enfermedades por *Cochliobolus*, producidas por ejemplo por *Cochliobolus sativus*

(En forma de conidio: *Drechslera*, *Bipolaris* Sinónimo: *Helminthosporium*);

35 Enfermedades por *Colletotrichum*, producidas por ejemplo por *Colletotrichum coccodes*;

Enfermedades por *Fusarium*, producidas por ejemplo por *Fusarium culmorum*;

Enfermedades por *Gibberella*, producidas por ejemplo por *Gibberella zeae*;

Enfermedades por *Macrofomina*, producidas por ejemplo por *Macrofomina faseolina*

Enfermedades por *Monograpella*, producidas por ejemplo por *Monograpella nivalis*;

40 Enfermedades por *Penicillium*, producidas por ejemplo por *Penicillium expansum*

Enfermedades por foma, producidas por ejemplo por *foma lingam*

Enfermedades por fomopsis, producidas por ejemplo por *fomopsis sojæ*;

Enfermedades por fytoftthora, producidas por ejemplo por *fytoftthora cactorum*;

Enfermedades por Pyrenofora, producidas por ejemplo por *Pyrenofora graminæ*

5 Enfermedades por Pyricularia, producidas por ejemplo por *Pyricularia oryzae*;

Enfermedades por Pythium, producidas por ejemplo por *Pythium ultimum*;

Enfermedades por Rhizoctonia, producidas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;

Enfermedades por Rhizopus, producidas por ejemplo por *Rhizopus oryzae*

Enfermedades por Sclerotium, producidas por ejemplo por *Sclerotium rolfsii*;

10 Enfermedades por Septoria, producidas por ejemplo por *Septoria nodorum*;

Enfermedades por Typhula, producidas por ejemplo por *Typhula incarnata*;

Enfermedades por Verticillium, producidas por ejemplo por *Verticillium dahliae*;

Enfermedades por chancro, retama y puntiseco tales como:

Enfermedades por Nectria, producidas por ejemplo por *Nectria galligena*;

15 Enfermedades por tizón, tales como:

Enfermedades por Monilinia, producidas por ejemplo por *Monilinia laxa*;

Enfermedades por ampolla de la hoja o encrespamiento de la hoja, tales como:

Enfermedades por Exobasidium, producidas por ejemplo por *Exobasidium vexans*;

Enfermedades por Tafrina, producidas por ejemplo por *Tafrina deformans*;

20 Enfermedades de deterioro de plantas madereras, tales como:

Enfermedades por Esca, producidas por ejemplo por *Phaemoniella clamydospora*;

Acronecrosis por Eutypa, producida por ejemplo por *Eutypa lata*;

Enfermedades por Ganoderma, producidas por ejemplo por *Ganoderma boninense*;

Enfermedades por Rigidoporus, causadas por ejemplo por *Rigidoporus lignosus*

25 Enfermedades de flores y semillas tales como:

Enfermedades por Botrytis, causadas por ejemplo por *Botrytis cinerea*;

Enfermedades de tubérculos, tales como:

Enfermedades por Rhizoctonia, causadas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;

Enfermedades por Helminthosporium, producidas por ejemplo por *Helminthosporium solani*;

30 Enfermedades por hernia de las raíces de las crucíferas, tales como

Enfermedades por Plasmodiophora, causadas por ejemplo por *Plasmodiophora brassicae*.

Enfermedades causadas por organismos bacterianos, tales como:

Especies de xanthomonas, por ejemplo *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

Especies de pseudomonas, por ejemplo *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

35 Especies de Erwinia, por ejemplo *Erwinia amylovora*.

La composición según la invención también se puede usar contra enfermedades fúngicas susceptibles de desarrollarse sobre madera o en el interior de la misma. El término “madera” significa todos los tipos de especies de madera y todos los tipos de labores de esta madera destinados a la construcción, por ejemplo, madera maciza, madera de alta densidad, madera laminada y

40

contrachapado. El método para tratar la madera de acuerdo con la invención consiste fundamentalmente en ponerla en contacto con uno o más compuestos de acuerdo con la invención, o con una composición de acuerdo con la invención; esto incluye, por ejemplo, aplicación directa, pulverización, inmersión, inyección o cualquier otro medio adecuado.

5

La dosis de compuesto activo aplicada normalmente en el método de tratamiento de acuerdo con la invención está general y ventajosamente entre 10 y 800 g/ha, preferiblemente, entre 50 y 300 g/ha para aplicaciones en tratamiento de las hojas. La dosis de sustancia activa aplicada está general y ventajosamente entre 2 y 200 g por 100 kg de semillas, preferentemente entre 3 y 150 g por 100 kg de semillas en el caso del tratamiento de semillas.

10

Se entiende claramente que las dosis indicadas en la presente memoria se proporcionan como ejemplos ilustrativos del método de acuerdo con la invención. Un experto en la materia sabrá cómo adaptar la dosis de aplicación, en particular según la naturaleza de la planta o del cultivo a tratar.

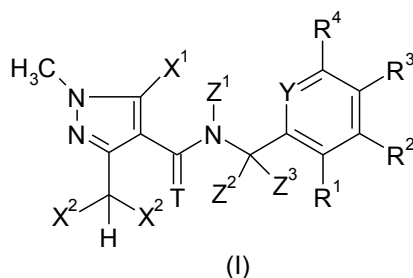
15

Los compuestos o mezclas de acuerdo con la invención también se pueden utilizar para la preparación de una composición útil para tratar en forma terapéutica o preventiva enfermedades fúngicas en seres humanos o animales tales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, tricofitosis y candidiasis o enfermedades provocadas por *Aspergillus spp.*, por ejemplo *Aspergillus fumigatus*.

20

Varios aspectos de la invención se ilustrarán ahora con relación a las siguientes tablas de ejemplos de compuestos y la siguiente preparación o ejemplos de eficacia.

La tabla 1 ilustra de forma no limitante ejemplos de compuestos de fórmula (I) según la invención.



25

En la tabla 1, M+H (Apcl+) se refiere al pico molecular iónico, más o menos 1 u.m.a. (unidades de masa atómica) tal como se observa en espectroscopía de masas, mediante ionización química a presión atmosférica positiva.

30

En la tabla 1, los valores log P se determinaron de acuerdo con la Directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Resolución) en una columna de fase inversa (C18), usando el método descrito a continuación:

Temperatura: 40°C; Fases móviles: Acetonitrilo y ácido fórmico acuoso al 0,1%; gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 90% de acetonitrilo.

35

La calibración se realizó usando alcan-2-onas sin ramificar (que comprenden de 3 a 16 átomos de carbono) con valores de log P conocidos (determinación de los valores de log P por los tiempos de

retención usando interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas). Los valores máximos de λ se determinaron usando espectros UV de 200 nm a 400 nm y los valores pico de las señales cromatográficas.

Tabla 1

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
1	Cl	F	O	H	Me	H	H	H	H	H	CR ⁵	H	2,49	314
2	F	F	O	H	Me	H	H	H	H	H	CR ⁵	H	2,33	298
3	F	F	O	H	CN	H	H	H	H	H	CR ⁵	H	2,07	
4	Cl	F	O	H	CN	H	H	H	H	H	CR ⁵	H	2,20	
5	Cl	F	O	Me	H	H	Me	H	H	H	CR ⁵	Me	3,02	342
6	F	F	O	Me	H	H	Me	H	H	H	CR ⁵	Me	2,84	326
7	Cl	F	O	H	CN	H	F	H	H	F	CR ⁵	H	2,31	
8	F	F	O	H	CN	H	F	H	H	F	CR ⁵	H	2,01	
9	F	F	O	H	Me	Me	F	H	H	H	CR ⁵	F	4,19	348
10	Cl	F	O	H	Me	Me	F	H	H	H	CR ⁵	F	3,89	364
11	F	F	O	cianometilo	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	2,68	351

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
12	F	F	O	ciclobutilo	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	3,63	366
13	F	F	O	Et	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	3.13	340
14	F	F	O	i-Pr ⁽¹⁾	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	3,39	354
15	F	F	O	Me	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	2.81	326
16	F	F	O	Alilo	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	3.36	352
17	F	F	O	propargilo	H	H	Et	H	H	H	CR ⁵	H	3.10	350
18	F	F	S	Me	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	3,44	362
19	Cl	F	O	H	CF ₃	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	3,33	402
20	Cl	F	O	H	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2,92	348
21	Cl	F	O	H	H	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2,69	334
22	Cl	F	O	H	Me	Me	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	3,15	362
23	F	F	O	H	CF ₃	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	3,21	386

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
24	F	F	O	H	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2,75	332
25	F	F	O	H	H	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2.50	318
26	F	F	O	H	Me	Me	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2,92	346
27	Cl	F	O	Me	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2,84	362
28	F	F	O	Me	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	H	2,68	346
29	F	F	O	H	Me	H	Cl	Cl	H	H	CR ⁵	H	3.13	366
30	Cl	F	O	ciclobutilo	H	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,39	422
31	F	F	O	ciclobutilo	H	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,19	406
32	Cl	F	O	H	CF ₃	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,89	436
33	Cl	F	O	H	Me	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,39	382
34	Cl	F	O	H	H	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,19	368
35	Cl	F	O	H	Me	Me	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,89	396

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
36	F	F	O	H	Me	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,39	366
37	F	F	O	H	H	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,19	352
38	F	F	O	H	-CH ₂ CH ₂ -		Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,89	378
39	F	F	O	H	Me	Me	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,39	380
40	F	F	O	H	CF ₃	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	4,19	420
41	Cl	F	O	H	-CH ₂ CH ₂ -		Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,89	394
42	Cl	F	O	Me	H	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,37	382
43	F	F	O	Me	H	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,19	366
44	Cl	F	S	H	Me	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,99	398
45	F	F	O	OMe	Me	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,65	396
46	Cl	F	O	OMe	Me	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,81	412
47	Cl	F	O	H	H	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,39	368

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
48	Cl	F	O	H	-CH ₂ CH ₂ -		Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,19	394
49	Cl	F	O	H	Me	Me	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,89	396
50	Cl	F	O	H	Me	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,39	382
51	F	F	O	H	-CH ₂ CH ₂ -		Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,19	378
52	F	F	O	H	Me	Me	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,89	380
53	F	F	O	H	Me	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,39	366
54	F	F	O	H	H	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,19	352
55	Cl	F	O	Me	Me	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,33	396
56	F	F	O	Me	Me	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,15	380
57	Cl	F	O	Me	H	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,23	382
58	F	F	O	Me	H	H	Cl	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,02	366
59	Cl	F	O	H	H	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,89	368

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
60	F	F	O	H	H	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	Cl	4,39	352
61	Cl	F	O	Me	H	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,02	382
62	F	F	O	Me	H	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	Cl	2,82	366
63	Cl	F	O	Me	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,25	396
64	F	F	O	Me	Me	H	Cl	H	H	H	CR ⁵	Cl	3.13	380
65	F	F	O	H	H	H	c-Pr ⁽¹⁾	H	H	H	CR ⁵	H	2,78	324
66	Cl	F	O	H	H	H	c-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	2,98	340
67	F	F	O	cianometilo	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	2,94	365
68	F	F	O	Et	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,42	354
69	F	F	O	i-Pr	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,70	368
70	F	F	O	ciclobutilo	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,90	380
71	F	F	O	Alilo	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3.66	366

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
72	F	F	O	Me	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,11	340
73	F	F	O	propargilo	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,37	364
74	F	F	O	H	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,02	326
75	F	F	S	ciclobutilo	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	4,63	396
76	F	F	O	OMe	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,37	356
77	Cl	F	O	OMe	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,51	372
78	F	F	O	2,2- difluoroetilo	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,49	
79	Cl	F	O	H	H	H	i-Pr	H	H	H	CR ⁵	H	3,19	342
80	F	F	O	2,2- difluoroetilo	H	H	i-Pr	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,81	
81	F	F	O	H	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	H	2,76	352
82	Cl	F	O	H	Me	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	H	3,11	382
83	Cl	F	O	H	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	H	2,96	368

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
84	F	F	O	H	Me	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	H	2,96	366
85	Cl	F	S	H	Me	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	H	3,55	398
86	Cl	F	O	3-tietanilo	H	H	CF ₃	H	H	Cl	CR ⁵	H	4,08	474
87	F	F	O	3-tietanilo	H	H	CF ₃	H	H	Cl	CR ⁵	H	3,92	458
88	F	F	O	cianometilo	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	2,68	425
89	F	F	O	Me	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	2,93	400
90	F	F	O	ciclobutilo	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,81	440
91	F	F	O	Et	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,22	414
92	F	F	O	i-Pr	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,61	428
93	F	F	O	propargilo	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,05	424
94	F	F	O	Alilo	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	Cl	3,37	426
95	F	F	O	H	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	F	2,69	370

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
96	Cl	F	O	H	H	H	CF ₃	H	H	H	CR ⁵	F	2,86	386
97	F	F	O	cianometilo	H	H	trimetilsililo	H	H	H	CR ⁵	H	3,52	395
98	F	F	O	ciclobutilo	H	H	trimetilsililo	H	H	H	CR ⁵	H	4,61	410
99	F	F	O	Et	H	H	trimetilsililo	H	H	H	CR ⁵	H	4,09	384
100	F	F	O	Alilo	H	H	trimetilsililo	H	H	H	CR ⁵	H	4,27	396
101	F	F	O	propargilo	H	H	trimetilsililo	H	H	H	CR ⁵	H	3,93	394
102	F	F	O	i-Pr	H	H	trimetilsililo	H	H	H	CR ⁵	H	4,37	398
103	F	F	O	Me	H	H	trimetilsililo	H	H	H	CR ⁵	H	3,78	370
104	Cl	F	O	Me	H	H	Br	H	H	H	CR ⁵	H	2,90	392
105	F	F	O	Me	H	H	Br	H	H	H	CR ⁵	H	2,71	376
106	Cl	F	O	H	H	H	SCF3	H	H	H	CR ⁵	H	3,29	400
107	F	F	O	H	H	H	SCF3	H	H	H	CR ⁵	H	3,11	384

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
108	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	CF ₃	H	H	CR ⁵	H	3,65	406
109	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	CF ₃	H	H	CR ⁵	H	3,80	422
110	F	F	O	H	H	H	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		H	CR ⁵	H	3,25	338
111	Cl	F	O	H	H	H	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		H	CR ⁵	H	3,44	354
112	Cl	F	O	H	Me	Me	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	3,73	396
113	Cl	F	O	H	H	H	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	3,23	368
114	F	F	O	H	Me	Me	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	3,59	380
115	F	F	O	H	H	H	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	3,09	352
116	Cl	F	O	Me	Me	H	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	3,65	396
117	F	F	O	Me	Me	H	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	3,46	380
118	F	F	S	Me	Me	H	H	Cl	H	Cl	CR ⁵	H	4,24	396
119	F	F	O	H	H	H	H	OMe	OMe	H	CR ⁵	H	1,79	344

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
120	Cl	F	O	H	H	H	H	OMe	OMe	H	CR ⁵	H	1.36	360
121	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	CF ₃	H	CR ⁵	H	3,72	406
122	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	CF ₃	H	CR ⁵	H	3,87	422
123	F	F	O	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CR ⁵	H	2,75	352
124	Cl	F	O	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CR ⁵	H	2.90	368
125	F	F	O	H	-CH ₂ CH ₂ -		H	H	Cl	CF ₃	CR ⁵	H	3,27	412
126	Cl	F	O	H	-CH ₂ CH ₂ -		H	H	Cl	CF ₃	CR ⁵	H	3,41	428
127	F	F	O	H	H	H	H	H	Cl	H	CR ⁵	H	2,55	318
128	Cl	F	O	H	H	H	H	H	Cl	H	CR ⁵	H	2.70	334
129	F	F	O	H	Me	H	H	H	Ciclohexilo	H	CR ⁵	H	4,34	380
130	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	OEt	H	CR ⁵	H	3.59	398
131	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	OEt	H	CR ⁵	H	3,44	382

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
132	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	OMe	H	CR ⁵	H	3,19	384
133	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	OMe	H	CR ⁵	H	3,06	368
134	F	F	O	H	H	H	H	H	OMe	H	CR ⁵	H	2,08	314
135	F	F	O	H	H	H	H	H	t-Bu ⁽¹⁾	H	CR ⁵	H	3,42	340
136	Cl	F	O	H	H	H	H	H	t-Bu	H	CR ⁵	H	3,58	356
137	Cl	F	O	H	H	-CH ₂ CH ₂ -		H	H	H	CR ⁵	H	2,73	326
138	F	F	O	H	H	-CH ₂ CH ₂ -		H	H	H	CR ⁵	H	2,57	310
139	Cl	F	O	H	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		H	H	H	CR ⁵	H	3,02	340
140	F	F	O	H	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		H	H	H	CR ⁵	H	2,84	324
141	F	F	O	Me	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		H	H	H	CR ⁵	H	2,92	338
142	Cl	F	O	Me	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		H	H	H	CR ⁵	H	3,09	354
143	Cl	F	O	H	H	H	fenoxi	H	H	H	CR ⁵	H	3,46	392

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
144	F	F	O	H	H	H	fenoxi	H	H	H	CR ⁵	H	3,25	376
145	F	F	O	H	H	H	H	fenoxi	H	H	CR ⁵	H	3,23	376
146	Cl	F	O	H	H	H	H	fenoxi	H	H	CR ⁵	H	3,46	392
147	Cl	F	O	3-oxetanilo	H	H	H	fenoxi	H	H	CR ⁵	H	3,19	448
148	F	F	O	3-oxetanilo	H	H	H	fenoxi	H	H	CR ⁵	H	3,06	432
149	Cl	F	O	Me	H	H	H	fenoxi	H	H	CR ⁵	H	3,46	406
150	F	F	O	Me	H	H	H	fenoxi	H	H	CR ⁵	H	3,31	390
151	Cl	F	O	H	H	H	H	H	fenoxi	H	CR ⁵	H	3,37	392
152	F	F	O	H	H	H	H	H	fenoxi	H	CR ⁵	H	3,23	376
153	Cl	F	O	Me	Me	H	H	H	fenoxi	H	CR ⁵	H	3,76	420
154	F	F	O	Me	Me	H	H	H	fenoxi	H	CR ⁵	H	3,59	404
155	Cl	F	O	Me	H	H	H	H	fenoxi	H	CR ⁵	H	3,48	406

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
156	F	F	O	Me	H	H	H	H	fenoxi	H	CR ⁵	H	3,33	390
157	Cl	F	O	Me	H	H	H	H	4-cloro fenoxi	H	CR ⁵	H	3,96	440
158	F	F	O	Me	H	H	H	H	4-cloro fenoxi	H	CR ⁵	H	3,81	424
159	Cl	F	O	H	Me	H	H	H	benciloxi	H	CR ⁵	H	3,58	420
160	Cl	F	O	H	H	H	H	H	benciloxi	H	CR ⁵	H	3,37	406
161	F	F	O	H	H	H	H	H	benciloxi	H	CR ⁵	H	3,23	390
162	F	F	O	H	Me	H	H	H	benciloxi	H	CR ⁵	H	3,41	404
163	F	F	O	H	H	H	fenilo	H	H	H	CR ⁵	H	3,21	360
164	Cl	F	O	H	H	H	fenilo	H	H	H	CR ⁵	H	3,39	376
165	Cl	F	O	H	H	H	H	fenilo	H	H	CR ⁵	H	3,33	376
166	F	F	O	H	H	H	H	fenilo	H	H	CR ⁵	H	3,19	360
167	Cl	F	O	H	Me	H	H	H	fenilo	H	CR ⁵	H	3,62	390

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
168	Cl	F	O	H	H	H	H	H	fenilo	H	CR ⁵	H	3,35	376
169	F	F	O	H	Me	H	H	H	fenilo	H	CR ⁵	H	3,46	374
170	F	F	O	H	H	H	H	H	fenilo	H	CR ⁵	H	3,21	360
171	Cl	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	H	H	N	-	1.30	355
172	F	F	O	H	-[CH ₂] ₄ -		H	H	H	H	N	-	1.13	339
173	Cl	F	O	Me	H	H	H	Cl	H	H	N	-	2,01	349
174	F	F	O	Me	H	H	H	Cl	H	H	N	-	1,84	333
175	F	F	O	H	Me	H	Cl	H	CF ₃	H	N	-	3,19	401
176	F	F	O	H	H	H	Cl	H	CF ₃	H	N	-	2,76	387
177	Cl	F	O	H	Me	H	Cl	H	CF ₃	H	N	-	3,48	417
178	Cl	F	O	H	H	H	Cl	H	CF ₃	H	N	-	3,08	403
179	F	F	O	Me	H	H	Cl	H	Cl	H	N	-	2,53	367

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
180	Cl	F	O	Me	H	H	Cl	H	Cl	H	N	-	2,73	383
181	F	F	O	OMe	H	H	Cl	H	Cl	H	N	-	2,73	383
182	Cl	F	O	OMe	H	H	Cl	H	Cl	H	N	-	2,88	399
183	F	F	O	Ciclopentilo	H	H	Cl	H	Cl	H	N	-	3,85	421
184	Cl	F	O	Ciclopentilo	H	H	Cl	H	Cl	H	N	-	4,11	437
185	F	F	O	Me	Me	H	Cl	H	Cl	H	N	-	2,92	381
186	Cl	F	O	Me	Me	H	Cl	H	Cl	H	N	-	3,11	397
187	F	F	O	Ciclopentilo	Me	H	Cl	H	Cl	H	N	-	4,44	435
188	Cl	F	O	Ciclopentilo	Me	H	Cl	H	Cl	H	N	-	4,67	451
189	Cl	F	O	Ciclopentilo	H	H	Cl	H	CF ₃	H	N	-	4,21	471
190	F	F	O	Ciclopentilo	H	H	Cl	H	CF ₃	H	N	-	3,96	455
191	Cl	F	O	H	Et	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,79	396

Compuesto	X1	X2	T	Z ¹	Z ²	Z ³	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	Y	R ⁵	log P	Masa M+H
192	F	F	O	H	Et	H	Cl	H	Cl	H	CR ⁵	H	3,61	380

Nota 1 : i-Pr : isopropilo; c-Pr : ciclopropilo; t-Bu : terc-butilo

Los siguientes ejemplos ilustran de forma no limitante la preparación y eficacia de los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención.

Síntesis del ácido 5-cloro-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (ejemplo IIIa-1)

5 En un matraz de 500 ml, se añaden a 30 ml de tolueno 6,0 g (31 mmol) de 5-cloro-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carbaldehído. Se añade a la mezcla de reacción una disolución de 2,4 g (62 mmol) de hidróxido de sodio en 6 ml de agua, seguido de 103 ml de una disolución de peróxido de hidrógeno al 30% en agua, manteniendo la temperatura por debajo de 37°C. Después de finalizada la adición, la mezcla de reacción se agita a 50°C durante 7
10 horas. Una vez que la mezcla de reacción ha vuelto a temperatura ambiente, las dos fases se separan y la fase orgánica se extrae con 100 ml de agua. Las fases acuosas combinadas se acidifican a pH 2 con ácido clorhídrico. El precipitado blanco resultante se filtra, se lava dos veces con 20 ml de agua, y se seca para proporcionar 3,2 g de ácido 5-cloro-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico como un sólido blanco. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ ppm :
15 3,78 (s, 3H); 7,12 (t, 1H, JHF = 53,60 Hz); 13,19 (s, 1H); IR (KBr) : 1688 cm⁻¹ (C=O); 2200-3200 cm⁻¹ ancho (enlace de hidrógeno).

Síntesis del cloruro de 5-cloro-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carbonilo (ejemplo IIIb-1)

3,2 g de ácido 5-cloro-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico y 44,3 ml de cloruro de
20 tionilo se mantuvieron a reflujo durante 5 horas. Después de enfriarse, la mezcla de reacción se evapora a vacío para proporcionar 3,5 g de cloruro de 5-cloro-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carbonilo como un aceite amarillo. ¹H NMR (400 MHz, CHCl₃-*d*₆) δ ppm : 3,97 (s, 3H); 7,00 (t, J=52,01 Hz, 1 H); IR (TQ) : 1759 y 1725 cm⁻¹ (C=O).

25 Síntesis del fluoruro de 3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carbonilo (ejemplo IIIc-1)

A una disolución seca de 4,0 g (70 mmol) de fluoruro de potasio en 21 ml de 1,1-dióxido de tetrahidrotiofeno se añade una disolución de 5,0 g (22 mmol) de cloruro de 5-cloro-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carbonilo en 15 ml de tolueno a 100°C. La mezcla de
30 reacción resultante se agita a 190-200°C durante 22 horas. La destilación a vacío proporciona 8 g de una disolución (0,25 M) de fluoruro de 3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carbonilo en 1,1-dióxido de tetrahidrotiofeno. ¹H NMR (250 MHz, CHCl₃-*d*₆) δ ppm : 3,87 (s, 3H); 6,79 (t, J=53,75 Hz, 1 H); ¹⁹F NMR (250 MHz, CHCl₃-*d*₆) δ ppm : 45,37 (s, COF); -117,5 (d, J=28,2 Hz); -131,6 (m).

35 Síntesis del ácido 3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (ejemplo III d-1)

A 400 ml de una disolución acuosa de hidróxido de sodio 1N se añaden gota a gota 67,5 g de una disolución (0,1 M) de fluoruro de 3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carbonilo en 1,1-dióxido de tetrahidrotiofeno. La temperatura se mantiene por debajo de 20°C durante la adición. Después de 2 horas de agitación a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se

acidifica cuidadosamente a pH 2 con ácido clorhídrico acuoso concentrado. El precipitado blanco resultante se filtra, se lava con agua, y se seca para proporcionar 6 g de ácido 3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico como un sólido blanco. ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 3,90 (s, 3H); 7,22 (t, 1H, $J_{\text{HF}} = 53,55\text{Hz}$); 13,33 (s, 1H).

5

Síntesis del cloruro de 3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carbonilo (ejemplo IIIe-1)

9,1 g de ácido 3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico y 75,5 ml de cloruro de tionilo se mantuvieron a reflujo durante 1,5 horas. Después de enfriarse, la mezcla de reacción se evapora a vacío para proporcionar 10 g de cloruro de 3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carbonilo como un aceite amarillo. GC-MS; M/z observado : Ión molecular: (M^+) = 212; fragmentos : ($\text{M}^+ - \text{Cl}$) = 177 y ($\text{M}^+ - \text{F}$) = 193.

10

Ejemplo de preparación general 2: preparación de la amida de fórmula (I) en el aparato Chemspeed™

En un vial de 13 ml Chemspeed™ se distribuyen 4 ml de una disolución 0,15 M de la amina (II) (0,60 mmol) en diclorometano seguido de 0,72 mmol de trietilamina. A un caudal de 1 mL/min, se añaden 2 mL de una disolución 0,30 molar del cloruro de acilo (IIIb) o (IIIe) (0,60 mmol) y la mezcla se agita entonces a temperatura ambiente toda la noche. A continuación se añade 1 ml de agua y la mezcla se vierte sobre un cartucho de alúmina básico (2 g) y se eluye con diclorometano. Se eliminan los disolventes y el derivado de amida en bruto se analiza por LCMS y RMN. Los compuestos con pureza insuficiente se purifican más por LCMS de preparación.

20

Ejemplo de preparación general 3: tionación de la amida de fórmula (I) en el aparato Chemspeed™

25

En un vial Chemspeed™ de 13 ml se pesan 0,27 mmoles pentasulfuro de fósforo (P_2S_5). Se añaden 3 ml de una disolución 0,18 M de la amida (I) (0,54 mmoles) en dioxano y la mezcla se calienta a reflujo durante dos horas. La temperatura se enfría a continuación a 80°C y se añaden 2,5 ml de agua. La mezcla se calienta a 80°C durante una hora más. Se añaden a continuación 2 ml de agua y la mezcla de reacción se extrae dos veces con 4 ml de diclorometano. La fase orgánica se deposita sobre un cartucho de alúmina básica (2 g) y se eluye dos veces con 8 ml de diclorometano. Se eliminan los disolventes y el derivado de tioamida en bruto se analiza por LCMS y RMN. Los compuestos con pureza insuficiente se purifican más por LCMS de preparación.

30

35

Ejemplo A: Ensayo preventivo *in vivo* en *Sphaerotheca fuliginea* (pepino)

Disolvente: 49 partes en peso de N,N-dimetilformamida

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicoléter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad preventiva, se pulverizan las plántulas con la preparación de compuesto activo en la relación de aplicación indicada. Después de que se ha secado el recubrimiento de pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas de *Sphaerotheca fuliginea*. Después, las plantas se colocan en un invernadero a aproximadamente 23°C y una humedad atmosférica relativa del 70%.

Se evaluaron los ensayos 7 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a aquella del control sin tratar, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa enfermedad.

En estas condiciones, se observa una protección de buena (al menos 75% de control de la enfermedad) a total (100% de control de la enfermedad) a una dosis de 500 ppm ppm de ingrediente activo con los compuestos siguientes de la tabla A:

Tabla A:

Ejemplo	Eficacia	Ejemplo	Eficacia	Ejemplo	Eficacia
12	95	45	100	90	100
13	90	49	94	91	95
15	83	50	98	98	96
17	94	52	80	99	95
18	90	53	95	103	91
19	84	55	83	108	85
20	94	56	95	112	95
22	80	65	85	116	75
24	89	68	100	117	95
26	88	70	100	118	95
28	85	71	91	125	100
29	93	72	98	162	88
32	95	73	98	169	89
33	96	74	95	175	95
35	86	75	100	177	93
36	93	76	93	191	100
38	89	78	93	192	100
39	95	82	94		
40	83	84	90		

En las mismas condiciones, se observa protección elevada (al menos 90%) a una dosis de 500 ppm de ingrediente activo con el compuesto 29, mientras que se observa una protección media (menos de 60%) con el compuesto del ejemplo 1.043 descrito en la solicitud de patente WO-2009/024342 como en la tabla A2.

Tabla A2:

Ejemplo	dosis (ppm)	Eficacia
29 de esta invención	500	93
1.043 de WO2009/024342	500	55

El ejemplo 1.043 descrito en la patente internacional WO-2009/024342 corresponde a N-[1-(2,3-diclorofenil)etil]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.

Estos resultados muestran que los compuestos según la invención tienen una actividad biológica mejor que los compuestos estructuralmente más próximos descritos en WO-2009/024342.

Ejemplo B: Ensayo preventivo in vivo en *Alternaria solani* (tomate)

Disolvente: 49 partes en peso de N,N-dimetilformamida

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicoléter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad preventiva, se pulverizan las plántulas con la preparación de compuesto activo en la relación de aplicación indicada. Un día después de este tratamiento, se inoculan las plantas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria solani*. Las plantas permanecen durante un día en una cabina de incubación a aproximadamente 22°C y a una humedad atmosférica relativa de 100%. Luego las plantas se colocan en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y a una humedad atmosférica relativa de 96%.

Se evaluaron los ensayos 7 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a aquella del control sin tratar, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa enfermedad.

En estas condiciones, se observa una protección de buena (al menos 70% de control de la enfermedad) a total (100% de control de la enfermedad) a una dosis de 500 ppm de ingrediente activo con los compuestos siguientes de la tabla B:

Tabla B:

Ejemplo	Eficacia	Ejemplo	Eficacia	Ejemplo	Eficacia
1	95	56	100	121	70
2	93	65	90	127	90
12	90	68	80	129	95
13	95	70	90	137	89
15	95	71	95	138	94
16	80	72	95	139	100
17	80	73	95	140	94
18	95	74	95	141	80
19	90	76	94	144	89
20	95	78	100	145	90
23	89	81	90	147	70
24	94	82	100	148	80
26	94	83	90	150	70
27	80	84	100	152	89
28	95	85	95	153	90
29	94	88	80	154	95
30	90	89	95	156	89
33	95	90	95	158	95
36	94	91	100	161	94
37	94	98	70	162	100
38	94	99	95	166	78
39	70	100	80	167	95
40	94	101	70	169	94
41	80	103	90	170	94
43	90	105	95	175	95
44	100	107	80	176	70
45	100	110	94	177	90
46	100	112	80	179	90
50	95	113	90	180	80
51	94	115	94	181	80
53	94	116	95	185	100
54	89	117	100	191	95
55	95	118	100	192	95

En las mismas condiciones, se observa una protección de excelente (al menos 95%) a elevada
5 (al menos 90%) a una dosis de 500 ppm y 100 ppm de ingrediente activo con el compuesto 129,
mientras que se observa una protección de buena (al menos 80%) a ninguna protección con el
compuesto del ejemplo 1.029 descrito en la solicitud de patente WO-2009/024342 como en la
tabla B2.

Tabla B2:

Ejemplo	dosis (ppm)	Eficacia
129 de esta invención	500	95
	100	90
1.029 de WO2009/024342	500	89
	100	0

El ejemplo 1.029 descrito en la patente internacional WO-2009/024342 corresponde a N-[1-(4-ciclohexilfenil)etil]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.

Estos resultados muestran que los compuestos según la invención tienen una actividad biológica mejor que los compuestos estructuralmente más próximos descritos en WO-2009/024342.

En las mismas condiciones, se observa una protección de elevada (al menos 90%) a excelente (al menos 95%) a una dosis de 500 ppm de ingrediente activo con el compuesto 28 y el compuesto 30 sin ningún daño en la planta, mientras que se observan daños en la planta del 100% con el compuesto del ejemplo 89 descrito en la solicitud de patente WO-2009/016221 como en la tabla B3.

Tabla B3:

Ejemplo	dosis (ppm)	Eficacia
28 de esta invención	500	95
30 de esta invención	500	90
89 de WO2009/016221	500	- (a)

nota a : 100% de daños de las plantas

El ejemplo 89 descrito en la patente internacional WO-2009/016221 corresponde a N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[1-(1-naftil)etil]-1H-pirazol-4-carboxamida.

Estos resultados muestran que los compuestos según la invención tienen una actividad biológica mejor que los compuestos estructuralmente más próximos descritos en WO-2009/016221.

En las mismas condiciones, se observa una protección de elevada (al menos 90%) a total a una dosis de 500 ppm de ingrediente activo con el compuesto 43 y el compuesto 45 sin ningún daño en la planta, mientras que se observa una protección deficiente (menor que 30%) al 90% de daños de la planta con los compuestos del ejemplo 236 y del ejemplo 263 descrito en la solicitud de patente WO-2007/087906 como en la tabla B4.

Tabla B4:

Ejemplo	dosis (ppm)	Eficacia
43 de esta invención	500	90
45 de esta invención	500	100
236 de WO2007/087906	500	30
263 de WO2007/087906	500	- ^(b)

nota b : 90% de daños de las plantas

- 5 El ejemplo 236 descrito en la patente internacional WO-2007/087906 corresponde a N-ciclopropil-N-(2,4-diclorobencil)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida y el ejemplo 263 descrito en la patente internacional WO-2007/087906 corresponde a N-ciclopropil-N-[1-(2,4-diclorofenil)etil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida.

Estos resultados muestran que los compuestos según la invención tienen una actividad biológica mejor que los compuestos estructuralmente más próximos descritos en WO-2007/087906.

Ejemplo C: Ensayo preventivo *in vivo* en *Pyrenophora teres* (cebada)

Disolvente: 49 partes en peso de N,N-dimetilacetamida

- 15 Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad preventiva, se pulverizan las plántulas con la preparación de compuesto activo en la relación de aplicación indicada. Un día después de este tratamiento, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas de *Pyrenophora teres*. Las plantas permanecen durante 48 horas en una cabina de incubación a 22°C y una humedad atmosférica relativa del 100%. Después, las plantas se colocan en un invernadero a una temperatura de aproximadamente 20°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 80%.

- 25 Los ensayos se evalúan 7-9 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a aquella del control sin tratar, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa enfermedad.

En estas condiciones, se observa una protección de buena (al menos 70% de control de la enfermedad) a total (100% de control de la enfermedad) a una dosis de 500 ppm de ingrediente activo con los compuestos siguientes de la tabla C:

Tabla C :

Ejemplo	Eficacia	Ejemplo	Eficacia	Ejemplo	Eficacia
1	95	71	95	128	80
2	94	72	100	129	100
5	89	73	100	131	94
6	78	74	100	133	95
12	100	75	100	135	95
13	95	78	100	139	70
15	95	79	95	140	80
16	100	80	100	141	100
17	100	82	95	142	95
18	100	84	100	148	95
20	95	85	100	149	70
24	100	87	95	150	100
27	100	89	100	152	95
28	100	90	100	153	80
29	100	91	95	154	100
30	100	92	70	156	90
31	100	93	95	157	90
33	100	94	80	158	100
36	100	99	95	159	95
38	95	101	80	161	90
39	95	103	70	162	100
40	95	104	78	166	80
43	100	105	94	167	90
44	100	106	90	169	100
45	100	107	100	170	95
46	100	108	94	174	75
50	95	110	80	175	100
51	80	112	95	177	100
53	95	113	80	179	100
55	100	115	90	180	100
56	100	116	100	181	100
61	100	117	100	182	95
62	100	118	100	185	95
64	95	121	94	187	90
65	94	123	70	188	95
67	90	125	95	191	100
68	100	126	95	192	100
70	100	127	90		

En las mismas condiciones, se observa una protección buena (al menos 70%) y excelente (al menos 95%) a una dosis de 500 ppm de ingrediente activo con los compuestos 123 y 135, mientras que no se observa protección o se observa una protección deficiente (menor que 30%) con los compuestos del ejemplo 145 y del ejemplo 146 descritos en la solicitud de patente CN1188764 como en la tabla C2.

Tabla C2:

Ejemplo	dosis (ppm)	Eficacia
123 de esta invención	500	70
135 de esta invención	500	95
145 de CN1188764	500	0
146 de CN1188764	500	20

El ejemplo 145 descrito en la patente internacional CN1188764 corresponde a 5-cloro-1,3-dimetil-N-[4-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida y el ejemplo 146 descrito en la patente internacional CN1188764 corresponde a N-(4-terc-butilbencil)-5-cloro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida.

Estos resultados muestran que los compuestos según la invención tienen una actividad biológica mejor que los compuestos estructuralmente más próximos descritos en CN1188764.

En las mismas condiciones, se observa una protección elevada (al menos 80%) a una dosis de 500 ppm de ingrediente activo con el compuesto 127 y el compuesto 128, mientras que no se observa protección con el compuesto del ejemplo 24 descrito en J. Korean Agric. Chem. Soc. (1992), 35(2), 87-91 como en la tabla C3.

Tabla C3:

Ejemplo	dosis (ppm)	Eficacia
127 de esta invención	500	90
128 de esta invención	500	80
24 de J.Korean.Agric. Chem.Soc (1992), 35, 87	500	0

El ejemplo 24 descrito en J. Korean Agric. Chem. Soc. (1992), 35(2), 87-91 corresponde a 5-cloro-N-(4-clorobencil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida

Estos resultados muestran que los compuestos según la invención tienen una actividad biológica mejor que los compuestos estructuralmente más próximos descritos en J. Korean Agric. Chem. Soc. (1992), 35(2), 87-91.

Ejemplo D: ensayo preventivo in vivo en *Leptosphaeria nodorum* (trigo)

Disolvente: 49 partes en peso de N,N-dimetilacetamida

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad preventiva, los brotes se pulverizan con una preparación del compuesto activo a la dosis de aplicación indicada. Un día después de este tratamiento, las

plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas de *Leptosphaeria nodorum*. Las plantas permanecen durante 48 horas en una cabina de incubación a 22°C y una humedad atmosférica relativa del 100%. Después, las plantas se colocan en un invernadero a una temperatura de aproximadamente 22°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 90%.

Los ensayos se evalúan 7-9 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a aquella del control sin tratar, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa enfermedad.

En estas condiciones, se observa protección de buena (al menos 70%) a excelente (al menos 95%) con una dosis de 500 ppm de ingrediente activo con los compuestos siguientes de la tabla D:

Tabla D :

Ejemplo	Eficacia	Ejemplo	Eficacia	Ejemplo	Eficacia
18	95	72	78	136	70
30	90	74	80	141	95
31	80	76	89	154	70
39	90	79	94	179	70
44	89	117	70	181	70
45	95	118	70	185	95
56	70	135	75	187	80

Ejemplo E: ensayo preventivo *in vivo* en *Puccinia triticina* (trigo)

Disolvente: 49 partes en peso de N,N-dimetilacetamida

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaryl poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo o combinación de compuestos activos se mezcla con cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad preventiva, las plántulas se pulverizan con la preparación del compuesto activo o combinación de compuesto activo con la dosis de aplicación indicada.

Después de que se ha secado el recubrimiento de pulverización, las plantas se pulverizan con una suspensión de esporas de *Puccinia triticina*. Las plantas permanecen durante 48 horas en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 100%.

Las plantas se colocan en el invernadero a una temperatura de aproximadamente 20°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 80%.

El ensayo se evalúa 8 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a aquella del control sin tratar, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa enfermedad.

En estas condiciones, se observa protección de buena (al menos 70 %) a total con una dosis de 500 ppm de ingrediente activo con los compuestos siguientes de la tabla E :

Tabla E:

Ejemplo	Eficacia	Ejemplo	Eficacia	Ejemplo	Eficacia
29	80	100	80	141	95
68	70	101	90	180	80
90	95	106	80	181	70
98	95	117	70	184	70
99	100	126	78	185	90

En las mismas condiciones, se observa una protección buena (al menos 80%) a una dosis de 500 ppm de ingrediente activo con el compuesto 29, mientras que no se observa protección con el compuesto del ejemplo 1.043 descrito en la solicitud de patente WO-2009/024342 como en la tabla E2.

Tabla E2:

Ejemplo	dosis (ppm)	Eficacia
29 de esta invención	500	80
1.043 de WO2009/024342	500	0

El ejemplo 1.043 descrito en la patente internacional WO-2009/024342 corresponde a N-[1-(2,3-diclorofenil)etil]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.

Estos resultados muestran que los compuestos según la invención tienen una actividad biológica mejor que los compuestos estructuralmente más próximos descritos en WO-2009/024342.

Ejemplo F : ensayo preventivo in vivo en *Septoria tritici* (trigo)

Disolvente: 49 partes en peso de N,N-dimetilacetamida

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo o combinación de compuestos activos se mezcla con cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad preventiva, las plántulas se pulverizan con la preparación del compuesto activo o combinación de compuesto activo con la dosis de aplicación indicada.

Después de que se ha secado el recubrimiento de pulverización, las plantas se pulverizan con una suspensión de esporas de *Septoria tritici*. Las plantas permanecen durante 48 horas en una cabina de incubación a aproximadamente 20°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 100% y después durante 60 horas a aproximadamente 15°C en una cabina de incubación translúcida a una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 100%.

Las plantas se colocan en el invernadero a una temperatura de aproximadamente 15°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 80%.

Se evaluaron los ensayos 21 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a aquella del control sin tratar, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa enfermedad.

En estas condiciones, se observa protección de buena (al menos 70 %) a total con una dosis de 500 ppm de ingrediente activo con los compuestos siguientes de la tabla F:

Tabla F:

Ejemplo	Eficacia
29	88
68	100
72	90
90	100
141	70
185	100

Ejemplo G : ensayo preventivo in vivo en *Blumeria graminis* (cebada)

Disolvente: 49 partes en peso de N,N-dimetilacetamida

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada del compuesto activo, 1 parte en peso del compuesto activo o combinación de compuestos activos se mezcla con cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para ensayar la actividad preventiva, las plántulas se pulverizan con la preparación del compuesto activo o combinación de compuesto activo con la dosis de aplicación indicada.

Después de que se ha secado el recubrimiento de pulverización, las plantas se espolvorearon con esporas de *Blumeria graminis f.sp. hordei*.

Las plantas se colocan en el invernadero a una temperatura de aproximadamente 18°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 80% para promover el desarrollo de las pústulas de mildiú.

Se evaluaron los ensayos 7 días después de la inoculación. 0% significa una eficacia que corresponde a aquella del control sin tratar, mientras que una eficacia del 100% significa que no se observa enfermedad.

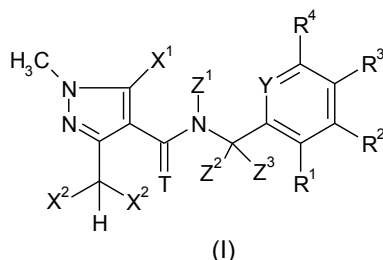
En estas condiciones, se observa protección total a una dosis de 500 ppm de ingrediente activo con los compuestos siguientes de la tabla G :

Tabla G :

Ejemplo	Eficacia
68	100
72	100
90	100
141	100
185	100

REIVINDICACIONES DE LA SOLICITUD DIVISIONAL DE LA SOLICITUD DE PATENTE NO. 13.122.457

1. Un compuesto de fórmula (I)



en la que

- Y representa N;
- T representa O;
- X¹ representa un átomo de cloro o de flúor;
- X², representa un átomo de flúor;
- Z¹ representa un átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₈ sustituido (con halógeno, ciano) o no sustituido; alcoxi(C₁-C₈) sin sustituir; alqueno(C₂-C₈) sin sustituir; alquino(C₂-C₈) sin sustituir; 3-oxetanilo sin sustituir; o 3-tietanilo sin sustituir;
- Z² y Z³, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; alquilo(C₁-C₈) sustituido con halógeno o sin sustituir; o Z³ y R¹ junto con los átomos de carbono consecutivos a los que están unidos forman un carbo- o hetero-ciclo parcialmente saturado, de 5, 6 ó 7 miembros, sustituido con alquilo C₁-C₈ o sin sustituir que comprende un heteroátomo seleccionado de un átomo de oxígeno o azufre y Z² es como se describe en la presente memoria; o Z² y Z³ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un cicloalquilo C₃-C₇ sin sustituir;
- R¹, R², R³, y R⁴, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo (C₁-C₈) sin sustituir; halogenoalquilo (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; halogenoalquil(C₁-C₈)sulfanilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo(C₃-C₇) sin sustituir; tri(alquil(C₁-C₈) sin

sustituir)sililo; fenilo que puede estar sustituido por hasta 7 átomos de halógeno; fenoxi que puede estar sustituido por hasta 7 átomos de halógeno; o

Dos sustituyentes vecinos R junto con los átomos de carbono consecutivos a los que están unidos forman un carbociclo saturado de 6 miembros sin sustituir y los otros sustituyentes R son como se describen en la presente memoria; o

R^1 y Z^3 junto con los átomos de carbono consecutivos a los que están unidos forman un carbo- o hetero-ciclo parcialmente saturado, de 5, 6 ó 7 miembros, sustituido con alquilo C_1-C_8 o sin sustituir que comprende un heteroátomo seleccionado de un átomo de oxígeno o azufre y R^2 a R^4 son como se describen en la presente memoria;

así como sales, y sus isómeros ópticamente activos o geométricos.

2 . Un compuesto según la reivindicación 1 en donde X^1 representa un átomo de flúor.

3. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, en el que Z^1 representa un átomo de hidrógeno.

4. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que Z^1 representa un metilo o un etilo.

5. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, en donde Z^2 y Z^3 representan independientemente un átomo de hidrógeno o un metilo.

6. Un compuesto según la reivindicación 5, en donde Z^2 representa un átomo de hidrógeno y Z^3 representa un átomo de hidrógeno o un metilo;

7. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 en donde R^1 , R^2 , R^3 , y R^4 , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo(C_1-C_8) sin sustituir; halogenoalquilo(C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo(C_3-C_7) sin sustituir; tri(alquil(C_1-C_8))sililo; o un halogenoalquil(C_1-C_8)-sulfanilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes.

8. Un compuesto según la reivindicación 7 en donde el sustituyente R^1 representa un átomo de halógeno; alquilo(C_1-C_8); halogenoalquilo(C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo(C_3-C_7); tri(alquil(C_1-C_8))sililo o halogenoalquil(C_1-C_8)sulfanilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes.

9. Un compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 en donde los sustituyentes R^1 y R^4 , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de halógeno; alquilo(C_1-C_8); halogenoalquilo(C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo(C_3-C_7); tri(alquil(C_1-C_8))sililo o halogenoalquil(C_1-C_8)sulfanilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes.

RESUMEN

La presente invención se refiere a derivados de N-bencil carboxamidas heterocíclicas o a sus derivados de tiocarboxamidas, a su proceso de preparación, a su utilización como agentes fungicidas, particularmente en forma de composiciones, y a métodos para el control de hongos fitopatógenos, principalmente de plantas, que utilizan estos compuestos o composiciones.

POWER OF ATTORNEY

The undersigned.

Bayer Intellectual Property GmbH

located at

**Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim,
Germany**

declares that it hereby grants to

**ÁLVARO CORREA-ORDÓÑEZ and/or
RICARDO METKE MENDEZ and/or JUAN PABLO
CONCHIA-DELGADO**

of the firm Baker & McKenzie Colombia S.A members of
Baker & McKenzie, domiciled at Av. 82 No. 10-62, 6th floor, of
Bogotá D.C., Colombia, full and sufficient power of attorney to
pursue before the competent authorities the following matters:

Trademark registrations and renewals; deposit and
registration of commercial names and commercial ensigns;
registration and renewal of domain names; Prosecution and
obtainment of patents, utility models, industrial designs,
integrated circuits layout-designs and vegetal varieties;
records of mergers, changes of name, assignments,
changes of domicile and address; security interests; liens
and other acts that affect or limit the mentioned industrial
property rights; filing and prosecution of oppositions;
recordal of license of use agreements; filing and prosecution
of cancellation actions, annulment actions, annulment and
reinstatement of right action, and all judicial actions
available for the prosecution of proceedings related to
intellectual property matters, unfair competition, and
protection of consumers.

to which end it empowers them to file requests, petitions and
lawsuits, appeals and objections, pay taxes, receive, including
faculties to enter into settlement agreements, conciliations and
transactions, abandon applications and renounce rights and, in
general, to take all the actions before the competent authorities
in order to duly protect our intellectual property. To the said
mandatories sufficient power is granted hereby to receive
notifications for and on behalf of the Company, to confer
powers on those who are to represent the Company judicially
and extrajudicially, to answer in court in the matter of all claims
and demands that may be presented in connection with the
marks and other intellectual property rights, and to do
everything that may be required before administrative or
judicial officers of any class to comply this power, giving them
likewise faculty to substitute these presents and revoke such
substitutions if necessary.

Done and subscribed in

Leverkusen

ppa. Dr. Stephan Semrau, (Senior Counsel)

On the

24th

day of

April of 2013

PODER

La abajo firmada,

Bayer Intellectual Property GmbH

domiciliada en

**Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim,
Alemania**

declara por el presente que otorga a

**ÁLVARO CORREA-ORDÓÑEZ y/o RICARDO METKE
MÉNDEZ y/o JUAN PABLO CONCHIA-DELGADO**

de la firma Baker & McKenzie Colombia S.A., miembros de Baker &
McKenzie, domiciliada en la Av. 82 No. 10-62 Piso 6 en Bogotá D.C.,
Colombia, poder especial amplio y suficiente, para adelantar ante las
autoridades competentes los siguientes asuntos:

Registro y renovación de marcas; depósito y registro de nombres
comerciales y enseñas comerciales; registro y renovación de
nombres de dominio; trámite y obtención de solicitudes de patentes
de invención, modelos de utilidad, diseños industriales, esquemas
de trazado de circuitos integrados y variedades vegetales;
inscripción de fusiones, cambios de nombre, traspasos, cambios de
domicilio y de dirección; inscripción de contratos de prenda,
embargos y otros actos que afecten o limiten los mencionados
derechos de propiedad industrial; presentación y tramitación de
oposiciones; inscripción de licencias de uso; presentación y
tramitación de acciones de cancelación; acciones de nulidad,
acciones de nulidad y restablecimiento del derecho y demás
acciones judiciales, relacionadas con procesos de propiedad
industrial, competencia desleal y protección al consumidor.

a cuyo efecto los faculta para presentar solicitudes, peticiones y
demandas, interponer recursos, reclamos, pagar impuestos y tasas,
recibir, transigir y desistir, incluyendo facultades para entrar en
acuerdos amigables, conciliaciones y transacciones, abandonar
solicitudes y renunciar a derechos, y en general, a dar ante las
autoridades competentes todos los pasos necesarios para la debida
protección de nuestra propiedad industrial. Asimismo se concede a los
expresados mandatarios poder suficiente para recibir notificaciones a
nombre de la compañía, otorgar poderes a quienes vayan a representar
a la compañía judicial y extrajudicialmente, responder en juicio a todas
las reclamaciones o demandas que por motivo de marcas y otros
derechos de propiedad industrial se presenten y hacer cuanto fuere
necesario ante las autoridades administrativas o judiciales de cualquier
orden para el cumplimiento de este mandato, dándoles igualmente
facultad para sustituir el presente poder y en caso necesario, revocar
dichas sustituciones.

Dado y firmado en

A los

días del mes de

de 20

1. I certify that the individual, named

Mr. Dr. Stephan Semrau, business address: c/o Bayer Intellectual Property GmbH,
Alfred-Nobel-Straße 10, 40789 Monheim, Germany,

appeared before me and executed the foregoing document and signed personally

- personally known to me -.

I confirm that Mr. Dr. Stephan Semrau is authorised representative of Bayer Intellectual Property GmbH in Monheim and having today electronically inspected the commercial register of the local court in Düsseldorf is recorded in Section B 67604 as severally authorised representative.

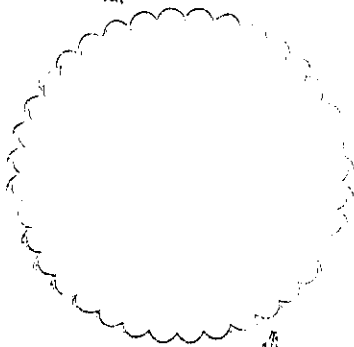
2. Ich beglaubige die vor mir vollzogene Unterschrift von :

Herrn Dr. Stephan Semrau, geschäftsansässig: c/o Bayer Intellectual Property GmbH, Alfred-Nobel-Straße 10, 40789 Monheim, Deutschland,

- von Person bekannt -.

Ich bescheinige aufgrund elektronischer Einsicht vom heutigen Tage in das Handelsregister des Amtsgerichts Düsseldorf - HRB 67604 -, dass Herr Dr. Stephan Semrau berechtigt ist, die Bayer Intellectual Property GmbH in Monheim als Prokurist einzeln zu vertreten.

Leverkusen, den 24. April 2013



Klaus Striewski
(Notar in Leverkusen)

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland

Diese öffentliche Urkunde

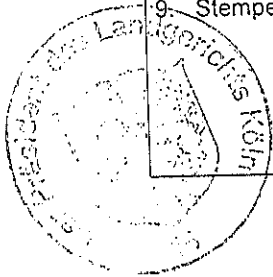
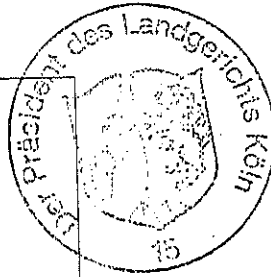
2. ist unterschrieben von Klaus Striewski
3. in seiner Eigenschaft als Notar
4. sie ist versehen mit dem Siegel des Notars Klaus Striewski

Bestätigt

5. in Köln
6. am 02.05.2013
7. durch den Vizepräsidenten des Landgerichts
8. unter Nr.: 2341/13
9. Stempel:

10. Unterschrift:

Schmitz-Justen



3. Certifico la firma realizada ante mí por

el Señor Dr. Stephen Semrau, con domicilio comercial: c/o Bayer Intellectual Property, GmbH, Alfred Nobel Strasse 10, 40789 Monheim, Deutschland,

-conocido personalmente-

Certifico con base en la revisión electrónica realizada el día de hoy en el Registro Mercantil del Tribunal de Distrito de Düsseldorf –HRB 67604– que el Señor Dr. Semrau está autorizado a representar como Director Ejecutivo a la firma Bayer Intellectual Property GmbH en Monheim.

Leverkusen, abril 24 de 2013

(Firmado)

Klaus Striewski

(Firma ilegible)

A p o s t i l l a
(Convención de La Haya de 5 de octubre de 1961)

1. País: Alemania Federal

Este documento público

2. Es firmado por: Klaus Striewski

3. En su calidad de Notario

4. Está provisto con el sello del

Notario Kluas Striewski

certificado notarialmente

5. En: Colonia,

6. A: los 2 días del mes de mayo de 2013

7. Por el Vicepresidente de la Audiencia Provincial del Land

8. Con el número 2341/13

9. Sello: (Sello de tinta de la Presidencia de la Audiencia Provincial de Colonia 1)

10. Firmado:

Schmitz-Justen (Firma ilegible)

ASSIGNMENT

BENTING, Jürgen
CRISTAU, Pierre
DESBORDES, Philippe
GARY, Stéphanie
GREUL, Jörg
HELMKE, Hendrik

by means of this document assign(s) to

Bayer Intellectual Property GmbH

A company organized under the laws of

Germany

Domiciled in

**Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim,
Germany**

all my (our) rights, title and interest in and to my (our)
invention entitled and as fully set forth and described in:

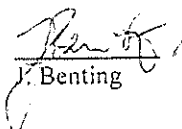
**N-BENZYL HETEROCYCLIC
CARBOXAMIDES**

So far as the Republic of Colombia is concerned and any
other country in which the application is filed.

Done and subscribed in *Monheim*

On the *15th* day of *May* of 20 *13*

Signature of the inventors


J. Benting

P. Cristau

P. Desbordes

S. Gary

J. Greul

H. Helmke

CESION

BENTING, Jürgen
CRISTAU, Pierre
DESBORDES, Philippe
GARY, Stéphanie
GREUL, Jörg
HELMKE, Hendrik

por medio de la presente cedo (cedemos) a

Bayer Intellectual Property GmbH

Una compañía organizada bajo las leyes de

Alemania

domiciliada en

**Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim,
Alemania**

todos mis (nuestros) derechos, título e interés sobre mi
(nuestra) invención titulada y tal como describe en:

**N-BENCIL CARBOXAMIDAS
HETEROCÍCLICAS**

en lo que concierne a la República de Colombia y cualquier
otro país del mundo en donde se presente la solicitud.

Dado y firmado en

A los días del mes de de 20

Firma de los inventores

ASSIGNMENT

BENTING, Jürgen
CRISTAU, Pierre
DESBORDES, Philippe
GARY, Stéphanie
GREUL, Jörg
HELMKE, Hendrik

by means of this document assign(s) to

Bayer Intellectual Property GmbH

A company organized under the laws of

Germany

Domiciled in

**Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim,
Germany**

all my (our) rights, title and interest in and to my (our)
invention entitled and as fully set forth and described in:

**N-BENZYL HETEROCYCLIC
CARBOXAMIDES**

So far as the Republic of Colombia is concerned and any
other country in which the application is filed.

Done and subscribed in

On the _____ day of _____ of 20____

Signature of the inventors

J. Benting

P. Cristau

P. Desbordes

S. Gary

J. Greul

H. Helmke

CESION

BENTING, Jürgen
CRISTAU, Pierre
DESBORDES, Philippe
GARY, Stéphanie
GREUL, Jörg
HELMKE, Hendrik

por medio de la presente cedo (cedemos) a

Bayer Intellectual Property GmbH

Una compañía organizada bajo las leyes de

Alemania

domiciliada en

**Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim,
Alemania**

todos mis (nuestros) derechos, título e interés sobre mi
(nuestra) invención titulada y tal como describe en:

**N-BENCIL CARBOXAMIDAS
HETEROCÍCLICAS**

en lo que concierne a la República de Colombia y cualquier
otro país del mundo en donde se presente la solicitud.

Dado y firmado en

A los _____ días del mes de _____ de 20____

Firma de los inventores

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCTNOTIFICATION OF THE RECORDING
OF A CHANGE(PCT Rule 92bis.1 and
Administrative Instructions, Section 422)

To:

GUITTON, Carole
BAYER SAS
Patents & Licensing Department
14 impasse Pierre Baizet
CS 99163
F-69263 LYON cedex 09
FRANCE

Date of mailing (day/month/year) 21 May 2013 (21.05.2013)	IMPORTANT NOTIFICATION
Applicant's or agent's file reference BCS 10-4019	
International application No. PCT/EP2011/068288	International filing date (day/month/year) 20 October 2011 (20.10.2011)

1. The following indications appeared on record concerning:		
☒ the applicant	☐ the inventor	☐ the agent
☐ the common representative		
Name and Address BAYER CROPSOURCE AG Alfred-Nobel-Strasse 50 40789 Monheim Germany	State of Nationality DE	State of Residence DE
	Telephone No.	
	Facsimile No.	
	E-mail address	
2. The International Bureau hereby notifies the applicant that the following change has been recorded concerning:		
☒ the person	☐ the name	☐ the address
☐ the nationality		
☐ the residence		
Name and Address BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH Alfred-Nobel-Strasse 10 40789 Monheim Germany	State of Nationality DE	State of Residence DE
	Telephone No.	
	Facsimile No.	
	E-mail address ☐ Notifications by e-mail authorized	
3. Further observations, if necessary:		
4. A copy of this notification has been sent to:		
☒ the receiving Office	☐ the International Preliminary Examining Authority	
☐ the International Searching Authority	☒ the designated Offices concerned	
☐ the Authority(ies) specified for supplementary search	☐ the elected Offices concerned	
	☐ other:	

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer Blanc Veronique e-mail pt06.pct@wipo.int Telephone No. +41 22 338 74 06
Facsimile No. +41 22 338 82 70	