

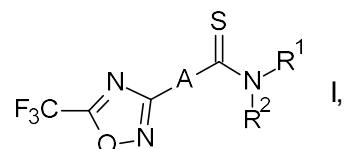
OXADIAZOLES SUSTITUIDOS PARA COMBATIR HONGOS FITOPATÓGENOS

La presente invención se refiere a trifluorometiloxadiazoles novedosos de la Fórmula I, o un N-óxido, y/o sus sales útiles en la agricultura; a su uso para controlar hongos fitopatógenos; a un método para combatir hongos fitopatógenos dañinos, en donde el proceso comprende tratar los hongos o las plantas, el suelo o las semillas que se desean proteger del ataque fúngico, con una cantidad eficaz de al menos un compuesto de la Fórmula I, o un N-óxido, o una sal de aquel aceptable en la agricultura; a composiciones agroquímicas que comprenden al menos dicho compuesto; y a composiciones agroquímicas que también comprenden semillas.

WO 2017/055469 A1 y WO 2017/055473 A1 describen derivados de trifluorometiloxadiazoles y su uso para combatir microorganismos fitopatógenos. WO 2015/185485 A1 describe derivados similares de trifluorometiloxadiazoles y se refiere a su uso para combatir microorganismos fitopatógenos. EP 276432 A2 se refiere a derivados de 3-fenil-5-trifluorometiloxadiazol y a su uso para combatir microorganismos fitopatógenos. WO 97/30047 A1 describe algunos análogos de trifluorometiloxadiazol con actividad fungicida, en donde el grupo trifluorometiloxadiazol y un grupo funcional amida se unen a un anillo de fenilo en una relación *orto*.

En varios casos, en particular, con bajas tasas de aplicación, la actividad fungicida de los compuestos fungicidas conocidos no es satisfactoria. Por ello, un objeto de la presente invención es proveer compuestos que tengan mejor actividad y/o un espectro de actividad más amplio contra hongos fitopatógenos. Este objetivo se logra mediante el uso de oxadiazoles de la Fórmula I y/o sus sales útiles en la agricultura para controlar los hongos fitopatógenos.

En consecuencia, la presente invención se refiere a compuestos de la Fórmula I, o a los N-óxidos, o a las sales de aquellos aceptables en la agricultura,



en donde:

- A es fenilo o tiofenilo; y en donde los grupos cíclicos A son no sustituidos o sustituidos con 1, 2, 3 o 4 grupos R^A idénticos o diferentes; en donde R^A es OH, ciclopropilo, halógeno, ciano, diC₁-C₆-alquilamino, C₁-C₆-alquilo,

C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo o C₃-C₈-cicloalcoxi; y en donde cualquiera de las porciones alifáticas o cíclicas es no sustituida o sustituida con 1, 2, 3 o 4 grupos R^a idénticos o diferentes; en donde

R^a es halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi;

R¹, R² son, independientemente entre sí, hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, C₁-C₄-alcoxi, -C(=O)-(C₁-C₆-alquilo), -C(=O)-(C₁-C₆-alcoxi), fenil-C₁-C₄-alquilo, heteroaril-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo, fenilo, naftilo o un heterociclo monocíclico o bicíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 3 a 10 miembros, en donde los átomos miembros del anillo de dicho heterociclo monocíclico o bicíclico incluyen, además de átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos adicionales seleccionados de N, O y S como átomos miembros del anillo, y en donde 1 o 2 átomos miembros del anillo del heterociclo se pueden reemplazar por 1 o 2 grupos seleccionados independientemente de -C(=O)- y -C(=S)-; y en donde el grupo heteroarilo en heteroaril-C₁-C₄-alquilo es un heterociclo aromático de 5 o 6 miembros, en donde los átomos miembros del anillo heterocíclico incluyen, además de átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O y S como átomos miembros del anillo; y en donde cualquiera de los grupos alifáticos o cíclicos antes mencionados es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes;

o R¹ y R², junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclo monocíclico o bicíclico saturado o parcialmente insaturado de 3 a 10 miembros, en donde el heterociclo incluye, además de un átomo de nitrógeno y uno o más átomos de carbono, 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente de N, O y S como átomos miembros del anillo; y en donde uno o dos grupos CH₂ del heterociclo se pueden reemplazar por uno o dos grupos seleccionados independientemente del grupo de -C(=O)- y -C(=S)-; y en donde el heterociclo es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes; en donde

R^{1a} es halógeno, ciano, NO₂, OH, SH, NH₂, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio, C₃-C₈-cicloalquilo, -NHSO₂-C₁-C₄-alquilo, -(C=O)-C₁-C₄-alquilo, -C(=O)-C₁-C₄-

alcoxi o C₁-C₆-alquilsulfonilo, hidroxíC₁-C₄-alquilo, -C(=O)-NH₂, -C(=O)-NH(C₁-C₄-alquilo), C₁-C₄-alquiltio-C₁-C₄-alquilo, aminoC₁-C₄-alquilo, C₁-C₄-alquilamino-C₁-C₄-alquilo, diC₁-C₄-alquilamino-C₁-C₄-alquilo, aminocarbonil-C₁-C₄-alquilo o C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo.

Las sales útiles en la agricultura de los compuestos I abarcan, en especial, las sales de los cationes o las sales de adición ácida de los ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen ningún efecto adverso en la acción fungicida de los compuestos I. Por ende, los cationes adecuados son, en particular, los iones de los metales alcalinos, preferentemente, sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, preferentemente, calcio, magnesio y bario, de los metales de transición, preferentemente, manganeso, cobre, zinc y hierro, y también el ion de amonio que, si se desea, se puede sustituir con 1 a 4 sustituyentes de C₁-C₄-alquilo y/o un sustituyente de fenilo o bencilo, preferentemente, diisopropilamonio, tetrametilamonio, tetrabutilamonio, trimetilbencilamonio, y también iones de fosfonio, iones de sulfonio, preferentemente, tri(C₁-C₄-alquil)sulfonio y iones de sulfoxonio, preferentemente, tri(C₁-C₄-alquil)sulfoxonio.

Los aniones de sales de adición ácida útiles son, principalmente, cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogenosulfato, sulfato, dihidrogenofosfato, hidrogenofosfato, fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato y los aniones de ácidos C₁-C₄-alcanoicos, preferentemente, formiato, acetato, propionato y butirato. Se pueden formar haciendo reaccionar un compuesto I con un ácido del anión correspondiente, preferentemente, de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

Los compuestos I pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros que surgen de la rotación restringida alrededor de un enlace simple de grupos asimétricos e isómeros geométricos. Una persona del oficio de nivel medio comprenderá que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede exhibir efectos beneficiosos cuando se enriquece con respecto a los otros estereoisómeros o cuando se separa de los otros estereoisómeros. Además, la persona del oficio de nivel medio sabe cómo separar, enriquecer y/o preparar selectivamente estos estereoisómeros. Los compuestos de la invención pueden estar presentes como una mezcla de estereoisómeros, por ejemplo, un racemato, estereoisómeros individuales o como una forma ópticamente activa.

Los compuestos de la Fórmula I pueden estar presentes en diferentes

modificaciones de cristal cuya actividad biológica puede diferir. También forman parte del objeto de la presente invención. Los compuestos de la Fórmula I pueden estar presentes en atropisómeros que surgen de la rotación restringida alrededor de un enlace simple de grupos asimétricos. También forman parte del objeto de la presente invención.

Con respecto a las variables, las formas de realización de los intermediarios obtenidas durante la preparación de los compuestos I corresponden a las formas de realización de los compuestos de la Fórmula I. El término "compuestos I" se refiere a compuestos de la Fórmula I.

En las definiciones de las variables indicadas anteriormente, se usan términos colectivos que son, en general, representativos de los sustituyentes en cuestión. El término " C_n-C_m " indica la cantidad de átomos de carbono posibles en cada caso en el sustituyente o en la porción del sustituyente en cuestión:

Las porciones que tienen dos o más posibilidades de unirse se aplican de la siguiente manera:

Las porciones que no tienen paréntesis en el nombre están unidas mediante la última porción, por ejemplo, heteroaril- C_1-C_4 -alquilo está unido mediante C_1-C_4 -alquilo, etc.

Las porciones que tienen paréntesis en el nombre están unidas mediante la primera porción, por ejemplo, $C(=O)-(C_1-C_6\text{-alquilo})$ está unido mediante $C=O$, etc.

El término "halógeno" se refiere a flúor, cloro, bromo y yodo.

El término " C_1-C_6 -alquilo" se refiere a un grupo hidrocarburo saturado de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo y 1,1-dimetiletilo.

El término " C_1-C_6 -haloalquilo" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono (como se definió anteriormente), en donde algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos se pueden reemplazar por los átomos de halógeno antes mencionados, por ejemplo, clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo y pentafluoroetilo, 2-fluoropropilo, 3-fluoropropilo, 2,2-difluoropropilo, 2,3-difluoropropilo, 2-cloropropilo, 3-cloropropilo, 2,3-dicloropropilo, 2-bromopropilo, 3-bromopropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 3,3,3-tricloropropilo, $CH_2C_2F_5$, $CF_2C_2F_5$, $CF(CF_3)_2$, 1-(fluorometil)-2-fluoroetilo, 1-

(clorometil)-2-cloroetilo, 1-(bromometil)-2-bromoetilo, 4-fluorobutilo, 4-clorobutilo, 4-bromobutilo o nonafluorobutilo.

El término " C_1 - C_6 -alcoxi" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono (como se definió anteriormente), que se une mediante un oxígeno, en cualquier posición del grupo alquilo, por ejemplo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, butoxi, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi o 1,1-dimetiletoxi.

El término " C_1 - C_6 -haloalcoxi" se refiere a un grupo C_1 - C_6 -alcoxi como se definió anteriormente, en donde algunos o todos los átomos de hidrógeno se pueden reemplazar por átomos de halógeno, como se mencionó anteriormente, por ejemplo, OCH_2F , $OCHF_2$, OCF_3 , OCH_2Cl , $OCHCl_2$, $OCCL_3$, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-iodoetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, OC_2F_5 , 2-fluoropropoxi, 3-fluoropropoxi, 2,2-difluoropropoxi, 2,3-difluoropropoxi, 2-cloropropoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 2-bromopropoxi, 3-bromopropoxi, 3,3,3-trifluoropropoxi, 3,3,3-tricloropropoxi, $OCH_2-C_2F_5$, $OCF_2-C_2F_5$, 1-(CH_2F)-2-fluoroetoxi, 1-(CH_2Cl)-2-cloroetoxi, 1-(CH_2Br)-2-bromoetoxi, 4-fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, 4-bromobutoxi o nonafluorobutoxi.

Los términos "fenil- C_1 - C_4 -alquilo o heteroaril- C_1 - C_4 -alquilo" se refieren a un alquilo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono (como se definieron anteriormente), en donde un átomo de hidrógeno del radical alquilo se reemplaza por un radical fenilo o un radical heteroarilo respectivamente.

El término " C_1 - C_4 -alcoxi- C_1 - C_4 -alquilo" se refiere a alquilo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono (como se definió anteriormente), en donde un átomo de hidrógeno del radical alquilo se reemplaza por un grupo C_1 - C_4 -alcoxi (como se definió anteriormente). Asimismo, el término " C_1 - C_4 -alquiltio- C_1 - C_4 -alquilo" se refiere a alquilo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono (como se definió anteriormente), en donde un átomo de hidrógeno del radical alquilo se reemplaza por un grupo C_1 - C_4 -alquiltio.

El término " C_1 - C_6 -alquiltio", como se usa en la presente, se refiere a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 6 átomos de carbono (como se definió anteriormente) unidos mediante un átomo de azufre. En consecuencia, el término " C_1 - C_6 -haloalquiltio", como se usa en la presente, se refiere a un grupo haloalquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono (como se definió anteriormente) unidos mediante un átomo de azufre, en cualquier posición

del grupo haloalquilo.

El término "C₁-C₆-alquilsulfinilo" se refiere a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 6 átomos de carbono (como se definió anteriormente) unidos mediante una porción -S(=O)-, en cualquier posición del grupo alquilo, por ejemplo, metilsulfinilo, etilsulfinilo y similares. En consecuencia, el término "C₁-C₆haloalquilsulfinilo" se refiere a un grupo haloalquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono (como se definió anteriormente) unidos mediante una porción -S(=O)-, en cualquier posición del grupo haloalquilo.

El término "C₁-C₆-alquilsulfonilo" se refiere a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada que tienen de 1 a 6 átomos de carbono (como se definió anteriormente) unidos mediante una porción -S(=O)₂-, en cualquier posición del grupo alquilo, por ejemplo, metilsulfonilo. En consecuencia, el término "C₁-C₆haloalquilsulfonilo" se refiere a un grupo haloalquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 6 átomos de carbono (como se definió anteriormente) unidos mediante una porción -S(=O)₂-, en cualquier posición del grupo haloalquilo.

El término "hidroxiC₁-C₄-alquilo" se refiere a alquilo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, en donde un átomo de hidrógeno del radical alquilo se reemplaza por un grupo OH.

El término "aminoC₁-C₄-alquilo" se refiere a alquilo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, en donde un átomo de hidrógeno del radical alquilo se reemplaza por un grupo NH₂.

El término "diC₁-C₆-alquilamino" se refiere a un grupo amino, que se sustituye con dos residuos seleccionados independientemente del grupo que se define mediante el término C₁-C₆-alquilo.

El término "C₁-C₄-alquilamino-C₁-C₄-alquilo" se refiere a alquilo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono (como se definió anteriormente), en donde un átomo de hidrógeno del radical alquilo se reemplaza por un grupo C₁-C₄-alquil-NH- que está unido a través del nitrógeno. Asimismo, el término "diC₁-C₄-alquilamino-C₁-C₄-alquilo" se refiere a alquilo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono (como se definió anteriormente), en donde un átomo de hidrógeno del radical alquilo se reemplaza por un grupo (C₁-C₄-alquil)₂N- que está unido a través del nitrógeno.

El término "aminocarbonil-C₁-C₄-alquilo" se refiere a alquilo que tiene de 1 a 4 átomos de carbono, en donde un átomo de hidrógeno del radical alquilo se reemplaza por un grupo -(C=O)-NH₂.

El término "C₂-C₆-alquenilo" se refiere a un radical hidrocarburo insaturado de

cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y un enlace doble en cualquier posición, por ejemplo, etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo (alilo), 1-metiletlenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo.

El término " C_2 - C_6 -alquinilo" se refiere a un radical hidrocarburo insaturado de cadena lineal o ramificada que tiene de 2 a 6 átomos de carbono y que contiene al menos un enlace triple, tal como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo (propargilo), 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo.

El término " C_3 - C_8 -cicloalquilo" se refiere a un radical hidrocarburo monocíclico saturado que tiene de 3 a 8 miembros del anillo de carbono, tales como ciclopropilo (C_3H_5), ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo o ciclooctilo.

El término " C_3 - C_8 -cicloalquiloxi" se refiere a un radical cicloalquilo que tiene de 3 a 8 átomos de carbono (como se definió anteriormente), que está unido mediante un oxígeno.

El término " $C(=O)$ - C_1 - C_4 -alquilo" se refiere a un radical que está unido a través del átomo de carbono del grupo $-C(=O)-$, según se indica por la cantidad de valencias del átomo de carbono.

El término "alifático" se refiere a compuestos o radicales compuestos de carbono e hidrógeno, y que son compuestos no aromáticos. Un radical o compuesto alicíclico es un compuesto orgánico que es alifático y cíclico. Contienen uno o más de todos los anillos de carbono que pueden ser saturados o insaturados, pero no tienen carácter aromático.

Las expresiones "porción cíclica" o "grupo cíclico" se refieren a un radical que es un anillo alicíclico o un anillo aromático, tal como fenilo o heteroarilo.

La expresión "y en donde cualquiera de los grupos alifáticos o cíclicos es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes" se refiere a grupos alifáticos, grupos cíclicos y grupos que contienen una porción alifática y cíclica en un grupo, tal como en fenil- C_1 - C_4 -alquilo; por lo tanto, un grupo que contiene una porción alifática y cíclica, en donde ambas porciones pueden ser sustituidas o no sustituidas independientemente entre sí.

El término "arilo" se refiere a sistemas de anillos monocíclicos o policíclicos aromáticos que pueden o no incluir, además de átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados independientemente del grupo que consiste en N, O y S.

El término "heteroarilo" se refiere a sistemas de anillos monocíclicos o policíclicos aromáticos que incluyen, además de átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4

heteroátomos seleccionados independientemente del grupo que consiste en N, O y S.

El término “fenilo” se refiere a un sistema de anillos aromáticos que incluye seis átomos de carbono (comúnmente denominados anillo de benceno). En relación con el grupo A, el término “fenilo” se debe interpretar como un anillo de benceno o un anillo de fenileno, que está unido a ambos, la porción oxadiazol y el grupo $-C(=S)NR^1R^2$.

La expresión "heterociclo mono- o bicíclico saturado, parcialmente insaturado o aromático de 3 a 10 miembros", en donde los átomos miembros del anillo de dicho heterociclo mono- o bicíclico incluyen, además de átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos adicionales seleccionados de N, O y S como átomos miembros del anillo", significa tanto sistemas de anillos heteroaromáticos mono- y bicíclicos aromáticos, como heterociclos saturados y parcialmente insaturados, por ejemplo: un heterociclo saturado de 3 o 4 miembros que contiene 1 o 2 heteroátomos del grupo que consiste en O, N y S como miembros del anillo, tales como oxirano, aziridina, tiirano, oxetano, azetidina, tietano, [1,2]dioxetano, [1,2]ditietano, [1,2]diazetidina; y un heterociclo saturado o parcialmente insaturado de 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos del grupo que consiste en N, O y S como miembros del anillo, tales como 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-

dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ilo y también los radicales -ilideno correspondientes; y

un heterociclo saturado o parcialmente insaturado de 7 miembros, tal como tetra- e hexahidroazepinilo, tal como 2,3,4,5-tetrahidro[1H]azepin-1-,-2-,-3-,-4-,-5-,-6- o -7-ilo, 3,4,5,6-tetrahidro[2H]azepin-2-,-3-,-4-,-5-,-6- o -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H]azepin-1-,-2-,-3-,-4-,-5-,-6- o -7-ilo, 2,3,6,7-tetrahidro[1H]azepin-1-,-2-,-3-,-4-,-5-,-6- o -7-ilo, hexahidroazepin-1-,-2-,-3- o -4-ilo, tetra- y hexahidrooxepinilo, tal como 2,3,4,5-tetrahidro[1H]oxepin-2-,-3-,-4-,-5-,-6- o -7-ilo, 2,3,4,7-tetrahidro[1H]oxepin-2-,-3-,-4-,-5-,-6- o -7-ilo, 2,3,6,7-tetrahidro[1H]oxepin-2-,-3-,-4-,-5-,-6- o -7-ilo, hexahidroazepin-1-,-2-,-3- o -4-ilo, tetra- y hexahidro-1,3-diazepinilo, tetra- y hexahidro-1,4-diazepinilo, tetra- y hexahidro-1,3-oxazepinilo, tetra- y hexahidro-1,4-oxazepinilo, tetra- y hexahidro-1,3-dioxepinilo, tetra- y hexahidro-1,4-dioxepinilo y los radicales -ilideno correspondientes; y

la expresión “heteroarilo de 5 o 6 miembros” o la expresión “heterociclo aromático de 5 o 6 miembros” se refieren a sistemas de anillos aromáticos que incluyen, además de átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados independientemente del grupo que consiste en N, O y S, por ejemplo, un heteroarilo de 5 miembros, tal como pirrol-1-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, tien-2-ilo, tien-3-ilo, furan-2-ilo, furan-3-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, pirazol-5-ilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, imidazol-5-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, 1,2,4-triazolil-1-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-5-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo y 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo; o

un heteroarilo de 6 miembros, tal como piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo, pirazin-2-ilo y 1,3,5-triazin-2-ilo y 1,2,4-triazin-3-ilo.

Con respecto a las variables, las formas de realización de los intermediarios corresponden a las formas de realización de los compuestos I. Se prefieren los compuestos I y, si corresponde, también los compuestos de todas las subfórmulas

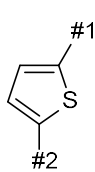
proporcionadas en la presente, por ejemplo, fórmulas (I.1) a (I.8).

Con respecto a las variables, las formas de realización de los intermediarios corresponden a las formas de realización de los compuestos I. Se prefieren los compuestos I y, cuando corresponda, también los compuestos de todas las subfórmulas proporcionadas en la presente, por ejemplo, las Fórmulas (I.1) a (I.8), en donde las variables, tales como R^1 , R^2 , A, R^A , R^a y R^{1a} tienen, independientemente entre sí o, con mayor preferencia, en combinación (cualquier combinación posible de 2 o más sustituyentes definidos en la presente), los siguientes significados:

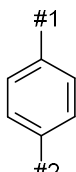
En un aspecto de la invención, A es fenilo que es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3 o 4 grupos R^A idénticos o diferentes como se definió o, preferentemente, como se define en la presente, y en donde el grupo $-C(=S)NR^1R^2$ está unido al anillo de fenilo en la posición para con respecto al grupo trifluorometiloxadiazol.

En una forma de realización, A es tiofenilo, en donde el heterociclo aromático es no sustituido o sustituido con 1 o 2 grupos R^A idénticos o diferentes, como se definió o, preferentemente, como se define en la presente; en particular, R^A es cloro, flúor o metilo.

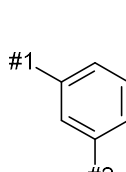
En una forma de realización, la invención se refiere a compuestos de la Fórmula I, o a los N-óxidos, o a las sales de aquellos aceptables en la agricultura, en donde la porción cíclica A es como se define en las Subfórmulas (A.1) a (A.3),



(A.1)



(A.2)



(A.3)

en donde #1 indica la posición que está unida a la porción trifluorometiloxadiazol y #2 indica la posición, que está conectada al grupo $-C(=S)NR^1R^2$ de compuestos de la Fórmula I; y en donde la porción cíclica A es no sustituida o sustituida con 1 o 2 grupos R^A idénticos o diferentes, y en donde R^A es como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. En otra forma de realización, las porciones cíclicas A definidas en cualquiera de las Subfórmulas (A.1) a (A.3) son no sustituidas o sustituidas con 1 o 2 grupos R^A idénticos o diferentes; y en donde R^A es cloro, flúor o metilo. En una forma de realización preferida, la porción cíclica A definida en cualquiera de las Subfórmulas (A.1) a (A.3) es no sustituida.

En una forma de realización preferida de la invención, R^A es halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo o C_3 - C_8 -cicloalquilo; y en

donde cualquiera de las porciones alifáticas y cíclicas es no sustituida o sustituida con 1, 2, 3, 4 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^a idénticos o diferentes como se definió o, preferentemente, como se define en la presente.

En otra forma de realización preferida de la invención, R^A es halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo o C₃-C₈-cicloalquilo; y en donde cualquiera de las porciones alifáticas y cíclicas es no sustituida o sustituida con 1, 2, 3, 4 o hasta la cantidad máxima posible de grupos idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi y C₃-C₈-cicloalquilo; en particular, flúor.

Con mayor preferencia, R^A es halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi; en particular, halógeno, C₁-C₆-alquilo; más en particular, cloro, flúor, metilo. En una forma de realización de mayor preferencia, R^A es cloro, flúor o metilo.

De acuerdo con la invención, R^a es halógeno, ciano, NO₂, OH, SH, NH₂, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi, C₁-C₆-alquiltio, C₁-C₆-haloalquiltio o C₃-C₈-cicloalquilo. En una forma de realización preferida de la invención, R^a es halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi o C₃-C₈-cicloalquilo. Con mayor preferencia, R^a es halógeno, en particular, flúor.

En un aspecto de la invención, R¹ y R² son, independientemente entre sí, hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo, C₃-C₆-cicloalquenilo, -C(=O)-(C₁-C₆-alquilo) o -C(=O)-(C₁-C₆-alcoxi); y en donde cualquiera de los grupos alifáticos o cíclicos antes mencionados es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes, como se definió o, preferentemente, como se define en la presente.

En un aspecto de la invención, R¹ y R² son, independientemente entre sí, hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₆-cicloalquilo o C₃-C₆-cicloalquenilo; y en donde cualquiera de los grupos alifáticos o cíclicos antes mencionados es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3 o hasta la máxima cantidad posible de R^{1a} idénticos o diferentes, como se definió o, preferentemente, como se define en la presente.

En otro aspecto de la invención, R¹ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo o C₂-C₆-alquinilo, y R² es fenil-C₁-C₄-alquilo, heteroaril-C₁-C₄-alquilo, fenilo o heteroarilo; y en donde el grupo heteroarilo es un heterociclo aromático de 5 o 6 miembros, en donde el anillo incluye, además de átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados de N, O y S como átomos miembros del anillo; y en

donde cualquiera de los grupos alifáticos o cíclicos antes mencionados es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes como se definieron o, preferentemente, como se definen en la presente.

En otro aspecto de la invención, R^1 y R^2 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclo saturado o parcialmente insaturado de 3 a 6 miembros, en donde el heterociclo incluye, además de un átomo de nitrógeno y uno o más átomos de carbono, 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente de N, O y S como átomos miembros del anillo; y en donde uno o dos grupos CH_2 del heterociclo se pueden reemplazar por uno o dos grupos seleccionados independientemente del grupo de $-C(=O)-$ y $-C(=S)-$; y en donde el heterociclo es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes como se definió o, preferentemente, como se define en la presente.

Aun en otro aspecto de la invención, R^1 y R^2 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclo saturado o parcialmente insaturado de 3 a 6 miembros, en donde el heterociclo incluye, además de un átomo de nitrógeno y uno o más átomos de carbono, un heteroátomo adicional seleccionado de N, O y S como un átomo miembro del anillo; y en donde el heterociclo es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes como se definió o, preferentemente, como se define en la presente.

En una forma de realización, R^1 es hidrógeno o metilo, y R^2 es C_3 - C_6 -cicloalquilo, en donde el grupo cicloalquilo es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes, como se definió o, preferentemente, como se define en la presente.

En una forma de realización, R^1 es hidrógeno o metilo, y R^2 es C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_6 -alquenilo o C_2 - C_6 -alquinilo, en donde los grupos alifáticos son no sustituidos o sustituidos con 1, 2, 3, 4 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes, como se definió o, preferentemente, como se define en la presente.

En otra forma de realización, R^1 es hidrógeno o metilo, y R^2 es metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo o ciclopropilo; y en donde cualquiera de los grupos alifáticos o cíclicos es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes, como se definió o, preferentemente, como se define en la presente.

Aun en otra forma de realización, R^1 es hidrógeno o metilo, y R^2 es fenil- C_1 - C_4 -

alquilo, heteroaril-C₁-C₄-alquilo, C₃-C₆-cicloalquil-C₁-C₄-alquilo; y en donde cualquiera de los grupos alifáticos o cíclicos es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4, 5 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes, como se definió o, preferentemente, como se define en la presente.

En una forma de realización, R¹ es hidrógeno o metilo, y R² es heteroaril-C₁-C₄-alquilo, en donde cualquiera de los grupos alifáticos o cíclicos es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes, como se definió o, preferentemente, como se define en la presente.

En una forma de realización, R¹ es hidrógeno o metilo, y R² es fenilo, en donde el grupo fenilo es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes, como se definió o, preferentemente, como se define en la presente.

En una forma de realización preferida de la invención, R^{1a} es halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-haloalcoxi o C₃-C₈-cicloalquilo. En otro aspecto preferido de la invención, R^{1a} es halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi o C₁-C₆-haloalcoxi. En un aspecto de mayor preferencia de la invención, R^{1a} es halógeno o ciano; en particular, halógeno; con máxima particularidad, flúor.

En otra forma de realización, la invención se refiere a compuestos (I.1) de la Fórmula I, o a los N-óxidos, o a las sales de aquellos aceptables en la agricultura, en donde:

A se selecciona del grupo que consiste en las Subfórmulas (A.1) a (A.3), que son no sustituidas o sustituidas con 1 o 2 grupos R^A idénticos o diferentes; en donde

R^A es halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo o C₃-C₈-cicloalcoxi; y en donde las porciones alifáticas y cíclicas son no sustituidas o sustituidas con 1, 2, 3 o 4 grupos R^a idénticos o diferentes; en donde

R^a es halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi o C₃-C₈-cicloalquilo;

R¹ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C(=O)-(C₁-C₆-alquilo) o C(=O)-(C₁-C₆-alcoxi);

R² es fenilo, un heterociclo aromático de 5 o 6 miembros, fenil-C₁-C₄-alquilo o heteroaril-C₁-C₄-alquilo; en donde los átomos miembros del anillo del heterociclo aromático incluyen, además de átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4

heteroátomos seleccionados de N, O y S como átomos miembros del anillo; y en donde cualquiera de los grupos cíclicos es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3 o 4 grupos idénticos o diferentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-haloalcoxi.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.1), en donde A es (A.1). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.1), en donde A es (A.1), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A, como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.1), en donde A es (A.1), y en donde A es no sustituido.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.1), en donde A es (A.2). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.1), en donde A es (A.2), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A, como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.1), en donde A es (A.2), y en donde A es no sustituido.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.2) de la Fórmula I, o a los N-óxidos, o a las sales de aquellos aceptables en la agricultura, en donde:

A se selecciona del grupo que consiste en las Subfórmulas (A.1) a (A.3), que son no sustituidas o sustituidas con 1 o 2 grupos R^A idénticos o diferentes; en donde

R^A es halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi, C₁-C₆-alquilsulfonilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo o C₃-C₈-cicloalcoxi; y en donde las porciones alifáticas y cíclicas son no sustituidas o sustituidas con 1, 2, 3 o 4 grupos R^a idénticos o diferentes; en donde R^a es halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-alcoxi o C₃-C₈-cicloalquilo;

R¹ es hidrógeno, C₁-C₆-alquilo, C₂-C₆-alquenilo, C₂-C₆-alquinilo, C₃-C₈-cicloalquilo, C₃-C₈-cicloalquenilo, C(=O)-(C₁-C₆-alquilo) o C(=O)-(C₁-C₆-alcoxi);

R² es fenilo, que es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3 o 4 grupos idénticos o diferentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, C₁-C₆-alquilo, C₁-C₆-haloalquilo, C₁-C₆-alcoxi y C₁-C₆-haloalcoxi.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.2), en

donde A es (A.1). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.2), en donde A es (A.1), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.2), en donde A es (A.1), y en donde A es no sustituido.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.2), en donde A es (A.2). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.2), en donde A es (A.2), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.2), en donde A es (A.2), y en donde A es no sustituido.

Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.3) de la Fórmula I, o a los N-óxidos, o a las sales de aquellos aceptables en la agricultura, en donde:

A se selecciona del grupo que consiste en las Subfórmulas (A.1) a (A.3), que son no sustituidas o sustituidas con 1 o 2 grupos R^A idénticos o diferentes; en donde

R^A es halógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi o C_1 - C_6 -haloalcoxi;

R^1 es hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo, C_3 - C_8 -cicloalquenilo, $C(=O)$ -(C_1 - C_6 -alquilo) o $C(=O)$ -(C_1 - C_6 -alcoxi);

R^2 es fenilo, que es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3 o 4 grupos idénticos o diferentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi y C_1 - C_6 -haloalcoxi.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.3), en donde A es (A.1). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.3), en donde A es (A.1), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.3), en donde A es (A.1), y en donde A es no sustituido.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.3), en donde A es (A.2). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.3), en donde A es (A.2), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.3), en donde A es (A.2), y en

donde A es no sustituido.

Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.4) de la Fórmula I, o a los N-óxidos, o a las sales de aquellos aceptables en la agricultura, en donde:

A se selecciona del grupo que consiste en las Subfórmulas (A.1) a (A.3), que son no sustituidas o sustituidas con 1 o 2 grupos R^A idénticos o diferentes; en donde

R^A es halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi o C_1 - C_6 -haloalcoxi;

R^1 es hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_6 -alquenilo o C_2 - C_6 -alquinilo;

R^2 es fenilo, que es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3 o 4 grupos idénticos o diferentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi y C_1 - C_6 -haloalcoxi.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.4), en donde A es (A.1). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.4), en donde A es (A.1), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.4), en donde A es (A.1), y en donde A es no sustituido.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.4), en donde A es (A.2). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.4), en donde A es (A.2), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.4), en donde A es (A.2), y en donde A es no sustituido.

Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.5) de la Fórmula I, o a los N-óxidos, o a las sales de aquellos aceptables en la agricultura, en donde:

A se selecciona del grupo que consiste en las Subfórmulas (A.1) a (A.3), que son no sustituidas o sustituidas con 1 o 2 grupos R^A idénticos o diferentes; en donde

R^A es halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -alquilsulfonilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo o C_3 - C_8 -cicloalcoxi; y en donde las porciones alifáticas y cíclicas son no sustituidas o sustituidas con 1, 2, 3 o 4 grupos R^a idénticos o diferentes; en donde

R^a es halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -alcoxi o C_3 - C_8 -cicloalquilo;

R^1 y R^2 son, independientemente entre sí, hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo o C_3 - C_8 -cicloalquenilo; en particular, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo o ciclopropilo; y en donde los grupos alifáticos y cíclicos son no sustituidos o sustituidos con 1, 2, 3, 4 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes, como se definió o, preferentemente, como se define en la presente.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.5), en donde A es (A.1). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.5), en donde A es (A.1), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.5), en donde A es (A.1), y en donde A es no sustituido.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.5), en donde A es (A.2). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.5), en donde A es (A.2), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.5), en donde A es (A.2), y en donde A es no sustituido.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.6) de la Fórmula I, o a los N-óxidos, o a las sales de aquellos aceptables en la agricultura, en donde:

A se selecciona del grupo que consiste en las Subfórmulas (A.1) a (A.3), que son no sustituidas o sustituidas con 1 o 2 grupos R^A idénticos o diferentes; en donde

R^A es halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi o C_1 - C_6 -haloalcoxi;

R^1 y R^2 son, independientemente entre sí, hidrógeno, C_1 - C_6 -alquilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo o C_3 - C_8 -cicloalquenilo; en particular, hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo o ciclopropilo.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.6), en donde A es (A.1). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.6), en donde A es (A.1), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma

de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.6), en donde A es (A.1), y en donde A es no sustituido.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.6), en donde A es (A.2). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.6), en donde A es (A.2), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.6), en donde A es (A.2), y en donde A es no sustituido.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.7) de la Fórmula I, o a los N-óxidos, o a las sales de aquellos aceptables en la agricultura, en donde:

A se selecciona del grupo que consiste en las Subfórmulas (A.1) a (A.3), que son no sustituidas o sustituidas con 1 o 2 grupos R^A idénticos o diferentes; en donde

R^A es halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -alcoxi, C_1 - C_6 -alquilsulfonilo, C_2 - C_6 -alquenilo, C_2 - C_6 -alquinilo, C_3 - C_8 -cicloalquilo o C_3 - C_8 -cicloalcoxi; y en donde las porciones alifáticas y cíclicas son no sustituidas o sustituidas con 1, 2, 3 o 4 grupos R^a idénticos o diferentes; en donde R^a es halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -alcoxi o C_3 - C_8 -cicloalquilo;

R^1 y R^2 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclo saturado o parcialmente insaturado de 3 a 6 miembros, en donde el heterociclo incluye, además de un átomo de nitrógeno y átomos de carbono, ningún heteroátomo adicional o 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente de N, O y S como átomos miembros del anillo; y en donde uno o dos grupos CH_2 del carbociclo o heterociclo se pueden reemplazar por uno o dos grupos seleccionados independientemente del grupo de $C(=O)$ y $C(=S)$; y en donde el heterociclo es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3, 4 o hasta la máxima cantidad posible de grupos R^{1a} idénticos o diferentes, como se definió o, preferentemente, como se define en la presente.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.7), en donde A es (A.1). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.7), en donde A es (A.1), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.7), en donde A es (A.1), y en

donde A es no sustituido.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.7), en donde A es (A.2). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.7), en donde A es (A.2), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.7), en donde A es (A.2), y en donde A es no sustituido.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.8) de la Fórmula I, o a los N-óxidos, o a las sales de aquellos aceptables en la agricultura, en donde:

A se selecciona del grupo que consiste en las Subfórmulas (A.1) a (A.3), que son no sustituidas o sustituidas con 1 o 2 grupos R^A idénticos o diferentes; en donde

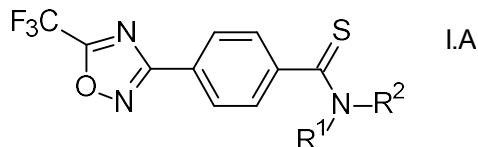
R^A es halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi o C_1 - C_6 -haloalcoxi;

R^1 y R^2 , junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclo saturado o parcialmente insaturado de 3 a 6 miembros, en donde el heterociclo incluye, además de un átomo de nitrógeno y átomos de carbono, ningún heteroátomo adicional o 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente de N, O y S como átomos miembros del anillo; y en donde el heterociclo es no sustituido o sustituido con 1, 2, 3 o 4 grupos idénticos o diferentes seleccionados de halógeno, ciano, C_1 - C_6 -alquilo, C_1 - C_6 -haloalquilo, C_1 - C_6 -alcoxi y C_1 - C_6 -haloalcoxi.

En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.8), en donde A es (A.1). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.8), en donde A es (A.1), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.8), en donde A es (A.1), y en donde A es no sustituido.

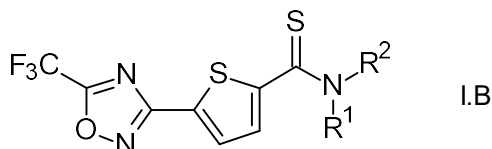
En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.8), en donde A es (A.2). En otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.8), en donde A es (A.2), y en donde A se sustituye con 1 grupo R^A , como se definió o, preferentemente, como se define en la presente. Aun en otra forma de realización, la invención se refiere a los compuestos (I.8), en donde A es (A.2), y en donde A es no sustituido.

De acuerdo con una forma de realización, la presente invención se refiere a compuestos de la Fórmula I.A



o al uso de los compuestos de la Fórmula I.A para controlar hongos fitopatógenos, en donde R^1 y R^2 son como se definieron o, preferentemente, como se definen en la presente para la Fórmula I.

De acuerdo con una forma de realización, la presente invención se refiere a compuestos de la Fórmula I.B



o al uso de los compuestos de la Fórmula I.B para controlar hongos fitopatógenos, en donde R^1 y R^2 son como se definieron o, preferentemente, como se definen en la presente para la Fórmula I.

Se prefieren los compuestos I y su uso de acuerdo con la invención, que se compilan en las Tablas 1 y 2 a continuación. Las combinaciones de los grupos R^1 y R^2 mencionados en la Tabla A, y a los que se hace referencia en la Tabla 1 y la Tabla 2, son además por sí mismas, independientemente de la combinación en la que se mencionen, un aspecto de particular preferencia del sustituyente en cuestión.

Tabla 1

Compuestos de la Fórmula I.A, en donde R^1 y R^2 , para cada compuesto individual, corresponden en cada caso a una línea A-1 a A-473 de la Tabla A (I.A.A-1 a I.A.A-473).

Tabla 2

Compuestos de la Fórmula I.B, en donde R^1 y R^2 , para cada compuesto individual, corresponden en cada caso a una línea A-1 a A-473 de la Tabla A (I.B.A-1 a I.B.A- 473).

Tabla A:

N.º	R^1	R^2
A-1	H	H
A-2	H	CH ₃
A-3	H	CH ₂ CH ₃
A-4	H	CH ₂ CH ₂ CH ₃

N.º	R^1	R^2
A-5	H	CH(CH ₃) ₂
A-6	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-7	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-8	H	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₃

N.°	R ¹	R ²
A-9	H	C(CH ₃) ₃
A-10	H	alilo
A-11	H	propargilo
A-12	H	CH ₂ CN
A-13	H	ciclopropilo
A-14	H	1-metilciclopropilo
A-15	H	1-trifluormetil-ciclopropilo
A-16	H	1-fluorociclopropilo
A-17	H	1-ciclopropilciclopropilo
A-18	H	1-cianociclopropilo
A-19	H	2-metilciclopropilo
A-20	H	2-etilciclopropilo
A-21	H	2-trifluormetil-ciclopropilo
A-22	H	2-fluorociclopropilo
A-23	H	2-ciclopropilciclopropilo
A-24	H	1-cianociclopropilo
A-25	H	2,2-difluorciclopropilo
A-26	H	2,2-difluor-1-metil-ciclopropilo
A-27	H	ciclopentilo
A-28	H	ciclohexilo
A-29	H	fenilo
A-30	H	2-piridilo
A-31	H	3-piridilo
A-32	H	4-piridilo
A-33	H	2-F-fenilo
A-34	H	3-F-fenilo
A-35	H	4-F-fenilo
A-36	H	2-Cl-fenilo
A-37	H	3-Cl-fenilo
A-38	H	4-Cl-fenilo
A-39	H	2-metil-fenilo
A-40	H	3-metil-fenilo
A-41	H	4-metil-fenilo
A-42	H	2-etil-fenilo
A-43	H	3-etil-fenilo
A-44	H	4-etil-fenilo
A-45	H	2-isopropil-fenilo
A-46	H	3-isopropil-fenilo
A-47	H	4-isopropil-fenilo
A-48	H	2-(2,2,2-trifluoroetil)-fenilo
A-49	H	3-(2,2,2-trifluoroetil)-fenilo
A-50	H	4-(2,2,2-trifluoroetil)-fenilo
A-51	H	2-trifluorometil-fenilo
A-52	H	3-trifluorometil-fenilo
A-53	H	4-trifluorometil-fenilo
A-54	H	2-metoxi-fenilo
A-55	H	3-metoxi-fenilo
A-56	H	4-metoxi-fenilo
A-57	H	2-trifluorometoxi-fenilo
A-58	H	3-trifluorometoxi-fenilo
A-59	H	4-trifluorometoxi-fenilo
A-60	H	2-difluorometoxi-fenilo
A-61	H	3-difluorometoxi-fenilo

N.°	R ¹	R ²
A-62	H	4-difluorometoxi-fenilo
A-63	H	2-(2,2,2-trifluoroetoxi)-fenilo
A-64	H	3-(2,2,2-trifluoroetoxi)-fenilo
A-65	H	4-(2,2,2-trifluoroetoxi)-fenilo
A-66	H	2-ciano-fenilo
A-67	H	3-ciano-fenilo
A-68	H	4-ciano-fenilo
A-69	H	2,3-difluoro-fenilo
A-70	H	2,4-difluoro-fenilo
A-71	H	2,5-difluoro-fenilo
A-72	H	2,6-difluoro-fenilo
A-73	H	2,3-dicloro-fenilo
A-74	H	2,4-dicloro-fenilo
A-75	H	2,5-dicloro-fenilo
A-76	H	2,6-dicloro-fenilo
A-77	H	2-F-3-Cl-fenilo
A-78	H	2-F-4-Cl-fenilo
A-79	H	2-F-5-Cl-fenilo
A-80	H	2-F-6-Cl-fenilo
A-81	H	3-F-4-Cl-fenilo
A-82	H	3-F-5-Cl-fenilo
A-83	H	2-Cl-3-F-fenilo
A-84	H	2-Cl-4-F-fenilo
A-85	H	2-Cl-5-F-fenilo
A-86	H	3-Cl-4-F-fenilo
A-87	H	2-F-3-metil-fenilo
A-88	H	2-F-4-metil-fenilo
A-89	H	2-F-5-metil-fenilo
A-90	H	2-F-6-metil-fenilo
A-91	H	3-F-4-metil-fenilo
A-92	H	3-F-5-metil-fenilo
A-93	H	2-metil-3-F-fenilo
A-94	H	2-metil-4-F-fenilo
A-95	H	2-metil-5-F-fenilo
A-96	H	3-metil-4-F-fenilo
A-97	H	2-F-3-CF ₃ -fenilo
A-98	H	2-F-4-CF ₃ -fenilo
A-99	H	2-F-5-CF ₃ -fenilo
A-100	H	2-F-6-CF ₃ -fenilo
A-101	H	3-F-4-CF ₃ -fenilo
A-102	H	3-F-5-CF ₃ -fenilo
A-103	H	2-CF ₃ -3-F-fenilo
A-104	H	2-CF ₃ -4-F-fenilo
A-105	H	2-CF ₃ -5-F-fenilo
A-106	H	3-CF ₃ -4-F-fenilo
A-107	H	2-F-3-OMe-fenilo
A-108	H	2-F-4-OMe-fenilo
A-109	H	2-F-5-OMe-fenilo
A-110	H	2-F-6-OMe-fenilo
A-111	H	3-F-4-OMe-fenilo
A-112	H	3-F-5-OMe-fenilo
A-113	H	2-OMe-3-F-fenilo

N.º	R ¹	R ²
A-114	H	2-OMe-4-F-fenilo
A-115	H	2-OMe-5-F-fenilo
A-116	H	3-OMe-4-F-fenilo
A-117	H	2-F-3-OCHF ₂ -fenilo
A-118	H	2-F-4-OCHF ₂ -fenilo
A-119	H	2-F-5-OCHF ₂ -fenilo
A-120	H	2-F-6-OCHF ₂ -fenilo
A-121	H	3-F-4-OCHF ₂ -fenilo
A-122	H	3-F-5-OCHF ₂ -fenilo
A-123	H	2-OCHF ₂ -3-F-fenilo
A-124	H	2-OCHF ₂ -4-F-fenilo
A-125	H	2-OCHF ₂ -5-F-fenilo
A-126	H	3-OCHF ₂ -4-F-fenilo
A-127	H	2-F-3-CN-fenilo
A-128	H	2-F-4-CN-fenilo
A-129	H	2-F-5-CN-fenilo
A-130	H	2-F-6-CN-fenilo
A-131	H	3-F-4-CN-fenilo
A-132	H	3-F-5-CN-fenilo
A-133	H	2-CN-3-F-fenilo
A-134	H	2-CN-4-F-fenilo
A-135	H	2-CN-5-F-fenilo
A-136	H	3-CN-4-F-fenilo
A-137	H	2-Cl-3-metil-fenilo
A-138	H	2-Cl-4-metil-fenilo
A-139	H	2-Cl-5-metil-fenilo
A-140	H	2-Cl-6-metil-fenilo
A-141	H	3-Cl-4-metil-fenilo
A-142	H	3-Cl-5-metil-fenilo
A-143	H	2-metil-3-Cl-fenilo
A-144	H	2-metil-4-Cl-fenilo
A-145	H	2-metil-5-Cl-fenilo
A-146	H	3-metil-4-Cl-fenilo
A-147	H	2-Cl-3-CF ₃ -fenilo
A-148	H	2-Cl-4-CF ₃ -fenilo
A-149	H	2-Cl-5-CF ₃ -fenilo
A-150	H	2-Cl-6-CF ₃ -fenilo
A-151	H	3-Cl-4-CF ₃ -fenilo
A-152	H	3-Cl-5-CF ₃ -fenilo
A-153	H	2-CF ₃ -3-Cl-fenilo
A-154	H	2-CF ₃ -4-Cl-fenilo
A-155	H	2-CF ₃ -5-Cl-fenilo
A-156	H	3-CF ₃ -4-Cl-fenilo
A-157	H	2-Cl-3-OMe-fenilo
A-158	H	2-Cl-4-OMe-fenilo
A-159	H	2-Cl-5-OMe-fenilo
A-160	H	2-Cl-6-OMe-fenilo
A-161	H	3-Cl-4-OMe-fenilo
A-162	H	3-Cl-5-OMe-fenilo
A-163	H	2-OMe-3-Cl-fenilo
A-164	H	2-OMe-4-Cl-fenilo
A-165	H	2-OMe-5-Cl-fenilo
A-166	H	3-OMe-4-Cl-fenilo
A-167	H	2-Cl-3-OCHF ₂ -fenilo

N.º	R ¹	R ²
A-168	H	2-Cl-4-OCHF ₂ -fenilo
A-169	H	2-Cl-5-OCHF ₂ -fenilo
A-170	H	2-Cl-6-OCHF ₂ -fenilo
A-171	H	3-Cl-4-OCHF ₂ -fenilo
A-172	H	3-Cl-5-OCHF ₂ -fenilo
A-173	H	2-OCHF ₂ -3-Cl-fenilo
A-174	H	2-OCHF ₂ -4-Cl-fenilo
A-175	H	2-OCHF ₂ -5-Cl-fenilo
A-176	H	3-OCHF ₂ -4-Cl-fenilo
A-177	H	2-Cl-3-CN-fenilo
A-178	H	2-Cl-4-CN-fenilo
A-179	H	2-Cl-5-CN-fenilo
A-180	H	2-Cl-6-CN-fenilo
A-181	H	3-Cl-4-CN-fenilo
A-182	H	3-Cl-5-CN-fenilo
A-183	H	2-CN-3-Cl-fenilo
A-184	H	2-CN-4-Cl-fenilo
A-185	H	2-CN-5-Cl-fenilo
A-186	H	3-CN-4-Cl-fenilo
A-187	H	CH ₂ -ciclopropilo
A-188	H	CH ₂ -ciclopentilo
A-189	H	CH ₂ -ciclohexilo
A-190	H	CH ₂ -(4-quinolinilo)
A-191	H	CH ₂ -(2-piridilo)
A-192	H	CH ₂ -(3-piridilo)
A-193	H	CH ₂ -(4-piridilo)
A-194	H	CH ₂ -(2-tienilo)
A-195	H	CH ₂ -(3-tienilo)
A-196	H	CH ₂ -(N-metil-3-pirazolilo)
A-197	H	CH ₂ -(N-metil-4-pirazolilo)
A-198	H	CH ₂ -(1-pirazolilo)
A-199	H	CH ₂ -(2-oxazolilo)
A-200	H	CH ₂ -(4-oxazolilo)
A-201	H	CH ₂ -(5-oxazolilo)
A-202	H	CH ₂ -(2-(1,3,4-oxadiazolilo))
A-203	H	CH ₂ -(2-furilo)
A-204	H	CH ₂ -(3-furilo)
A-205	H	3-hidroxi-propilo
A-206	H	CH ₂ -(N-metil-3-pirrolidinilo)
A-207	H	3-dimetilaminopropilo
A-208	H	2-dimetilaminoetilo
A-209	H	3-pirrolidinilo
A-210	H	bencilo
A-211	H	(2-F-fenil)metilo
A-212	H	(3-F-fenil)metilo
A-213	H	(4-F-fenil)metilo
A-214	H	(2-Cl-fenil)metilo
A-215	H	(3-Cl-fenil)metilo
A-216	H	(4-Cl-fenil)metilo
A-217	H	(2-metil-fenil)metilo
A-218	H	(3-metil-fenil)metilo
A-219	H	(4-metil-fenil)metilo
A-220	H	(2-metoxi-fenil)metilo

N.º	R ¹	R ²
A-221	H	(3-metoxi-fenil)metilo
A-222	H	(4-metoxi-fenil)metilo
A-223	H	(2-ciano-fenil)metilo
A-224	H	(3-ciano-fenil)metilo
A-225	H	(4-ciano-fenil)metilo
A-226	H	(2,3-difluoro-fenil)metilo
A-227	H	(2,4-difluoro-fenil)metilo
A-228	H	(2,5-difluoro-fenil)metilo
A-229	H	(2,6-difluoro-fenil)metilo
A-230	H	(2,3-dicloro-fenil)metilo
A-231	H	(2,4-dicloro-fenil)metilo
A-232	H	(2,5-dicloro-fenil)metilo
A-233	H	(2,6-dicloro-fenil)metilo
A-234	R ¹ y R ² , junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un aziridinilo	
A-235	R ¹ y R ² , junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un azetidínilo	
A-236	R ¹ y R ² , junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un 1-pirrolidinilo	
A-237	R ¹ y R ² , junto con el nitrógeno al que están unidos, forman una 1-piperidina	
A-238	R ¹ y R ² , junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un 1-piperazinilo	
A-239	R ¹ y R ² , junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un 1-metil-4-piperazinilo	
A-240	R ¹ y R ² , junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un 4-morfolinilo	
A-241	CH ₃	H
A-242	CH ₃	CH ₃
A-243	CH ₃	CH ₂ CH ₃
A-244	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-245	CH ₃	CH(CH ₃) ₂
A-246	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
A-247	CH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
A-248	CH ₃	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₃
A-249	CH ₃	C(CH ₃) ₃
A-250	CH ₃	alilo
A-251	CH ₃	propargilo
A-252	CH ₃	CH ₂ CN
A-253	CH ₃	ciclopropilo
A-254	CH ₃	1-metilciclopropilo
A-255	CH ₃	1-trifluormetil-ciclopropilo
A-256	CH ₃	1-fluorociclopropilo
A-257	CH ₃	1-ciclopropilciclopropilo
A-258	CH ₃	1-cianociclopropilo
A-259	CH ₃	2-metilciclopropilo
A-260	CH ₃	2-etilciclopropilo
A-261	CH ₃	2-trifluorometil-ciclopropilo

N.º	R ¹	R ²
A-262	CH ₃	2-fluorociclopropilo
A-263	CH ₃	2-ciclopropilciclopropilo
A-264	CH ₃	1-cianociclopropilo
A-265	CH ₃	2,2-difluorciclopropilo
A-266	CH ₃	2,2-difluor-1-metil-ciclopropilo
A-267	CH ₃	ciclopentilo
A-268	CH ₃	ciclohexilo
A-269	CH ₃	fenilo
A-270	CH ₃	2-piridilo
A-271	CH ₃	3-piridilo
A-272	CH ₃	4-piridilo
A-273	CH ₃	2-F-fenilo
A-274	CH ₃	3-F-fenilo
A-275	CH ₃	4-F-fenilo
A-276	CH ₃	2-Cl-fenilo
A-277	CH ₃	3-Cl-fenilo
A-278	CH ₃	4-Cl-fenilo
A-279	CH ₃	2-metil-fenilo
A-280	CH ₃	3-metil-fenilo
A-281	CH ₃	4-metil-fenilo
A-282	CH ₃	2-etil-fenilo
A-283	CH ₃	3-etil-fenilo
A-284	CH ₃	4-etil-fenilo
A-285	CH ₃	2-isopropil-fenilo
A-286	CH ₃	3-isopropil-fenilo
A-287	CH ₃	4-isopropil-fenilo
A-288	CH ₃	2-(2,2,2-trifluoroetil)-fenilo
A-289	CH ₃	3-(2,2,2-trifluoroetil)-fenilo
A-290	CH ₃	4-(2,2,2-trifluoroetil)-fenilo
A-291	CH ₃	2-trifluorometil-fenilo
A-292	CH ₃	3-trifluorometil-fenilo
A-293	CH ₃	4-trifluorometil-fenilo
A-294	CH ₃	2-metoxi-fenilo
A-295	CH ₃	3-metoxi-fenilo
A-296	CH ₃	4-metoxi-fenilo
A-297	CH ₃	2-trifluorometoxi-fenilo
A-298	CH ₃	3-trifluorometoxi-fenilo
A-299	CH ₃	4-trifluorometoxi-fenilo
A-300	CH ₃	2-difluorometoxi-fenilo
A-301	CH ₃	3-difluorometoxi-fenilo
A-302	CH ₃	4-difluorometoxi-fenilo
A-303	CH ₃	2-(2,2,2-trifluoroetoxi)-fenilo
A-304	CH ₃	3-(2,2,2-trifluoroetoxi)-fenilo
A-305	CH ₃	4-(2,2,2-trifluoroetoxi)-fenilo
A-306	CH ₃	2-ciano-fenilo
A-307	CH ₃	3-ciano-fenilo
A-308	CH ₃	4-ciano-fenilo
A-309	CH ₃	2,3-difluoro-fenilo
A-310	CH ₃	2,4-difluoro-fenilo
A-311	CH ₃	2,5-difluoro-fenilo
A-312	CH ₃	2,6-difluoro-fenilo

N.º	R ¹	R ²
A-313	CH ₃	2,3-dicloro-fenilo
A-314	CH ₃	2,4-dicloro-fenilo
A-315	CH ₃	2,5-dicloro-fenilo
A-316	CH ₃	2,6-dicloro-fenilo
A-317	CH ₃	2-F-3-Cl-fenilo
A-318	CH ₃	2-F-4-Cl-fenilo
A-319	CH ₃	2-F-5-Cl-fenilo
A-320	CH ₃	2-F-6-Cl-fenilo
A-321	CH ₃	3-F-4-Cl-fenilo
A-322	CH ₃	3-F-5-Cl-fenilo
A-323	CH ₃	2-Cl-3-F-fenilo
A-324	CH ₃	2-Cl-4-F-fenilo
A-325	CH ₃	2-Cl-5-F-fenilo
A-326	CH ₃	3-Cl-4-F-fenilo
A-327	CH ₃	2-F-3-metil-fenilo
A-328	CH ₃	2-F-4-metil-fenilo
A-329	CH ₃	2-F-5-metil-fenilo
A-330	CH ₃	2-F-6-metil-fenilo
A-331	CH ₃	3-F-4-metil-fenilo
A-332	CH ₃	3-F-5-metil-fenilo
A-333	CH ₃	2-metil-3-F-fenilo
A-334	CH ₃	2-metil-4-F-fenilo
A-335	CH ₃	2-metil-5-F-fenilo
A-336	CH ₃	3-metil-4-F-fenilo
A-337	CH ₃	2-F-3-CF ₃ -fenilo
A-338	CH ₃	2-F-4-CF ₃ -fenilo
A-339	CH ₃	2-F-5-CF ₃ -fenilo
A-340	CH ₃	2-F-6-CF ₃ -fenilo
A-341	CH ₃	3-F-4-CF ₃ -fenilo
A-342	CH ₃	3-F-5-CF ₃ -fenilo
A-343	CH ₃	2-CF ₃ -3-F-fenilo
A-344	CH ₃	2-CF ₃ -4-F-fenilo
A-345	CH ₃	2-CF ₃ -5-F-fenilo
A-346	CH ₃	3-CF ₃ -4-F-fenilo
A-347	CH ₃	2-F-3-OMe-fenilo
A-348	CH ₃	2-F-4-OMe-fenilo
A-349	CH ₃	2-F-5-OMe-fenilo
A-350	CH ₃	2-F-6-OMe-fenilo
A-351	CH ₃	3-F-4-OMe-fenilo
A-352	CH ₃	3-F-5-OMe-fenilo
A-353	CH ₃	2-OMe-3-F-fenilo
A-354	CH ₃	2-OMe-4-F-fenilo
A-355	CH ₃	2-OMe-5-F-fenilo
A-356	CH ₃	3-OMe-4-F-fenilo
A-357	CH ₃	2-F-3-OCHF ₂ -fenilo
A-358	CH ₃	2-F-4-OCHF ₂ -fenilo
A-359	CH ₃	2-F-5-OCHF ₂ -fenilo
A-360	CH ₃	2-F-6-OCHF ₂ -fenilo
A-361	CH ₃	3-F-4-OCHF ₂ -fenilo
A-362	CH ₃	3-F-5-OCHF ₂ -fenilo
A-363	CH ₃	2-OCHF ₂ -3-F-fenilo
A-364	CH ₃	2-OCHF ₂ -4-F-fenilo
A-365	CH ₃	2-OCHF ₂ -5-F-fenilo
A-366	CH ₃	3-OCHF ₂ -4-F-fenilo

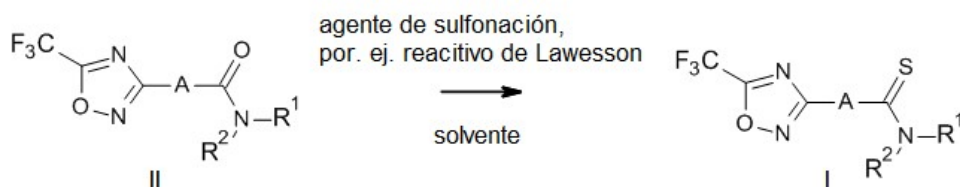
N.º	R ¹	R ²
A-367	CH ₃	2-F-3-CN-fenilo
A-368	CH ₃	2-F-4-CN-fenilo
A-369	CH ₃	2-F-5-CN-fenilo
A-370	CH ₃	2-F-6-CN-fenilo
A-371	CH ₃	3-F-4-CN-fenilo
A-372	CH ₃	3-F-5-CN-fenilo
A-373	CH ₃	2-CN-3-F-fenilo
A-374	CH ₃	2-CN-4-F-fenilo
A-375	CH ₃	2-CN-5-F-fenilo
A-376	CH ₃	3-CN-4-F-fenilo
A-377	CH ₃	2-Cl-3-metil-fenilo
A-378	CH ₃	2-Cl-4-metil-fenilo
A-379	CH ₃	2-Cl-5-metil-fenilo
A-380	CH ₃	2-Cl-6-metil-fenilo
A-381	CH ₃	3-Cl-4-metil-fenilo
A-382	CH ₃	3-Cl-5-metil-fenilo
A-383	CH ₃	2-metil-3-Cl-fenilo
A-384	CH ₃	2-metil-4-Cl-fenilo
A-385	CH ₃	2-metil-5-Cl-fenilo
A-386	CH ₃	3-metil-4-Cl-fenilo
A-387	CH ₃	2-Cl-3-CF ₃ -fenilo
A-388	CH ₃	2-Cl-4-CF ₃ -fenilo
A-389	CH ₃	2-Cl-5-CF ₃ -fenilo
A-390	CH ₃	2-Cl-6-CF ₃ -fenilo
A-391	CH ₃	3-Cl-4-CF ₃ -fenilo
A-392	CH ₃	3-Cl-5-CF ₃ -fenilo
A-393	CH ₃	2-CF ₃ -3-Cl-fenilo
A-394	CH ₃	2-CF ₃ -4-Cl-fenilo
A-395	CH ₃	2-CF ₃ -5-Cl-fenilo
A-396	CH ₃	3-CF ₃ -4-Cl-fenilo
A-397	CH ₃	2-Cl-3-OMe-fenilo
A-398	CH ₃	2-Cl-4-OMe-fenilo
A-399	CH ₃	2-Cl-5-OMe-fenilo
A-400	CH ₃	2-Cl-6-OMe-fenilo
A-401	CH ₃	3-Cl-4-OMe-fenilo
A-402	CH ₃	3-Cl-5-OMe-fenilo
A-403	CH ₃	2-OMe-3-Cl-fenilo
A-404	CH ₃	2-OMe-4-Cl-fenilo
A-405	CH ₃	2-OMe-5-Cl-fenilo
A-406	CH ₃	3-OMe-4-Cl-fenilo
A-407	CH ₃	2-Cl-3-OCHF ₂ -fenilo
A-408	CH ₃	2-Cl-4-OCHF ₂ -fenilo
A-409	CH ₃	2-Cl-5-OCHF ₂ -fenilo
A-410	CH ₃	2-Cl-6-OCHF ₂ -fenilo
A-411	CH ₃	3-Cl-4-OCHF ₂ -fenilo
A-412	CH ₃	3-Cl-5-OCHF ₂ -fenilo
A-413	CH ₃	2-OCHF ₂ -3-Cl-fenilo
A-414	CH ₃	2-OCHF ₂ -4-Cl-fenilo
A-415	CH ₃	2-OCHF ₂ -5-Cl-fenilo
A-416	CH ₃	3-OCHF ₂ -4-Cl-fenilo
A-417	CH ₃	2-Cl-3-CN-fenilo
A-418	CH ₃	2-Cl-4-CN-fenilo
A-419	CH ₃	2-Cl-5-CN-fenilo
A-420	CH ₃	2-Cl-6-CN-fenilo

N.º	R ¹	R ²
A-421	CH ₃	3-Cl-4-CN-fenilo
A-422	CH ₃	3-Cl-5-CN-fenilo
A-423	CH ₃	2-CN-3-Cl-fenilo
A-424	CH ₃	2-CN-4-Cl-fenilo
A-425	CH ₃	2-CN-5-Cl-fenilo
A-426	CH ₃	3-CN-4-Cl-fenilo
A-427	CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo
A-428	CH ₃	CH ₂ -ciclopentilo
A-429	CH ₃	CH ₂ -ciclohexilo
A-430	CH ₃	CH ₂ -(4-quinolinilo)
A-431	CH ₃	CH ₂ -(2-piridilo)
A-432	CH ₃	CH ₂ -(3-piridilo)
A-433	CH ₃	CH ₂ -(4-piridilo)
A-434	CH ₃	CH ₂ -(2-tienilo)
A-435	CH ₃	CH ₂ -(3-tienilo)
A-436	CH ₃	CH ₂ -(N-metil-3-pirazolilo)
A-437	CH ₃	CH ₂ -(N-metil-4-pirazolilo)
A-438	CH ₃	CH ₂ -(1-pirazolilo)
A-439	CH ₃	CH ₂ -(2-oxazolilo)
A-440	CH ₃	CH ₂ -(4-oxazolilo)
A-441	CH ₃	CH ₂ -(5-oxazolilo)
A-442	CH ₃	CH ₂ -(2-(1,3,4-oxadiazolilo))
A-443	CH ₃	CH ₂ -(2-furilo)
A-444	CH ₃	CH ₂ -(3-furilo)
A-445	CH ₃	3-hidroxipropilo
A-446	CH ₃	CH ₂ -(N-metil-3-pirrolidinilo)

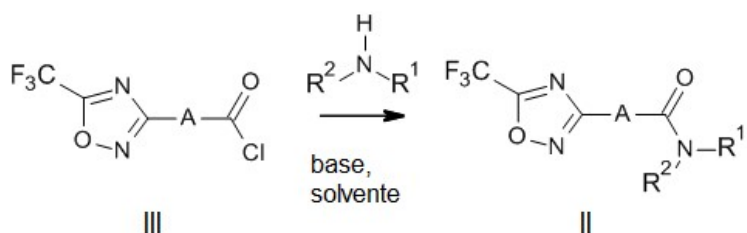
N.º	R ¹	R ²
A-447	CH ₃	3-dimetilaminopropilo
A-448	CH ₃	2-dimetilaminoetilo
A-449	CH ₃	3-pirrolidinilo
A-450	CH ₃	bencilo
A-451	CH ₃	(2-F-fenil)metilo
A-452	CH ₃	(3-F-fenil)metilo
A-453	CH ₃	(4-F-fenil)metilo
A-454	CH ₃	(2-Cl-fenil)metilo
A-455	CH ₃	(3-Cl-fenil)metilo
A-456	CH ₃	(4-Cl-fenil)metilo
A-457	CH ₃	(2-metil-fenil)metilo
A-458	CH ₃	(3-metil-fenil)metilo
A-459	CH ₃	(4-metil-fenil)metilo
A-460	CH ₃	(2-metoxi-fenil)metilo
A-461	CH ₃	(3-metoxi-fenil)metilo
A-462	CH ₃	(4-metoxi-fenil)metilo
A-463	CH ₃	(2-ciano-fenil)metilo
A-464	CH ₃	(3-ciano-fenil)metilo
A-465	CH ₃	(4-ciano-fenil)metilo
A-466	CH ₃	(2,3-difluoro-fenil)metilo
A-467	CH ₃	(2,4-difluoro-fenil)metilo
A-468	CH ₃	(2,5-difluoro-fenil)metilo
A-469	CH ₃	(2,6-difluoro-fenil)metilo
A-470	CH ₃	(2,3-dicloro-fenil)metilo
A-471	CH ₃	(2,4-dicloro-fenil)metilo
A-472	CH ₃	(2,5-dicloro-fenil)metilo
A-473	CH ₃	(2,6-dicloro-fenil)metilo

Los compuestos de la Fórmula I se pueden preparar de acuerdo con los métodos o de manera análoga a los métodos descritos en el arte previo. La síntesis se beneficia de materiales de inicio fácilmente disponibles que son conocidos, están disponibles en el comercio o se pueden preparar de acuerdo con procedimientos convencionales de compuestos conocidos.

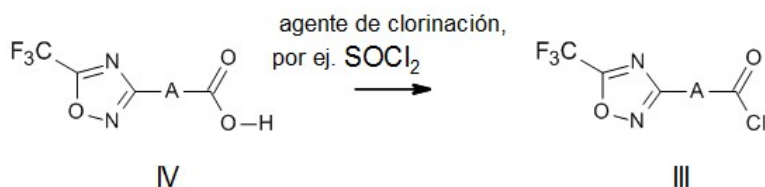
Los compuestos de la Fórmula I se pueden preparar haciendo reaccionar amidas de tipo II con un reactivo de sulfonación adecuado, preferentemente, reactivo de Lawesson, en un solvente orgánico, preferentemente, a temperaturas de 20 °C a 150 °C, preferentemente, a 110 °C, como se describió previamente (véase, por ejemplo, Journal of Organic Chemistry, 2008, 73, 9102 o European Journal of Organic Chemistry, 2015, 30, 6687).



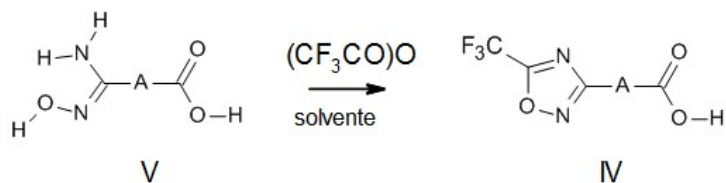
Los compuestos de la Fórmula II se pueden preparar de manera análoga a los métodos descritos en WO 2015/185485 A1, por ejemplo, haciendo reaccionar cloruros ácidos de tipo II con la amina respectiva o su sal de clorhidrato en un solvente orgánico, preferentemente, en un hidrocarburo no polar a temperaturas de $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $40\text{ }^{\circ}\text{C}$, preferentemente, a $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ o a temperatura ambiente, como se describió anteriormente (véanse, por ejemplo, Journal of the American Chemical Society, 2012, 134 (20), 8298 o Journal of the American Chemical Society, 2005, 127(38), 13150). Si se usa la sal de clorhidrato, puede ser adecuado agregar una base orgánica, preferentemente, una amina, para liberar la amina libre *in situ*.



Los compuestos III se pueden obtener haciendo reaccionar ácidos carboxílicos de la Fórmula IV con un agente de clorinación adecuado, preferentemente, cloruro de tionilo, ya sea puro o en un solvente orgánico, preferentemente, un hidrocarburo no polar o un halocarburo. La reacción se realiza mejor a temperaturas elevadas, preferentemente, en el rango de $40\text{--}100\text{ }^{\circ}\text{C}$.

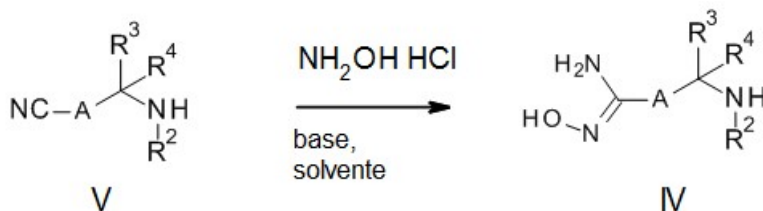


Los compuestos IV se pueden preparar haciendo reaccionar amidinas de la Fórmula V con anhídrido trifluoroacético en un solvente orgánico, por ejemplo, diclorometano, o THF a temperaturas de $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $100\text{ }^{\circ}\text{C}$, preferentemente, a alrededor de $25\text{ }^{\circ}\text{C}$, como se describió anteriormente en WO 2013/008162.



Una persona del oficio de nivel medio reconocerá que los compuestos de tipo IV se pueden obtener mediante el tratamiento de nitrilos de tipo V con hidroxilamina (o su sal de HCl) en un solvente orgánico y en presencia de una base (para

antecedentes, véanse, por ejemplo, WO2009/074950, WO2006/013104, EP1932843).



Los compuestos de la Fórmula I o las composiciones que comprenden dichos compuestos de acuerdo con la invención son adecuados como fungicidas. Se los distingue por una excelente eficacia contra un amplio espectro de hongos fitopatógenos, que incluyen hongos que habitan en el suelo, que derivan especialmente de las siguientes clases o están estrechamente relacionados con cualquiera de estas: *Ascomycota* (*Ascomycetes*), por ejemplo, entre otros, el género *Cochliobolus*, *Colletotrichum*, *Fusarium*, *Microdochium*, *Penicillium*, *Phoma*, *Magnaporthe*, *Zymoseptoria* y *Pseudocercospora*; *Basidiomycota* (*Basidiomycetes*), por ejemplo, entre otros, el género *Phakospora*, *Puccinia*, *Rhizoctonia*, *Sphacelotheca*, *Tilletia*, *Typhula* y *Ustilago*; *Chytridiomycota* (*Chytridiomycetes*), por ejemplo, entre otros, el género *Chytridiales* y *Synchytrium*; *Deuteromycetes* (syn. *Fungi imperfecti*), por ejemplo, entre otros, el género *Ascochyta*, *Diplodia*, *Erysiphe*, *Fusarium*, *Phomopsis* y *Pyrenophora*; *Peronosporomycetes* (syn. *Oomycetes*), por ejemplo, entre otros, el género *Peronospora*, *Pythium*, *Phytophthora*; *Plasmodiophoromycetes*, por ejemplo, entre otros, el género *Plasmodiophora*; *Zygomycetes*, por ejemplo, entre otros, el género *Rhizopus*.

Algunos de los compuestos de la Fórmula I y las composiciones de acuerdo con la invención son sistémicamente eficaces y se pueden usar para la protección de cultivos como fungicidas foliares, fungicidas para el recubrimiento de semillas y fungicidas del suelo. Asimismo, son adecuados para controlar hongos dañinos que se producen, entre otros, en la madera o en las raíces de las plantas.

Los compuestos I y las composiciones de acuerdo con la invención son particularmente importantes para el control de múltiples hongos fitopatógenos en distintas plantas cultivadas, tales como cereales, por ejemplo, trigo, centeno, cebada, triticale, avena o arroz; remolacha, por ejemplo, remolacha azucarera o remolacha forrajera; frutos, tales como frutos pomos, frutos con carozo o frutos blandos, por ejemplo, manzanas, peras, ciruelas, duraznos, almendras, cerezas, frutillas, frambuesas, moras o grosellas espinosas; plantas leguminosas, tales como lentejas, arvejas, alfalfa o soja; plantas oleaginosas, tales como colza, mostaza, aceitunas,

girasoles, coco, granos de cacao, plantas de aceite de ricino, palma aceitera, maní o soja; cucurbitas, tales como calabazas, pepino o melones; plantas fibrosas, tales como algodón, lino, cáñamo o yute; frutos cítricos, tales como naranjas, limones, pomelos o mandarinas; hortalizas, tales como espinaca, lechuga, espárrago, repollo, zanahoria, cebolla, tomate, papa, cucurbitas o pimentón; plantas lauráceas, tales como palta, canela o alcanfor; plantas de energía y materia prima, tales como maíz, soja, colza, caña de azúcar o palma aceitera; maíz; tabaco; nueces; café; té; bananas; vides (uva de mesa y parras para jugo de uva); lúpulo; césped; hierba dulce (también denominada Stevia); plantas de caucho natural o plantas ornamentales y de silvicultura, tales como flores, arbustos, árboles de hojas anchas o perennes, por ejemplo, coníferas; y en el material de propagación vegetal, tales como semillas, y el material de cultivo de estas plantas.

Preferentemente, los compuestos I y sus composiciones, respectivamente, se usan para el control de múltiples hongos en los cultivos de campo, tales como papa, remolacha azucarera, tabaco, trigo, centeno, cebada, avena, arroz, maíz, algodón, soja, colza, legumbres, girasol, café o caña de azúcar; frutos; vides; ornamentales; o vegetales, tales como pepino, tomate, poroto o calabaza.

La expresión "material de propagación vegetal" indica todas las partes generativas de la planta, tales como semillas y material vegetativo de la planta, tal como esquejes y tubérculos (por ejemplo, papas), que se pueden usar para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas, brotes, retoños y otras partes de las plantas, incluso plántulas y plantas jóvenes, que se trasplantarán después de la germinación o después de que surjan del suelo. Estas plantas jóvenes también se pueden proteger, antes de trasplantarlas, con un tratamiento total o parcial mediante inmersión o vertido.

Preferentemente, el tratamiento de los materiales de propagación vegetal con los compuestos I y sus composiciones, respectivamente, se usa para el control de múltiples hongos en cereales, tales como trigo, centeno, cebada y avena; arroz, maíz, algodón y soja.

La expresión "plantas cultivadas" incluye plantas que fueron modificadas por mutagénesis o ingeniería genética con el fin de proporcionar un nuevo rasgo a una planta o modificar un rasgo ya existente.

Los compuestos I y sus composiciones, respectivamente, son particularmente adecuados para controlar las siguientes enfermedades de las plantas:

Albugo spp. (roya blanca) en ornamentales, vegetales (por ejemplo, *A. candida*)

y girasoles (por ejemplo, *A. tragopogonis*); *Alternaria* spp. (mancha de la hoja *Alternaria*) en vegetales, colza (*A. brassicola* o *brassicae*), remolacha azucarera (*A. tenuis*), frutos, arroz, soja, papas (por ejemplo, *A. solani* o *A. alternata*), tomates (por ejemplo, *A. solani* o *A. alternata*) y trigo; *Aphanomyces* spp. en remolacha azucarera y vegetales; *Ascochyta* spp. en cereales y vegetales, por ejemplo, *A. tritici* (antracnosis) en trigo y *A. hordei* en cebada; *Bipolaris* y *Drechslera* spp. (teleomorfo: *Cochliobolus* spp.), por ejemplo, tizón de la hoja del Sur (*D. maydis*) o tizón de la hoja del Norte (*B. zeicola*) en maíz, por ejemplo, mancha (*B. sorokiniana*) en cereales y, por ejemplo, *B. oryzae* en arroz y césped; *Blumeria* (anteriormente *Erysiphe*) *graminis* (moho pulverulento) en cereales (por ejemplo, en trigo o cebada); *Botrytis cinerea* (teleomorfo: *Botryotinia fuckeliana*: moho gris) en frutas y bayas (por ejemplo, frutillas), hortalizas (por ejemplo, lechuga, zanahorias, apio y repollos), colza, flores, vides, plantas forestales y trigo; *Bremia lactucae* (mildió) en lechuga; *Ceratocystis* (syn. *Ophiostoma*) spp. (podredumbre o marchitamiento) en árboles de hojas anchas y perennes, por ejemplo, *C. ulmi* (enfermedad del olmo holandés) en olmos; *Cercospora* spp. (manchas foliares de *Cercospora*) en maíz (por ejemplo, mancha foliar gris: *C. zeae-maydis*), arroz, remolacha azucarera (por ejemplo, *C. beticola*), caña de azúcar, hortalizas, café, soja (por ejemplo, *C. sojae* o *C. kikuchii*) y arroz; *Cladosporium* spp. en tomates (por ejemplo, *C. fulvum*: moho de la hoja) y cereales, por ejemplo, *C. herbarum* (espiga negra) en trigo; *Claviceps purpurea* (ergot) en cereales; *Cochliobolus* (anamorfo: *Helminthosporium* de *Bipolaris*) spp. (manchas foliares) en maíz (*C. carbonum*), cereales (por ejemplo, *C. sativus*, anamorfo: *B. sorokiniana*) y arroz (por ejemplo, *C. miyabeanus*, anamorfo: *H. oryzae*); *Colletotrichum* (teleomorfo: *Glomerella*) spp. (antracnosis) en algodón (por ejemplo, *C. gossypii*), maíz (por ejemplo, *C. graminicola*: podredumbre del tallo antracnosis), frutos blandos, papas (por ejemplo, *C. coccodes*: mancha negra), porotos (por ejemplo, *C. lindemuthianum*) y soja (por ejemplo, *C. truncatum* o *C. gloeosporioides*); *Corticium* spp., por ejemplo, *C. sasakii* (tizón de la vaina) en arroz; *Corynespora cassiicola* (manchas foliares) en soja y ornamentales; *Cycloconium* spp., por ejemplo, *C. oleaginum* en árboles de oliva; *Cylindrocarpon* spp. (por ejemplo, úlcera del árbol frutal o deterioro de la vid joven, teleomorfo: *Nectria* o *Neonectria* spp.) en árboles frutales, vides (por ejemplo, *C. liriodendri*, teleomorfo: *Neonectria liriodendri*: Enfermedad del Pie Negro) y ornamentales; *Dematophora* (teleomorfo: *Rosellinia*) necatrix (podredumbre de raíz y tallo) en soja; *Diaporthe* spp., por ejemplo, *D. phaseolorum* (caída) en soja; *Drechslera* (syn. *Helminthosporium*, teleomorfo: *Pyrenophora*) spp. en maíz, cereales, tales como

cebada (por ejemplo, *D. teres*, mancha en red) y trigo (por ejemplo, *D. tritici-repentis*: mancha amarronada), arroz y césped; Esca (acronecrosis (*dieback*), apoplejía) en vides, causada por *Formitiporia* (syn. *Phellinus*) *punctata*, *F. mediterranea*, *Phaeomoniella chlamydospora* (*Phaeoacremonium chlamydosporum* temprano), *Phaeoacremonium aleophilum* y/o *Botryosphaeria obtusa*; *Elsinoe* spp. en frutos pomo (*E. pyri*), frutos blandos (*E. veneta*: antracnosis) y vides (*E. ampelina*: antracnosis); *Entyloma oryzae* (tizne de la hoja) en arroz; *Epicoccum* spp. (moho negro) en trigo; *Erysiphe* spp. (moho pulverulento) en remolacha azucarera (*E. betae*), hortalizas (por ejemplo, *E. pisi*), tales como cucurbitas (por ejemplo, *E. cichoracearum*), repollo, colza (por ejemplo, *E. cruciferarum*); *Eutypa lata* (úlceras Eutypa o acronecrosis, anamorfo: *Cytosporina lata*, syn. *Libertella blepharis*) en árboles frutales, vides y bosques ornamentales; *Exserohilum* (syn. *Helminthosporium*) spp. en maíz (por ejemplo, *E. turcicum*); *Fusarium* (teleomorfo: *Gibberella*) spp. (marchitamiento, podredumbre de raíz o tallo) en varias plantas, tales como *F. graminearum* o *F. culmorum* (podredumbre de raíz, costra o tizón de la parte superior) en cereales (por ejemplo, trigo o cebada), *F. oxysporum* en tomates, *F. solani* (f. sp. *glycines* ahora syn. *F. virguliforme*) y *F. tucumaniae* y *F. brasiliense*, cada una de las cuales provoca el síndrome de la muerte súbita en soja, y *F. verticillioides* en maíz; *Gaeumannomyces graminis* (*take-all*) en cereales (por ejemplo, en trigo o cebada) y maíz; *Gibberella* spp. en cereales (por ejemplo, *G. zeae*) y arroz (por ejemplo, *G. fujikuroi*: enfermedad Bakanae); *Glomerella cingulata* en vides, frutos pomo y otras plantas, y *G. gossypii* en algodón; complejos de tinción de granos en arroz; *Guignardia bidwellii* (podredumbre negra) en vides; *Gymnosporangium* spp. en plantas rosáceas y enebros, por ejemplo, *G. sabinae* (roya) en peras; *Helminthosporium* spp. (syn. *Drechslera*, teleomorfo: *Cochliobolus*) en maíz, cereales y arroz; *Hemileia* spp., por ejemplo, *H. vastatrix* (roya de la hoja del café) en café; *Isariopsis clavispora* (syn. *Cladosporium vitis*) en vides; *Macrophomina phaseolina* (syn. *phaseoli*) (podredumbre de raíz y tallo) en soja y algodón; *Microdochium* (syn. *Fusarium*) *nivale* (moho rosa de la nieve) en cereales (por ejemplo, trigo o cebada); *Microsphaera diffusa* (moho pulverulento) en soja; *Monilinia* spp., por ejemplo, *M. laxa*, *M. fructicola* y *M. fructigena* (tizón de flor y ramilla, podredumbre marrón) en frutos de carozo y otras plantas rosáceas; *Mycosphaerella* spp. en cereales, bananas, frutos blandos y maní, tales como, por ejemplo, *M. graminicola* (anamorfo: *Septoria tritici*, mancha Septoria) en trigo o *M. fijiensis* (enfermedad de Sigatoka negra) en bananas; *Peronospora* spp. (mildíu) en repollo (por ejemplo, *P. brassicae*), colza (por ejemplo, *P. parasitica*), cebolla (por ejemplo, *P.*

destructor), tabaco (*P. tabacina*) y soja (por ejemplo, *P. manshurica*); *Phakopsora pachyrhizi* y *P. meibomiae* (roya de la soja) en soja; *Phialophora* spp. por ejemplo, en vides (por ejemplo, *P. tracheiphila* y *P. tetraspora*) y soja (por ejemplo, *P. gregata*: podredumbre de tallo); *Phoma lingam* (podredumbre de raíz y tallo) en colza y repollo, y *P. betae* (podredumbre de raíz, mancha de la hoja y caída) en remolacha azucarera; *Phomopsis* spp. en girasoles, vides (por ejemplo, *P. viticola*: can y mancha de la hoja) y soja (por ejemplo, podredumbre de tallo: *P. phaseoli*, teleomorfo: *Diaporthe phaseolorum*); *Physoderma maydis* (manchas marrones) en maíz; *Phytophthora* spp. (marchitamiento, podredumbre de raíz, hoja, fruto y tallo) en varias plantas, tales como pimentón y cucurbitas (por ejemplo, *P. capsici*), soja (por ejemplo, *P. megasperma*, syn. *P. sojae*), papas y tomates (por ejemplo, *P. infestans*: tizón tardío) y árboles de hojas anchas (por ejemplo, *P. ramorum*: muerte súbita del roble); *Plasmodiophora brassicae* (distorsión de raíz (*club root*)) en repollo, colza, rabanito y otras plantas; *Plasmopara* spp., por ejemplo, *P. viticola* (mildíu de vid) en vides y *P. halstedii* en girasoles; *Podosphaera* spp. (moho pulverulento) en plantas rosáceas, lúpulo, frutos pomo y frutos blandos, por ejemplo, *P. leucotricha* en manzana; *Polymyxa* spp., por ejemplo, en cereales, tales como cebada y trigo (*P. graminis*) y remolacha azucarera (*P. betae*) y, por lo tanto, enfermedades virales transmitidas; *Pseudocercospora herpotrichoides* (mancha ocular, teleomorfo: *Tapesia yallundae*) en cereales, por ejemplo, trigo o cebada; *Pseudoperonospora* (mildíu) en varias plantas, por ejemplo, *P. cubensis* en cucurbitas o *P. humili* en lúpulo; *Pseudopezizula tracheiphila* (enfermedad que causa color rojo o "rotbrenner", anamorfo: *Phialophora*) en vides; *Puccinia* spp. (royas) en varias plantas, por ejemplo, *P. triticina* (roya de la hoja o marrón), *P. striiformis* (roya a rayas o amarilla), *P. hordei* (roya enana), *P. graminis* (roya del tallo o negra) o *P. recondita* (roya marrón o de la hoja) en cereales, tales como, por ejemplo, trigo, cebada o centeno, *P. kuehnii* (roya naranja) en caña de azúcar y *P. asparagi* en espárragos; *Pyrenophora* (anamorfo: *Drechslera*) *tritici-repentis* (mancha amarronada) en trigo o *P. teres* (mancha en red) en cebada; *Pyricularia* spp., por ejemplo, *P. oryzae* (teleomorfo: *Magnaporthe grisea*, hongo del arroz) en arroz y *P. grisea* en césped y cereales; *Pythium* spp. (caída) en césped, arroz, maíz, trigo, algodón, colza, girasol, soja, remolacha azucarera, hortalizas y otras varias plantas (por ejemplo, *P. ultimum* o *P. aphanidermatum*); *Ramularia* spp., por ejemplo, *R. collo-cygni* (manchas foliares *Ramularia*, manchas foliares fisiológicas) en cebada y *R. beticola* en remolacha azucarera; *Rhizoctonia* spp. en algodón, arroz, papa, césped, maíz, colza, papa, remolacha azucarera, hortalizas y otras varias plantas, por ejemplo, *R. solani*

(podredumbre de raíz y tallo) en soja, *R. solani* (tizón de la vaina) en arroz o *R. cerealis* (tizón primaveral Rhizoctonia) en trigo o cebada; *Rhizopus stolonifer* (moho negro, podredumbre leve) en frutillas, zanahorias, repollos, vides y tomates; *Rhynchosporium secalis* (escaldadura) en cebada, centeno y triticale; *Sarocladium oryzae* y *S. attenuatum* (podredumbre de la vaina) en arroz; *Sclerotinia* spp. (podredumbre de tallo o moho blanco) en hortalizas y cultivos de campo, tales como colza, girasol (por ejemplo, *S. sclerotiorum*) y soja (por ejemplo, *S. rolfsii* o *S. sclerotiorum*); *Septoria* spp. en varias plantas, por ejemplo, *S. glycines* (mancha marrón) en soja, *S. tritici* (mancha Septoria) en trigo y *S.* (syn. *Stagonospora*) *nodorum* (mancha Stagonospora) en cereales; *Uncinula* (syn. *Erysiphe*) *necator* (moho pulverulento, anamorfo: *Oidium tuckeri*) en vides; *Setosphaeria* spp. (tizón de la hoja) en maíz (por ejemplo, *S. turcicum*, syn. *Helminthosporium turcicum*) y césped; *Sphacelotheca* spp. (tizne) en maíz, (por ejemplo, *S. reiliana*: tizne de parte superior), sorgo y caña de azúcar; *Sphaerotheca fuliginea* (moho pulverulento) en cucurbitas; *Spongospora subterranea* (costra pulverulenta) en papas y, por lo tanto, enfermedades virales transmitidas; *Stagonospora* spp. en cereales, por ejemplo, *S. nodorum* Stagonospora, teleomorfo: *Leptosphaeria* [syn. *Phaeosphaeria*] *nodorum*) en trigo; *Synchytrium endobioticum* en papa (enfermedad de verruga de la papa); *Taphrina* spp., por ejemplo, *T. deformans* (enfermedad de enrollamiento de la hoja) en durazno y *T. pruni* (cavidades en la ciruela) en ciruelas; *Thielaviopsis* spp. (podredumbre de raíz negra) en tabaco, frutos pomo, hortalizas, soja y algodón, por ejemplo, *T. basicola* (syn. *Chalara elegans*); *Tilletia* spp. (carbón común o tizne hediondo) en cereales, tales como *T. tritici* (syn. *T. caries*, carbón del trigo) y *T. controversa* (carbón enano) en trigo; *Typhula incarnata* (moho de la nieve gris) en cebada o trigo; *Urocystis* spp., por ejemplo, *U. occulta* (tizne de tallo) en centeno; *Uromyces* spp. (roya) en hortalizas, tales como porotos (por ejemplo, *U. appendiculatus*, syn. *U. phaseoli*) y remolacha azucarera (por ejemplo, *U. betae*); *Ustilago* spp. (tizne suelto) en cereales (por ejemplo, *U. nuda* y *U. avenae*), maíz (por ejemplo, *U. maydis*: tizne del maíz) y caña de azúcar; *Venturia* spp. (costra) en manzanas (por ejemplo, *V. inaequalis*) y peras; y *Verticillium* spp. (marchitamiento) en varias plantas, tales como frutos y ornamentales, vides, frutos blandos, vegetales y cultivos de campo, por ejemplo, *V. dahliae* en frutillas, colza, papas y tomates.

En una forma de realización preferida, los compuestos I y sus composiciones, respectivamente, son particularmente adecuados para controlar las siguientes enfermedades de las plantas: *Puccinia* spp. (royas) en varias plantas, por ejemplo, *P.*

tritricina (roya de la hoja o marrón), *P. striiformis* (roya a rayas o amarilla), *P. hordei* (roya enana), *P. graminis* (roya del tallo o negra) o *P. recondita* (roya marrón o de la hoja) en cereales, tales como trigo, cebada o centeno, y *Phakopsoraceae* spp. en distintas plantas, en particular, *Phakopsora pachyrhizi* y *P. meibomia* (roya de la soja) en soja.

Los compuestos I y sus composiciones, respectivamente, también son adecuados para el control de hongos dañinos para la protección de productos almacenados o cosechas, y para la protección de materiales.

La expresión "protección de materiales" indica la protección de materiales técnicos y no vivos, tales como adhesivos, pegamentos, madera, papel y cartón, tejidos, cuero, dispersiones de pintura, plásticos, lubricantes de refrigeración, fibras o telas, contra la infestación y la destrucción por parte de microorganismos dañinos, tales como hongos y bacterias. Con respecto a la protección de maderas y otros materiales, son de particular importancia los siguientes hongos dañinos: Ascomycetes, tales como *Ophiostoma* spp., *Ceratocystis* spp., *Aureobasidium pullulans*, *Sclerophoma* spp., *Chaetomium* spp., *Hemicoloma* spp., *Petriella* spp., *Trichurus* spp.; Basidiomycetes, tales como *Coniophora* spp., *Coriolus* spp., *Gloeophyllum* spp., *Lentinus* spp., *Pleurotus* spp., *Poria* spp., *Serpula* spp. y *Tyromyces* spp.; Deuteromycetes, tales como *Aspergillus* spp., *Cladosporium* spp., *Penicillium* spp., *Trichormia* spp., *Alternaria* spp., *Paecilomyces* spp. y Zygomycetes, tales como *Mucor* spp.; además, para la protección de productos almacenados y la cosecha, son importantes los siguientes hongos de la levadura: *Candida* spp. y *Saccharomyces cerevisiae*.

El método de tratamiento de acuerdo con la invención también se puede usar en el ámbito de la protección de productos almacenados o cosechas contra el ataque de hongos y microorganismos. De acuerdo con la presente invención, la expresión "productos almacenados" indica sustancias naturales de origen vegetal o animal y sus formas procesadas, que se tomaron del ciclo de vida natural y para las cuales se desea una protección prolongada. Los productos almacenados de plantas de cultivo, tales como plantas o partes de estas, por ejemplo, tallos, hojas, tubérculos, semillas, frutos o granos, se pueden proteger en estado recientemente cultivado o en forma procesada, tal como previamente seca, húmeda, desmenuzada, molida, a presión o tostada, cuyo proceso también se conoce como tratamiento posterior a la cosecha. La definición de productos almacenados también abarca madera, ya sea en forma de madera cruda, tal como madera para la construcción, torres de alta tensión y barreras, o en forma de artículos terminados, tales como muebles u objetos de madera. Los

productos almacenados de origen animal son cueros, pieles, pelos y similares. Las combinaciones de acuerdo con la presente invención pueden prevenir efectos no deseados, tales como el deterioro, la descoloración o el moho. Preferentemente, la expresión "productos almacenados" indica sustancias naturales de origen vegetal y sus formas procesadas, con mayor preferencia, frutos y sus formas procesadas, tales como frutos pomos, frutos con carozo, frutos blandos y frutos cítricos, y sus formas procesadas.

Los compuestos de la Fórmula I pueden estar presentes en diferentes modificaciones de cristal cuya actividad biológica puede diferir. Estos también son objeto de la presente invención.

Los compuestos I se usan como tales o en forma de composiciones para el tratamiento de los hongos o las plantas, los materiales de propagación vegetal, tales como las semillas, el suelo, las superficies, los materiales o los espacios que se desean proteger del ataque fúngico, con una cantidad eficaz como fungicida de las sustancias activas. La aplicación se puede realizar antes y después de que los hongos infecten plantas, materiales de propagación vegetal, tales como semillas, suelo, superficies, materiales o habitaciones.

Los materiales de propagación vegetal se pueden tratar profilácticamente con los compuestos I como tales o con una composición que comprende al menos un compuesto I, ya sea durante o antes de la plantación o del trasplante.

La invención también se refiere a composiciones agroquímicas que comprenden un auxiliar y al menos un compuesto I de acuerdo con la invención.

Una composición agroquímica comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto I. La expresión "cantidad eficaz" indica una cantidad de la composición o de los compuestos I que es suficiente para controlar los hongos dañinos en las plantas cultivadas o para la protección de materiales, y que no genera un daño considerable a las plantas tratadas. Esa cantidad puede variar en un amplio rango y depende de varios factores, tales como las especies de hongos que se desean controlar, el material o la planta cultivada tratada, las condiciones climáticas y el compuesto I específico que se usa.

Los compuestos I, sus N-óxidos y sales se pueden convertir en los tipos habituales de composiciones agroquímicas, por ejemplo, soluciones, emulsiones, suspensiones, polvillo, polvos, pastas, gránulos, productos prensados, cápsulas y mezclas de estos. Los ejemplos de tipos de composiciones son suspensiones (por ejemplo, SC, OD, FS), concentrados emulsionables (por ejemplo, EC), emulsiones

(por ejemplo, EW, EO, ES, ME), cápsulas (por ejemplo, CS, ZC), pastas, pastillas, polvos o polvillos humectables (por ejemplo, WP, SP, WS, DP, DS), productos prensados (por ejemplo, BR, TB, DT), gránulos (por ejemplo, WG, SG, GR, FG, GG, MG), artículos insecticidas (por ejemplo, LN), así como formulaciones en gel para el tratamiento de materiales de propagación vegetal, tales como semillas (por ejemplo, GF). Estos y otros tipos de composiciones se definen en “Catalogue of pesticide formulation types and international coding system”, monografía técnica N.º 2, 6.^a edición, mayo de 2008, CropLife International.

Las composiciones se preparan de una manera conocida, como describen Mollet y Grubemann, *Formulation technology*, Wiley VCH, Weinheim, 2001; o Knowles, *New developments in crop protection product formulation*, Agrow Reports DS243, T&F Informa, Londres, 2005.

Los auxiliares adecuados son solventes, portadores líquidos, portadores sólidos o agentes de relleno, tensioactivos, dispersantes, emulgentes, humectantes, adyuvantes, solubilizantes, mejoradores de la penetración, coloides protectores, agentes de adhesión, espesantes, humectantes, repelentes, atrayentes, estimulantes alimenticios, compatibilizadores, bactericidas, agentes anticongelantes, agentes antiespuma, colorantes, mejoradores de la pegajosidad y aglutinantes.

Los solventes y los portadores líquidos adecuados son agua y solventes orgánicos, tales como fracciones de aceite mineral con un punto de ebullición de mediano a alto, por ejemplo, queroseno, gasóleo; aceites de origen vegetal o animal; hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, tolueno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados; alcoholes, por ejemplo, etanol, propanol, butanol, bencilalcohol, ciclohexanol; glicoles; DMSO; cetonas, por ejemplo, ciclohexanona; ésteres, por ejemplo, lactatos, carbonatos, ésteres de ácidos grasos, gamma-butirolactona; ácidos grasos; fosfonatos; aminas; amidas, por ejemplo, N-metilpirrolidona, dimetilamidas de ácidos grasos; y mezclas de estos.

Los portadores o agentes de relleno sólidos adecuados son tierras minerales, por ejemplo, silicatos, silicageles, talco, caolín, piedra caliza, cal viva, creta, arcilla, dolomita, tierra diatomácea, bentonita, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio; polisacáridos, por ejemplo, celulosa, almidón; fertilizantes, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas; productos de origen vegetal, por ejemplo, harina de cereal, harina de corteza de árbol, harina de madera, harina de cáscara de nuez y mezclas de estos.

Los tensioactivos adecuados son compuestos activos en la superficie, tales

como tensioactivos aniónicos, catiónicos, no iónicos y anfóteros, polímeros en bloque, polielectrolitos y mezclas de estos. Dichos tensioactivos pueden usarse como emulgentes, dispersantes, solubilizantes, hidratantes, mejoradores de la penetración, coloides protectores o adyuvantes. Los ejemplos de tensioactivos se enumeran en McCutcheon's, vol.1: Emulsifiers & Detergents, McCutcheon's Directories, Glen Rock, EE. UU., 2008 (Ed. internacional o ed. estadounidense).

Los tensioactivos aniónicos adecuados son sales alcalinas, alcalinotérreas o de amonio de sulfonatos, sulfatos, fosfatos, carboxilatos y mezclas de estos. Los ejemplos de sulfonatos son alquilarilsulfonatos, difenilsulfonatos, sulfonatos de alfa-olefina, sulfonatos de lignina, sulfonatos de ácidos grasos y aceites, sulfonatos de alquifenoles etoxilados, sulfonatos de arilfenoles alcoxilados, sulfonatos de naftalenos condensados, sulfonatos de dodecibencenos y tridecibencenos, sulfonatos de naftalenos y alquilnaftalenos, sulfosuccinatos o sulfosuccinamatos. Los ejemplos de sulfatos son sulfatos de ácidos grasos y aceites, de alquifenoles etoxilados, de alcoholes, de alcoholes etoxilados o de ésteres de ácidos grasos. Los ejemplos de fosfatos son ésteres de fosfato. Los ejemplos de carboxilatos son alquilcarboxilatos, y alcohol carboxilado o etoxilados de alquilfenol.

Los tensioactivos no iónicos adecuados son alcoxilados, amidas de ácidos grasos sustituidos con N, óxidos de amina, ésteres, tensioactivos a base de azúcar, tensioactivos poliméricos y mezclas de estos. Los ejemplos de alcoxilados son compuestos, tales como alcoholes, alquifenoles, aminas, amidas, arilfenoles, ácidos grasos o ésteres de ácidos grasos que se alcoxilaron con 1 a 50 equivalentes. El óxido de etileno y/o el óxido de propileno pueden emplearse para la alcoxilación, preferentemente, el óxido de etileno. Los ejemplos de aminas de ácidos grasos sustituidas con N son glucamidas de ácido graso o alcanolamidas de ácido graso. Los ejemplos de ésteres son ésteres de ácidos grasos, ésteres de glicerol o monoglicéridos. Los ejemplos de tensioactivos a base de azúcar son sorbitán, sorbitán etoxilado, ésteres de sacarosa y glucosa o alquilpoliglucósidos. Los ejemplos de tensioactivos poliméricos son homopolímeros o copolímeros de vinilpirrolidona, alcohol de vinilo o acetato de vinilo.

Los tensioactivos catiónicos adecuados son tensioactivos cuaternarios, por ejemplo, compuestos de amonio cuaternario con 1 o 2 grupos hidrófobos o sales de aminas primarias de cadena larga. Los tensioactivos anfóteros adecuados son alquilbetaínas e imidazolininas. Los polímeros en bloque adecuados son polímeros en bloque de tipo A-B o A-B-A, que comprenden bloques de óxido de polietileno y óxido

de polipropileno, o de tipo A-B-C, que comprenden alcanol, óxido de polietileno y óxido de polipropileno. Los polielectrolitos adecuados son poliácidos o polibases. Los ejemplos de poliácidos son sales alcalinas de ácido poliacrílico o polímeros poliácidos tipo peine. Los ejemplos de polibases son aminas de polivinilo o aminas de polietileno.

Los adyuvantes adecuados son compuestos que tienen poca o incluso ninguna acción plaguicida y que mejoran el rendimiento biológico del compuesto I en la diana. Los ejemplos son tensioactivos, aceites minerales o vegetales, y otros auxiliares. Se enumeran otros ejemplos en Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa Reino Unido, 2006, capítulo 5.

Los espesantes adecuados son polisacáridos (por ejemplo, goma xantana, carboximetilcelulosa), arcillas inorgánicas (modificadas en forma orgánica o no modificadas), policarboxilados y silicatos.

Los bactericidas adecuados son derivados de bronopol e isotiazolinona, tales como alquilisotiazolinonas y bencisotiazolinonas.

Los agentes anticongelantes adecuados son etilenglicol, propilenglicol, urea y glicerina.

Los agentes antiespuma adecuados son siliconas, alcoholes de cadena larga y sales de ácidos grasos.

Los colorantes adecuados (por ejemplo, en rojo, azul o verde) son pigmentos de baja hidrosolubilidad y tinturas hidrosolubles. Los ejemplos son colorantes inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, hexacianoferrato de hierro) y colorantes orgánicos (por ejemplo, colorantes de alizarina, azo y ftalocianina).

Los mejoradores de la pegajosidad o los aglutinantes adecuados son polivinilpirrolidonas, polivinilacetatos, alcoholes de polivinilo, poliacrilatos, ceras biológicas o sintéticas y éteres de celulosa.

Los ejemplos de tipos de composiciones y su preparación son:

i) Concentrados hidrosolubles (SL, LS)

Se disuelven 10-60% en peso de un compuesto I y 5-15% en peso de agente humectante (por ejemplo, alcohol alcoxilado) en agua y/o en un solvente hidrosoluble (por ejemplo, alcoholes) hasta 100% en peso. La sustancia activa se disuelve al ser diluida con agua.

ii) Concentrados dispersables (DC)

Se disuelven 5-25 % en peso de un compuesto I y 1-10 % en peso de dispersante (por ejemplo, polivinilpirrolidona) en solvente orgánico (por ejemplo, ciclohexanona) en hasta 100 % en peso. La dilución con agua produce una dispersión.

iii) Concentrados emulsionables (EC)

Se disuelven 15-70 % en peso de sustancias activas y 5-10 % en peso de emulgentes (por ejemplo, dodecilbencensulfonato de calcio y aceite de ricino etoxilado) en un solvente no hidrosoluble (por ejemplo, hidrocarburo aromático) hasta 100 % en peso. La dilución con agua produce una emulsión.

iv) Emulsiones (EW, EO, ES)

Se disuelven 5-40 % en peso de un compuesto I y 1-10 % en peso de emulgentes (por ejemplo, dodecilbencensulfonato de calcio y aceite de ricino etoxilado) en 20-40% en peso de solvente orgánico no hidrosoluble (por ejemplo, hidrocarburo aromático). Esta mezcla se introduce en hasta 100 % en peso de agua mediante una máquina emulsionante y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua produce una emulsión.

v) Suspensiones (SC, OD, FS)

En un molino de bolas en agitación, se desmenuzan 20-60 % en peso de un compuesto I con la adición 2-10 % en peso de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato sódico y alcohol etoxilado), 0,1-2 % en peso de espesante (por ejemplo, goma xantana) y agua hasta 100 % en peso para obtener una suspensión fina de sustancia activa. La dilución con agua produce una suspensión estable de la sustancia activa. Para la composición tipo FS, se agrega hasta 40 % en peso de aglutinante (por ejemplo, polivinilalcohol).

vi) Gránulos dispersables en agua y gránulos solubles en agua (WG, SG)

Se muelen finamente 50-80 % en peso de un compuesto I con la adición de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y alcohol etoxilado) hasta 100 % en peso y se preparan como gránulos dispersables en agua o gránulos solubles en agua mediante artefactos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de pulverización, lecho fluidizado). La dilución con agua produce una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

vii) Polvos dispersables en agua y polvos hidrosolubles (WP, SP, WS)

Se muelen 50-80 % en peso de un compuesto I en un molino rotor estator con la adición de 1-5 % en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio), 1-3 % en peso de agentes humectantes (por ejemplo, alcohol etoxilado) y un portador sólido (por ejemplo, gel de sílice) hasta 100 % en peso. La dilución con agua produce una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

viii) Gel (GW, GF)

En un molino de bolas en agitación, se desmenuzan 5-25 % en peso de un

compuesto I con la adición 3-10 % en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato sódico), 1-5 % en peso de un espesante (por ejemplo, carboximetilcelulosa) y hasta 100 % en peso de agua para obtener una suspensión fina de la sustancia activa. La dilución con agua produce una suspensión estable de la sustancia activa.

ix) Microemulsión (ME)

Se agregan 5-20 % en peso de un compuesto I a 5-30 % en peso de una mezcla de solventes orgánicos (por ejemplo, ciclohexanona y dimetilamida de ácido graso), 10-25 % en peso de una mezcla de tensioactivos (por ejemplo, alcohol etoxilado y arilfenol etoxilado) y agua hasta 100 % en peso. Esta mezcla se agita durante 1 h para producir de manera espontánea una microemulsión termodinámicamente estable.

x) Microcápsulas (CS)

Una fase oleosa que comprende 5-50 % en peso de un compuesto I, 0-40 % en peso de solvente orgánico no hidrosoluble (por ejemplo, hidrocarburo aromático), 2-15 % en peso de monómeros acrílicos (por ejemplo, metilmetacrilato, ácido metacrílico y un diacrilato o triacrilato) se dispersan en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol de polivinilo). La polimerización de radicales produce la formación de microcápsulas de poli(met)acrilato. De modo alternativo, una fase oleosa que comprende 5-50 % en peso de un compuesto I de acuerdo con la invención, 0-40 % en peso de solvente orgánico no hidrosoluble (por ejemplo, hidrocarburo aromático) y un monómero de isocianato (por ejemplo, difenilmeten-4,4'-diisocianato) se dispersan en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol de polivinilo). La adición de una poliamina (por ejemplo, hexametilendiamina) provoca la formación de microcápsulas de poliurea. Los monómeros representan 1-10 % en peso. El porcentaje en peso se refiere a la composición CS total.

xi) Polvos que se pueden convertir en polvillos (DP, DS)

Se muelen finamente 1-10 % en peso de un compuesto I y se mezclan minuciosamente con un portador sólido (por ejemplo, caolín finamente dividido) hasta 100 % en peso.

xii) Gránulos (GR, FG)

Se muelen finamente 0,5-30 % en peso de un compuesto I y se asocian con un portador sólido (por ejemplo, silicato) hasta 100 % en peso. La granulación se obtiene mediante extrusión, secado por pulverización o lecho fluidizado.

xiii) Líquidos de volumen ultrabajo (UL)

Se disuelven 1-50 % en peso de un compuesto I en solvente orgánico (por ejemplo, hidrocarburo aromático) en hasta 100 % en peso.

Los tipos de composiciones de i) a xiii) pueden comprender, opcionalmente, otros auxiliares, tales como 0,1-1 % en peso de bactericidas, 5-15 % en peso de agentes anticongelantes, 0,1-1 % en peso de agentes antiespuma y 0,1-1 % en peso de colorantes.

En general, las composiciones agroquímicas comprenden de 0,01 a 95 %, preferentemente, de 0,1 a 90 %, con mayor preferencia, de 1 a 70 %, y con mayor preferencia, de 10 a 60 % en peso de sustancia activa. Las sustancias activas se utilizan en una pureza de 90% a 100%, preferentemente de 95% a 100% (de acuerdo con el espectro RMN).

Con frecuencia, las soluciones para el tratamiento de semillas (LS), suspoemulsiones (SE), concentrados fluidizables (FS), polvos para tratamiento en seco (DS), polvos dispersables en agua para tratamiento en suspensión (WS), polvos hidrosolubles (SS), emulsiones (ES), concentrados emulsionables (EC) y geles (GF) se usan para el tratamiento de materiales de propagación vegetal, en particular, semillas. Las composiciones en cuestión producen, después de una dilución de dos a diez veces, concentraciones de sustancia activa de 0,01 a 60 % en peso, preferentemente, de 0,1 a 40 % en las preparaciones listas para usar. La aplicación se puede realizar antes o durante la siembra. Los métodos para aplicar el compuesto I y sus composiciones, respectivamente, en el material de propagación vegetal, en especial, en las semillas, incluyen métodos de aplicación por recubrimiento, revestimiento, peleteo, espolvoreo y empapado y en surco. Preferentemente, el compuesto I o sus composiciones, respectivamente, se aplican en el material de propagación vegetal mediante un método que no induce la germinación, por ejemplo, mediante recubrimiento, peleteo, revestimiento y espolvoreo de semillas.

Cuando se usan para la fitoprotección, la cantidad de sustancias activas aplicadas varía, según el tipo de efecto deseado, de 0,001 a 2 kg por ha, preferentemente, de 0,005 a 2 kg por ha, con mayor preferencia, de 0,05 a 0,9 kg por ha y, en particular, de 0,1 a 0,75 kg por ha.

Para el tratamiento de materiales de propagación vegetal, tales como semillas, por ejemplo, por espolvoreo, revestimiento o empapado de semillas, en general se requieren cantidades de sustancia activa de 0,1 a 1000 g, preferentemente, de 1 a 1000 g, con mayor preferencia, de 1 a 100 g y, con máxima preferencia, de 5 a 100 g por 100 kilogramos de material de propagación vegetal (preferentemente, semillas).

Cuando se usan para la protección de materiales o productos almacenados, la cantidad de sustancia activa aplicada depende del tipo de área de aplicación y del efecto deseado. Las cantidades que se aplican habitualmente para la protección de materiales son de 0,001 g a 2 kg, preferentemente, de 0,005 g a 1 kg, de sustancia activa por metro cúbico de material tratado.

Se pueden agregar varios tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, fertilizantes o micronutrientes y otros plaguicidas (por ejemplo, herbicidas, insecticidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, protectores, bioplaguicidas) a las sustancias activas o a las composiciones que los comprenden, como premezclas o, si correspondiese, solo inmediatamente antes del uso (mezcla en el tanque). Estos agentes se pueden mezclar con las composiciones de acuerdo con la invención en una relación en peso de 1:100 a 100:1, preferentemente, de 1:10 a 10:1.

Por lo general, un plaguicida es un agente químico o biológico (tal como un ingrediente activo plaguicida, un compuesto, una composición, un virus, una bacteria, un agente antimicrobiano o un desinfectante) que, mediante su efecto, impide, imposibilita, elimina o desalienta la actividad de las plagas. Las plagas diana pueden incluir insectos, patógenos vegetales, malezas, moluscos, aves, mamíferos, peces, nematodos (gusanos) y microbios que destruyen bienes, generan molestias, propagan enfermedades o son portadores de enfermedades. El término "plaguicida" incluye también reguladores del crecimiento de la planta que alteran las tasas de crecimiento, floración o reproducción previstas de las plantas; desfoliantes que provocan la caída de hojas u otra clase de follaje de una planta, en general, para facilitar la cosecha; desecantes que promueven el secado de los tejidos vivos, tales como las partes superiores no deseadas de las plantas; activadores vegetales que activan la fisiología de las plantas para la defensa contra ciertas plagas; protectores que reducen la acción herbicida no deseada de plaguicidas en las plantas de cultivo; y promotores del crecimiento vegetal que afectan la fisiología de las plantas, por ejemplo, para aumentar el crecimiento, la biomasa y el rendimiento de las plantas, o cualquier otro parámetro de calidad de los bienes cosechables de una planta de cultivo.

En general, el usuario aplica la composición de acuerdo con la invención con un dispositivo de predosificación, un pulverizador de mochila, un tanque de pulverización, un avión de pulverización o un sistema de irrigación. Con frecuencia, la composición agroquímica está compuesta por agua, amortiguador y/u otros auxiliares en la concentración de aplicación deseada y, como resultado, se obtiene el licor de pulverización listo para usar o la composición agroquímica de acuerdo con la

invención. Con frecuencia, se aplican de 20 a 2000 litros, preferentemente, de 50 a 400 litros, del licor de pulverización listo para usar por hectárea de área agrícola útil.

De acuerdo con una forma de realización, el usuario puede mezclar los componentes individuales de la composición de acuerdo con la invención, tales como partes de un kit o partes de una mezcla binaria o ternaria, en un tanque de pulverización o en cualquier otro tipo de recipiente usado para la aplicación (por ejemplo, tambores para el tratamiento de semillas, maquinaria para el peleteo de semillas, pulverizador de mochila) y se pueden agregar otros auxiliares, de ser adecuado.

En consecuencia, una forma de realización de la invención comprende un kit para preparar una composición plaguicida utilizable; el kit comprende a) una composición que comprende el componente 1) como se define en la presente y al menos un auxiliar; y b) una composición que comprende el componente 2) como se define en la presente y al menos un auxiliar; y opcionalmente c) una composición que comprende al menos un auxiliar y opcionalmente otro componente activo 3) como se define en la presente.

I. Síntesis

I.1) Preparación de ácido 4-[(Z)-N'-hidroxicarbamimidóil]benzoico

A una solución de ácido 4-ciano benzoico (500 g, 1,0 eq.) en una mezcla de etanol y agua (5 litros/2 litros) se agregaron hidroxilamina clorhidrato (495 g, 2,0 eq.) y carbonato de potasio (751 g, 1,5 eq.). A la mezcla resultante, se agregó 8-hidroxiquinolina (6,5 g, 0,1 eq.) y se calentó a reflujo hasta que la HPLC indicó la conversión completa del material de inicio. Después de enfriarse hasta temperatura ambiente, se agregó agua, y el precipitado resultante se recolectó y se secó para obtener el compuesto del título lo suficientemente puro para usarse directamente sin purificación adicional.

I.2) Preparación de ácido 4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoico

Una solución de ácido 4-[(Z)-N'-hidroxicarbamimidóil]benzoico (200 g, 1,0 eq.) en tetrahidrofurano (2,5 litros) se trató con anhídrido trifluoroacético (350 g, 1,5 eq.). La mezcla resultante se agitó durante la noche a temperatura ambiente, antes de diluirse con metil ter-butílico y lavarse con una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio. La capa orgánica se liberó del solvente a presión reducida para obtener un producto crudo que se volvió a cristalizar de di-iso-propiléter para obtener el

compuesto del título como un sólido marrón claro (220 g, 76 %). ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆, 298 K): δ [ppm] = 13.40 (br. s, 1H), 8.22 - 8.10 (m, 4H).

I.3) Preparación de cloruro de 4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoílo

Se cargó un matraz de fondo redondo de 250 ml con ácido 4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoico (20 g, 1,0 eq.), y se agregó por goteo cloruro de tionilo (50 ml, 5 eq.). A la suspensión se agregaron 2 gotas de N,N-dimetilformamida, y la mezcla se calentó hasta alcanzar reflujo suave durante 2 h. Cuando la HPLC indicó que la conversión del material de inicio estaba completa, la mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente, y todos los volátiles se retiraron a presión reducida. El residuo se absorbió en tolueno y se coevaporó para retirar el cloruro de tionilo residual. El compuesto del título se aisló como un sólido marrón claro (20,7 g, 97 %). ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃, 298 K): δ [ppm] = 8.35 - 8.25 (m, 4H).

I.4) Preparación de N,N-dimetil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida

Una solución de cloruro de 4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoílo (1,5 g, 1,0 eq.) y dimetilamina (10,8 ml, 2M en THF, 4 eq.) en tetrahidrofurano (120 ml) se agitó durante la noche, antes de inactivarse mediante la adición de agua, y el producto se extrajo en cloruro de metileno. Las capas orgánicas combinadas se lavaron sucesivamente con soluciones acuosas diluidas de ácido clorhídrico y bicarbonato de sodio, sucesivamente, se secaron sobre sulfato de sodio y se liberaron del solvente a presión reducida para obtener el compuesto del título (1,46 g) que se usó directamente sin purificación adicional.

I.5) Preparación de N,N-dimetil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencencarbotioamida (compuesto Ej. 7)

A una solución de N,N-dimetil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida (200 mg, 1,0 eq.) en tolueno (2,5 ml) se agregó 2,4-bis(4-metoxifenil)-2,4-ditioxo-1,3,2,4-ditiadifosfetano (170 mg, 0,6 eq.). La mezcla resultante se calentó a reflujo hasta que la HPLC indicó la conversión completa del material de inicio. Después de enfriarse a temperatura ambiente, la mezcla se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía flash para obtener el compuesto del título (0,10 g, 79 %).

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃, 298 K): δ [ppm] = 8.16 (d, 2H), 7.48 (d, 2H), 3.61 (s, 3H), 3.20 (s, 3H).

Los compuestos enumerados en la Tabla I se prepararon de manera análoga.

Tabla I: Compuestos Ej. 1 a Ej. 29 de la Fórmula I, en donde A corresponde a las Subfórmula (A.2), en donde el grupo (A.2) es no sustituido, y en donde el significado de R¹ y R² es como se define en cada línea.

Ej. n.º	R ¹	R ²	HPLC R _t (min)*	Punto de fusión (°C)
Ej. 1	CH ₃	bencilo	1,387	63
Ej. 2	CH ₃	ciclopropilo	1,286	113
Ej. 3	H	ciclopropilo	1,170	135
Ej. 4	H	CH ₃	1,163	154
Ej. 5	H	bencilo	1,342	125
Ej. 6	CH ₃	fenilo	1,295	114
Ej. 7	CH ₃	CH ₃	1,129	82
Ej. 8	H	2-cloro-4-fluorofenilo	1,279	142
Ej. 9	CH ₃	2-fluorobencilo	1,301	-
Ej. 10	H	4-fluorobencilo	1,273	133
Ej. 11	H	2-fluorofenilo	1,250	123
Ej. 12	H	4-fluorofenilo	1,266	186
Ej. 13	H	2-metilfenilo	1,234	109
Ej. 14	H	4-metilfenilo	1,263	186
Ej. 15	H	2,4-difluorofenilo	1,239	164
Ej. 16	H	fenilo	1,335	165
Ej. 17	H	etilo	1,246	134
Ej. 18	H	CH ₂ ciclopropilo	1,318	136
Ej. 19	H	isopropilo	1,288	90
Ej. 20	CH ₃	isopropilo	1,305	70
Ej. 21	CH ₃	etilo	1,255	65
Ej. 22	CH ₃	2-fluorofenilo	1,373	-
Ej. 23	CH ₃	4-fluorofenilo	1,356	107
Ej. 24	CH ₃	2-metilfenilo	1,389	-
Ej. 25	CH ₃	4-metilfenilo	1,267	-
Ej. 26	CH ₃	2,4-difluorofenilo	1,379	88
Ej. 27	CH ₃	4-fluorobencilo	1,377	106
Ej. 28	CH ₃	CH ₂ CN	1,197	-
Ej. 29	CH ₃	CH ₂ -ciclopropilo	1,392	69
Ej. 30	H	4-fluoro-2-metilfenilo	1,465	144
Ej. 31	CH ₃	4-fluoro-2-metilfenilo	1,403	-
Ej. 32	H	2-clorofenilo	1,347	104
Ej. 33	CH ₃	2-clorofenilo	1,393	-
Ej. 34	H	2-fluoro-4-metilfenilo	1,343	-
Ej. 35	CH ₃	2-fluoro-4-metilfenilo	1,422	-
Ej. 36	H	4-clorofenilo	1,363	188
Ej. 37	CH ₃	2-cloro-4-fluorofenilo	1,421	118
Ej. 38	CH ₃	4-clorofenilo	1,412	139
Ej. 39	H	<i>ter</i> -butilo	1,346	97
Ej. 40	H	4-cloro-2-fluorofenilo	1,416	143
Ej. 41	CH ₃	4-cloro-2-fluorofenilo	1,461	-
Ej. 42	H	2,2-difluorociclopropilo	1,244	95
Ej. 43	H	2-etilciclopropilo	1,378	94
Ej. 44	H	2-metilciclopropilo	1,317	132
Ej. 45	H	1-metilciclopropilo	1,304	111
Ej. 46	H	2-fluorobencilo	1,331	139

*HPLC: Cromatografía de líquidos de alta resolución; columna de HPLC Kinetex XB

C18 1,7 μ (50 x 2,1 mm); eluyente: acetonitrilo / agua + 0,1 % de ácido trifluoroacético (gradiente de 5:95 a 100 : 0 en 1,5 min a 60 °C; gradiente de flujo de 0,8 a 1,0 ml/min en 1,5 min). MS: Ionización de electrospray cuadrupolo, 80 V (modo positivo). R_t : tiempo de retención en minutos.

II. Ejemplos biológicos de la actividad fungicida

A. Ensayos de invernadero

La acción fungicida de los compuestos de la Fórmula I se demostró mediante los siguientes experimentos. Las soluciones para pulverizar se prepararon en varias etapas. Se preparó una mezcla de acetona y/o sulfóxido de dimetilo, y el agente humectante/emulgente Wettol, que se basa en alquilfenoles etoxilados, en una relación (volumen) solvente:emulgente de 99:1 se agregó a 25 mg del compuesto para obtener un total de 5 ml. Luego se agregó agua hasta alcanzar un volumen total de 100 ml. Esta solución de reserva se diluyó con la mezcla de solvente-emulgente-agua descrita hasta obtener la concentración indicada.

1. Control curativo de la roya de la soja en los porotos de soja causada por *Phakopsora pachyrhizi*

Las hojas de las plántulas de soja cultivadas en macetas se inocularon con esporas de *Phakopsora pachyrhizi*. Para asegurar el éxito de la inoculación artificial, las plantas se transfirieron a una cámara húmeda con una humedad relativa de alrededor de 95 % y una temperatura de 20 a 24 °C durante 24 h. Al día siguiente, las plantas se cultivaron durante 3 días en una cámara de invernadero a una temperatura de 23-27 °C y una humedad relativa de 60 a 80 %. Luego las plantas se pulverizaron hasta quedar empapadas con una suspensión acuosa, que contenía la concentración de ingrediente activo o su mezcla, como se describe más adelante. Las plantas se secaron al aire. Luego, las plantas de prueba se cultivaron durante 14 días en una cámara de invernadero a una temperatura de 23-27 °C y una humedad relativa de 60 a 80 %. El alcance del ataque fúngico en las hojas se evaluó visualmente como % del área enferma de la hoja.

En este ensayo, las plantas que se habían tratado con 32 ppm del compuesto activo Ej. 1, Ej. 2, Ej. 3, Ej. 4, Ej. 5, Ej. 7, Ej. 8, Ej. 9, Ej. 11, Ej. 12, Ej. 13, Ej. 15, Ej. 16, Ej. 17, Ej. 18, Ej. 19, Ej. 20, Ej. 21, Ej. 28, Ej. 32, Ej. 39, Ej. 43, Ej. 44 y Ej. 45 mostraron un área enferma de la hoja de, como máximo, 15%, mientras que las plantas sin tratar mostraron un área enferma de la hoja de 90 %.

2. Control protector de la roya de la soja en los porotos de soja causada por *Phakopsora pachyrhizi*

Las hojas de plántulas de soja cultivadas en macetas se pulverizaron hasta quedar empapadas con una suspensión acuosa que contenía la concentración de ingrediente activo o su mezcla, como se describe más adelante. Las plantas se secaron al aire. Las plantas de prueba se cultivaron durante 2 días en una cámara de invernadero a una temperatura de 23-27 °C y una humedad relativa de 60 a 80 %. Luego, las plantas se inocularon con esporas de *Phakopsora pachyrhizi*. Para asegurar el éxito de la inoculación artificial, las plantas se transfirieron a una cámara húmeda con una humedad relativa de alrededor de 95 % y una temperatura de 20 a 24 °C durante 24 horas. Luego, las plantas de prueba se cultivaron durante 14 días en una cámara de invernadero a una temperatura de 23-27 °C y una humedad relativa de 60 a 80 %. El alcance del ataque fúngico en las hojas se evaluó visualmente como % del área enferma de la hoja.

En este ensayo, las plantas que se habían tratado con 32 ppm del compuesto activo Ej. 1, Ej. 2, Ej. 3, Ej. 4, Ej. 5, Ej. 6, Ej. 7, Ej. 8, Ej. 9, Ej. 10, Ej. 11, Ej. 12, Ej. 13, Ej. 14, Ej. 15, Ej. 16, Ej. 17, Ej. 18, Ej. 19, Ej. 20, Ej. 21, Ej. 23, Ej. 25, Ej. 27, Ej. 28, Ej. 30, Ej. 32, Ej. 34, Ej. 35, Ej. 36, Ej. 39, Ej. 40, Ej. 42, Ej. 43, Ej. 44 y Ej. 45 mostraron un área enferma de la hoja de, como máximo, 15 %, mientras que las plantas sin tratar mostraron un área enferma de la hoja de 90 %.

3. Control curativo de la roya marrón del trigo causada por *Puccinia recondita*

Las primeras dos hojas desarrolladas de las plántulas de trigo cultivadas en maceta se espolvorearon con esporas de *Puccinia recondita*. Para asegurar el éxito de la inoculación artificial, las plantas se transfirieron a una cámara húmeda sin luz con una humedad relativa de 95 a 99 % y una temperatura de 20 a 24 °C durante 24 horas. El día siguiente, las plantas se cultivaron durante 3 días en una cámara de invernadero a una temperatura de 20 a 24 °C y una humedad relativa de 65 a 70 %. Luego las plantas se pulverizaron hasta quedar empapadas con una suspensión acuosa, que contenía la concentración de ingrediente activo o su mezcla, como se describe más adelante. Las plantas se secaron al aire. Luego, las plantas de prueba se cultivaron durante 8 días en una cámara de invernadero a una temperatura de 20 a 24°C y una humedad relativa de 65 a 70 %. El alcance del ataque fúngico en las hojas se evaluó visualmente como % del área enferma de la hoja.

En este ensayo, las plantas que se habían tratado con 63 ppm del compuesto

activo Ej. 1, Ej. 2, Ej. 3, Ej. 4, Ej. 9, Ej. 10, Ej. 17, Ej. 18, Ej. 19, Ej. 21, Ej. 28, Ej. 29, Ej. 43, Ej. 44 y Ej. 45 mostraron un área enferma de la hoja de, como máximo, 15 %, mientras que las plantas sin tratar mostraron un área enferma de la hoja de 90 %.

4. Control preventivo de la roya marrón del trigo causada por *Puccinia recondita*

Las primeras dos hojas desarrolladas de las plántulas de trigo cultivadas en macetas se pulverizaron hasta quedar empapadas con una suspensión acuosa que contenía la concentración de ingrediente activo o su mezcla, como se describe a continuación. Después de siete días, las plantas se inocularon con esporas de *Puccinia recondita*. Para asegurar el éxito de la inoculación artificial, las plantas se transfirieron a una cámara húmeda sin luz con una humedad relativa de 95 a 99 % y una temperatura de 20 a 24 °C durante 24 horas. Luego, las plantas de prueba se cultivaron durante 6 días en una cámara de invernadero a una temperatura de 20 a 24°C y una humedad relativa de 65 a 70 %. El alcance del ataque fúngico en las hojas se evaluó visualmente como % del área enferma de la hoja.

En este ensayo, las plantas que se habían tratado con 63 ppm del compuesto activo Ej. 1, Ej. 3, Ej. 4, Ej. 8, Ej. 9, Ej. 10, Ej. 12, Ej. 13, Ej. 16, Ej. 17, Ej. 18, Ej. 19, Ex-28, Ej. 43, Ej. 44 y Ej. 45 mostraron un área enferma de la hoja de, como máximo, 15 %, mientras que las plantas sin tratar mostraron un área enferma de la hoja de 80 %.