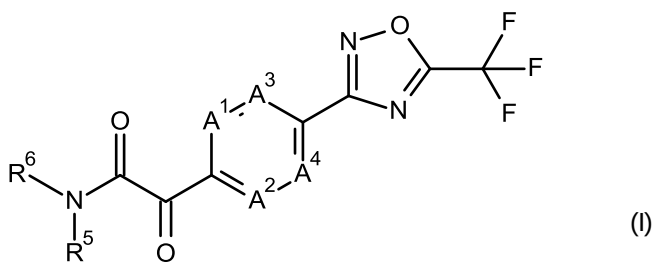


DERIVADOS DE OXADIAZOL MICROBIOCIDAS

La presente invención se refiere a derivados de oxadiazol microbiocidas, p. ej., como principios activos, que tienen actividad microbiciada, en particular actividad fungicida. La invención se refiere además a composiciones agroquímicas que comprenden al menos uno de los derivados de oxadiazol, a procesos de preparación de estos compuestos y a los usos de los derivados de oxadiazol o las composiciones en agricultura u horticultura para controlar o prevenir la infestación de plantas, cultivos alimentarios recolectados, semillas o materiales inertes por parte de microorganismos fitopatógenos, preferentemente hongos.

Los documentos EP 0 276 432 y WO 2015/185485 describen el uso de oxadiazoles sustituidos para combatir hongos fitopatógenos.

De acuerdo con la presente invención, se proporciona un compuesto de Fórmula (I):



donde

A¹ es N o CR¹, A² es CR², A³ es N o CR³ y A⁴ es CR⁴, donde R¹, R², R³ y R⁴ representan cada uno independientemente hidrógeno o halógeno y

donde no más de uno de los grupos A¹ y A³ es N;

R⁵ es hidrógeno, alquilo C₁₋₄, (alcoxi C₁₋₂) (alquilo C₁₋₄), alquenido C₃₋₄, alquino C₃₋₄, ciclopropilo o ciclopropilmetilo;

R^6 es hidrógeno, hidroxilo, amino, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-4} , alqueno C_{3-6} , alquenoilo C_{3-4} , alquenoilo C_{3-6} , alquenoilo C_{3-4} , haloalquilo C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-4} , ciano(alquilo C_{1-6}), hidroxialquilo C_{1-6} , (alcoxi C_{1-2}) (alquilo C_{1-4}), di(alcoxi C_{1-2}) (alquilo C_{1-4}), (alquil C_{1-2}) sulfanil(alquilo C_{1-4}), N,N -di(alquil C_{1-4}) amino, aminoalquilo C_{1-4} , N -(alquil C_{1-4}) amino(alquilo C_{1-4}), N,N -di(alquil C_{1-4}) amino(alquilo C_{1-4}), (alquil C_{1-4}) carbonil(alquilo C_{1-6}), (alcoxi C_{1-4}) carbonil(alquilo C_{1-6}), N -(alquil C_{1-4}) aminocarbonil(alquilo C_{1-4}), N,N -di(alquil C_{1-4}) aminocarbonil(alquilo C_{1-4}), N -(alquil C_{1-4}) carbonilamino(alquilo C_{1-4}), (alquil C_{1-4}) carbonilamino(alquilo C_{1-4}), (alcoxi C_{1-4}) carbonilamino(alquilo C_{1-4}), cicloalquilo C_{3-8} , (cicloalquil C_{3-8}) (alquilo C_{1-2}), (cicloalquil C_{3-8}) carbonilamino(alquilo C_{1-2}), fenilo, fenil(alquilo C_{1-2}), benciloxi, heteroarilo o heteroaril(alquilo C_{1-2}), donde el resto de heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados individualmente entre N, O y S, heterociclilo o heterocicli(alquilo C_{1-2}), donde el resto de heterociclilo es un anillo no aromático de 4 a 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente entre N, O y S, y donde cualquier resto de cicloalquilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados a partir de R^7 ;

R^7 se selecciona entre metilo, etilo, isopropilo, cloro, fluoro, hidroxilo, ciano, difluorometilo,

trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y ciclopropilo; o

cuando R^6 es cicloalquilo C_{3-8} , (cicloalquil C_{3-8})(alquilo C_{1-2}), (cicloalquil C_{3-8})carbonilamino(alquilo C_{1-2}), heterociclilo o heterociclil(alquilo C_{1-2}), R^7 puede representar oxo (=O); o

R^5 y R^6 , junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, forman un ciclo de 4 a 6 miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo o grupo adicional seleccionado entre O, S, $S(O)_2$, carbonilo (C=O) o NR^8 ; donde

R^8 es hidrógeno, metilo o metoxi; o

una de sus sales o *N*-óxidos.

Sorprendentemente, se ha descubierto que los compuestos novedosos de Fórmula (I) tienen, a efectos prácticos, un nivel muy favorable de actividad biológica para proteger plantas contra enfermedades provocadas por hongos.

De acuerdo con un segundo aspecto de la invención, se proporciona una composición agroquímica que comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de Fórmula (I). Una composición agrícola de este tipo puede comprender además al menos un principio activo adicional y/o un diluyente o portador agroquímicamente aceptable.

De acuerdo con un tercer aspecto de la invención, se proporciona un método para controlar o prevenir la infestación de plantas útiles por parte de microorganismos fitopatógenos, donde una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de Fórmula (I), o una composición que comprende este compuesto como principio activo, se aplica a las plantas o sus partes o su emplazamiento.

De acuerdo con un cuarto aspecto de la invención, se proporciona el uso de un compuesto de Fórmula (I) como fungicida. De acuerdo con este aspecto particular de la invención, el uso puede excluir métodos para el tratamiento del cuerpo humano o animal mediante cirugía o terapia.

El término "halógeno" o "halo", tal como se utiliza en la presente, se refiere a flúor (fluoro), cloro, bromo o yodo, preferentemente flúor, cloro o bromo.

El término "alquilo C₁₋₆", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical que es una cadena hidrocarbonada lineal o ramificada constituida únicamente por átomos de carbono e hidrógeno, que no contiene insaturaciones, que tiene de uno a seis átomos de carbono y que está unida al resto de la molécula por un enlace sencillo. Los términos "alquilo C₁₋₄" y "alquilo C₁₋₂" se deben interpretar con el mismo sentido. Los ejemplos de alquilo C₁₋₆ incluyen, sin carácter limitante, metilo, etilo, *n*-propilo, 1-metiletilo (isopropilo), *n*-butilo, 2-metilpropilo (isobutilo) y 1-dimetiletilo (*t*-butilo). Un grupo "alquilenos C₁₋₆" se refiere a la definición correspondiente de alquilo C₁₋₆ (y alquilo C₁₋₄ y alquilo C₁₋₃), excepto que un radical de este tipo está unido al resto de la molécula mediante dos enlaces sencillos. Los ejemplos de alquilenos C₁₋₆ incluyen, sin carácter limitante, -CH₂-, -CH₂CH₂- y -(CH₂)₃-.

El término "ciano", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un grupo -CN.

El término "hidroxi", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un grupo -OH.

El término "amino", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un grupo -NH₂.

El término "alcoxi C₁₋₄", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de fórmula -OR_a donde R_a es un radical alquilo C₁₋₄ tal como se ha definido de manera general anteriormente. Los términos "alcoxi C₁₋₄" y "alcoxi C₁₋₂" se deben interpretar con el mismo sentido. Los ejemplos de alcoxi C₁₋₆ incluyen, sin carácter limitante, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi y *tert*-butoxi.

El término "haloalquilo C₁₋₆", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical alquilo C₁₋₆, tal como se ha definido de manera general anteriormente, sustituido con uno o más átomos de tipo halógeno iguales o diferentes. Los términos "haloalquilo C₁₋₄" y "haloalquilo C₁₋₂" se deben interpretar con el mismo sentido. Los ejemplos de haloalquilo C₁₋₆ incluyen, sin carácter limitante, fluorometilo, fluoroetilo, difluorometilo, trifluorometilo y 2,2,2-trifluoroetilo.

El término "alqueno C₃₋₆", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un grupo radical que es una cadena hidrocarbonada lineal o ramificada constituida únicamente por átomos de carbono e hidrógeno, que contiene al menos un doble enlace que puede tener la configuración (*E*)- o (*Z*), que tiene de tres a seis átomos de carbono y que está unida al resto de la molécula por un enlace sencillo. El término "alqueno C₃₋₄" se debe interpretar con el mismo sentido. Los ejemplos de alqueno C₃₋₆ incluyen, sin carácter limitante, prop-1-enilo, alilo (prop-2-enilo) y but-1-enilo.

El término "alquenoiloxi C₃₋₄", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de fórmula R_aO-, donde R_a es un radical alqueno C₃₋₄ tal como se ha definido de manera general anteriormente.

El término "alquinilo C₃₋₆", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un grupo radical que es una cadena hidrocarbonada lineal o ramificada constituida únicamente por átomos de carbono e hidrógeno, que contiene al menos un triple enlace, que tiene de tres a seis átomos de carbono y que está unida al resto de la molécula por un enlace sencillo. El término "alquinilo C₃₋₄" se debe interpretar con el mismo sentido. Los ejemplos de alquinilo C₃₋₆ incluyen, sin carácter limitante, prop-1-inilo, propargilo (prop-2-inilo) y but-1-inilo.

El término "alquiniloxi C₃₋₄", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de fórmula R_aO-, donde R_a es un radical alquinilo C₃₋₄ tal como se ha definido de manera general anteriormente.

El término "haloalcoxi C₁₋₄", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un grupo alcoxi C₁₋₄ tal como se ha definido anteriormente sustituido con uno o más átomos de tipo halógeno iguales o diferentes. El término "haloalcoxi C₁₋₂" (que incluye fluoroalcoxi C₁₋₂) se debe interpretar con el mismo sentido. Los ejemplos de haloalcoxi C₁₋₄ incluyen, sin carácter limitante, fluorometoxi, difluorometoxi, fluoroetoxi, trifluorometoxi y trifluoroetoxi.

El término "(alcoxi C₁₋₂)(alquilo C₁₋₄)", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de fórmula R_b-O-R_a- donde R_b es un radical alquilo C₁₋₂ tal como se ha definido de manera general anteriormente y R_a es un radical alquilenos C₁₋₄ tal como se ha definido de manera general anteriormente.

El término "aminoalquilo C₁₋₄", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de fórmula H₂NR_a-

donde R_a es un radical alquilenos C_{1-4} tal como se ha definido de manera general anteriormente.

El término "N-(alquil C_{1-4})amino(alquilo C_{1-4})", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de fórmula R_bNH-R_a- , donde R_b es un radical alquilo C_{1-4} tal como se ha definido de manera general anteriormente y R_a es un radical alquilenos C_{1-4} tal como se ha definido de manera general anteriormente.

El término "N-(alquil C_{1-4})aminocarbonil(alquilo C_{1-4})", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de fórmula $R_bNHC(O)R_a-$, donde R_b es un radical alquilo C_{1-4} tal como se ha definido de manera general anteriormente y R_a es un radical alquilenos C_{1-4} tal como se ha definido de manera general anteriormente.

El término "N-(alquil C_{1-4})carbonilamino(alquilo C_{1-4})", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de fórmula $R_bC(O)NHR_a-$, donde R_b es un radical alquilo C_{1-4} tal como se ha definido de manera general anteriormente y R_a es un radical alquilenos C_{1-4} tal como se ha definido de manera general anteriormente.

El término "(alcoxi C_{1-4})carbonilamino(alquilo C_{1-4})", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de fórmula $R_bOC(O)NHR_a-$, donde R_b es un radical alquilo C_{1-4} tal como se ha definido de manera general anteriormente y R_a es un radical alquilenos C_{1-4} tal como se ha definido de manera general anteriormente. Los ejemplos de (alcoxi C_{1-4})carbonilamino(alquilo C_{1-4}) incluyen, sin carácter limitante, *t*-butoxicarbonilaminoetilo.

El término "hidroxialquilo C_{1-6} ", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical alquilo C_{1-6} tal

como se ha definido de manera general anteriormente sustituido con uno o más grupos hidroxilo.

El término "(alquil C₁₋₂)sulfanil(alquilo C₁₋₄)", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de fórmula R_aSR_b-, donde R_a es un radical alquilo C₁₋₂ tal como se ha definido de manera general anteriormente y R_b es un radical alquilenos C₁₋₄ tal como se ha definido de manera general anteriormente. El término "metilsulfanil(alquilo C₁₋₂)" se debe interpretar con el mismo sentido.

El término "ciano(alquilo C₁₋₆)", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical alquilo C₁₋₆ tal como se ha definido de manera general anteriormente sustituido con uno o más grupos ciano. El término "ciano(alquilo C₁₋₄)" se debe interpretar con el mismo sentido. Los ejemplos de ciano(alquilo C₁₋₆) incluyen, sin carácter limitante, cianometilo.

El término "(alquil C₁₋₄)carbonil(alquilo C₁₋₆)", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de fórmula -R_bC(O)R_a donde R_a es un alquilo C₁₋₄ tal como se ha definido de manera general anteriormente y R_b es un radical alquilenos C₁₋₆ tal como se ha definido de manera general anteriormente. El término "(alquil C₁₋₄)carbonil(alquilo C₁₋₄)" se debe interpretar con el mismo sentido.

El término "(alcoxi C₁₋₄)carbonil(alquilo C₁₋₆)", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de fórmula -R_bC(O)OR_a, donde R_a es un radical alquilo C₁₋₄ tal como se ha definido de manera general anteriormente y R_b es un radical alquilenos C₁₋₆ tal como se ha definido de manera general anteriormente.

El término "(alquil C₁₋₄)aminocarbonil(alquilo C₁₋₄)", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical

de fórmula $-R_bC(O)NHR_a$, donde R_a es un radical alquilo C_{1-4} tal como se ha definido de manera general anteriormente y R_b es un radical alquilenos C_{1-4} tal como se ha definido de manera general anteriormente.

El término "cicloalquilo C_{3-8} ", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical anular monocíclico estable que está saturado o parcialmente insaturado y contiene de 3 a 8 átomos de carbono. El término "cicloalquilo C_{3-6} " se debe interpretar con el mismo sentido. Los ejemplos de cicloalquilo C_{3-8} incluyen, sin carácter limitante, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

El término "(cicloalquil C_{3-8})(alquilo C_{1-2})", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un anillo de cicloalquilo C_{3-8} , tal como se ha definido anteriormente, unido al resto de la molécula mediante un radical alquilenos C_{1-2} tal como se ha definido anteriormente. El término "(cicloalquil C_{3-6})(alquilo C_{1-2})" se debe interpretar con el mismo sentido. Los ejemplos de (cicloalquil C_{3-8})(alquilo C_{1-2}) incluyen, sin carácter limitante, ciclopropilmetilo y ciclobutiletilo.

El término "(cicloalquil C_{3-8})carbonilamino(alquilo C_{1-2})", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un anillo de cicloalquilo C_{3-8} , tal como se ha definido anteriormente, unido al resto de la molécula mediante un radical de fórmula $-C(O)NHR_a-$, donde R_a es un radical alquilenos C_{1-2} tal como se ha definido de manera general anteriormente. Los ejemplos de (cicloalquil C_{3-8})carbonilamino(alquilo C_{1-2}) incluyen, sin carácter limitante, ciclopropilcarbonilaminoetilo.

El término "fenil(alquilo C₁₋₂)", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un anillo de fenilo unido al resto de la molécula mediante un radical alquileo C₁₋₂ tal como se ha definido anteriormente. Los ejemplos de
5 fenil(alquilo C₁₋₂) incluyen, sin carácter limitante, bencilo.

El término "heteroarilo", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical anular aromático monocíclico de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4
10 heteroátomos seleccionados individualmente entre nitrógeno, oxígeno y azufre. El radical heteroarilo puede estar unido al resto de la molécula mediante un átomo de carbono o un heteroátomo. Los ejemplos de heteroarilo incluyen furanilo, pirrolilo, tienilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo,
15 isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, triazolilo, tetrazolilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidilo, piridilo e indolilo.

El término "heteroaril(alquilo C₁₋₂)", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un anillo de
20 heteroarilo tal como se ha definido anteriormente que está unido al resto de la molécula mediante un radical alquileo C₁₋₂ tal como se ha definido anteriormente.

El término "heterociclilo" o "heterocíclico", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical anular monocíclico no aromático estable de 5 o 6 miembros que
25 comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente entre nitrógeno, oxígeno y azufre. El radical heterociclilo se puede unir al resto de la molécula mediante un átomo de carbono o un heteroátomo. Los ejemplos
30 de heterociclilo incluyen, sin carácter limitante, pirrolinilo, pirrolidilo, tetrahidrofuranilo,

tetrahidrotienilo, tetrahidrotiopiraniilo, piperidilo, piperazinilo, tetrahidropiraniilo, dioxolanilo, morfolinilo, oxazinaniilo, oxetaniilo, δ -lactaniilo, perhidroazepinilo, indolinilo o bencimidazol. Preferentemente, los ejemplos de heterocicliilo son morfolinilo, oxazinaniilo, oxetaniilo y piperazinilo (especialmente morfolinilo, oxetaniilo y piperazinilo).

El término "heterocicliil(alquilo C₁₋₂)", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un anillo heterocíclico tal como se ha definido anteriormente que está unido al resto de la molécula mediante un radical alquilenilo C₁₋₂ tal como se ha definido anteriormente.

La presencia de uno o más átomos de carbono asimétricos posibles en un compuesto de Fórmula (I) significa que los compuestos pueden existir en formas isoméricas quirales, es decir, formas enantioméricas o diastereoméricas. También pueden existir atropoisómeros como resultado de la rotación restringida alrededor de un enlace sencillo. Se pretende que la Fórmula (I) incluya todas estas formas isoméricas posibles y sus mezclas. La presente invención incluye todas aquellas formas isoméricas posibles y sus mezclas para los compuestos de Fórmula (I). Asimismo, se pretende que la Fórmula (I) incluya todos los tautómeros posibles (incluida la tautomería lactama-lactima y la tautomería ceto-enol) cuando estén presentes. La presente invención incluye todas las formas tautoméricas posibles para un compuesto de Fórmula (I).

En cada caso, los compuestos de Fórmula (I) de acuerdo con la invención se encuentran en forma libre, en forma oxidada como un *N*-óxido, en forma hidratada covalentemente

o en forma de sal, p. ej., una forma salina agronómicamente útil o agroquímicamente aceptable.

Los N-óxidos son formas oxidadas de aminas terciarias o formas oxidadas de compuestos heteroaromáticos que contienen nitrógeno. Se describen, por ejemplo, en el libro "Heterocyclic N-oxides" de A. Albini y S. Pietra, CRC Press, Boca Ratón 1991.

La siguiente lista proporciona definiciones, incluidas las definiciones preferidas, para los sustituyentes A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 y R^8 , que hacen referencia a los compuestos de Fórmula (I) de acuerdo con la invención. Para cualquiera de estos sustituyentes, se puede combinar cualquiera de las definiciones que se indican a continuación con cualquier definición de cualquier otro sustituyente que se indique a continuación o en otra sección de este documento.

A^1 es N o CR^1 , A^2 es CR^2 , A^3 es N o CR^3 y A^4 es CR^4 , donde R^1 , R^2 , R^3 y R^4 representan cada uno independientemente hidrógeno o halógeno y donde no más de uno de los grupos A^1 y A^3 es N.

Preferentemente, A^1 representa N o CR^1 , donde R^1 se selecciona entre hidrógeno, fluoro y cloro. Más preferentemente, R^1 es hidrógeno o fluoro. De la manera más preferida, R^1 es hidrógeno.

Preferentemente, R^2 se selecciona entre hidrógeno, fluoro y cloro. Más preferentemente, R^2 es hidrógeno o fluoro. De la manera más preferida, R^2 es hidrógeno.

Preferentemente, A^3 representa N o CR^3 , donde R^3 se selecciona entre hidrógeno, fluoro y cloro. Más preferentemente, R^3 es hidrógeno o fluoro. De la manera más preferida, R^3 es hidrógeno.

Preferentemente, R^4 se selecciona entre hidrógeno, fluoro y cloro. Más preferentemente, R^4 es hidrógeno o fluoro. De la manera más preferida, R^4 es hidrógeno.

En una realización, A^1 es CR^1 , A^3 es CR^3 , A^2 y A^4 son cada uno C-H, donde R^1 y R^3 son cada uno independientemente hidrógeno o fluoro.

En una realización adicional, A^1 es CR^1 , donde R^1 representa fluoro, y A^2 , A^3 y A^4 representan cada uno hidrógeno. En una realización adicional más, A^1 , A^2 y A^4 representan cada uno hidrógeno y A^3 es CR^3 , donde R^3 representa fluoro.

Preferentemente, al menos dos de los grupos A^1 , A^2 , A^3 y A^4 son C-H. Más preferentemente, al menos tres de los grupos A^1 , A^2 , A^3 y A^4 son C-H, donde cuando A^1 es N, A^2 , A^3 y A^4 representan todos C-H, y cuando A^3 es N, A^1 , A^2 y A^3 representan cada uno C-H. En una realización, A^1 , A^2 , A^3 y A^4 son cada uno C-H.

R^5 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} , (alcoxi C_{1-2})(alquilo C_{1-4}), alquenilo C_{3-4} , alquinilo C_{3-4} , ciclopropilo o ciclopropilmetilo. Preferentemente, R^5 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} , (alcoxi C_{1-2})(alquilo C_{1-4}), ciclopropilo o ciclopropilmetilo. Más preferentemente, R^5 es hidrógeno, alquilo C_{1-4} o (alcoxi C_{1-2})(alquilo C_{1-4}). Aún más preferentemente, R^5 es hidrógeno, metilo, etilo, metoxi, metoximetilo o metoxietilo. Más preferentemente todavía, R^5 es hidrógeno, metilo o metoxietilo. De la manera más preferida, R^5 es hidrógeno.

R^6 es hidrógeno, hidroxilo, amino, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-4} , alquenilo C_{3-6} , alqueniloxi C_{3-4} , alquinilo C_{3-6} , alquiniloxi C_{3-4} , haloalquilo C_{1-6} , haloalcoxi C_{1-4} , ciano(alquilo C_{1-6}), hidroxialquilo C_{1-6} , (alcoxi C_{1-4})

2) (alquilo C₁₋₄), di(alcoxi C₁₋₂)(alquilo C₁₋₄), (alquil C₁₋₂)sulfanil(alquilo C₁₋₄), N,N-di(alquil C₁₋₄)amino, aminoalquilo C₁₋₄, N-(alquil C₁₋₄)amino(alquilo C₁₋₄), N,N-di(alquil C₁₋₄)amino(alquilo C₁₋₄), (alquil C₁₋₄)carbonil(alquilo C₁₋₆), (alcoxi C₁₋₄)carbonil(alquilo C₁₋₆), N-(alquil C₁₋₄)aminocarbonil(alquilo C₁₋₄), N,N-di(alquil C₁₋₄)aminocarbonil(alquilo C₁₋₄), N-(alquil C₁₋₄)carbonilamino(alquilo C₁₋₄), (alquil C₁₋₄)carbonilamino(alquilo C₁₋₄), (alcoxi C₁₋₄)carbonilamino(alquilo C₁₋₄), cicloalquilo C₃₋₈, (cicloalquil C₃₋₈)(alquilo C₁₋₂), (cicloalquil C₃₋₈)carbonilamino(alquilo C₁₋₂), fenilo, fenil(alquilo C₁₋₂), benciloxi, heteroarilo, heteroaril(alquilo C₁₋₂), donde el resto de heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados individualmente entre N, O y S, heterociclilo, heterociclil(alquilo C₁₋₂), donde el resto de heterociclilo es un anillo no aromático de 4 a 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente entre N, O y S, y donde cualquier resto de cicloalquilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados a partir de R⁷.

Preferentemente, R⁶ se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₄, alqueno C₃₋₆, alqueno C₃₋₄, alqueno C₃₋₆, alqueno C₃₋₄, haloalquilo C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₄, ciano(alquilo C₁₋₆), hidroxialquilo C₁₋₆, (alcoxi C₁₋₂)(alquilo C₁₋₄), di(alcoxi C₁₋₂)(alquilo C₁₋₄), (alquil C₁₋₂)sulfanil(alquilo C₁₋₄), N,N-di(alquil C₁₋₄)amino, aminoalquilo C₁₋₄, N,N-di(alquil C₁₋₄)amino(alquilo C₁₋₄),

(alquil C₁₋₄)carbonil(alquilo C₁₋₆), (alcoxi C₁₋₄)carbonil(alquilo C₁₋₆), N-(alquil C₁₋₄)amino(alquilo C₁₋₄), (alquil C₁₋₄)carbonilamino(alquilo C₁₋₄), (alcoxi C₁₋₄)carbonilamino(alquilo C₁₋₄), cicloalquilo C₃₋₈,
5 (cicloalquil C₃₋₈)(alquilo C₁₋₂), (cicloalquil C₃₋₈)carbonilamino(alquilo C₁₋₂), fenilo, fenil(alquilo C₁₋₂), benciloxi, heteroarilo, heteroaril(alquilo C₁₋₂), donde el resto de heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados
10 individualmente entre N, O y S, heterociclilo, heterociclil(alquilo C₁₋₂), donde el resto de heterociclilo es un anillo no aromático de 4 a 6 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente entre N, O y S, y donde cualquier resto de cicloalquilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo está opcionalmente sustituido
15 con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados a partir de R⁷.

Más preferentemente, R⁶ se selecciona entre hidrógeno, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₂, alquenilo C₃₋₄, alqueniloxi C₃₋₄,
20 alquinilo C₃₋₄, alquiniloxi C₃₋₄, haloalquilo C₁₋₂, haloalcoxi C₁₋₂, cianometilo, hidroxietilo, metoxi(alquilo C₁₋₂), dimetoxi(alquilo C₁₋₂), metilsulfanil(alquilo C₁₋₂), N,N-di(alquil C₁₋₂)amino, aminoalquilo C₁₋₂, N,N-di(alquil C₁₋₂)amino(alquilo C₁₋₂), (alquil C₁₋₂)carbonil(alquilo C₁₋₂),
25 metilaminocarbonil(alquilo C₁₋₂), (alcoxi C₁₋₂)carbonil(alquilo C₁₋₂), (alquil C₁₋₂)carbonilamino(alquilo C₁₋₂), (alcoxi C₁₋₄)carbonilamino(alquilo C₁₋₂), cicloalquilo C₃₋₆, (cicloalquil C₃₋₆)(alquilo C₁₋₂), (cicloalquil C₃₋₆)carbonilamino(alquilo C₁₋₂), fenilo, fenil(alquilo C₁₋₂),
30 benciloxi, heteroarilo, heteroaril(alquilo C₁₋₂), donde el resto de heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6

miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente entre N, O y S, heterociclilo, heterocicliil(alquilo C₁₋₂), donde el resto de heterociclilo es un anillo no aromático de 4 a 6 miembros que comprende 1
5 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente entre N, O y S, y donde cualquier resto de cicloalquilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados a partir de R⁷.

10 Aún más preferentemente, R⁶ se selecciona entre hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, *n*-butilo, isobutilo, etoxi, alilo, aliloxi, prop-2-inilo, prop-2-inoxi, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-difluoroetoxi, cianometilo, hidroxietilo, 2-metoxietilo, 2,2-
15 dimetoxietilo, metilsulfaniletilo, *N,N*-dimetilamino, aminoetilo, *N,N*-dimetilaminoetilo, metilcarbonilmetilo, metoxycarbonilmetilo, metilaminocarbonilmetilo, metilcarbonilaminoetilo, *tert*-butoxycarbonilaminoetilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclopropilmetilo, ciclopropilcarbonilaminoetilo, fenilo, bencilo, benciloxi,
20 2-piridilo, 2-tienilmetilo, oxetan-3-ilo, isoxazolidin-4-ilo, 1,4-dioxan-2-ilmetilo, y donde cualquier resto de cicloalquilo, fenilo, heteroarilo o heterociclilo está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que
25 pueden ser iguales o diferentes, seleccionados a partir de R⁷.

Más preferentemente todavía, R⁶ se selecciona entre hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, *n*-butilo, isobutilo, etoxi, alilo, aliloxi, prop-2-inilo, prop-2-
30 inoxi, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-difluoroetoxi, cianometilo, hidroxietilo, 2-metoxietilo, 2,2-

dimetoxietilo, metilsulfaniletilo, *N,N*-dimetilamino, aminoetilo, *N,N*-dimetilaminoetilo, metilcarbonilmetilo, metoxycarbonilmetilo, metilaminocarbonilmetilo, metilcarbonilaminoetilo, *tert*-butoxicarbonilaminoetilo, 5 ciclopropilo, 2,2-difluorociclopentilo, ciclopropilmetilo, ciclopropilcarbonilaminoetilo, fenilo, 2-fluorobencilo, benciloxi, 6-metoxi-2-piridilo, 3-metil-2-tienilmetilo, oxetan-3-ilo, 2-etil-3-oxoisoxazolidin-4-ilo y 1,4-dioxan-2-ilmetilo.

10 Aún más preferentemente todavía, R^6 se selecciona entre etilo, *n*-propilo, alilo, prop-2-inilo, 2-fluoroetilo, *tert*-butoxicarbonilaminoetilo, ciclopropilmetilo, 6-metoxi-2-piridilo y 2,2-difluorociclopentilo.

15 R^7 se selecciona entre metilo, etilo, isopropilo, cloro, fluoro, hidroxilo, ciano, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi, difluorometoxi y ciclopropilo; preferentemente, R^7 se selecciona entre metilo, etilo, isopropilo, cloro, fluoro, difluorometilo, trifluorometilo, metoxi, etoxi y difluorometoxi; más 20 preferentemente, R^7 se selecciona entre metilo, etilo, fluoro y metoxi, de la forma más preferida R^7 es fluoro o metoxi.

25 Cuando R^6 es cicloalquilo C_{3-8} , (cicloalquil C_{3-8})(alquilo C_{1-2}), (cicloalquil C_{3-8})carbonilamino(alquilo C_{1-2}), heterociclilo o heterociclílo(alquilo C_{1-2}), R^7 también puede representar oxo (=O); preferentemente, cuando R^6 es cicloalquilo C_{3-8} o heterociclilo, R^7 también puede representar oxo (=O); más preferentemente, cuando R^6 es heterociclilo, R^7 también puede representar oxo (=O).

30 Como alternativa, R^5 y R^6 , junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, forman un ciclo de 4 a 6

miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo o grupo adicional seleccionado entre O, S, S(O)₂, oxo (=O) y NR⁸; donde R⁸ es hidrógeno, metilo o metoxi.

Preferentemente, R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, forman un ciclo de 5 o 6 miembros que contiene opcionalmente un heteroátomo o grupo adicional seleccionado entre O y NR⁸; donde R⁸ es hidrógeno, metilo o metoxi.

Más preferentemente, R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, forman un anillo de morfolino, 1,2-oxazinanilo, 1,4-oxazinanilo, pirrolidinilo o metoxipiperazinilo.

Aún más preferentemente, R⁵ y R⁶, junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, forman un anillo de morfolino, pirrolidinilo o metoxipiperazinilo.

En un conjunto de realizaciones, R⁶ se selecciona entre alquilo C₁₋₃, alquenilo C₃, alquinilo C₃, (alcoxi C₁₋₄)carbonil(alquilo C₁₋₂), cicloalquilo C₃₋₆, (cicloalquil C₃₋₆)metilo o heteroarilo, donde cualquier resto de cicloalquilo o heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, los cuales pueden ser iguales o diferentes, seleccionados a partir de R⁷, donde R⁷ se selecciona entre metilo, etilo, fluoro y metoxi.

Preferentemente, el compuesto de acuerdo con la Fórmula (I) se selecciona entre un compuesto 1.1-1.46 enumerado en la Tabla T1 (más adelante).

Preferentemente, en un compuesto de acuerdo con la Fórmula (I) de la invención, A¹, A², A³ y A⁴ son C-H;

R⁵ es hidrógeno;

R⁶ es alquilo C₁₋₆, alquenilo C₃₋₆, alquinilo C₃₋₆, haloalquilo C₁₋₆, (alcoxi C₁₋₄)carbonilamino(alquilo C₁₋₄),

cicloalquilo C₃₋₈, (cicloalquil C₃₋₈)(alquilo C₁₋₂) o heteroarilo, donde el resto de heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente entre N, O y S, y donde cualquiera de los restos de cicloalquilo y heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, los cuales pueden ser iguales o diferentes, seleccionados a partir de R⁷; y

R⁷ es metilo, etilo, fluoro o metoxi.

Más preferentemente, A¹, A², A³ y A⁴ son C-H;

R⁵ es hidrógeno;

R⁶ es alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂, alquenilo C₃₋₆, alquinilo C₃₋₆, (alcoxi C₁₋₄)carbonilamino(alquilo C₁₋₂), cicloalquilo C₃₋₆, (cicloalquil C₃₋₆)(alquilo C₁₋₂) o heteroarilo, donde el resto de heteroarilo es un anillo aromático de 6 miembros que comprende 1 átomo de nitrógeno, y donde cualquiera de los restos de cicloalquilo y heteroarilo está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, los cuales pueden ser iguales o diferentes, seleccionados a partir de R⁷; y

R⁷ es fluoro o metoxi.

Aún más preferentemente, A¹, A², A³ y A⁴ son cada uno C-H;

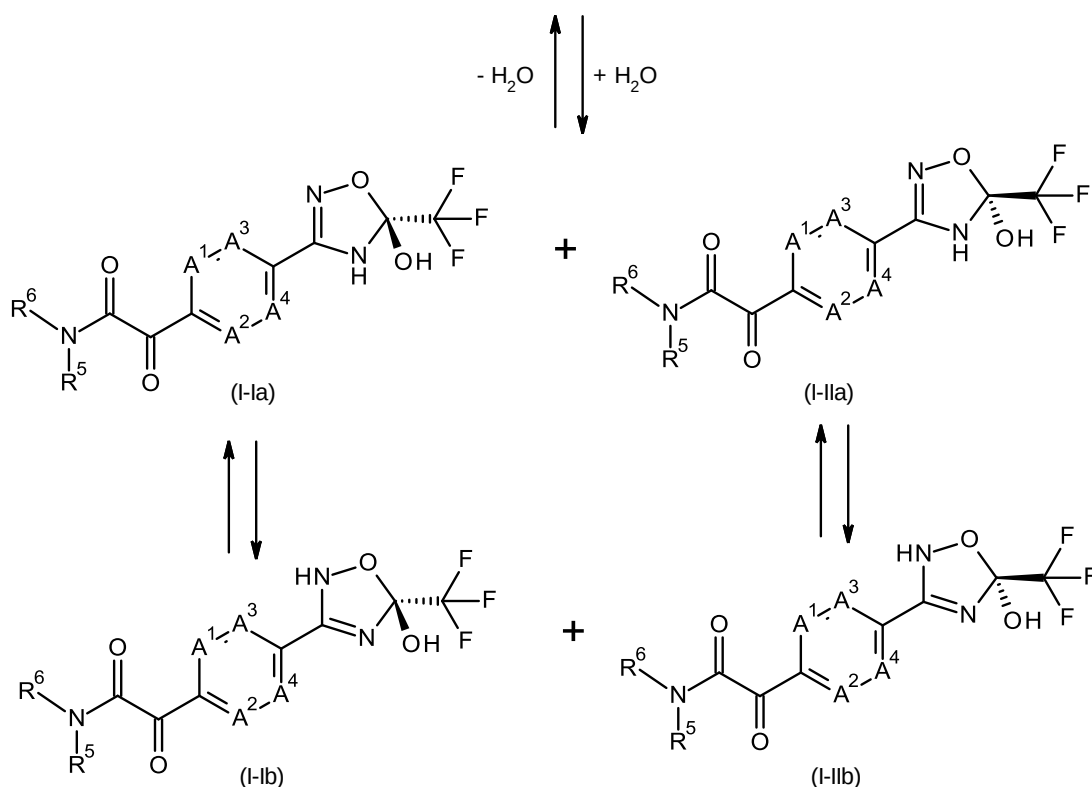
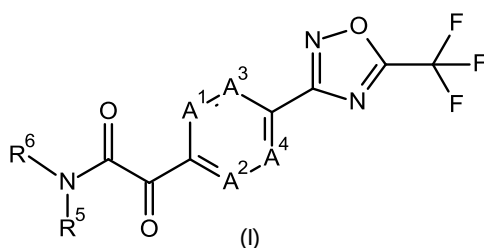
R⁵ es hidrógeno; y

R⁶ es etilo, *n*-propilo, 2-fluoroetilo, alilo, prop-2-inilo, *tert*-butoxicarbonilaminoetilo, ciclopropilmetilo, 2,2-difluorociclopentilo o 6-metoxi-2-piridilo.

Se sobreentiende que, cuando están en medios acuosos, los compuestos de Fórmula (I) de acuerdo con la invención pueden estar presentes en un equilibrio reversible con las correspondientes formas hidratadas covalentemente (es

decir, los compuestos de Fórmula (I-Ia) y Fórmula (I-IIa) que se muestran a continuación, los cuales pueden existir en forma tautomérica como los compuestos de Fórmula (I-Ib) y Fórmula (I-IIb)) en el motivo CF₃-oxadiazol. Este equilibrio dinámico puede ser importante para la actividad biológica de los compuestos de Fórmula (I).

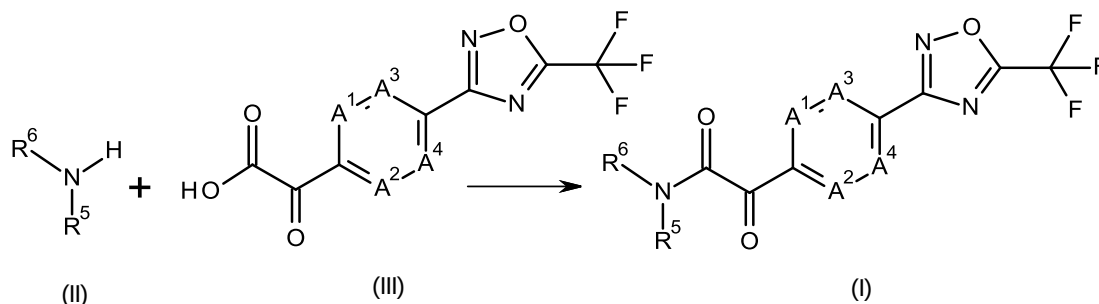
Las designaciones de A¹, A², A³, A⁴, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸, que hacen referencia a los compuestos de Fórmula (I) de la presente invención, se aplican generalmente a los compuestos de Fórmula (I-I) y Fórmula (I-II), así como también a las divulgaciones específicas de las combinaciones de A¹, A², A³, A⁴, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ y R⁸, según se representa para los compuestos de Fórmula (I) en las Tablas 1.1-1.5 (más adelante) o en las Tablas 2.1-2.3 (más adelante), o los compuestos 1.1-1.46 que se describen en la Tabla T1 (más adelante).



Los compuestos de la presente invención se pueden preparar como se muestra en los siguientes esquemas 1-12, en los que, a menos que se indique lo contrario, la definición de cada variable es como se ha definido en la presente para un compuesto de Fórmula (I).

Los compuestos de Fórmula (I) se pueden obtener mediante una transformación de tipo acoplamiento de amida con compuestos de Fórmula (II) y compuestos de Fórmula (III), activando la función ácido carboxílico de los compuestos de Fórmula (III), un proceso que normalmente tiene lugar convirtiendo el -OH del ácido carboxílico en un

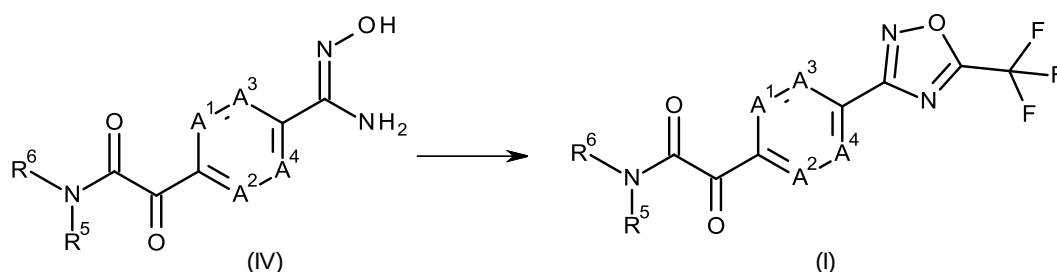
buen grupo saliente, tal como un grupo cloruro, por ejemplo, utilizando $(\text{COCl})_2$ o SOCl_2 , antes del tratamiento con los compuestos de Fórmula (II), preferentemente en un disolvente adecuado (p. ej., dimetilformamida, diclorometano o tetrahidrofurano), preferentemente a una temperatura comprendida entre 25 °C y 100 °C y, opcionalmente, en presencia de una base tal como trietilamina o *N,N*-diisopropiletilamina o en condiciones descritas en la bibliografía para un acoplamiento de amida. Para consultar algunos ejemplos, remítase a Valeur, E.; Bradley, M. *Chem. Soc. Rev.* (2009), 38, 606 y Chinchilla, R., Najera, C. *Chem. Soc. Rev.* (2011), 40, 5084. Los compuestos de Fórmula (III) o bien son conocidos o se pueden adquirir de proveedores comerciales. Esto se muestra en el Esquema 1 a continuación.



Esquema 1

Como alternativa, los compuestos de Fórmula (I) se pueden preparar a partir de compuestos de Fórmula (IV) mediante el tratamiento con anhídrido trifluoroacético en presencia de una base (p. ej., piridina o 4-dimetilaminopiridina) en un disolvente adecuado, tal como tetrahidrofurano o etanol, a una temperatura comprendida entre 25 °C y 75 °C. Para consultar algunos ejemplos relacionados, remítase a: los documentos WO 2003/028729 y

WO 2010/045251. Esta reacción se muestra en el Esquema 2 a continuación.

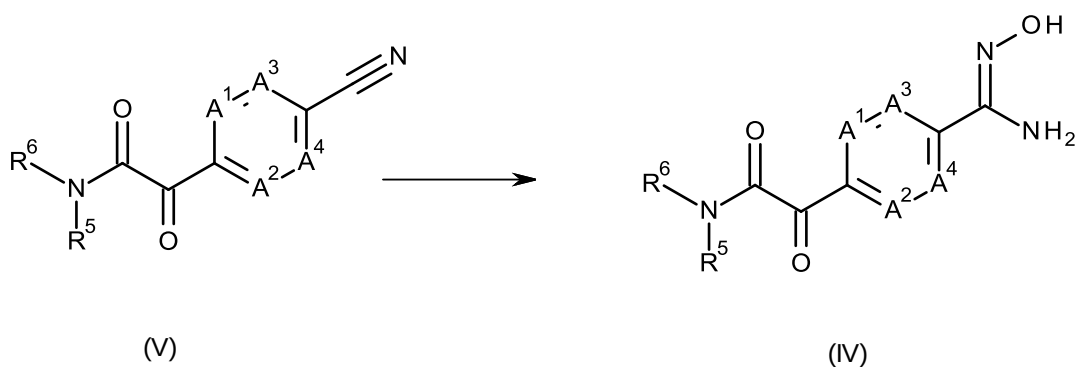


Esquema 2

Los compuestos de Fórmula (IV) se pueden preparar a partir de compuestos de Fórmula (V) mediante el tratamiento con clorhidrato de hidroxilamina en presencia de una base tal como trietilamina, en un disolvente adecuado tal como metanol, a una temperatura comprendida entre 0 °C y 100 °C. Para consultar algunos ejemplos relacionados, remítase a Kitamura, S. *et al Chem. Pharm. Bull.* (2001), 49, 268 y el documento WO 2013/066838. Esta reacción se muestra en el Esquema 3 a continuación.

10

15



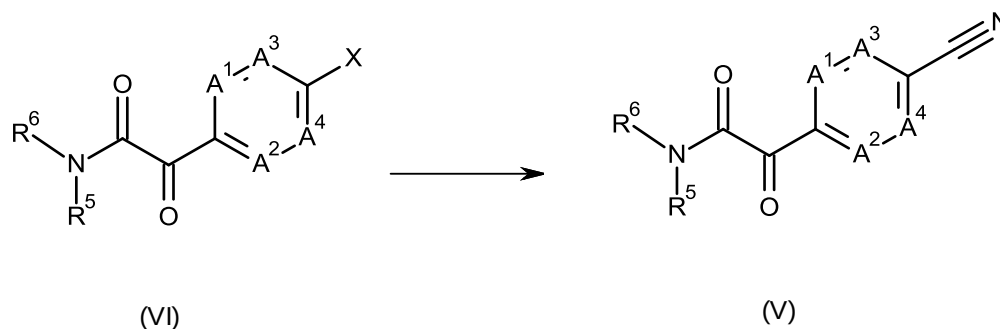
Esquema 3

Los compuestos de Fórmula (V) se pueden preparar a partir de compuestos de Fórmula (VI), donde X es Br o I, mediante una reacción que emplea un metal como promotor con un reactivo de tipo cianuro adecuado, tal como Pd(0)/Zn(CN)₂ o CuCN, en un disolvente adecuado (p. ej., dimetilformamida o N-metilpirrolidona) a una temperatura

25

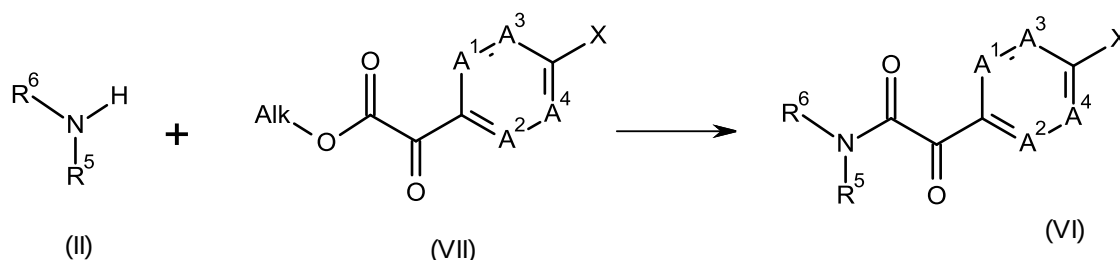
30

elevada comprendida entre 100 °C y 120 °C. Para consultar algunos ejemplos relacionados, remítase a los documentos US 2007/0155739 y WO 2009/022746. Esta reacción se muestra en el Esquema 4 a continuación.



Esquema 4

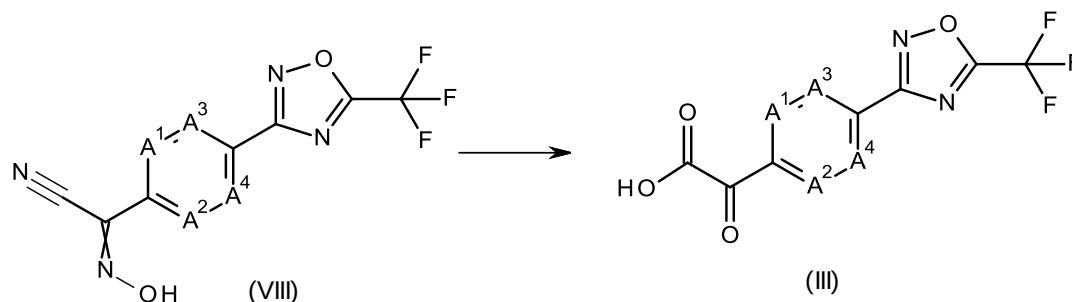
Los compuestos de Fórmula (VI), donde X es Br, I o CN, se pueden obtener mediante una transformación de tipo acoplamiento de amida con compuestos de Fórmula (II) y compuestos de Fórmula (VII), donde Alk es metilo o etilo, preferentemente en un disolvente adecuado (p. ej., dimetilformamida, diclorometano o tetrahidrofurano) a una temperatura comprendida entre 25 °C y 100 °C. Los compuestos de Fórmula (II) y los compuestos de Fórmula (VII) o bien son conocidos o se pueden adquirir de proveedores comerciales. Esta reacción se muestra en el Esquema 5 a continuación.



Esquema 5

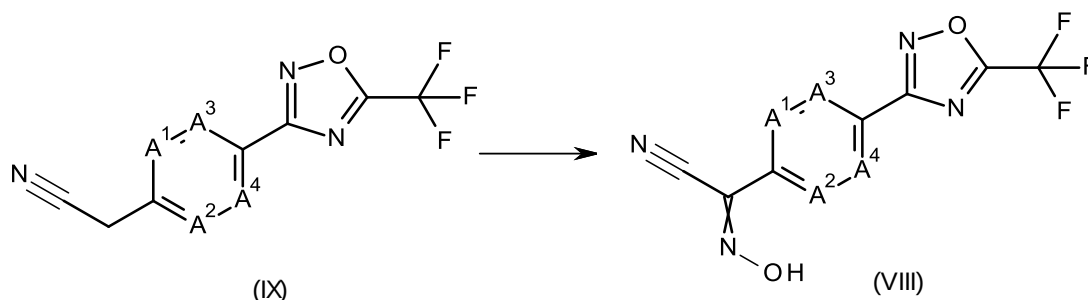
Los compuestos de Fórmula (III) se pueden obtener a partir de compuestos de Fórmula (VIII) utilizando ácido clorhídrico acuoso concentrado y un segundo componente

ácido, preferentemente ácido acético o ácido trifluoroacético, a temperaturas elevadas comprendidas entre 80 °C y 100 °C. Esta reacción se muestra en el Esquema 6 a continuación.



Esquema 6

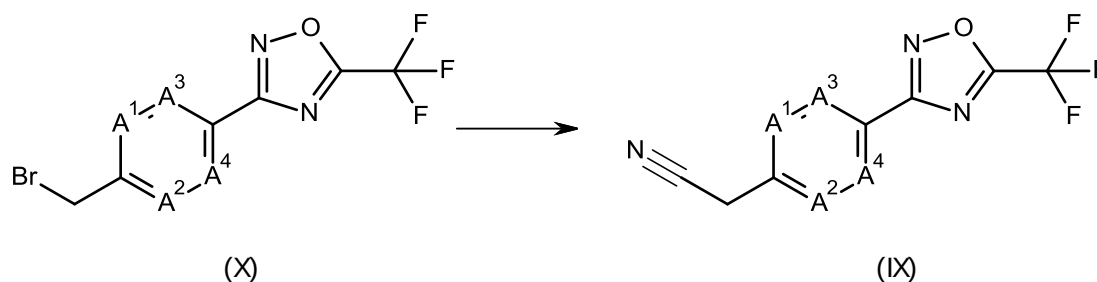
Los compuestos de Fórmula (VIII) se pueden obtener a partir de compuestos de Fórmula (IX) utilizando condiciones oxidantes, preferentemente con nitrito de sodio, en presencia de un ácido (p. ej., HCl), en un disolvente adecuado (p. ej., dioxano) a una temperatura comprendida entre 0 °C y 25 °C. Esta reacción se muestra en el Esquema 7 a continuación.



Esquema 7

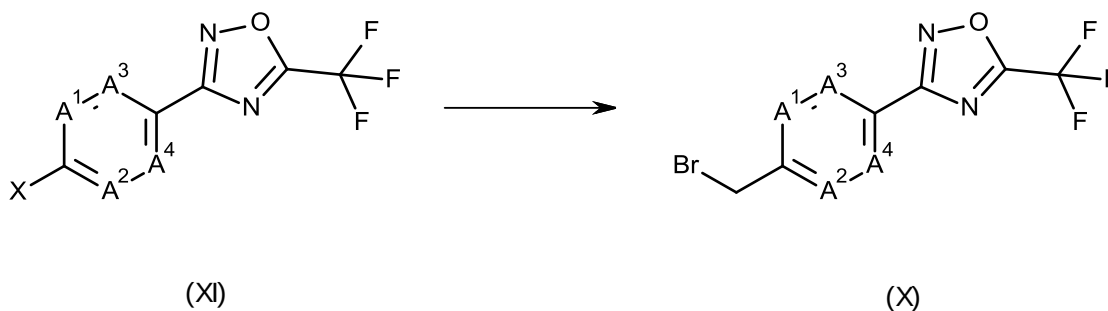
Los compuestos de Fórmula (IX) se pueden obtener a partir de compuestos de Fórmula (X) mediante una sustitución nucleofílica, preferentemente con KCN o cianuro de trimetilsililo en presencia de una fuente de fluoruro (p. ej., fluoruro de tetrabutilamonio), preferentemente en un disolvente adecuado (p. ej., acetonitrilo o DMSO) a una

temperatura comprendida entre 0 °C y 25 °C. Para consultar algunos ejemplos relacionados, remítase a Friedman, L. Shechter, H. *J. Org. Chem.* (**1960**), 877. Esta reacción se muestra en el Esquema 8 a continuación.



Esquema 8

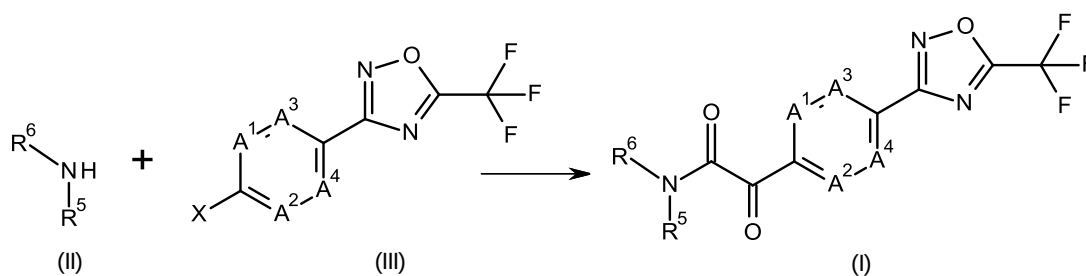
Los compuestos de Fórmula (X) se pueden preparar a partir de compuestos de Fórmula (XI), donde X es CH₃, mediante el tratamiento con una fuente de halógeno (p. ej., N-bromosuccinimida (NBS) o N-clorosuccinimida (NCS)) y un iniciador de radicales (p. ej., (PhCO₂)₂ o azobisisobutironitrilo (AIBN)) en un disolvente adecuado tal como tetraclorometano, a temperaturas comprendidas entre 55 °C y 100 °C en presencia de luz ultravioleta. Para consultar algunos ejemplos relacionados, remítase a Liu, S. *et al. Synthesis* (**2001**), 14, 2078 y Kompella, A. *et al. Org. Proc. Res. Dev.* (**2012**), 16, 1794. Esta reacción se muestra en el Esquema 9.



Esquema 9

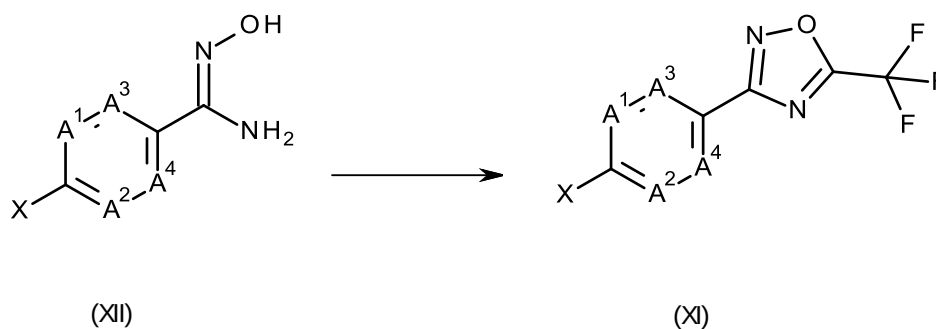
Los compuestos de Fórmula (I) se pueden obtener a partir de compuestos de Fórmula (XI), donde X es I, y una

amina de Fórmula (II), mediante una transformación de tipo dicarbonilación de un grupo amino catalizada por paladio, utilizando un complejo de un catalizador de paladio (p. ej., catalizador de PEPPSI™-IPr o un precursor de un catalizador de paladio con ligando de tipo XantPhos) y una atmósfera de monóxido de carbono (p. ej., 5 bar) en presencia de una base adecuada (p. ej., K₂CO₃) en un disolvente adecuado (p. ej., dioxano) a una temperatura comprendida entre 25 °C y 35 °C. Para consultar algunos ejemplos relacionados, remítase a Fang, W. *et al Org. Lett.*, **2013**, 15, 3678; Friis, D. *et al Org. Lett.*, 2014, 16, 4296-4299. Esta reacción se muestra en el Esquema 10 a continuación.



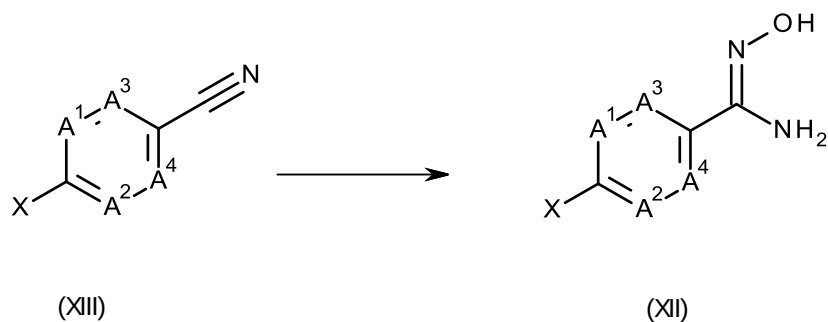
Esquema 10

Los compuestos de Fórmula (XI), donde X es I o CH₃, se pueden preparar a partir de compuestos de Fórmula (XII) mediante el tratamiento con anhídrido trifluoroacético, cloruro trifluoroacético o fluoruro trifluoroacético, en presencia de una base (p. ej., piridina o 4-dimetilaminopiridina) en un disolvente adecuado, tal como tetrahidrofurano o etanol, a una temperatura comprendida entre 25 °C y 75 °C. Para consultar algunos ejemplos relacionados, remítase a los documentos WO 2003/028729 y WO 2010/045251. Esto se muestra en el Esquema 11.



Esquema 11

Los compuestos de Fórmula (XII), donde X es I o CH₃, se pueden preparar a partir de compuestos de Fórmula (XIII) mediante el tratamiento con clorhidrato de hidroxilamina en presencia de una base tal como trietilamina, en un disolvente adecuado tal como metanol, a una temperatura comprendida entre 0 °C y 100 °C. Para consultar algunos ejemplos relacionados, remítase a Kitamura, S. *et al Chem. Pharm. Bull.* (2001), 49, 268 y el documento WO 2013/066838. Los compuestos de Fórmula (XIII) o bien son conocidos o se pueden adquirir de proveedores comerciales. Esta reacción se muestra en el Esquema 12 a continuación.



Esquema 12

Como ya se ha indicado, sorprendentemente, se acaba de descubrir que los compuestos novedosos de Fórmula (I) de la presente invención tienen, a efectos prácticos, un nivel muy ventajoso de actividad biológica para proteger plantas contra enfermedades que están provocadas por hongos.

Los compuestos de Fórmula (I) se pueden utilizar en el sector agrícola y campos de uso relacionados, p. ej., como principios activos para controlar plagas en plantas o en materiales inertes para controlar microorganismos responsables de su descomposición u organismos potencialmente dañinos para el ser humano. Los compuestos novedosos se diferencian por su excelente actividad con tasas de aplicación bajas, por ser bien tolerados por las plantas y por ser ecológicos. Tienen unas propiedades curativas, preventivas y sistémicas muy útiles, y pueden utilizarse para proteger numerosas plantas de cultivo. Los compuestos de Fórmula (I) se pueden utilizar para inhibir o destruir las plagas que aparecen en plantas o partes de plantas (frutos, flores, hojas, tallos, tubérculos, raíces) de diferentes cultivos de plantas útiles, a la vez que también protegen aquellas partes de las plantas que crecen más tarde, p. ej., de los microorganismos fitopatógenos.

La presente invención se refiere además a un método para controlar o prevenir la infestación de plantas o material de propagación vegetal y/o cultivos alimentarios recolectados susceptibles de ser atacados por microbios mediante el tratamiento de las plantas o material de propagación vegetal y/o cultivos alimentarios recolectados donde se aplica una cantidad eficaz de un compuesto de Fórmula (I) a las plantas, a partes de estas o al emplazamiento de estas.

También es posible utilizar compuestos de Fórmula (I) como fungicidas. El término "fungicida", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un compuesto que controla, modifica o previene el crecimiento de hongos. La expresión "cantidad eficaz como fungicida", cuando se

utilice, se refiere a la cantidad de un compuesto de este tipo o combinación de compuestos de este tipo que es capaz de producir un efecto sobre el crecimiento de los hongos. Los efectos de control o modificación incluyen toda desviación del desarrollo natural, tal como su exterminación, ralentización y similares, y la prevención incluye una barrera u otra formación defensiva en una planta o sobre esta para prevenir la infección fúngica.

También puede ser posible emplear los compuestos de Fórmula (I) como agentes de revestimiento para tratar el material de propagación vegetal, p. ej., semillas, tales como frutos, tubérculos o granos, o esquejes vegetales, para protegerlo contra infecciones fúngicas, así como también contra hongos fitopatógenos presentes en el suelo. El material de propagación se puede tratar con una composición que comprende un compuesto de Fórmula (I) antes de plantarlo: la semilla, por ejemplo, se puede revestir antes de ser sembrada. Los compuestos activos de Fórmula (I) también se pueden aplicar a granos (recubrimiento), ya sea impregnando las semillas en una formulación líquida o recubriéndolas con una formulación sólida. La composición también se puede aplicar al sitio de siembra cuando el material de propagación está siendo plantado, por ejemplo, al surco de la semilla durante la siembra. La invención se refiere también a tales métodos de tratamiento del material de propagación vegetal y al material de propagación vegetal tratado de tal modo.

Además, los compuestos de Fórmula (I) se pueden emplear para controlar hongos en áreas relacionadas, por ejemplo, en la protección de materiales técnicos, que incluyen la madera y productos técnicos relacionados con la

madera, en el almacenamiento de alimentos y en la gestión sanitaria.

Además, la invención se podría emplear para proteger materiales inertes contra ataques fúngicos, p. ej., madera, paneles para tabicar y pintura.

Los compuestos de Fórmula (I) son eficaces, por ejemplo, contra hongos y vectores fúngicos de enfermedades, así como también bacterias y virus fitopatógenos. Estos hongos y vectores fúngicos de enfermedades, así como también las bacterias y virus fitopatógenos, son, por ejemplo:

Absidia corymbifera, *Alternaria* spp, *Aphanomyces* spp, *Ascochyta* spp, *Aspergillus* spp. que incluyen *A. flavus*, *A. fumigatus*, *A. nidulans*, *A. niger*, *A. terrus*, *Aureobasidium* spp. que incluyen *A. pullulans*, *Blastomyces dermatitidis*, *Blumeria graminis*, *Bremia lactucae*, *Botryosphaeria* spp. que incluyen *B. dothidea*, *B. obtusa*, *Botrytis* spp. que incluyen *B. cinerea*, *Candida* spp. que incluyen *C. albicans*, *C. glabrata*, *C. krusei*, *C. lusitaniae*, *C. parapsilosis*, *C. tropicalis*, *Cephaloascus fragrans*, *Ceratocystis* spp, *Cercospora* spp. que incluyen *C. arachidicola*, *Cercosporidium personatum*, *Cladosporium* spp, *Claviceps purpurea*, *Coccidioides immitis*, *Cochliobolus* spp, *Colletotrichum* spp. que incluyen *C. musae*, *Cryptococcus neoformans*, *Diaporthe* spp, *Didymella* spp, *Drechslera* spp, *Elsinoe* spp, *Epidermophyton* spp, *Erwinia amylovora*, *Erysiphe* spp. que incluyen *E. cichoracearum*, *Eutypa lata*, *Fusarium* spp. que incluyen *F. culmorum*, *F. graminearum*, *F. langsethiae*, *F. moniliforme*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. subglutinans*, *F. solani*, *Gaeumannomyces graminis*, *Gibberella fujikuroi*, *Gloeodes pomigena*, *Gloeosporium*

musarum, *Glomerella cingulate*, *Guignardia bidwellii*,
Gymnosporangium juniperi-virginianae, *Helminthosporium* spp,
Hemileia spp, *Histoplasma* spp. que incluyen *H. capsulatum*,
Laetisaria fuciformis, *Leptographium lindbergi*, *Leveillula*
5 *taurica*, *Lophodermium seditiosum*, *Microdochium nivale*,
Microsporum spp, *Monilinia* spp, *Mucor* spp, *Mycosphaerella*
spp. que incluyen *M. graminicola*, *M. pomi*, *Oncobasidium*
theobromaeon, *Ophiostoma piceae*, *Paracoccidioides* spp,
Penicillium spp. que incluyen *P. digitatum*, *P. italicum*,
10 *Petriellidium* spp, *Peronosclerospora* spp. que incluyen *P.*
maydis, *P. philippinensis* y *P. sorghi*, *Peronospora* spp,
Phaeosphaeria nodorum, *Phakopsora pachyrhizi*, *Phellinus*
igniarius, *Phialophora* spp, *Phoma* spp, *Phomopsis viticola*,
Phytophthora spp. que incluyen *P. infestans*, *Plasmopara*
15 spp. que incluyen *P. halstedii*, *P. viticola*, *Pleospora*
spp., *Podosphaera* spp. que incluyen *P. leucotricha*,
Polymyxa graminis, *Polymyxa betae*, *Pseudocercospora*
herpotrichoides, *Pseudomonas* spp, *Pseudoperonospora* spp.
que incluyen *P. cubensis*, *P. humuli*, *Pseudopeziza*
20 *tracheiphila*, *Puccinia* Spp. que incluyen *P. hordei*, *P.*
recondita, *P. striiformis*, *P. tritici*, *Pyrenopeziza* spp,
Pyrenophora spp, *Pyricularia* spp. que incluyen *P. oryzae*,
Pythium spp. que incluyen *P. ultimum*, *Ramularia* spp,
Rhizoctonia spp, *Rhizomucor pusillus*, *Rhizopus arrhizus*,
25 *Rhynchosporium* spp, *Scedosporium* spp. que incluyen *S.*
apiospermum y *S. prolificans*, *Schizothyrium pomi*,
Sclerotinia spp, *Sclerotium* spp, *Septoria* spp, que incluyen
S. nodorum, *S. tritici*, *Sphaerotheca macularis*,
Sphaerotheca fusca (*Sphaerotheca fuliginea*), *Sporothrix*
30 spp, *Stagonospora nodorum*, *Stemphylium* spp, *Stereum*
hirsutum, *Thanatephorus cucumeris*, *Thielaviopsis basicola*,

Tilletia spp, *Trichoderma* spp. que incluyen *T. harzianum*,
T. pseudokoningii, *T. viride*, *Trichophyton* spp, *Typhula*
spp, *Uncinula necator*, *Urocystis* spp, *Ustilago* spp,
Venturia spp. que incluyen *V. inaequalis*, *Verticillium* spp
y *Xanthomonas* spp.

Los compuestos de Fórmula (I) se pueden emplear, por
ejemplo, en el césped, en plantas ornamentales tales como
flores, arbustos, árboles latifolios o perennifolios, por
ejemplo, coníferas, así como también para la inyección de
árboles, gestión de plagas y similares.

Dentro del alcance de la presente invención, los
cultivos y/o plantas útiles diana que se han de proteger
comprenden normalmente cultivos perennes y anuales tales
como plantas de bayas, por ejemplo, moras, arándanos
azules, arándanos rojos, frambuesas y frutillas; cereales,
por ejemplo, cebada, maíz, mijo, avena, arroz, centeno,
sorgo, triticale y trigo; plantas que producen fibra, por
ejemplo, algodón, lino, cáñamo, yute y sisal; cultivos de
campo, por ejemplo, azúcar y remolacha forrajera, café,
lúpulos, mostaza, colza oleaginosa (canola), amapola, caña
de azúcar, girasol, té y tabaco; árboles frutales, por
ejemplo, los que producen manzana, damasco, palta, banana,
cereza, cítricos, nectarina, durazno, pera y ciruela;
pastos, por ejemplo, grama común, pasto azul, *Agrostis*,
Eremocloa ophiuroides, festuca, *Lolium*, pasto de San
Agustín y pasto Zoysia; hierbas tales como albahaca,
borraja, ciboulette, cilantro, lavanda, apio de monte,
menta, orégano, perejil, romero, salvia y tomillo;
legumbres, por ejemplo, porotos, lentejas, arvejas y soja;
frutos secos, por ejemplo, almendra, castaña de cajú,
cacahuete, avellana, maní, pacana, pistacho y nuez;

palmeras, por ejemplo, palmera oleaginosa; plantas ornamentales, por ejemplo, flores, arbustos y árboles; otros árboles, por ejemplo, de cacao, coco, oliva y caucho; hortalizas, por ejemplo, espárragos, berenjena, brócoli, repollo, zanahoria, pepino, ajo, lechuga, zapallito, melón, quingombó, cebolla, pimiento, papa, zapallo, ruibarbo, espinaca y tomate; y vides, por ejemplo, uvas.

Se debe sobreentender que la expresión "plantas útiles" también incluye las plantas útiles que han sido modificadas para que sean tolerantes a herbicidas, tales como bromoxinilo, o a clases de herbicidas (tales como, por ejemplo, inhibidores de HPPD, inhibidores de ALS, por ejemplo, primisulfurón, prosulfurón y trifloxisulfurón, inhibidores de EPSPS (5-enolpirovil-shikimato-3-fosfato-sintasa), inhibidores de GS (glutamina-sintetasa) o inhibidores de PPO (protoporfirinógeno-oxidasa)) como resultado de métodos convencionales de cultivo selectivo o de ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que ha sido modificado para que sea tolerante a imidazolinonas, p. ej., imazamox, mediante métodos convencionales de cultivo selectivo (mutagénesis) es la colza de verano Clearfield® (canola). Los ejemplos de cultivos que han sido modificados para que sean tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas mediante métodos de ingeniería genética incluyen las variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato comercializadas con los nombres comerciales RoundupReady®, Herculex I® y LibertyLink®.

Se debe sobreentender que la expresión "plantas útiles" también incluye plantas útiles que han sido transformadas utilizando técnicas de ADN recombinante, las cuales son capaces de sintetizar una o más toxinas que

actúan selectivamente tales como, por ejemplo, las conocidas que proceden de bacterias que producen toxinas, especialmente las del género *Bacillus*.

Algunos ejemplos de estas plantas son: YieldGard® (variedad del maíz que expresa una toxina CryIA(b)); YieldGard Rootworm® (variedad del maíz que expresa una toxina CryIIIB(b1)); YieldGard Plus® (variedad del maíz que expresa una toxina CryIA(b) y una toxina CryIIIB(b1)); Starlink® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry9(c)); Herculex I® (variedad del maíz que expresa una toxina CryIF(a2) y la enzima fosfinotricina-N-acetiltransferasa (PAT) para conseguir tolerancia al herbicida glufosinato de amonio); NuCOTN 33B® (variedad del algodón que expresa una toxina CryIA(c)); Bollgard I® (variedad del algodón que expresa una toxina CryIA(c)); Bollgard II® (variedad del algodón que expresa una toxina CryIA(c) y una toxina CryIIA(b)); VIPCOT® (variedad del algodón que expresa una toxina VIP); NewLeaf® (variedad de la papa que expresa una toxina CryIIIA); NatureGard® Agrisure® GT Advantage (rasgo de tolerancia a glifosato GA21), Agrisure® CB Advantage (rasgo del barrenador del maíz (CB) Bt11), Agrisure® RW (rasgo del gusano de la raíz del maíz) y Protecta®.

Se debe sobreentender que el término "cultivos" también incluye las plantas de cultivo que han sido transformadas mediante el uso de técnicas de ADN recombinante de tal forma que son capaces de sintetizar una o más toxinas que actúan selectivamente tales como, por ejemplo, las conocidas que proceden de bacterias que producen toxinas, especialmente las del género *Bacillus*.

Las toxinas que pueden ser expresadas por estas plantas transgénicas incluyen, por ejemplo, proteínas insecticidas de *Bacillus cereus* o *Bacillus popilliae*; o proteínas insecticidas de *Bacillus thuringiensis* tales como δ -endotoxinas, p. ej., Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 o Cry9C, o proteínas insecticidas vegetativas (Vip), p. ej., Vip1, Vip2, Vip3 o Vip3A; o proteínas insecticidas de nematodos que colonizan bacterias, por ejemplo, *Photorhabdus* spp. o *Xenorhabdus* spp., tales como *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; toxinas producidas por animales tales como toxinas de escorpiones, toxinas de arácnidos, toxinas de avispa y otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos tales como toxinas de estreptomicetos, lectinas de plantas tales como lectinas de arvejas, lectinas de cebada o lectinas de la campanilla de invierno; aglutininas; inhibidores de proteinasas tales como inhibidores de la tripsina, inhibidores de la serina-proteasa, inhibidores de la patatina, cistatina, papaína; proteínas que desactivan ribosomas (RIP, por sus siglas en inglés) tales como ricina, RIP del maíz, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas que participan en el metabolismo de esteroides tales como 3-hidroxiesteroxidasa, ecdiesterioide-UDP-glicosiltransferasa, colesterol-oxidasas, inhibidores de la ecdisona, HMG-COA-reductasa, bloqueadores de los canales iónicos tales como los bloqueadores de los canales del sodio o el calcio, esterasa de la hormona juvenil, receptores de hormonas diuréticas, estilbeno-sintasa, bibencilo-sintasa, quitinasas y glucanasas.

Además, en el contexto de la presente invención, se debe sobreentender que las δ -endotoxinas son, por ejemplo, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 o Cry9C, o proteínas insecticidas vegetativas (Vip), por ejemplo, Vip1, Vip2, Vip3 o Vip3A, expresamente también toxinas híbridas, toxinas truncadas y toxinas modificadas. Las toxinas híbridas se producen de manera recombinante mediante una nueva combinación de diferentes dominios de estas proteínas (remítase, por ejemplo, al documento WO 02/15701). Existe constancia de toxinas truncadas, por ejemplo, una toxina Cry1Ab truncada. En el caso de las toxinas modificadas, se reemplazan uno o más aminoácidos de la toxina de origen natural. En tales reemplazos de aminoácidos, preferentemente se insertan secuencias de reconocimiento de proteasas artificiales en la toxina, como, por ejemplo, en el caso de Cry3A055, en el que se inserta una secuencia de reconocimiento de catepsina-G en una toxina Cry3A (remítase al documento WO 03/018810).

Se describen ejemplos de estas toxinas o plantas transgénicas capaces de sintetizar estas toxinas, por ejemplo, en los documentos EP-A-0 374 753, WO93/07278, WO95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878 y WO 03/052073.

Los procesos para preparar estas plantas transgénicas son generalmente conocidos por los expertos en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas previamente. Los ácidos desoxirribonucleicos de tipo CryI y su preparación se describen, por ejemplo, en los documentos WO 95/34656, EP-A-0 367 474, EP-A-0 401 979 y WO 90/13651.

La toxina contenida en las plantas transgénicas confiere a las plantas tolerancia a insectos dañinos. Estos insectos pueden pertenecer a cualquier grupo taxonómico de

insectos, pero de forma habitual pertenecen especialmente al grupo de los escarabajos (coleópteros), insectos con dos alas (dípteros) y mariposas (lepidópteros).

Existe constancia de plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican resistencia a insecticidas y expresan una o más toxinas, y algunas de ellas se pueden adquirir de proveedores comerciales. Algunos ejemplos de estas plantas son: YieldGard® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry1Ab); YieldGard Rootworm® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry3Bb1); YieldGard Plus® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry1Ab y una Cry3Bb1); Starlink® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry9C); Herculex I® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry1Fa2 y la enzima fosfinotricina-*N*-acetiltransferasa (PAT) para conseguir tolerancia al herbicida glufosinato de amonio); NuCOTN 33B® (variedad del algodón que expresa una toxina Cry1Ac); Bollgard I® (variedad del algodón que expresa una toxina Cry1Ac); Bollgard II® (variedad del algodón que expresa una toxina Cry1Ac y una Cry2Ab); VipCot® (variedad del algodón que expresa una toxina Vip3A y una Cry1Ab); NewLeaf® (variedad de la papa que expresa una toxina Cry3A); NatureGard®, Agrisure® GT Advantage (rasgo tolerante a glifosato GA21), Agrisure® CB Advantage (rasgo del barrenador del maíz (CB) Bt11) y Protecta®.

Otros ejemplos de tales cultivos transgénicos son:

1. **Maíz Bt11** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. *Zea mays* modificado genéticamente que se ha vuelto resistente al ataque del barrenador del maíz europeo (*Ostrinia nubilalis* y *Sesamia nonagrioides*) mediante la

expresión transgénica de una toxina Cry1Ab truncada. El maíz Bt11 también expresa transgénicamente la enzima PAT para lograr tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

5 2. **Maíz Bt176** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. *Zea mays* modificado genéticamente que se ha vuelto resistente al ataque del barrenador del maíz europeo (*Ostrinia nubilalis* y *Sesamia nonagrioides*) mediante la expresión transgénica de una toxina Cry1Ab. El maíz Bt176
10 también expresa transgénicamente la enzima PAT para lograr tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

15 3. **Maíz MIR604** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. Consiste en maíz que se ha modificado para que sea resistente a insectos mediante la expresión transgénica de una toxina Cry3A modificada. Esta toxina es Cry3A055 modificada mediante la inserción de una secuencia de reconocimiento de la proteasa catepsina G. La preparación de estas plantas de maíz transgénicas se
20 describe en el documento WO 03/018810.

 4. **Maíz MON 863** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/DE/02/9. MON 863 expresa una toxina Cry3Bb1 y tiene resistencia a determinados insectos coleópteros.

25 5. **Algodón IPC 531** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/ES/96/02.

30 6. **Maíz 1507** de Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Bruselas, Bélgica, número de registro C/NL/00/10. Consiste en maíz modificado genéticamente para que exprese la proteína Cry1F, con el fin de obtener

resistencia a determinados insectos lepidópteros, y para que exprese la proteína PAT, con el fin de lograr tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

5 7. **Maíz NK603 × MON 810** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/GB/02/M3/03. Consiste en variedades de maíz híbridas cultivadas de forma convencional mediante el cruce de las variedades modificadas genéticamente NK603 y MON 810. El maíz NK603 × MON 810 expresa transgénicamente la
10 proteína CP4 EPSPS, obtenida de la cepa CP4 de *Agrobacterium sp.*, la cual confiere tolerancia al herbicida Roundup® (contiene glifosato), y también expresa una toxina Cry1Ab obtenida a partir de *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*, la cual proporciona tolerancia a determinados
15 lepidópteros, incluido el gusano barrenador del maíz europeo.

El término "emplazamiento", tal como se utiliza en la presente, se refiere a campos en los cuales o sobre los cuales crecen las plantas, o donde se siembran semillas de
20 plantas cultivadas o donde se colocarán semillas en el suelo. Este término incluye el suelo, las semillas y las plántulas, así como también la vegetación establecida.

El término "plantas" se refiere a todas las partes físicas de una planta, incluidas las semillas, plántulas,
25 briznas, raíces, tubérculos, tallos, espigas, follaje y frutos.

Se sobreentenderá que la expresión "material de propagación vegetal" se refiere a partes generativas de la planta, tales como las semillas, las cuales se pueden
30 emplear para la multiplicación de esta última, y a material vegetativo, tal como esquejes o tubérculos, por ejemplo,

papas. Cabe mencionar, por ejemplo, semillas (en el sentido estricto), raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas y partes de plantas. También se pueden mencionar plantas germinadas y plantas jóvenes que se van a trasplantar después de que germinen o después de que emerjan del suelo. Estas plantas jóvenes pueden protegerse antes de trasplantarlas mediante un tratamiento total o parcial por inmersión. Preferentemente, se sobreentiende que el "material de propagación vegetal" se refiere a las semillas.

Los compuestos de Fórmula (I) se pueden emplear en una forma no modificada o, preferentemente, junto con adyuvantes empleados tradicionalmente en el campo de la formulación. Con este fin, se pueden formular convenientemente de una forma conocida para obtener concentrados emulsionables, pastas que se pueden aplicar como recubrimiento, soluciones o suspensiones diluibles o que se pueden pulverizar directamente, emulsiones diluidas, polvos humectables, polvos solubles, polvos finos, materiales granulados y también encapsulaciones, p. ej., en sustancias poliméricas. Al igual que para el tipo de composiciones, los métodos de aplicación, tales como pulverización, atomización, espolvoreo, dispersión, recubrimiento o vertido, se seleccionan de acuerdo con los objetivos deseados y las circunstancias predominantes. Las composiciones también pueden contener otros adyuvantes tales como estabilizantes, antiespumantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes o adherentes, así como fertilizantes, dadores de micronutrientes u otras formulaciones para obtener efectos especiales.

Los adyuvantes y portadores adecuados, p. ej., para uso agrícola, pueden ser sólidos o líquidos y son sustancias útiles en la tecnología de la formulación, p. ej., sustancias minerales naturales o regeneradas, disolventes, dispersantes, agentes humectantes, adherentes, espesantes, aglutinantes o fertilizantes. Estos portadores se describen, por ejemplo, en el documento WO 97/33890.

Los concentrados en suspensión son formulaciones acuosas en las que se suspenden partículas sólidas finamente divididas del compuesto activo. Estas formulaciones incluyen agentes antisedimentación y agentes dispersantes y pueden incluir, además, un agente humectante para mejorar la actividad, así como también un antiespumante y un inhibidor del crecimiento cristalino. Cuando se utilizan, estos concentrados se diluyen en agua y se aplican normalmente como un aerosol a la zona que se desee tratar. La cantidad de principio activo puede variar entre un 0.5% y un 95% del concentrado.

Los polvos humectables se presentan en forma de partículas finamente divididas que se dispersan fácilmente en agua u otros portadores líquidos. Las partículas contienen el principio activo retenido en una matriz sólida. Las matrices sólidas típicas incluyen tierra de fuller, arcillas caoliníticas, sílices y otros sólidos orgánicos o inorgánicos fácilmente humectables. Los polvos humectables normalmente contienen entre un 5% y un 95% del principio activo más una pequeña cantidad del agente humectante, dispersante o emulsionante.

Los concentrados emulsionables son composiciones líquidas homogéneas dispersables en agua u otro líquido, y pueden constar únicamente del compuesto activo con un

agente emulsionante líquido o sólido, o también pueden
contener un portador líquido, tal como xileno, naftas
aromáticas pesadas, isoforona y otros disolventes orgánicos
no volátiles. Cuando se utilizan, estos concentrados se
dispersan en agua u otro líquido y se aplican normalmente
como un aerosol a la zona que se desee tratar. La cantidad
de principio activo puede variar entre un 0.5% y un 95% del
concentrado.

Las formulaciones granulares incluyen tanto extrudados
como partículas relativamente gruesas y se aplican
comúnmente sin dilución a la zona en la que se requiere el
tratamiento. Los portadores típicos para formulaciones
granulares incluyen arena, tierra de fuller, arcilla
atapulgítica, arcillas bentoníticas, arcilla
montmorillonítica, vermiculita, perlita, carbonato de
calcio, ladrillo, piedra pómez, pirofilita, caolín,
dolomita, escayola, harina de madera, mazorcas de maíz
molidas, cáscara de maní molida, azúcares, cloruro de
sodio, sulfato de sodio, silicato de sodio, borato de
sodio, magnesia, mica, óxido de hierro, óxido de zinc,
óxido de titanio, óxido de antimonio, criolita, yeso,
tierra de diatomeas, sulfato de calcio y otros materiales
orgánicos o inorgánicos que absorben el compuesto activo o
que pueden recubrirse con este. Las formulaciones
granulares normalmente contienen entre un 5% y un 25% de
principios activos que pueden incluir agentes tensioactivos
tales como naftas aromáticas pesadas, querosén y otras
fracciones de petróleo o aceites vegetales; y/o adherentes
tales como dextrinas, pegamento o resinas sintéticas.

Los polvos finos son mezclas no aglomeradas del
principio activo con sólidos finamente divididos tales como

talco, arcillas, harinas y otros sólidos orgánicos e inorgánicos que actúan como agentes dispersantes y portadores.

Las microcápsulas son normalmente microgotas o gránulos del principio activo envueltos en una carcasa porosa inerte que permite la salida del material envuelto hacia su entorno en tasas controladas. Las microgotas encapsuladas tienen normalmente un diámetro de entre 1 y 50 micrómetros. El líquido envuelto normalmente constituye entre un 50 y un 95% del peso de la cápsula y puede incluir disolvente además del compuesto activo. Los gránulos encapsulados son generalmente gránulos porosos con membranas porosas que sellan las aberturas de los poros de los gránulos, de este modo se retienen las especies activas en forma líquida dentro de los poros de los gránulos. Los gránulos tienen normalmente un diámetro de entre 1 milímetro y 1 centímetro y, preferentemente, de entre 1 y 2 milímetros. Los gránulos se forman por extrusión, aglomeración o perlado, o son de origen natural. Son ejemplos de tales materiales la vermiculita, arcilla sinterizada, caolín, arcilla atapulgítica, serrín y carbón granular. Los materiales de la membrana o la carcasa incluyen cauchos naturales y sintéticos, materiales celulósicos, copolímeros de estireno-butadieno, poliacrilonitrilos, poliacrilatos, poliésteres, poliamidas, poliureas, poliuretanos y xantatos de almidón.

Otras formulaciones útiles para aplicaciones agroquímicas incluyen simples soluciones del principio activo en un disolvente en el que sea completamente soluble para la concentración deseada, tal como acetona, naftalenos alquilados, xileno y otros disolventes orgánicos. Se pueden

utilizar también pulverizadores presurizados, en los que el principio activo se dispersa de forma finamente dividida como resultado de la vaporización de un portador del disolvente dispersante de bajo punto de ebullición.

5 Los expertos en la técnica estarán familiarizados con los adyuvantes y portadores agrícolas adecuados que son útiles para formular las composiciones de la invención en los tipos de formulaciones descritos anteriormente.

Los portadores líquidos que se pueden utilizar
10 incluyen, por ejemplo, agua, tolueno, xileno, nafta de petróleo, aceite de cultivos, acetona, cetona etil metílica, ciclohexanona, anhídrido acético, acetonitrilo, acetofenona, acetato de amilo, 2-butanona, clorobenceno, ciclohexano, ciclohexanol, acetatos alquílicos, alcohol
15 diacetónico, 1,2-dicloropropano, dietanolamina, *p*-dietilbenceno, dietilenglicol, abietato de dietilenglicol, éter butílico del dietilenglicol, éter etílico del dietilenglicol, éter metílico del dietilenglicol, *N,N*-dimetilformamida, sulfóxido de dimetilo, 1,4-dioxano,
20 dipropilenglicol, éter metílico del dipropilenglicol, dibenzoato de dipropilenglicol, diproxitol, alquilpirrolidona, acetato de etilo, 2-etilhexanol, carbonato de etileno, 1,1,1-tricloroetano, 2-heptanona, alfa-pineno, d-limoneno, etilenglicol, éter butílico del
25 etilenglicol, éter metílico del etilenglicol, gamma-butirolactona, glicerol, diacetato de glicerol, monoacetato de glicerol, triacetato de glicerol, hexadecano, hexilenglicol, acetato de isoamilo, acetato de isobornilo, isooctano, isoforona, isopropilbenceno, miristato de
30 isopropilo, ácido láctico, laurilamina, óxido de mesitilo, metoxipropanol, cetona isoamil metílica, cetona isobutil

metílica, laurato de metilo, octanoato de metilo, oleato de metilo, cloruro de metileno, *m*-xileno, *n*-hexano, *n*-octilamina, ácido octadecanoico, acetato de octilamina, ácido oleico, oleilamina, *o*-xileno, fenol, polietilenglicol (PEG400), ácido propiónico, propilenglicol, éter monometílico del propilenglicol, *p*-xileno, tolueno, fosfato de trietilo, trietilenglicol, ácido xilenosulfónico, parafina, aceite mineral, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etilo, acetato de amilo, acetato de butilo, metanol, etanol, isopropanol y alcoholes de peso molecular superior tales como el alcohol amílico, alcohol tetrahidrofurfurílico, hexanol, octanol, etc., etilenglicol, propilenglicol, glicerina y *N*-metil-2-pirrolidinona. Por lo general, el portador elegido para la dilución de los concentrados es el agua.

Los portadores sólidos adecuados incluyen, por ejemplo, talco, dióxido de titanio, arcilla pirofilítica, sílice, arcilla atapulgítica, kieselguhr, tiza, tierra de diatomeas, cal, carbonato de calcio, arcilla bentonítica, tierra de fuller, cáscaras de semillas de algodón, harina de trigo, harina de soja, piedra pómez, harina de madera, harina de cáscara de nuez y lignina.

Se emplea convenientemente una amplia gama de agentes tensioactivos tanto en dichas composiciones líquidas como sólidas, especialmente en las diseñadas para ser diluidas con un portador antes de su aplicación. Estos agentes, cuando se utilizan, normalmente comprenden entre un 0.1% y un 15% en peso de la formulación. Estos pueden ser de naturaleza aniónica, catiónica, no iónica o polimérica y se pueden emplear como agentes emulsionantes, agentes humectantes, agentes de suspensión o con otros fines. Los

agentes tensioactivos habituales incluyen sales de alquilsulfatos tales como laurilsulfato de dietanolamonio; sales de alquilarilsulfonato tales como dodecilbencenosulfonato de calcio; productos de adición de alquilfenol y óxido de alquilenos, tales como nonilfenol C₁₈ etoxilado; productos de adición de alcohol y óxido de alquilenos, tales como alcohol tridecílico C₁₆ etoxilado; jabones, tales como estearato de sodio; sales de alquilnaftalenosulfonato, tales como dibutilnaftalenosulfonato de sodio; ésteres dialquílicos de sales de sulfosuccinato, tales como sulfosuccinato sódico de di(2-etilhexilo); ésteres de sorbitol, tales como oleato de sorbitol; aminas cuaternarias, tales como cloruro de lauriltrimetilamonio; ésteres polietilenglicólicos de ácidos grasos, tales como estearato de polietilenglicol; copolímeros en bloque de óxido de etileno y óxido de propileno; y sales de ésteres de fosfato mono- y dialquílicos.

Otros adyuvantes utilizados comúnmente en composiciones agrícolas incluyen inhibidores de la cristalización, modificadores de la viscosidad, agentes de suspensión, modificadores de las microgotas de los aerosoles, pigmentos, antioxidantes, agentes espumantes, agentes antiespumantes, agentes bloqueadores de la luz, agentes compatibilizantes, agentes antiespuma, agentes secuestrantes, tampones y agentes neutralizantes, inhibidores de la corrosión, tintes, odorizantes, agentes de dispersión, potenciadores de la penetración, micronutrientes, emolientes, lubricantes y agentes adhesivos.

Asimismo, pueden combinarse otras composiciones o principios activos como biocidas adicionales con las composiciones de la invención, utilizarse en los métodos de la invención y aplicarse simultánea o secuencialmente con las composiciones de la invención. Cuando se aplican simultáneamente, estos principios activos adicionales pueden formularse junto con las composiciones de la invención o mezclarse, por ejemplo, en el tanque de pulverización. Estos principios activos como biocidas adicionales pueden ser fungicidas, herbicidas, insecticidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas y/o reguladores del crecimiento vegetal.

Los agentes pesticidas se mencionan en el presente documento utilizando su nombre común y se describen, por ejemplo, en "The Pesticide Manual", 15.^a Ed., Consejo Británico para la Protección de Cultivos, 2009.

Además, las composiciones de la invención también se pueden aplicar con uno o más inductores de resistencia adquirida sistémicamente (inductores "SAR"). Los inductores SAR son conocidos y se describen, por ejemplo, en la Patente de Estados Unidos N.º US 6 919 298 e incluyen, por ejemplo, salicilatos y el inductor SAR comercializado acibenzolar-S-metilo.

Los compuestos de Fórmula (I) se utilizan normalmente en forma de composiciones agroquímicas y se pueden aplicar a la zona de cultivo o a la planta que se va a tratar, simultánea o sucesivamente, con otros compuestos. Estos otros compuestos pueden ser, p. ej., fertilizantes o dadores de micronutrientes u otros preparados que influyan sobre el crecimiento vegetal. También pueden ser herbicidas selectivos o herbicidas no selectivos, así como también

insecticidas, fungicidas, bactericidas, nematocidas, molusquicidas o mezclas de varios de estos preparados, si se desea junto con otros portadores, tensioactivos o adyuvantes que faciliten la aplicación empleados habitualmente en el campo de la formulación.

Los compuestos de Fórmula (I) se pueden emplear en forma de composiciones (fungicidas) para el control o la protección contra microorganismos fitopatógenos, que comprenden como principio activo al menos un compuesto de Fórmula (I) o al menos un compuesto individual preferido tal como se define en la presente, en forma libre o en forma salina útil desde un punto de vista agroquímico, y al menos uno de los adyuvantes mencionados anteriormente.

Por lo tanto, la invención proporciona una composición, preferentemente una composición fungicida, que comprende al menos un compuesto de Fórmula (I), un portador aceptable en agricultura y opcionalmente un adyuvante. Un portador agrícola aceptable es, por ejemplo, un portador que sea adecuado para el uso agrícola. Los portadores agrícolas son muy conocidos en la técnica. Preferentemente, dicha composición puede comprender al menos uno o más compuestos activos como pesticidas, por ejemplo, un principio activo fungicida adicional además del compuesto de Fórmula (I).

El compuesto de Fórmula (I) puede ser el único principio activo de una composición o puede estar mezclado con uno o más principios activos adicionales tales como un pesticida, fungicida, compuesto sinérgico, herbicida o regulador del crecimiento vegetal, cuando proceda. En algunos casos, un principio activo adicional puede producir actividades sinérgicas inesperadas.

Los ejemplos de principios activos adicionales adecuados incluyen los siguientes: fungicidas aminoacídicos acíclicos, fungicidas alifáticos nitrogenados, fungicidas de tipo amida, fungicidas de tipo anilida, fungicidas
5 antibióticos, fungicidas aromáticos, fungicidas que contienen arsénico, fungicidas de tipo cetona aril
fenílica, fungicidas de tipo benzamida, fungicidas de tipo benzanilida, fungicidas de tipo bencimidazol, fungicidas de
10 tipo benzotiazol, fungicidas botánicos, fungicidas
difenílicos con puente, fungicidas de tipo carbamato,
fungicidas de tipo carbanilato, fungicidas de tipo conazol,
fungicidas que contienen cobre, fungicidas de tipo
dicarboximida, fungicidas de tipo dinitrofenol, fungicidas
15 de tipo ditiocarbamato, fungicidas de tipo ditiolano,
fungicidas de tipo furamida, fungicidas de tipo furanilida,
fungicidas de tipo hidrazida, fungicidas de tipo imidazol,
fungicidas que contienen mercurio, fungicidas morfolínicos,
fungicidas organofosforados, fungicidas de organoestaño,
fungicidas de tipo oxatiino, fungicidas de tipo oxazol,
20 fungicidas de tipo fenilsulfamida, fungicidas de tipo
polisulfuro, fungicidas de tipo pirazol, fungicidas de tipo
piridina, fungicidas de tipo pirimidina, fungicidas de tipo
pirrol, fungicidas de tipo amonio cuaternario, fungicidas
de tipo quinolina, fungicidas de tipo quinona, fungicidas
25 de tipo quinoxalina, fungicidas de tipo estrobilurina,
fungicidas de tipo sulfonanilida, fungicidas de tipo
tiadiazol, fungicidas de tipo tiazol, fungicidas de tipo
tiazolidina, fungicidas de tipo tiocarbamato, fungicidas de
tipo tiofeno, fungicidas de tipo triazina, fungicidas de
30 tipo triazol, fungicidas de tipo triazolopirimidina,

fungicidas de tipo urea, fungicidas de tipo valinamida y fungicidas que contienen zinc.

Los ejemplos de principios activos adicionales adecuados también incluyen los siguientes:

(9-diclorometileno-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il)amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxílico, metoxi-[1-metil-2-(2,4,6-triclorofenil)etil]amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxílico, (2-diclorometileno-3-etil-1-metilindan-4-il)amida del ácido 1-metil-3-difluorometil-1*H*-pirazol-4-carboxílico (1072957-71-1), (4'-metilsulfanilbifenil-2-il)amida del ácido 1-metil-3-difluorometil-1*H*-pirazol-4-carboxílico, [2-(2,4-diclorofenil)-2-metoxi-1-metiletil]amida del ácido 1-metil-3-difluorometil-4*H*-pirazol-4-carboxílico, (5-cloro-2,4-dimetil-piridin-3-il) (2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (5-bromo-4-cloro-2-metoxipiridin-3-il)-(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, 2-{2-[(*E*)-3-(2,6-diclorofenil)-1-metilprop-2-en-(*E*)-ilidenoaminoximetil]fenil}-2-[(*Z*)-metoxiimino]-*N*-metilacetamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, (*E*)-*N*-metil-2-[2-(2,5-dimetilfenoximetil)fenil]-2-metoxiiminoacetamida, 4-bromo-2-ciano-*N,N*-dimetil-6-trifluorometilbencimidazol-1-sulfonamida, *a*-[*N*-(3-cloro-2,6-xilil)-2-metoxiacetamido]ilbutirolactona, 4-cloro-2-ciano-*N,N*-dimetil-5-*p*-tolilimidazol-1-sulfonamida, *N*-alil-4,5-dimetil-2-trimetilsililtiofeno-3-carboxamida, *N*-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenoxi)propionamida, *N*-(2-metoxi-5-piridil)-ciclopropanocarboxamida, (.-+.-)-*cis*-1-(4-clorofenil)-2-(1*H*-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, 2-(1-

tert-butil)-1-(2-clorofenil)-3-(1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, 2',6'-dibromo-2-metil-4-trifluorometoxi-4'-trifluorometil-1,3-tiazol-5-carboxanilida, 1-imidazolil-1-(4'-clorofenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ona, (*E*)-2-[2-[6-(2-cianofenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-[6-(2-tioamidofenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-[6-(2-fluorofenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-[6-(2,6-difluorofenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-[3-(pirimidin-2-iloxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-[3-(5-metilpirimidin-2-iloxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-[3-(fenilsulfoniloxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-[3-(4-nitrofenoxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-fenoxifenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-(3,5-dimetilbenzoil)pirrol-1-il]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-(3-metoxifenoxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2[2-(2-feniletan-1-il)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-(3,5-diclorofenoxi)piridin-3-il]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-(2-(3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenoxi)fenil)-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-(2-[3-(alfa-hidroxibencil)fenoxi]fenil)-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-(2-(4-fenoxipiridin-2-iloxi)fenil)-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-(3-*n*-propiloxifenoxi)fenil]3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-(3-isopropiloxifenoxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-[3-(2-fluorofenoxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-(3-etoxifenoxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (*E*)-2-[2-(4-*tert*-butilpiridin-2-iloxi)fenil]-3-

metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(3-cianofenoxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(3-metilpiridin-2-iloximetil)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2-metilfenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(5-bromopiridin-2-iloximetil)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3-(3-yodopiridin-2-iloxi)fenoxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2-cloropiridin-3-iloxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E), (E)-2-[2-(5,6-dimetilpirazin-2-ilmetiloximinometil)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(6-metilpiridin-2-iloxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E), (E)-2-[2-(3-metoxifenil)metiloximinometil]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(6-(2-azidofenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E), (E)-2-[2-[6-fenilpirimidin-4-il)metiloximinometil]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E), (E)-2-[2-[(4-clorofenil)metiloximinometil]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2-n-propilfenoxi)-1,3,5-triazin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E), (E)-2-[2-[(3-nitrofenil)metiloximinometil]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, 3-cloro-7-(2-aza-2,7,7-trimetiloct-3-en-5-ino), 2,6-dicloro-N-(4-trifluorometilbencil)benzamida, alcohol 3-yodo-2-propinílico, 4-clorofenil-3-yodopropargilformal, etilcarbamato de 3-bromo-2,3-diyodo-2-propenilo, alcohol 2,3,3-triyodoalílico, alcohol 3-bromo-2,3-diyodo-2-propenílico, n-butilcarbamato de 3-yodo-2-propinilo, n-hexilcarbamato de 3-yodo-2-propinilo, ciclohexilcarbamato de 3-yodo-2-propinilo, fenilcarbamato de 3-yodo-2-propinilo; derivados de fenol, tales como tribromofenol,

tetraclorofenol, 3-metil-4-clorofenol, 3,5-dimetil-4-clorofenol, fenoxietanol, diclorofeno, o-fenilfenol, m-fenilfenol, p-fenilfenol, 2-bencil-4-clorofenol, 5-hidrox-2(5H)-furanona; 4,5-dicloroditiazolinona, 4,5-benzoditiazolinona, 4,5-trimetilenoditiazolinona, 4,5-dicloro-(3H)-1,2-ditiol-3-ona, 3,5-dimetiltetrahidro-1,3,5-tiadiazina-2-tiona, cloruro de N-(2-p-clorobenzoiletil)hexaminio, acibenzolar, acipetacs, alanicarb, albendazol, aldimorf, alicina, alcohol alílico, ametoctradina, amisulbrom, amobam, ampropilfós, anilazina, asomato, aureofungina, azaconazol, azafendina, azitiram, azoxistrobina, polisulfuro de bario, benalaxilo, benalaxilo-M, benodanilo, benomilo, benquinox, bentalurón, bentiavalicarb, bentiazol, cloruro de benzalconio, benzamacrilo, benzamorf, ácido benzohidroxámico, benzovindiflupir, berberina, betoxazina, biloxazol, binapacrilo, bifenilo, bitertanol, bitionol, bixafeno, blasticidina-S, boscalid, bromotalonilo, bromuconazol, bupirimato, butiobato, polisulfuro cálcico de la butilamina, captafol, captano, carbamorf, carbendazim, clorhidrato de carbendazim, carboxina, carpropamida, carvona, CGA41396, CGA41397, quinometionato, quitosano, clobentiazona, cloraniformetano, cloranilo, clorfenazol, cloroneb, cloropicrina, clorotalonilo, clorozolinato, clozolinato, climbazol, clotrimazol, clozilación, compuestos que contienen cobre tales como acetato de cobre, carbonato de cobre, hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oleato de cobre, oxicloruro de cobre, oxiquinolato de cobre, silicato de cobre, sulfato de cobre, talato de cobre, cromato de cobre y zinc y caldo bordelés, cresol, cufraneb, cuproabam, óxido cuproso, ciazofamida, ciclafuramida, cicloheximida,

ciflufenamida, cimoxanilo, cependazol, ciproconazol, ciprodinilo, dazomet, debacarb, decafentina, ácido deshidroacético, 1,1'-dióxido del disulfuro de di-2-piridilo, diclofluanida, diclomezina, diclona, diclorano, 5 diclorofeno, diclozolina, diclobutrazol, diclocimet, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflumetorim, tiofosfato de O-diisopropil-S-bencilo, dimefluazol, dimetaclona, dimetconazol, dimetomorf, dimetirimol, diniconazol, diniconazol-M, dinobutón, dinocap, dinoctón, 10 dinopentón, dinosulfón, dinoterbón, difenilamina, dipiritiona, disulfiram, ditalimfós, ditianón, ditioéter, cloruro de dodecildimetilamonio, dodemorf, dodicina, dodina, doguadina, drazoxolón, edifenfós, enestroburina, epoxiconazol, etaconazol, etem, etaboxam, etirimol, 15 etoxiquina, etilicina, (Z)-N-bencil-N-([metil(metiltioetilidenoaminooxicarbonil)amino]tio)-β-alaninato de etilo, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenaminosulf, fenapanilo, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenitropano, fenoxanilo, 20 fenpiclonilo, fempicoxamida, fenpropidina, fenpropimorf, fenpirazamina, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumetover, flumorf, flupicolida, fluopiram, fluoroimida, fluotrimazol, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, 25 flutaniilo, flutolanilo, flutriafol, fluxapiroxad, folpet, formaldehído, fosetilo, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, furcarbanilo, furconazol, furfural, furmeciclox, furofanato, gliodina, griseofulvina, guazatina, halacrinato, hexaclorobenceno, 30 hexaclorobutadieno, hexaclorofeno, hexaconazol, hexiltiofós, hidrargafeno, hidroxiiisoxazol, himexazol,

imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, inezina, yodocarb, ipconazol, ipfentrifluconazol, iprobenfós, iprodiona, iprovalicarb, butilcarbamato de isopropanilo, 5 isoprotiolano, isopirazam, isotianilo, isovalediona, izopamfós, kasugamicina, kresoxim-metilo, LY186054, LY211795, LY248908, mancozeb, mandipropamida, maneb, mebenilo, mecarbinzida, mefenoxam, mefentrifluconazol, mepanipirim, mepronilo, cloruro mercúrico, cloruro 10 mercurioso, meptildinocap, metalaxilo, metalaxilo-M, metam, metazoxolón, metconazol, metasulfocarb, metfuroxam, bromuro de metilo, yoduro de metilo, isotiocianato de metilo, metiram, metiram-zinc, metominostrobin, metrafenona, metsulfovax, milneb, moroxidina, miclobutanilo, 15 miclozolina, nabam, natamicina, neoasozina, dimetilditiotiocarbamato de níquel, nitroestireno, nitrotal-isopropilo, nuarimol, octilina, ofurace, compuestos organomercuriales, orisastrobin, ostol, oxadixilo, oxasulfurón, oxatiapirrolina, oxina-cobre, ácido oxalíco, 20 oxpoconazol, oxicarboxina, parinol, pefurazoato, penconazol, pencicurón, penflufen, pentaclorofenol, pentiopirad, fenamacril, óxido de fenazina, fosdifeno, fosetilo-Al, ácidos de fósforo, ftalida, picoxistrobin, piperalina, policarbamato, polioxina D, polioxrim, poliram, 25 probenazol, procloraz, procimidona, propamidina, propamocarb, propiconazol, propineb, ácido propiónico, proquinazida, protiocarb, protioconazol, pidiflumetofeno, piracarbolid, piraclostrobin, pirametrostrobin, piraoxistrobin, pirazofós, piribencarb, piridinitrilo, 30 pirifenox, pirimetanilo, pirofenona, piroquilon, piroxiclor, piroxifur, pirrolnitrina, compuestos de amonio

cuaternario, quinacetol, quinazamida, quinconazol, quinometionato, quinoxifeno, quintozeno, rabenzazol, santonina, sedaxano, siltiofam, simeconazol, sipconazol, pentaclorofenato de sodio, espiroxamina, estreptomicina, azufre, sultropeno, tebuconazol, tebfloquina, tecloftalam, tecnazeno, tecoram, tetraconazol, tiabendazol, tiadiflúor, ticiofeno, tifluzamida, 2-(tiocianometiltio)benzotiazol, tiofanato-metilo, tioquinox, tiram, tiadinilo, timibenconazol, tioximida, tolclofós-metilo, tolilfluanida, triadimefón, triadimenol, triamifós, triarimol, triazbutilo, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobina, triflumazol, triforina, triflumizol, triticonazol, uniconazol, urbacida, validamicina, valifenalato, vapam, vinclozolina, zarilamida, zineb, ziram y zoxamida.

Los compuestos de la invención también se pueden utilizar combinados con agentes antihelmínticos. Tales agentes antihelmínticos incluyen compuestos seleccionados entre la clase de compuestos lactónicos macrocíclicos tales como derivados de ivermectina, avermectina, abamectina, emamectina, eprinomectina, doramectina, selamectina, moxidectina, nemadectina y milbemicina como los descritos en los documentos EP-357460, EP-444964 y EP-594291. Otros agentes antihelmínticos incluyen derivados de avermectina/milbemicina semisintéticos y biosintéticos tales como los descritos en los documentos US-5015630, WO-9415944 y WO-9522552. Otros agentes antihelmínticos incluyen bencimidazoles tales como albendazol, cambendazol, fenbendazol, flubendazol, mebendazol, oxfendazol, oxibendazol, parbendazol y otros miembros de la clase. Otros agentes antihelmínticos incluyen imidazotiazoles y

tetrahidropirimidinas tales como tetramisol, levamisol, pamoato de pirantel, oxantel o morantel. Otros agentes antihelmínticos incluyen fluquicidas, tales como triclabendazol y clorsulón, y cestocidas tales como praziquantel y epsiprantel.

Los compuestos de la invención se pueden utilizar combinados con derivados y análogos de la clase paraherquamida/marcfortina de agentes antihelmínticos así como también oxazolinas antiparasitarias tales como las descritas en los documentos US-5478855, US-4639771 y DE-19520936.

Los compuestos de la invención se pueden emplear combinados con derivados y análogos de la clase general de agentes antiparasitarios dioxomorfolínicos como los descritos en el documento WO 96/15121 y también con depsipéptidos antihelmínticos cíclicos activos tales como los descritos en los documentos WO 96/11945, WO 93/19053, WO 93/25543, EP 0 626 375, EP 0 382 173, WO 94/19334, EP 0 382 173 y EP 0 503 538.

Los compuestos de la invención se pueden emplear combinados con otros ectoparasiticidas, por ejemplo, fipronilo, piretroides, organofosfatos, reguladores del crecimiento de insectos tales como lufenurón, agonistas de la ecdisona tales como tebufenocida y similares, neonicotinoides tales como imidacloprida y similares.

Los compuestos de la invención se pueden emplear combinados con alcaloides terpénicos, por ejemplo, los descritos en las Publicaciones de Solicitud de Patente Internacional con números WO 95/19363 o WO 04/72086, particularmente los compuestos descritos en dichos documentos.

Otros ejemplos de este tipo de compuestos biológicamente activos que se pueden emplear combinados con los compuestos de la invención incluyen, sin carácter limitante, los siguientes:

5 Organofosfatos: acefato, azametifós, azinfós-etilo, azinfós-metilo, bromofós, bromofós-etilo, cadusafós, cloretoxifós, clorpirifós, clorfenvinfós, clormefós, demetón, demetón-S-metilo, demetón-S-metilsulfona, dialifós, diacinona, diclorvós, dicrotofós, dimetoato, 10 disulfotón, etión, etoprofós, etrimfós, famfur, fenamifós, fenitrotión, fensulfotión, fentiión, flupirazofós, fonofós, formotión, fostiazato, heptenofós, isazofós, isotioato, isoxatión, malatión, metacrifós, metamidofós, metidatión, paratión-metilo, mevinfós, monocrotofós, naled, ometoato, 15 oxidemetón-metilo, paraoxona, paratión, paratión-metilo, fentoato, fosalona, fosfolán, fosfocarb, fosmet, fosfamidón, forato, foxima, pirimifós, pirimifós-metilo, profenofós, propafós, proetamfós, protiofós, piraclofós, piridapentiión, quinalfós, sulprofós, temefós, terbufós, 20 tebupirimfós, tetraclorvinfós, timetón, triazofós, triclorfón, vamidotión.

 Carbamatos: alanicarb, aldicarb, metilcarbamato de 2-sec-butilfenilo, benfuracarb, carbarilo, carbofurano, carbosulfán, cloetocarb, etiofencarb, fenoxicarb, 25 fentiocarb, furatiocarb, HCN-801, isoprocarb, indoxacarb, metiocarb, metomilo, (metil)carbamato de 5-metil-*m*-cumenilbutirilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, UC-51717.

 Piretroides: acrinatina, aletrina, alfametrina, (*E*)- 30 (1*R*)-*cis*-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenometil)ciclopropanocarboxilato de 5-bencil-3-

furilmetilo, bifentrina, beta-ciflutrina, ciflutrina, a-cipermetrina, beta-cipermetrina, bioaletrina, bioaletrina (isómero *S* ciclopentílico), biorresmetrina, bifentrina, NCI-85193, cicloprotrina, cihalotrina, cititrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, fluvalinato (isómero *D*), imiprotrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, permetrina, fenotrina, praletrina, piretrinas (productos naturales), resmetrina, tetrametrina, transflutrina, theta-cipermetrina, silafluofeno, t-fluvalinato, teflutrina, tralometrina, Zeta-cipermetrina.

Reguladores del crecimiento de artrópodos: a) inhibidores de la síntesis de la quitina: benzoilureas: clorfluazurón, diflubenzurón, fluazurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, teflubenzurón, triflumurón, buprofecina, diofenolano, hexitiazox, etoxazol, clorfentacina; b) antagonistas de la ecdisona: halofenocida, metoxifenocida, tebufenocida; c) juvenoides: piriproxifeno, metopreno (incluido el *S*-metopreno), fenoxicarb; d) inhibidores de la biosíntesis de lípidos: espirodiclofeno.

Otros antiparasitarios: acequinocilo, amitraz, AKD-1022, ANS-118, azadiractina, *Bacillus thuringiensis*, bensultap, bifenazato, binapacrilo, bromopropilato, BTG-504, BTG-505, camfeclor, cartap, clorobencilato, clordimeform, clorfenapir, cromafenocida, clotianidina, ciromacina, diaclofeno, diafentiurón, DBI-3204, dinactina, dihidroximetildihidroxi pirrolidina, dinobutón, dinocap, endosulfán, etiprol, etofenprox, fenazaquina, flumite, MTI-800, fenpiroximato, fluacripirim, flubencimina,

flubrocitrinato, flufencina, flufenprox, fluproxifeno, halofenprox, hidrametilnona, IKI-220, kanemite, NC-196, protector de nim, nidinorterfurano, nitenpiram, SD-35651, WL-108477, piridarilo, propargita, protrifenbute, pimetrocina, piridabeno, pirimidifeno, NC-1111, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, silafluofeno, silomadina, espinosad, tebufenpirad, tetradifón, tetranactina, tiacloprid, tiociclam, tiametoxam, tolfenpirad, triazamato, trietoxiespinosina, trinactina, verbutina, vertalec, YI-5301.

Agentes biológicos: *Bacillus thuringiensis* ssp *aizawai*, *kurstaki*, delta endotoxina de *Bacillus thuringiensis*, baculovirus, bacterias, virus y hongos entomopatógenos.

Bactericidas: clortetraciclina, oxitetraciclina, estreptomycinina.

Otros agentes biológicos: enrofloxacinina, febantel, penetamato, moloxicam, cefalexina, kanamicina, pimobendano, clenbuterol, omeprazol, tiamulina, benazeprilo, piriprol, cefquinoma, florfenicol, buserelina, cefovecina, tulatromicina, ceftiofur, carprofeno, metaflumizona, praziquarantel, triclabendazol.

Se prefieren las siguientes mezclas de los compuestos de Fórmula (I) con principios activos. La abreviatura "TX" significa un compuesto seleccionado a partir del grupo constituido por los compuestos descritos en las Tablas 1.1-1.5, 2.1-2.3 o la Tabla T1 (compuestos 1.1-1.46) (más adelante):

un adyuvante seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por aceites de petróleo (nombre alternativo) (628) + TX,

un acaricida seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por 1,1-bis(4-clorofenil)-2-etoxietanol (nombre según la IUPAC) (910) + TX, bencenosulfonato de 2,4-diclorofenilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1059) + TX, 2-fluoro-*N*-metil-*N*-1-naftilacetamida (nombre según la IUPAC) (1295) + TX, sulfona 4-clorofenil fenílica (nombre según la IUPAC) (981) + TX, abamectina (1) + TX, acequinocilo (3) + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, amiditió (870) + TX, amidoflumet [CCN] + TX, amidotioato (872) + TX, amitón (875) + TX, hidrogenooxalato de amitón (875) + TX, amitraz (24) + TX, aramita (881) + TX, óxido arsenioso (882) + TX, AVI 382 (código de compuesto) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, azinfós-etilo (44) + TX, azinfós-metilo (45) + TX, azobenceno (nombre según la IUPAC) (888) + TX, azociclotina (46) + TX, azotoato (889) + TX, benomilo (62) + TX, benoxafós (nombre alternativo) [CCN] + TX, benzoximato (71) + TX, benzoato de bencilo (nombre según la IUPAC) [CCN] + TX, bifenazato (74) + TX, bifentrina (76) + TX, binapacrilo (907) + TX, brofenvalerato (nombre alternativo) + TX, bromocicleno (918) + TX, bromofós (920) + TX, bromofós-etilo (921) + TX, bromopropilato (94) + TX, buprofezina (99) + TX, butocarboxim (103) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, polisulfuro de calcio (nombre según la IUPAC) (111) + TX, camfeclor (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarilo (115) + TX, carbofurano (118) + TX, carbofenotión (947) + TX, CGA 50'439 (código de desarrollo) (125) + TX, quinometionato (126) + TX, clorbensida (959) + TX, clordimeform (964) +

TX, clorhidrato de clordimeform (964) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenetol (968) + TX, clorfensón (970) + TX, clorfensulfuro (971) + TX, clorfenvinfós (131) + TX, clorobencilato (975) + TX, cloromebuform (977) + TX, 5 clorometiurón (978) + TX, cloropropilato (983) + TX, clorpirifós (145) + TX, clorpirifós-metilo (146) + TX, clortiofós (994) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, clofentezina (158) + TX, closantel (nombre alternativo) [CCN] + TX, coumafós (174) + TX, 10 TX, crotamitón (nombre alternativo) [CCN] + TX, crotoxifós (1010) + TX, cufraneb (1013) + TX, ciantoato (1020) + TX, ciflumetofeno (n.º de Reg. CAS: 400882-07-7) + TX, cihalotrina (196) + TX, cihexatina (199) + TX, cipermetrina (201) + TX, DCPM (1032) + TX, DDT (219) + TX, demefión (1037) + TX, demefión-O (1037) + TX, demefión-S (1037) + TX, 15 demetón (1038) + TX, demetón-metilo (224) + TX, demetón-O (1038) + TX, demetón-O-metilo (224) + TX, demetón-S (1038) + TX, demetón-S-metilo (224) + TX, demetón-S-metilsulfón (1039) + TX, diafentiurón (226) + TX, 20 dialifós (1042) + TX, diazinona (227) + TX, diclofluanida (230) + TX, diclorvós (236) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dicofol (242) + TX, dicrotofós (243) + TX, dienoclor (1071) + TX, dimefox (1081) + TX, dimetoato (262) + TX, dinactina (nombre alternativo) (653) + TX, 25 dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinobutón (269) + TX, dinocap (270) + TX, dinocap-4 [CCN] + TX, dinocap-6 [CCN] + TX, dinocetón (1090) + TX, dinopentón (1092) + TX, dinosulfón (1097) + TX, dinoterbón (1098) + TX, dioxatión (1102) + TX, difenilsulfona (nombre según la IUPAC) (1103) + TX, disulfiram (nombre alternativo) [CCN] + TX, 30 TX, disulfotón (278) + TX, DNOC (282) + TX, dofenapina

(1113) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, endosulfano (294) + TX, endotión (1121) + TX, EPN (297) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, etiión (309) + TX, etoato-metilo (1134) + TX, etoxazol (320) + TX, etrimfós (1142) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenazaquina (328) + TX, óxido de fenbutatina (330) + TX, fenotiocarb (337) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fenpiroximato (345) + TX, fensón (1157) + TX, fentrifanilo (1161) + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronilo (354) + TX, fluacripirim (360) + TX, fluazurón (1166) + TX, flubencimina (1167) + TX, flucicloxurón (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetilo (1169) + TX, flufenoxurón (370) + TX, flumetrina (372) + TX, fluorbensida (1174) + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, formetanato (405) + TX, clorhidrato de formetanato (405) + TX, formotión (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, gamma-HCH (430) + TX, gliodina (1205) + TX, halfenprox (424) + TX, heptenofós (432) + TX, ciclopropanocarboxilato de hexadecilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1216) + TX, hexitiazox (441) + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, isocarbofós (nombre alternativo) (473) + TX, O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo (nombre según la IUPAC) (473) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolina II (696) + TX, jodfenfós (1248) + TX, lindano (430) + TX, lufenurón (490) + TX, malatión (492) + TX, malonobeno (1254) + TX, mecarbam (502) + TX, mefosfolano (1261) + TX, mesulfeno (nombre alternativo) [CCN] + TX, metacrifós (1266) + TX, metamidofós (527) + TX, metidatión (529) + TX, metiocarb (530) + TX, metomilo (531) + TX, bromuro de

metilo (537) + TX, metolcarb (550) + TX, mevinfós (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, monocrotofós (561) + TX, morfotión (1300) + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, naled (567) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, NC-512 (código de compuesto) + TX, nifluridida (1309) + TX, nikkomicinas (nombre alternativo) [CCN] + TX, nitrilacarb (1313) + TX, complejo de nitrilacarb y cloruro de zinc 1:1 (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) + TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxideprofós (1324) + TX, oxidisulfotón (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, paratión (615) + TX, permetrina (626) + TX, aceites del petróleo (nombre alternativo) (628) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosalona (637) + TX, fosfolán (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosfamidón (639) + TX, foxim (642) + TX, pirimifós-metilo (652) + TX, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + TX, polinactinas (nombre alternativo) (653) + TX, proclonol (1350) + TX, profenofós (662) + TX, promacilo (1354) + TX, propargita (671) + TX, propetamfós (673) + TX, propoxur (678) + TX, protidatión (1360) + TX, protoato (1362) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridabeno (699) + TX, piridafentión (701) + TX, pirimidifeno (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, quinalfós (711) + TX, quintiofós (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, RA-17 (código de desarrollo) (1383) + TX, rotenona (722) + TX, escradán (1389) + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, sofamida (1402) + TX,

espiroclorfenol (738) + TX, espiromesifeno (739) + TX, SSI-121 (código de desarrollo) (1404) + TX, sulfiram (nombre alternativo) [CCN] + TX, sulfluramida (750) + TX, sulfotep (753) + TX, azufre (754) + TX, SZI-121 (código de desarrollo) (757) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tebufenpirad (763) + TX, TEPP (1417) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, tetraclorvinfós (777) + TX, tetradifón (786) + TX, tetranactina (nombre alternativo) (653) + TX, tetrasul (1425) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometón (801) + TX, tioquinox (1436) + TX, turingiensina (nombre alternativo) [CCN] + TX, triamifós (1441) + TX, triarateno (1443) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón (nombre alternativo) + TX, triclorfón (824) + TX, trifenofós (1455) + TX, trinactina (nombre alternativo) (653) + TX, vamidotión (847) + TX, vaniliprol [CCN] e YI-5302 (código de compuesto) + TX,

un algicida seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por betoxazina [CCN] + TX, dioctanoato de cobre (nombre según la IUPAC) (170) + TX, sulfato de cobre (172) + TX, cibutrina [CCN] + TX, diclona (1052) + TX, diclorofeno (232) + TX, endotal (295) + TX, fentina (347) + TX, cal hidratada [CCN] + TX, nabam (566) + TX, quinoclamina (714) + TX, quinonamida (1379) + TX, simazina (730) + TX, acetato de trifenilestaño (nombre según la IUPAC) (347) e hidróxido de trifenilestaño (nombre según la IUPAC) (347) + TX,

un antihelmíntico seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por abamectina (1) + TX, crufomato (1011) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX,

eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, piperazina [CCN] + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, espinosad (737) y tiofanato (1435) + TX,

un avicida seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por cloralosa (127) + TX, endrina (1122) + TX, fenti3n (346) + TX, piridin-4-amina (nombre seg3n la IUPAC) (23) y estriqnina (745) + TX,

un bactericida seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por 1-hidroxi-1*H*-piridin-2-tiona (nombre seg3n la IUPAC) (1222) + TX, 4-(quinoxal3n-2-ilamino)bencenosulfonamida (nombre seg3n la IUPAC) (748) + TX, sulfato de 8-hidroxiquinolina (446) + TX, bronopol (97) + TX, dioctanoato de cobre (nombre seg3n la IUPAC) (170) + TX, hidr3xido de cobre (nombre seg3n la IUPAC) (169) + TX, cresol [CCN] + TX, diclorofeno (232) + TX, dipiritiona (1105) + TX, dodicina (1112) + TX, fenaminosulf (1144) + TX, formaldeh3do (404) + TX, hidrargafeno (nombre alternativo) [CCN] + TX, kasugamicina (483) + TX, clorhidrato de kasugamicina hidratada (483) + TX, bis(dimetilditiocarbamato) de n3quel (nombre seg3n la IUPAC) (1308) + TX, nitrapirina (580) + TX, octilinona (590) + TX, 3cido oxol3nico (606) + TX, oxitetraciclina (611) + TX, hidroxiquinolinsulfato de potasio (446) + TX, probenazol (658) + TX, estreptomina (744) + TX, sesquisulfato de estreptomina (744) + TX, tecloftalam (766) + TX, y tiomersal (nombre alternativo) [CCN] + TX,

un agente biol3gico seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por *Adoxophyes orana* GV (nombre

alternativo) (12) + TX, *Agrobacterium radiobacter* (nombre alternativo) (13) + TX, *Amblyseius* spp. (nombre alternativo) (19) + TX, *Anagrapha falcifera* NPV (nombre alternativo) (28) + TX, *Anagrus atomus* (nombre alternativo) (29) + TX, *Aphelinus abdominalis* (nombre alternativo) (33) + TX, *Aphidius colemani* (nombre alternativo) (34) + TX, *Afidoteles afidimyza* (nombre alternativo) (35) + TX, *Autographa californica* NPV (nombre alternativo) (38) + TX, *Bacillus firmus* (nombre alternativo) (48) + TX, *Bacillus sphaericus* Neide (nombre científico) (49) + TX, *Bacillus thuringiensis* Berliner (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis* (nombre científico) (51) + TX, *Beauveria bassiana* (nombre alternativo) (53) + TX, *Beauveria brongniartii* (nombre alternativo) (54) + TX, *Chrysoperla carnea* (nombre alternativo) (151) + TX, *Cryptolaemus montrouzieri* (nombre alternativo) (178) + TX, *Cydia pomonella* GV (nombre alternativo) (191) + TX, *Dacnusa sibirica* (nombre alternativo) (212) + TX, *Diglyphus isaea* (nombre alternativo) (254) + TX, *Encarsia formosa* (nombre científico) (293) + TX, *Eretmocerus eremicus* (nombre alternativo) (300) + TX, *Helicoverpa zea* NPV (nombre alternativo) (431) + TX, *Heterorhabditis bacteriophora* y *H. megidis* (nombre alternativo) (433) + TX, *Hippodamia convergens* (nombre alternativo) (442) + TX, *Leptomastix dactylopii* (nombre alternativo) (488) + TX, *Macrolophus*

caliginosus (nombre alternativo) (491) + TX, *Mamestra brassicae* NPV (nombre alternativo) (494) + TX, *Metaphycus helvolus* (nombre alternativo) (522) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *acridum* (nombre científico) (523) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* (nombre científico) (523) + TX, *Neodiprion sertifer* NPV y *N. lecontei* NPV (nombre alternativo) (575) + TX, *Orius* spp. (nombre alternativo) (596) + TX, *Paecilomyces fumosoroseus* (nombre alternativo) (613) + TX, *Phytoseiulus persimilis* (nombre alternativo) (644) + TX, virus de la polihedrosis nuclear multicapsídico de *Spodoptera exigua* (nombre científico) (741) + TX, *Steinernema bibionis* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema carpocapsae* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema feltiae* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema glaseri* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema riobrave* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema riobravis* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema scapterisci* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema* spp. (nombre alternativo) (742) + TX, *Trichogramma* spp. (nombre alternativo) (826) + TX, *Typhlodromus occidentalis* (nombre alternativo) (844) y *Verticillium lecanii* (nombre alternativo) (848) + TX, *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* cepa FZB24 (se puede adquirir de Novozymes Biologicals Inc., 5400 Corporate Circle, Salem, VA 24153, EE. UU. y se conoce como la marca Taegro®) + TX,

un esterilizante del suelo seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por yodometano (nombre según la IUPAC) (542) y bromuro de metilo (537) + TX,

un quimioesterilizante seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por afolato [CCN] + TX, bisazir

(nombre alternativo) [CCN] + TX, busulfán (nombre alternativo) [CCN] + TX, diflubenzurón (250) + TX, dimatif (nombre alternativo) [CCN] + TX, hemel [CCN] + TX, hempa [CCN] + TX, metepa [CCN] + TX, metiotepa [CCN] + TX, 5 afolato de metilo [CCN] + TX, morzid [CCN] + TX, penflurón (nombre alternativo) [CCN] + TX, tepa [CCN] + TX, tiohempa (nombre alternativo) [CCN] + TX, tiotepa (nombre alternativo) [CCN] + TX, tretamina (nombre alternativo) [CCN] y uredepa (nombre alternativo) [CCN] + TX,

10 una feromona de insecto seleccionada a partir del grupo de sustancias constituido por acetato de (*E*)-dec-5-en-1-ilo con (*E*)-dec-5-en-1-ol (nombre según la IUPAC) (222) + TX, acetato de (*E*)-tridec-4-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (829) + TX, (*E*)-6-metilhept-2-en-4-ol (nombre 15 según la IUPAC) (541) + TX, acetato de (*E,Z*)-tetradeca-4,10-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (779) + TX, acetato de (*Z*)-dodec-7-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (285) + TX, (*Z*)-hexadec-11-enal (nombre según la IUPAC) (436) + TX, acetato de (*Z*)-hexadec-11-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (437) + TX, acetato de (*Z*)-hexadec-13-en-11-in-1-ilo 20 (nombre según la IUPAC) (438) + TX, (*Z*)-icos-13-en-10-ona (nombre según la IUPAC) (448) + TX, (*Z*)-tetradec-7-en-1-al (nombre según la IUPAC) (782) + TX, (*Z*)-tetradec-9-en-1-ol (nombre según la IUPAC) (783) + TX, acetato de (*Z*)-tetradec-9-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (784) + TX, 25 acetato de (7*E*,9*Z*)-dodeca-7,9-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (283) + TX, acetato de (9*Z*,11*E*)-tetradeca-9,11-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (780) + TX, acetato de (9*Z*,12*E*)-tetradeca-9,12-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (781) + TX, 14-metiloctadec-1-eno (nombre según la IUPAC) 30 (545) + TX, 4-metilnonan-5-ol con 4-metilnonan-5-ona

(nombre según la IUPAC) (544) + TX, alfa-multistriatina
(nombre alternativo) [CCN] + TX, brevicomina (nombre
alternativo) [CCN] + TX, codlelure (nombre alternativo)
[CCN] + TX, codlemona (nombre alternativo) (167) + TX,
5 cuelure (nombre alternativo) (179) + TX, disparlure (277) +
TX, acetato de dodec-8-en-1-ilo (nombre según la IUPAC)
(286) + TX, acetato de dodec-9-en-1-ilo (nombre según la
IUPAC) (287) + TX, dodeca-8 + TX, acetato de 10-dien-1-ilo
(nombre según la IUPAC) (284) + TX, dominicalure (nombre
10 alternativo) [CCN] + TX, 4-metiloctanoato de etilo (nombre
según la IUPAC) (317) + TX, eugenol (nombre alternativo)
[CCN] + TX, frontalina (nombre alternativo) [CCN] + TX,
gosiplure (nombre alternativo) (420) + TX, grandlure (421)
+ TX, grandlure I (nombre alternativo) (421) + TX,
15 grandlure II (nombre alternativo) (421) + TX, grandlure III
(nombre alternativo) (421) + TX, grandlure IV (nombre
alternativo) (421) + TX, hexalure [CCN] + TX, ipsdienol
(nombre alternativo) [CCN] + TX, ipsenol (nombre
alternativo) [CCN] + TX, japonilure (nombre alternativo)
20 (481) + TX, lineatina (nombre alternativo) [CCN] + TX,
litlure (nombre alternativo) [CCN] + TX, looplure (nombre
alternativo) [CCN] + TX, medlure [CCN] + TX, ácido
megatomoico (nombre alternativo) [CCN] + TX, eugenol
metílico (nombre alternativo) (540) + TX, muscalure (563) +
25 TX, acetato de octadeca-2,13-dien-1-ilo (nombre según la
IUPAC) (588) + TX, acetato de octadeca-3,13-dien-1-ilo
(nombre según la IUPAC) (589) + TX, orfralure (nombre
alternativo) [CCN] + TX, orictalure (nombre alternativo)
(317) + TX, ostramona (nombre alternativo) [CCN] + TX,
30 siglure [CCN] + TX, sordidina (nombre alternativo) (736) +
TX, sulcatol (nombre alternativo) [CCN] + TX, acetato de

tetradec-11-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (785) + TX, trimedlure (839) + TX, trimedlure A (nombre alternativo) (839) + TX, trimedlure B₁ (nombre alternativo) (839) + TX, trimedlure B₂ (nombre alternativo) (839) + TX, trimedlure C (nombre alternativo) (839) y trunc-call (nombre alternativo) [CCN] + TX,

un repelente de insectos seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por 2-(octiltio)etanol (nombre según la IUPAC) (591) + TX, butopironoxilo (933) + TX, butoxi(polipropilenglicol) (936) + TX, adipato de dibutilo (nombre según la IUPAC) (1046) + TX, ftalato de dibutilo (1047) + TX, succinato de dibutilo (nombre según la IUPAC) (1048) + TX, dietiltoluamida [CCN] + TX, carbato de dimetilo [CCN] + TX, ftalato de dimetilo [CCN] + TX, etilhexanodiol (1137) + TX, hexamida [CCN] + TX, metoquina-butilo (1276) + TX, metilneodecanamida [CCN] + TX, oxamato [CCN] y picaridina [CCN] + TX,

un insecticida seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por 1-dicloro-1-nitroetano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1058) + TX, 1,1-dicloro-2,2-bis(4-etilfenil)etano (nombre según la IUPAC) (1056), + TX, 1,2-dicloropropano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno (nombre según la IUPAC) (1063) + TX, 1-bromo-2-cloroetano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (916) + TX, acetato de 2,2,2-tricloro-1-(3,4-diclorofenil)etilo (nombre según la IUPAC) (1451) + TX, metilfosfato de 2,2-diclorovinilo y 2-etilsulfiniletilo (nombre según la IUPAC) (1066) + TX, dimetilcarbamato de 2-(1,3-ditiolan-2-il)fenilo (nombre según la IUPAC/ Chemical Abstracts) (1109) + TX, tiocianato de 2-(2-

butoxietoxi)etilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (935) + TX, metilcarbamato de 2-(4,5-dimetil-1,3-dioxolan-2-il)fenilo (nombre según la IUPAC/ Chemical Abstracts) (1084) + TX, 2-(4-cloro-3,5-xililoxi)etanol (nombre según la IUPAC) (986) + TX, fosfato dietílico de 2-clorovinilo (nombre según la IUPAC) (984) + TX, 2-imidazolidona (nombre según la IUPAC) (1225) + TX, 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre según la IUPAC) (1246) + TX, metilcarbamato de 2-metil(prop-2-inil)aminofenilo (nombre según la IUPAC) (1284) + TX, laurato de 2-tiocianatoetilo (nombre según la IUPAC) (1433) + TX, 3-bromo-1-cloroprop-1-eno (nombre según la IUPAC) (917) + TX, dimetilcarbamato de 3-metil-1-fenilpirazol-5-ilo (nombre según la IUPAC) (1283) + TX, metilcarbamato de 4-metil(prop-2-inil)amino-3,5-xililo (nombre según la IUPAC) (1285) + TX, dimetilcarbamato de 5,5-dimetil-3-oxociclohex-1-enilo (nombre según la IUPAC) (1085) + TX, abamectina (1) + TX, acefato (2) + TX, acetamiprid (4) + TX, acetión (nombre alternativo) [CCN] + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, acrilonitrilo (nombre según la IUPAC) (861) + TX, alanicarb (15) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, aldrina (864) + TX, aletrina (17) + TX, alosamidina (nombre alternativo) [CCN] + TX, alixicarb (866) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, alfa-ecdisona (nombre alternativo) [CCN] + TX, fosfuro de aluminio (640) + TX, amiditió (870) + TX, amidotioato (872) + TX, aminocarb (873) + TX, amitón (875) + TX, hidrogenooxalato de amitón (875) + TX, amitraz (24) + TX, anabasina (877) + TX, atidatió (883) + TX, AVI 382 (código de compuesto) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, azadiractina (nombre alternativo) (41) + TX, azametifós (42) + TX,

azinfós-etilo (44) + TX, azinfós-metilo (45) + TX, azotoato (889) + TX, endotoxinas delta de *Bacillus thuringiensis* (nombre alternativo) (52) + TX, hexafluorosilicato de bario (nombre alternativo) [CCN] + TX, polisulfuro de bario (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (892) + TX, bartrina [CCN] + TX, Bayer 22/190 (código de desarrollo) (893) + TX, Bayer 22408 (código de desarrollo) (894) + TX, bendiocarb (58) + TX, benfuracarb (60) + TX, bensultap (66) + TX, beta-ciflutrina (194) + TX, beta-cipermetrina (203) + TX, bifentrina (76) + TX, bioaletrina (78) + TX, isómero S-ciclopentenílico de la bioaletrina (nombre alternativo) (79) + TX, bioetanometrina [CCN] + TX, biopermetrina (908) + TX, biorresmetrina (80) + TX, éter bis(2-cloroetílico) (nombre según la IUPAC) (909) + TX, bistriflurón (83) + TX, borax (86) + TX, brofenvalerato (nombre alternativo) + TX, bromfenvinfós (914) + TX, bromocicleno (918) + TX, bromo-DDT (nombre alternativo) [CCN] + TX, bromofós (920) + TX, bromofós-etilo (921) + TX, bufencarb (924) + TX, buprofezina (99) + TX, butacarb (926) + TX, butatiofós (927) + TX, butocarboxim (103) + TX, butonato (932) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, cadusafós (109) + TX, arseniato de calcio [CCN] + TX, cianuro de calcio (444) + TX, polisulfuro de calcio (nombre según la IUPAC) (111) + TX, camfeclor (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarilo (115) + TX, carbofurano (118) + TX, disulfuro de carbono (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (945) + TX, tetracloruro de carbono (nombre según la IUPAC) (946) + TX, carbofenotión (947) + TX, carbosulfán (119) + TX, cartap (123) + TX, clorhidrato de cartap (123) + TX, cevadina (nombre alternativo) (725) + TX, clorbicicleno (960) + TX,

clordano (128) + TX, clordecona (963) + TX, clordimeform (964) + TX, clorhidrato de clordimeform (964) + TX, cloretoxifós (129) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenvinfós (131) + TX, clorfluazurón (132) + TX, 5 clormefós (136) + TX, cloroformo [CCN] + TX, cloropicrina (141) + TX, clorfoxim (989) + TX, clorprazofós (990) + TX, clorpirifós (145) + TX, clorpirifós-metilo (146) + TX, clortiofós (994) + TX, cromafenozida (150) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, 10 *cis*-resmetrina (nombre alternativo) + TX, cismetrina (80) + TX, clocitrina (nombre alternativo) + TX, cloetocarb (999) + TX, closantel (nombre alternativo) [CCN] + TX, clotianidina (165) + TX, acetoarsenito de cobre [CCN] + TX, arseniato de cobre [CCN] + TX, oleato de cobre [CCN] + TX, 15 coumafós (174) + TX, coumitoato (1006) + TX, crotamitón (nombre alternativo) [CCN] + TX, crotoxifós (1010) + TX, cruformato (1011) + TX, criolito (nombre alternativo) (177) + TX, CS 708 (código de desarrollo) (1012) + TX, cianofenfós (1019) + TX, cianofós (184) + TX, ciantoato (1020) + TX, cicletrina [CCN] + TX, cicloprotrina (188) + 20 TX, ciflutrina (193) + TX, cihalotrina (196) + TX, cipermetrina (201) + TX, cifenotrina (206) + TX, ciromazina (209) + TX, citioato (nombre alternativo) [CCN] + TX, *d*-limoneno (nombre alternativo) [CCN] + TX, *d*-tetrametrina (nombre alternativo) (788) + TX, DAEP (1031) + TX, dazomet (216) + TX, DDT (219) + TX, decarbofurano (1034) + TX, deltametrina (223) + TX, demefión (1037) + TX, demefión-O (1037) + TX, demefión-S (1037) + TX, demetón (1038) + TX, demetón-metilo (224) + TX, demetón-O (1038) + TX, demetón-O-metilo (224) + TX, demetón-S (1038) + TX, demetón-S- 30 metilo (224) + TX, demetón-S-metilsulfona (1039) + TX,

diafentiurón (226) + TX, dialifós (1042) + TX, diamidafós (1044) + TX, diazinona (227) + TX, dicaptón (1050) + TX, diclofentión (1051) + TX, diclorvós (236) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dicresilo (nombre alternativo) [CCN] + TX, dicrotofós (243) + TX, diciclanilo (244) + TX, dieldrina (1070) + TX, fosfato dietílico de 5-metilpirazol-3-ilo (nombre según la IUPAC) (1076) + TX, diflubenzurón (250) + TX, dilor (nombre alternativo) [CCN] + TX, dimeflutrina [CCN] + TX, dimefox (1081) + TX, dimetán (1085) + TX, dimetoato (262) + TX, dimetrina (1083) + TX, dimetilvinfós (265) + TX, dimetilán (1086) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinoprop (1093) + TX, dinosam (1094) + TX, dinoseb (1095) + TX, dinotefurano (271) + TX, diofenolán (1099) + TX, dioxabenzofós (1100) + TX, dioxacarb (1101) + TX, dioxatión (1102) + TX, disulfotón (278) + TX, diticrofós (1108) + TX, DNOC (282) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, DSP (1115) + TX, ecdisterona (nombre alternativo) [CCN] + TX, EI 1642 (código de desarrollo) (1118) + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, EMPC (1120) + TX, empentrina (292) + TX, endosulfano (294) + TX, endotión (1121) + TX, endrina (1122) + TX, EPBP (1123) + TX, EPN (297) + TX, epofenonano (1124) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, esfenvalerato (302) + TX, etafós (nombre alternativo) [CCN] + TX, etiofencarb (308) + TX, etiión (309) + TX, etiprol (310) + TX, etoato-metilo (1134) + TX, etoprofós (312) + TX, formiato de etilo (nombre según la IUPAC) [CCN] + TX, etil-DDD (nombre alternativo) (1056) + TX, dibromuro de etileno (316) + TX, dicloruro de etileno (nombre químico) (1136) + TX, óxido de etileno [CCN] + TX, etofenprox (319) + TX, etrimfós (1142) + TX, EXD (1143) +

TX, famfur (323) + TX, fenamifós (326) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenclorfós (1148) + TX, fenetacarb (1149) + TX, fenflutrina (1150) + TX, fenitrotión (335) + TX, fenobucarb (336) + TX, fenoxacrim (1153) + TX, fenoxicarb (340) + TX, fenpiritrina (1155) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fensulfotión (1158) + TX, fentiión (346) + TX, fentiión-etilo [CCN] + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronilo (354) + TX, flonicamida (358) + TX, flubendiamida (N.º de Reg. CAS.: 272451-65-7) + TX, flucofurón (1168) + TX, flucicloxurón (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetilo (1169) + TX, flufenerim [CCN] + TX, flufenoxurón (370) + TX, flufenprox (1171) + TX, flumetrina (372) + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, fonofós (1191) + TX, formetanato (405) + TX, clorhidrato de formetanato (405) + TX, formotión (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, fosmetilán (1194) + TX, fospirato (1195) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietán (1196) + TX, furatiocarb (412) + TX, furetrina (1200) + TX, gamma-cihalotrina (197) + TX, gamma-HCH (430) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, halfenprox (424) + TX, halofenozida (425) + TX, HCH (430) + TX, HEOD (1070) + TX, heptaclor (1211) + TX, heptenofós (432) + TX, heterofós [CCN] + TX, hexaflumurón (439) + TX, HHDN (864) + TX, hidrametilnona (443) + TX, cianuro de hidrógeno (444) + TX, hidropreno (445) + TX, hiquincarb (1223) + TX, imidacloprid (458) + TX, imiprotrina (460) + TX, indoxacarb (465) + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, IPSP (1229) + TX, isazofós (1231) + TX, isobenzán (1232) + TX, isocarbofós (nombre alternativo) (473) + TX, isodrina (1235) + TX,

isofenfós (1236) + TX, isolano (1237) + TX, isoprocarb
(472) + TX, O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de
isopropilo (nombre según la IUPAC) (473) + TX,
isoprotiolano (474) + TX, isotioato (1244) + TX, isoxatió
5 (480) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX,
jasmolina I (696) + TX, jasmolina II (696) + TX, jodfenfós
(1248) + TX, hormona juvenil I (nombre alternativo) [CCN] +
TX, hormona juvenil II (nombre alternativo) [CCN] + TX,
hormona juvenil III (nombre alternativo) [CCN] + TX,
10 keleván (1249) + TX, kinopreno (484) + TX, lambda-
cihalotrina (198) + TX, arseniato de plomo [CCN] + TX,
lepimectina (CCN) + TX, leptofós (1250) + TX, lindano (430)
+ TX, lirimfós (1251) + TX, lufenurón (490) + TX,
litidatió (1253) + TX, metilcarbamato de *m*-cumenilo
15 (nombre según la IUPAC) (1014) + TX, fosfuro de magnesio
(nombre según la IUPAC) (640) + TX, malatió (492) + TX,
malonobeno (1254) + TX, mazidox (1255) + TX, mecarbam (502)
+ TX, mecarfón (1258) + TX, menazón (1260) + TX,
mefosfolano (1261) + TX, cloruro mercurioso (513) + TX,
20 mesulfenfós (1263) + TX, metaflumizona (CCN) + TX, metam
(519) + TX, metam-potasio (nombre alternativo) (519) + TX,
metam-sodio (519) + TX, metacrifós (1266) + TX, metamidofós
(527) + TX, fluoruro de metanosulfonilo (nombre según la
IUPAC/Chemical Abstracts) (1268) + TX, metidatió (529) +
25 TX, metiocarb (530) + TX, metocrotofós (1273) + TX,
metomilo (531) + TX, metopreno (532) + TX, metoquina-butilo
(1276) + TX, metotrina (nombre alternativo) (533) + TX,
metoxiclor (534) + TX, metoxifenoazida (535) + TX, bromuro
de metilo (537) + TX, isotiocianato de metilo (543) + TX,
30 metilcloroformo (nombre alternativo) [CCN] + TX, cloruro de
metileno [CCN] + TX, metoflutrina [CCN] + TX, metolcarb

(550) + TX, metoxadiazona (1288) + TX, mevinfós (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, mirex (1294) + TX, monocrotofós (561) + TX, morfotión (1300) + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, naftalofós (nombre alternativo) [CCN] + TX, naled (567) + TX, naftaleno (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1303) + TX, NC-170 (código de desarrollo) (1306) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, nicotina (578) + TX, sulfato de nicotina (578) + TX, nifluridida (1309) + TX, nitenpiram (579) + TX, nitiazina (1311) + TX, nitrilacarb (1313) + TX, complejo de nitrilacarb y cloruro de zinc 1:1 (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) + TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, nornicotina (nombre tradicional) (1319) + TX, novalurón (585) + TX, noviflumurón (586) + TX, etilfosfonotioato de *O*-5-dicloro-4-yodofenilo y *O*-etilo (nombre según la IUPAC) (1057) + TX, fosforotioato de *O,O*-dietilo y *O*-4-metil-2-oxo-2*H*-cromen-7-ilo (nombre según la IUPAC) (1074) + TX, fosforotioato de *O,O*-dietilo y *O*-6-metil-2-propilpirimidin-4-ilo (nombre según la IUPAC) (1075) + TX, ditiopirofosfato de *O,O,O',O'*-tetrapropilo (nombre según la IUPAC) (1424) + TX, ácido oleico (nombre según la IUPAC) (593) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxidemetón-metilo (609) + TX, oxideprofós (1324) + TX, oxidisulfotón (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, para-diclorobenceno [CCN] + TX, paratión (615) + TX, paratión-metilo (616) + TX, penflurón (nombre alternativo) [CCN] + TX, pentaclorofenol (623) + TX, laurato de pentaclorofenilo (nombre según la IUPAC) (623) + TX, permetrina (626) + TX, aceites del petróleo (nombre alternativo) (628) + TX, PH 60-38 (código de desarrollo)

(1328) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fenotrina (630) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosadona (637) + TX, fosfolán (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosniclor (1339) + TX, fosfamidón (639) + TX, fosfina (nombre según la IUPAC) (640) + TX, foxim (642) + TX, foxim-metilo (1340) + TX, pirimetafós (1344) + TX, pirimicarb (651) + TX, pirimifós-etilo (1345) + TX, pirimifós-metilo (652) + TX, isómeros de policlorodidiclopentadieno (nombre según la IUPAC) (1346) + TX, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + TX, arsenito de potasio [CCN] + TX, tiocianato de potasio [CCN] + TX, praletina (655) + TX, precoceno I (nombre alternativo) [CCN] + TX, precoceno II (nombre alternativo) [CCN] + TX, precoceno III (nombre alternativo) [CCN] + TX, primidofós (1349) + TX, profenofós (662) + TX, proflutrina [CCN] + TX, promacilo (1354) + TX, promecarb (1355) + TX, propafós (1356) + TX, propetamfós (673) + TX, propoxur (678) + TX, protidación (1360) + TX, protiofós (686) + TX, protoato (1362) + TX, protrifenbuto [CCN] + TX, pimetrozina (688) + TX, piraclofós (689) + TX, pirazofós (693) + TX, piresmetrina (1367) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridabeno (699) + TX, piridalilo (700) + TX, piridafentión (701) + TX, pirimidifeno (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, piriproxifeno (708) + TX, cuasia (nombre alternativo) [CCN] + TX, quinalfós (711) + TX, quinalfós-metilo (1376) + TX, quinoión (1380) + TX, quintiofós (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, rafoxanida (nombre alternativo) [CCN] + TX, resmetrina (719) + TX, rotenona (722) + TX, RU 15525 (código de desarrollo) (723) + TX, RU 25475 (código de desarrollo) (1386) + TX, riania (nombre alternativo) (1387) + TX, rianodina (nombre tradicional)

(1387) + TX, sabadilla (nombre alternativo) (725) + TX, escradán (1389) + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, SI-0205 (código de compuesto) + TX, SI-0404 (código de compuesto) + TX, SI-0405 (código de compuesto) + TX, silafluofeno (728) + TX, SN 72129 (código de desarrollo) (1397) + TX, arsenito de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoruro de sodio (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1399) + TX, hexafluorosilicato de sodio (1400) + TX, pentaclorofenóxido de sodio (623) + TX, seleniato de sodio (nombre según la IUPAC) (1401) + TX, tiocianato de sodio [CCN] + TX, sofamida (1402) + TX, espinosad (737) + TX, espiromesifeno (739) + TX, espirotetramat (CCN) + TX, sulcofurón (746) + TX, sulcofurón-sodio (746) + TX, sulfluramida (750) + TX, sulfotep (753) + TX, fluoruro de sulfurilo (756) + TX, sulprofós (1408) + TX, aceites de alquitrán (nombre alternativo) (758) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tazimcarb (1412) + TX, TDE (1414) + TX, tebufenozida (762) + TX, tebufenpirad (763) + TX, tebupirimfós (764) + TX, teflubenzurón (768) + TX, teflutrina (769) + TX, temefós (770) + TX, TEPP (1417) + TX, teraletrina (1418) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, terbufós (773) + TX, tetracloroetano [CCN] + TX, tetraclorvinfós (777) + TX, tetrametrina (787) + TX, theta-cipermetrina (204) + TX, tiacloprid (791) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tiametoxam (792) + TX, ticrofós (1428) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiociclam (798) + TX, hidrogenooxalato de tiociclam (798) + TX, tiodicarb (799) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometón (801) + TX, tionazina (1434) + TX, tiosultap (803) + TX, tiosultap-sodio (803) + TX, turingiensina

(nombre alternativo) [CCN] + TX, tolfenpirad (809) + TX,
tralometrina (812) + TX, transflutrina (813) + TX,
transpermetrina (1440) + TX, triamifós (1441) + TX,
triazamato (818) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón
5 (nombre alternativo) + TX, triclorfón (824) + TX,
triclormetafós-3 (nombre alternativo) [CCN] + TX,
tricloronat (1452) + TX, trifenofós (1455) + TX,
triflumurón (835) + TX, trimetacarb (840) + TX, tripreno
(1459) + TX, vamidotión (847) + TX, vaniliprol [CCN] + TX,
10 veratridina (nombre alternativo) (725) + TX, veratrina
(nombre alternativo) (725) + TX, XMC (853) + TX, xililcarb
(854) + TX, YI-5302 (código de compuesto) + TX, zeta-
cipermetrina (205) + TX, zetametrina (nombre alternativo) +
TX, fosfuro de zinc (640) + TX, zolaprofós (1469) y ZXI
15 8901 (código de desarrollo) (858) + TX, ciantraniliprol
[736994-63-19 + TX, clorantraniliprol [500008-45-7] + TX,
cienopirafeno [560121-52-0] + TX, ciflumetofeno [400882-07-
7] + TX, pirifluquinazón [337458-27-2] + TX, espinetoram
[187166-40-1 + 187166-15-0] + TX, espirotetramat [203313-
20 25-1] + TX, sulfoxaflor [946578-00-3] + TX, flufiprol
[704886-18-0] + TX, meperflutrina [915288-13-0] + TX,
tetrametilflutrina [84937-88-2] + TX, triflumezopirim
(descrito en el documento WO 2012/092115) + TX,

un molusquicida seleccionado a partir del grupo de
25 sustancias constituido por óxido de bis(tributilestaño)
(nombre según la IUPAC) (913) + TX, bromoacetamida [CCN] +
TX, arseniato de calcio [CCN] + TX, cloetocarb (999) + TX,
acetoarsenito de cobre [CCN] + TX, sulfato de cobre (172) +
TX, fentina (347) + TX, fosfato férrico (nombre según la
30 IUPAC) (352) + TX, metaldehído (518) + TX, metiocarb (530)
+ TX, niclosamida (576) + TX, niclosamida-olamina (576) +

TX, pentaclorofenol (623) + TX, pentaclorofenóxido de sodio (623) + TX, tazimcarb (1412) + TX, tiodicarb (799) + TX, óxido de tributilestaño (913) + TX, trifenmorf (1454) + TX, trimetacarb (840) + TX, acetato de trifenilestaño (nombre según la IUPAC) (347) e hidróxido de trifenilestaño (nombre según la IUPAC) (347) + TX, piriprol [394730-71-3] + TX,

un nematocida seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por AKD-3088 (código de compuesto) + TX, 1,2-dibromo-3-cloropropano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1045) + TX, 1,2-dicloropropano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno (nombre según la IUPAC) (1063) + TX, 1,3-dicloropropeno (233) + TX, 1,1-dióxido de 3,4-diclorotetrahidrotiofeno (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1065) + TX, 3-(4-clorofenil)-5-metilrodanina (nombre según la IUPAC) (980) + TX, ácido 5-metil-6-tioxo-1,3,5-tiadiazinan-3-ilacético (nombre según la IUPAC) (1286) + TX, 6-isopentenilaminopurina (nombre alternativo) (210) + TX, abamectina (1) + TX, acetoprol [CCN] + TX, alanicarb (15) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, benclotiaz [CCN] + TX, benomilo (62) + TX, butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, cadusafós (109) + TX, carbofurano (118) + TX, disulfuro de carbono (945) + TX, carbosulfán (119) + TX, cloropicrina (141) + TX, clorpirifós (145) + TX, cloetocarb (999) + TX, citocininas (nombre alternativo) (210) + TX, dazomet (216) + TX, DBCP (1045) + TX, DCIP (218) + TX, diamidafós (1044) + TX, diclofentión (1051) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dimetoato (262) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina

(291) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, etoprofós (312) + TX, dibromuro de etileno (316) + TX, fenamifós (326) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fensulfotión (1158) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietán (1196) + TX, furfural (nombre alternativo) [CCN] + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, heterofós [CCN] + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, isamidofós (1230) + TX, isazofós (1231) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, kinetina (nombre alternativo) (210) + TX, mecarfón (1258) + TX, metam (519) + TX, metam-potasio (nombre alternativo) (519) + TX, metam-sodio (519) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, isotiocianato de metilo (543) + TX, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, composición de *Myrothecium verrucaria* (nombre alternativo) (565) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, oxamilo (602) + TX, forato (636) + TX, fosfamidón (639) + TX, fosfocarb [CCN] + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, espinosad (737) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, terbufós (773) + TX, tetraclorotiofeno (nombre según la IUPAC/ Chemical Abstracts) (1422) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tionazina (1434) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón (nombre alternativo) + TX, xilenoles [CCN] + TX, YI-5302 (código de compuesto) y zeatina (nombre alternativo) (210) + TX, fluensulfona [318290-98-1] + TX,

un inhibidor de la nitrificación seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por etilxantato de potasio [CCN] y nitrapirina (580) + TX,

un activador vegetal seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por acibenzolar (6) + TX,

acibenzolar-*S*-metilo (6) + TX, probenazol (658) y extracto de *Reynoutria sachalinensis* (nombre alternativo) (720) + TX,

5 un rodenticida seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre según la IUPAC) (1246) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)bencenosulfonamida (nombre según la IUPAC) (748) + TX, alfa-clorohidrina [CCN] + TX, fosfuro de aluminio (640) + TX, antu (880) + TX, óxido arsenioso (882) + TX,
10 carbonato de bario (891) + TX, bistiosemi (912) + TX, brodifacoum (89) + TX, bromadiolona (91) + TX, brometalina (92) + TX, cianuro de calcio (444) + TX, cloralosa (127) + TX, clorofacinona (140) + TX, colecalciferol (nombre alternativo) (850) + TX, coumaclor (1004) + TX, coumafurilo (1005) + TX, coumatetralilo (175) + TX, crimidina (1009) + TX, difenacoum (246) + TX, difetialona (249) + TX, difacinona (273) + TX, ergocalciferol (301) + TX, flocoumafeno (357) + TX, fluoroacetamida (379) + TX, flupropadina (1183) + TX, clorhidrato de flupropadina (1183) + TX, gamma-HCH (430) + TX, HCH (430) + TX, cianuro de hidrógeno (444) + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, lindano (430) + TX, fosfuro de magnesio (nombre según la IUPAC) (640) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, norbormida (1318) + TX, fosacetim (1336) + TX,
25 fosfina (nombre según la IUPAC) (640) + TX, fósforo [CCN] + TX, pindona (1341) + TX, arsenito de potasio [CCN] + TX, pirinurón (1371) + TX, escilirrosida (1390) + TX, arsenito de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoroacetato de sodio (735) + TX, estriquina (745) + TX,
30 sulfato de talio [CCN] + TX, warfarina (851) y fosfuro de zinc (640) + TX,

un compuesto sinérgico seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por piperonilato de 2-(2-butoxi)etilo (nombre según la IUPAC) (934) + TX, 5-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-hexilciclohex-2-enona (nombre según la IUPAC) (903) + TX, farnesol con nerolidol (nombre alternativo) (324) + TX, MB-599 (código de desarrollo) (498) + TX, MGK 264 (código de desarrollo) (296) + TX, butóxido de piperonilo (649) + TX, piprotal (1343) + TX, isómero de propilo (1358) + TX, S421 (código de desarrollo) (724) + TX, sesamex (1393) + TX, sesasmolina (1394) y sulfóxido (1406) + TX,

un repelente de animales seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por antraquinona (32) + TX, cloralosa (127) + TX, naftenato de cobre [CCN] + TX, oxiclورو de cobre (171) + TX, diazinona (227) + TX, dicitopentadieno (nombre químico) (1069) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, metiocarb (530) + TX, piridin-4-amina (nombre según la IUPAC) (23) + TX, tiram (804) + TX, trimetacarb (840) + TX, naftenato de zinc [CCN] y ziram (856) + TX,

un virucida seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por imanina (nombre alternativo) [CCN] y ribavirina (nombre alternativo) [CCN] + TX,

un protector de lesiones seleccionado a partir del grupo de sustancias constituido por óxido de mercurio (512) + TX, octilinona (590) y tiofanato-metilo (802) + TX,

y compuestos biológicamente activos seleccionados a partir del grupo constituido por ametoctradina [865318-97-4] + TX, amisulbromo [348635-87-0] + TX, azaconazol [60207-31-0] + TX, benzovindiflupir [1072957-71-1] + TX, bitertanol [70585-36-3] + TX, bixafeno [581809-46-3] + TX,

bromuconazol [116255-48-2] + TX, coumoxistrobina [850881-70-8] + TX, ciproconazol [94361-06-5] + TX, difenoconazol [119446-68-3] + TX, diniconazol [83657-24-3] + TX, enoxastrobina [238410-11-2] + TX, epoxiconazol [106325-08-0] + TX, fenbuconazol [114369-43-6] + TX, fenpirazamina [473798-59-3] + TX, fluquinconazol [136426-54-5] + TX, flusilazol [85509-19-9] + TX, flutriafol [76674-21-0] + TX, fluxapiroxad [907204-31-3] + TX, fluopiram [658066-35-4] + TX, fenaminstrobina [366815-39-6] + TX, isofetamida [875915-78-9] + TX, hexaconazol [79983-71-4] + TX, imazalilo [35554-44-0] + TX, imibenconazol [86598-92-7] + TX, ipconazol [125225-28-7] + TX, ipfentrifluconazol [1417782-08-1] + TX, isotianilo [224049-04-1] + TX, mandestrobina [173662-97-0] (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2010/093059) + TX, mefentrifluconazol [1417782-03-6] + TX, metconazol [125116-23-6] + TX, miclobutanilo [88671-89-0] + TX, paclobutrazol [76738-62-0] + TX, pefurazoato [101903-30-4] + TX, penflufeno [494793-67-8] + TX, penconazol [66246-88-6] + TX, protioconazol [178928-70-6] + TX, pirifenox [88283-41-4] + TX, procloraz [67747-09-5] + TX, propiconazol [60207-90-1] + TX, simeconazol [149508-90-7] + TX, tebuconazol [107534-96-3] + TX, tetraconazol [112281-77-3] + TX, triadimefón [43121-43-3] + TX, triadimenol [55219-65-3] + TX, triflumizol [99387-89-0] + TX, triticonazol [131983-72-7] + TX, ancimidol [12771-68-5] + TX, fenarimol [60168-88-9] + TX, nuarimol [63284-71-9] + TX, bupirimato [41483-43-6] + TX, dimetirimol [5221-53-4] + TX, etirimol [23947-60-6] + TX, dodemorf [1593-77-7] + TX, fenpropidina [67306-00-7] + TX, fenpropimorf [67564-91-4] + TX, espiroxamina [118134-30-8] + TX, tridemorf [81412-43-3]

+ TX, ciprodinilo [121552-61-2] + TX, mepanipirim [110235-47-7] + TX, pirimetanilo [53112-28-0] + TX, fenpiclonilo [74738-17-3] + TX, fludioxonilo [131341-86-1] + TX, fluindapir [1383809-87-7] + TX, benalaxilo [71626-11-4] +
5 TX, furalaxilo [57646-30-7] + TX, metalaxilo [57837-19-1] + TX, R-metalaxilo [70630-17-0] + TX, ofurace [58810-48-3] + TX, oxadixilo [77732-09-3] + TX, benomilo [17804-35-2] + TX, carbendazim [10605-21-7] + TX, debacarb [62732-91-6] + TX, fuberidazol [3878-19-1] + TX, tiabendazol [148-79-8] +
10 TX, clozolinato [84332-86-5] + TX, diclozolina [24201-58-9] + TX, iprodiona [36734-19-7] + TX, miclozolina [54864-61-8] + TX, procimidona [32809-16-8] + TX, vinclozolina [50471-44-8] + TX, boscalida [188425-85-6] + TX, carboxina [5234-68-4] + TX, fenfuram [24691-80-3] + TX, flutolanilo [66332-96-5] + TX, flutianilo [958647-10-4] + TX, mepronilo [55814-41-0] + TX, oxicarboxina [5259-88-1] + TX, pentiopirad [183675-82-3] + TX, tifluzamida [130000-40-7] + TX, guazatina [108173-90-6] + TX, dodina [2439-10-3] [112-65-2] (base libre) + TX, iminoctadina [13516-27-3] + TX,
20 azoxistrobina [131860-33-8] + TX, dimoxistrobina [149961-52-4] + TX, enestroburina {Proc. BCPC, Int. Congr., Glasgow, 2003, **1**, 93} + TX, fluoxastrobina [361377-29-9] + TX, kresoxim-metilo [143390-89-0] + TX, metominostrobin [133408-50-1] + TX, trifloxistrobina [141517-21-7] + TX,
25 orisastrobina [248593-16-0] + TX, picoxistrobina [117428-22-5] + TX, piraclostrobina [175013-18-0] + TX, piraoxistrobina [862588-11-2] + TX, ferbam [14484-64-1] + TX, mancozeb [8018-01-7] + TX, maneb [12427-38-2] + TX, metiram [9006-42-2] + TX, propineb [12071-83-9] + TX, tiram [137-26-8] + TX, zineb [12122-67-7] + TX, ziram [137-30-4]
30 + TX, captafol [2425-06-1] + TX, captán [133-06-2] + TX,

diclofluanid [1085-98-9] + TX, fluoroimida [41205-21-4] + TX, folpet [133-07-3] + TX, tolilfluanid [731-27-1] + TX, caldo bordelés [8011-63-0] + TX, hidróxido de cobre [20427-59-2] + TX, oxicloruro de cobre [1332-40-7] + TX, sulfato de cobre [7758-98-7] + TX, óxido de cobre [1317-39-1] + TX, mancobre [53988-93-5] + TX, oxina-cobre [10380-28-6] + TX, dinocap [131-72-6] + TX, nitrotal-isopropilo [10552-74-6] + TX, edifenfós [17109-49-8] + TX, iprobenfós [26087-47-8] + TX, isoprotiolano [50512-35-1] + TX, fosdifeno [36519-00-3] + TX, pirazofós [13457-18-6] + TX, tolclófós-metilo [57018-04-9] + TX, acibenzolar-S-metilo [135158-54-2] + TX, anilazina [101-05-3] + TX, bentiavalicarb [413615-35-7] + TX, blasticidina-S [2079-00-7] + TX, quinometionato [2439-01-2] + TX, cloroneb [2675-77-6] + TX, clorotalonilo [1897-45-6] + TX, ciflufenamida [180409-60-3] + TX, cimoxanilo [57966-95-7] + TX, diclona [117-80-6] + TX, diclocimet [139920-32-4] + TX, diclomezina [62865-36-5] + TX, diclorán [99-30-9] + TX, dietofencarb [87130-20-9] + TX, dimetomorf [110488-70-5] + TX, SYP-LI90 (Flumorf) [211867-47-9] + TX, ditianón [3347-22-6] + TX, etaboxam [162650-77-3] + TX, etridiazol [2593-15-9] + TX, famoxadona [131807-57-3] + TX, fenamidona [161326-34-7] + TX, fenoxanilo [115852-48-7] + TX, fentina [668-34-8] + TX, ferimzona [89269-64-7] + TX, fluazinam [79622-59-6] + TX, fluopicolida [239110-15-7] + TX, flusulfamida [106917-52-6] + TX, fenhexamida [126833-17-8] + TX, fosetil-aluminio [39148-24-8] + TX, himexazol [10004-44-1] + TX, improvalicarb [140923-17-7] + TX, IKF-916 (Ciazofamid) [120116-88-3] + TX, kasugamicina [6980-18-3] + TX, metasulfocarb [66952-49-6] + TX, metrafenona [220899-03-6] + TX, pencicurón [66063-05-6] + TX, ftalida [27355-22-2] + TX, picarbutrazox [500207-04-5] + TX, polioxinas

[11113-80-7] + TX, probenazol [27605-76-1] + TX, propamocarb [25606-41-1] + TX, proquinazid [189278-12-4] + TX, pidiflumetofeno [1228284-64-7] + TX, pirametostrobina [915410-70-7] + TX, piroquilón [57369-32-1] + TX, 5 piriofenona [688046-61-9] + TX, piribencarb [799247-52-2] + TX, pirisoxazol [847749-37-5] + TX, quinoxifeno [124495-18-7] + TX, quintozeno [82-68-8] + TX, azufre [7704-34-9] + TX, Timorex GoldTM (extracto de plantas que contiene aceite de árbol de té procedente de Stockton Group) + TX, 10 tebufloquina [376645-78-2] + TX, tiadinilo [223580-51-6] + TX, triazóxido [72459-58-6] + TX, tolprocarb [911499-62-2] + TX, triclopiricarb [902760-40-1] + TX, triciclazol [41814-78-2] + TX, triforina [26644-46-2] + TX, validamicina [37248-47-8] + TX, valifenalato [283159-90-0] 15 + TX, zoxamida (RH7281) [156052-68-5] + TX, mandipropamida [374726-62-2] + TX, isopirazam [881685-58-1] + TX, fenamacrilo + TX, sedaxano [874967-67-6] + TX, trinexapac-etilo [95266-40-3] + TX, (9-diclorometileno-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il)amida del ácido 3- 20 difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxílico (descrita en el documento WO 2007/048556) + TX, (3',4',5'-trifluorobifenil-2-il)amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxílico (descrita en el documento WO 2006/087343) + TX, ciclopropanocarboxilato de 25 [(3*S*,4*R*,4*aR*,6*S*,6*aS*,12*R*,12*aS*,12*bS*)-3-[(ciclopropilcarbonil)oxi]-1,3,4,4*a*,5,6,6*a*,12,12*a*,12*b*-decahidro-6,12-dihidroxi-4,6*a*,12*b*-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2*H*,11*H*-naftol[2,1-*b*]pirano[3,4-*e*]piran-4-il]metilo [915972-17-7] + TX y 1,3,5-trimetil-*N*-(2-metil-1-oxopropil)-*N*-[3-(2-metilpropil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-

metoxi-1-(trifluorometil)etil]fenil]-1*H*-pirazol-4-carboxamida [926914-55-8] + TX,

o un compuesto biológicamente activo seleccionado a partir del grupo constituido por *N*-[(5-cloro-2-isopropilfenil)metil]-*N*-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metilpirazol-4-carboxamida (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2010/130767) + TX, 2,6-dimetil-1*H*,5*H*-[1,4]ditiino[2,3-*c*:5,6-*c'*]dipirrol-1,3,5,7(2*H*,6*H*)-tetrona (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2011/138281) + TX, 6-etil-5,7-dioxopirrolo[4,5][1,4]ditiino[1,2-*c*]isotiazol-3-carbonitrilo + TX, 4-(2-bromo-4-fluoro-fenil)-*N*-(2-cloro-6-fluorofenil)-2,5-dimetilpirazol-3-amina (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2012/031061) + TX, 3-(difluorometil)-*N*-(7-fluoro-1,1,3-trimetilindan-4-il)-1-metilpirazol-4-carboxamida (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2012/084812) + TX, CAS 850881-30-0 + TX, 1,1-dióxido de 3-(3,4-dicloro-1,2-tiazol-5-ilmetoxi)-1,2-benzotiazol (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2007/129454) + TX, 2-[2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-*N*-metilacetamida + TX, 3-(4,4-difluoro-3,4-dihidro-3,3-dimetilisoquinolin-1-il)quinolona (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2005/070917) + TX, 2-[2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metil-3-quinolil)oxi]fenil]propan-2-ol (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2011/081174) + TX, 2-[2-[(7,8-difluoro-2-metil-3-quinolil)oxi]-6-fluorofenil]propan-2-ol (se puede preparar

de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2011/081174) + TX, oxatiapiprolina + TX [1003318-67-9], N-[6-[[[(1-metiltetrazol-5-

il)fenilmetileno]amino]oximetil]-2-piridil]carbamato de

5 tert-butilo + TX, N-[2-(3,4-difluorofenil)fenil]-3-

(trifluorometil)pirazin-2-carboxamida (se puede preparar de

acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO

2007/ 072999) + TX, 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-

1,1,3-trimetilindan-4-il]pirazol-4-carboxamida (se puede

10 preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el

documento WO 2014/013842) + TX, N-[2-metil-1-[[[4-

metilbenzoil)amino]metil]propil]carbamato de 2,2,2-

trifluoroetilo + TX, (2RS)-2-[4-(4-clorofenoxi)- α,α,α -

trifluoro-o-tolil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol +

15 TX, (2RS)-2-[4-(4-clorofenoxi)- α,α,α -trifluoro-o-tolil]3-

metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol + TX, 2-

(difluorometil)-N-[(3R)-3-etil-1,1-dimetilindan-4-

il]piridin-3-carboxamida + TX, 2-(difluorometil)-N-[3-etil-

1,1-dimetilindan-4-il]piridin-3-carboxamida + TX, N'-(2,5-

20 dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilformamidina + TX, N'-

[4-(4,5-diclorotiazol-2-il)oxi-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-

metilformamidina (se puede preparar de acuerdo con los

procedimientos descritos en el documento WO 2007/031513) +

TX, metanosulfonato de [2-[3-[2-[1-[2-[3,5-

25 bis(difluorometil)pirazol-1-il]acetil]-4-piperidil]tiazol-

4-il]-4,5-dihidroisoxazol-5-il]-3-clorofenilo] (se puede

preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el

documento WO 2012/025557) + TX, N-[6-[[[(Z)-[(1-

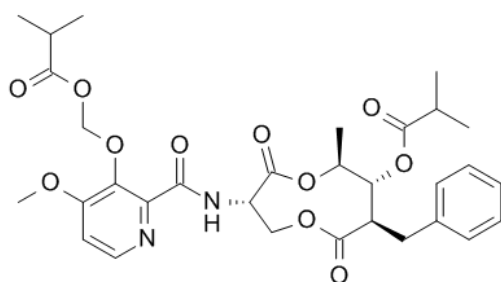
metiltetrazol-5-il)fenilmetilen]amino]oximetil]-2-

30 piridil]carbamato de but-3-inilo (se puede preparar de

acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO

2010/000841) + TX, 2-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-4*H*-1,2,4-triazol-3-tiona (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2010/146031) + TX, N-[[5-[4-(2,4-dimetilfenil)triazol-2-il]-2-metilfenil]metil]carbamato de metilo + TX, 3-cloro-6-metil-5-fenil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2005/121104) + TX, 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2013/024082) + TX, 3-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-6-metil-5-fenilpiridazina (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2012/020774) + TX, 4-(2,6-difluorofenil)-6-metil-5-fenilpiridazin-3-carbonitrilo (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2012/020774) + TX, (R)-3-(difluorometil)-1-metil-N-[1,1,3-trimetilindan-4-il]pirazol-4-carboxamida (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2011/162397) + TX, 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetilindan-4-il)-1-metilpirazol-4-carboxamida (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2012/084812) + TX, 1-[2-[[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oximetil]-3-metilfenil]-4-metiltetrazol-5-ona (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2013/162072) + TX, 1-metil-4-[3-metil-2-[[2-metil-4-(3,4,5-trimetilpirazol-1-il)fenoxi]metil]fenil]tetrazol-5-ona (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2014/051165) + TX, (*Z*,2*E*)-5-[1-(4-

clorofenil)pirazol-3-il]oxi-2-metoxiimino-*N*,3-dimetilpent-3-enamida + TX, 2-amino-6-metilpiridin-3-carboxilato de (4-fenoxifenil)metilo + TX, *N*-(5-cloro-2-isopropilbencil)-*N*-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metilpirazol-4-carboxamida [1255734-28-1] (se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2010/130767) + TX, 3-(difluorometil)-*N*-[(*R*)-2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1*H*-inden-4-il]-1-metilpirazol-4-carboxamida [1352994-67-2] + TX, *N'*-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-*N*-etil-*N*-metilformamidina + TX, *N'*-[4-(4,5-diclorotiazol-2-iloxi)-2,5-dimetilfenil]-*N*-etil-*N*-metilformamidina + TX, *N'*-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-*N*-etil-*N*-metilformamidina + TX, *N'*-[4-(4,5-diclorotiazol-2-iloxi)-2,5-dimetilfenil]-*N*-etil-*N*-metilformamidina + TX,



(fenpicoxamida [517875-34-2]) + TX (según se describe en el documento WO 2003/035617), 2-(difluorometil)-*N*-(1,1,3-trimetilindan-4-il)piridin-3-carboxamida + TX, 2-(difluorometil)-*N*-(3-etil-1,1-dimetilindan-4-il)piridin-3-carboxamida + TX, 2-(difluorometil)-*N*-(1,1-dimetil-3-propilindan-4-il)piridin-3-carboxamida + TX, 2-(difluorometil)-*N*-(3-isobutil-1,1-dimetilindan-4-il)piridin-3-carboxamida + TX, 2-(difluorometil)-*N*-[(3*R*)-1,1,3-trimetilindan-4-il]piridin-3-carboxamida + TX, 2-(difluorometil)-*N*-[(3*R*)-3-etil-1,1-dimetilindan-4-il]piridin-3-carboxamida + TX y 2-(difluorometil)-*N*-[(3*R*)-1,1-dimetil-3-propilindan-4-il]piridin-3-carboxamida + TX,

donde cada uno de estos compuestos de tipo carboxamida se puede preparar de acuerdo con los procedimientos descritos en el documento WO 2014/095675 y/o WO 2016/139189.

Las referencias entre corchetes tras los principios activos, p. ej. [3878-19-1], se refieren al número de registro del Chemical Abstracts. Los otros componentes de las mezclas descritos anteriormente son conocidos. Cuando los principios activos están incluidos en "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual - A World Compendium; decimotercera edición; Editor: C. D. S. Tomlin; Consejo Británico de Protección de los Cultivos], se describen en este con el número de entrada facilitado entre paréntesis anteriormente en la presente para el compuesto particular; por ejemplo, el compuesto "abamectina" se describe con el número de entrada (1). Cuando se ha añadido "[CCN]" anteriormente en la presente al compuesto particular, el compuesto en cuestión está incluido en el "Compendium of Pesticide Common Names", disponible en internet [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995-2004]; por ejemplo, el compuesto "acetoprol" se describe en la dirección de internet <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>.

Se hace referencia a la mayoría de los principios activos descritos anteriormente en la presente mediante el denominado "nombre común", utilizándose el "nombre común ISO" u otro "nombre común" relevante en casos individuales. Si la denominación no es un "nombre común", la naturaleza de la denominación empleada en su lugar se indica entre paréntesis para el compuesto particular; en este caso, se emplea el nombre según la IUPAC, el nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts, un "nombre químico", un "nombre

tradicional", un "nombre del compuesto" o un "código de desarrollo" o, si no se emplea ninguna de estas denominaciones ni ningún "nombre común", se emplea un "nombre alternativo". "N.º de Reg. CAS" se refiere al número de registro del Chemical Abstracts.

La mezcla de principios activos de los compuestos de Fórmula (I) seleccionados entre un compuesto 1.1-1.46 descrito en la Tabla T1 (más adelante) o un compuesto de Fórmula (I) descrito en las Tablas 1.1-1.5 o 2.1-2.3 (más adelante) y un principio activo como los descritos anteriormente tiene preferentemente una proporción de mezcla comprendida entre 100:1 y 1:6000, especialmente entre 50:1 y 1:50, más especialmente con una proporción comprendida entre 20:1 y 1:20, aún más especialmente entre 10:1 y 1:10, muy especialmente entre 5:1 y 1:5, con especial preferencia por una proporción comprendida entre 2:1 y 1:2, y siendo igualmente preferida una proporción comprendida entre 4:1 y 2:1, sobre todo una proporción de 1:1, o 5:1, o 5:2, o 5:3, o 5:4, o 4:1, o 4:2, o 4:3, o 3:1, o 3:2, o 2:1, o 1:5, o 2:5, o 3:5, o 4:5, o 1:4, o 2:4, o 3:4, o 1:3, o 2:3, o 1:2, o 1:600, o 1:300, o 1:150, o 1:35, o 2:35, o 4:35, o 1:75, o 2:75, o 4:75, o 1:6000, o 1:3000, o 1:1500, o 1:350, o 2:350, o 4:350, o 1:750, o 2:750, o 4:750. Estas relaciones de mezcla son en peso.

Las mezclas descritas anteriormente pueden emplearse en un método para controlar plagas, que comprende aplicar una composición que comprende una mezcla tal como se ha descrito anteriormente a las plagas o a su entorno, con la excepción de un método para tratar el cuerpo humano o animal mediante cirugía o terapia y métodos de diagnóstico practicados en el cuerpo humano o animal.

Las mezclas que comprenden un compuesto de Fórmula (I) seleccionado entre uno de las Tablas 1.1-1.5 o 2.1-2.3 (más adelante) o la Tabla T1 (más adelante) y uno o más principios activos como los descritos anteriormente pueden aplicarse, por ejemplo, en una única forma "ya mezclada", en una mezcla de pulverización combinada compuesta por formulaciones diferentes de cada uno de los componentes que son principios activos, tal como una "mezcla de tanque", y en un uso combinado de los principios activos individuales cuando estos se aplican de manera secuencial, es decir, uno después del otro en un periodo razonablemente corto tal como unas pocas horas o días. El orden de aplicación de los compuestos de Fórmula (I) seleccionados a partir de las Tablas 1.1-1.5 o 2.1-2.3 (más adelante) o la Tabla T1 (más adelante) y el o los principios activos como los descritos anteriormente no es esencial para llevar a la práctica la presente invención.

Las composiciones según la invención también pueden comprender otros auxiliares sólidos o líquidos tales como estabilizantes, por ejemplo, aceites vegetales epoxidados o no epoxidados (por ejemplo, aceite de coco, aceite de colza o aceite de soja epoxidados), antiespumantes, por ejemplo, aceite de silicona, conservantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes y/o adherentes, fertilizantes u otros principios activos para obtener efectos específicos, por ejemplo, bactericidas, fungicidas, nematocidas, activadores de plantas, molusquicidas o herbicidas.

Las composiciones según la invención se preparan de forma conocida en sí misma, en ausencia de auxiliares, por ejemplo, moliendo, tamizando y/o comprimiendo un principio activo sólido y, en presencia de al menos un auxiliar, por

ejemplo, mezclando íntimamente y/o moliendo el principio activo con el auxiliar (o los auxiliares). Estos procesos para preparar las composiciones y el uso de los compuestos de Fórmula (I) para preparar estas composiciones son también un objeto de la invención.

Otro aspecto de la invención se refiere al uso de un compuesto de Fórmula (I) o de un compuesto individual preferido según se define en la presente, de una composición que comprende al menos un compuesto de Fórmula (I) o al menos un compuesto individual preferido según se ha definido anteriormente, o de una mezcla fungicida o insecticida que comprende al menos un compuesto de Fórmula (I) o al menos un compuesto individual preferido según se ha definido anteriormente, mezclados con otros fungicidas o insecticidas, según se han descrito anteriormente, para controlar o prevenir la infestación de plantas, por ejemplo, plantas útiles tales como plantas de cultivo, su material de propagación, p. ej., semillas, cultivos recolectados, p. ej., cultivos alimentarios recolectados, o materiales inertes por parte de insectos o microorganismos fitopatógenos, preferentemente organismos fúngicos.

Un aspecto adicional de la invención se refiere a un método para controlar o prevenir una infestación de plantas, p. ej., de plantas útiles tales como plantas de cultivo, su material de propagación, p. ej., semillas, cultivos recolectados, p. ej., cultivos alimentarios recolectados, o de materiales inertes por parte de insectos o microorganismos fitopatógenos o responsables de la descomposición, u organismos potencialmente dañinos para el ser humano, especialmente organismos fúngicos, que comprende la aplicación de un compuesto de Fórmula (I) o un

compuesto individual preferido según se ha definido anteriormente como principio activo a las plantas, a partes de las plantas o a su emplazamiento, a su material de propagación o a cualquier parte de los materiales inertes.

5 Controlar o prevenir quiere decir reducir la infestación por parte de microorganismos fitopatógenos o responsables de la descomposición, u organismos potencialmente dañinos para el ser humano, especialmente organismos fúngicos, hasta un nivel tal que se demuestra
10 una mejora.

Un método preferido para controlar o prevenir una infestación de plantas de cultivo por parte de microorganismos fitopatógenos, especialmente organismos fúngicos, o insectos que comprende aplicar un compuesto de
15 Fórmula (I) o una composición agroquímica que contenga al menos uno de dichos compuestos, es la aplicación foliar. La frecuencia de aplicación y la tasa de aplicación dependerán del riesgo de infestación por parte del patógeno o insecto correspondiente. Sin embargo, los compuestos de Fórmula (I)
20 también se pueden infiltrar en la planta a través de las raíces mediante el suelo (acción sistémica) empapando el emplazamiento de la planta con una formulación líquida o aplicando los compuestos en forma sólida al suelo, p. ej., en forma granular (aplicación en el suelo). En cultivos de
25 arrozales, estos granulados se pueden aplicar al campo de arroz inundado. Los compuestos de Fórmula (I) también se pueden aplicar a las semillas (recubrimiento) impregnando las semillas o los tubérculos con una formulación líquida del fungicida o recubriéndolos con una formulación sólida.

30 Una formulación, p. ej., una composición que contiene el compuesto de Fórmula (I) y, si se desea, un adyuvante

sólido o líquido, o monómeros para encapsular el compuesto de Fórmula (I), se puede preparar empleando un método conocido, habitualmente mezclando y/o moliendo íntimamente el compuesto con extendedores, por ejemplo, disolventes, portadores sólidos y, opcionalmente, compuestos tensioactivos (surfactantes).

Las tasas de aplicación convenientes son normalmente de 5 g a 2 kg de principio activo (p.a.) por hectárea (ha), preferentemente de 10 g a 1 kg de p.a./ha y más preferentemente de 20 g a 600 g de p.a./ha. Cuando se emplea como un agente para empapar las semillas, las dosis convenientes son de 10 mg a 1 g de sustancia activa por kg de semillas.

Cuando las combinaciones de la presente invención se emplean para el tratamiento de semillas, en general, son suficientes unas tasas de 0.001 a 50 g de un compuesto de Fórmula (I) por kg de semillas, preferentemente de 0.01 a 10 g por kg de semillas.

Convenientemente, una composición que comprende un compuesto de Fórmula (I) de acuerdo con la presente invención se aplica ya sea de manera preventiva, que se refiere a antes del desarrollo de la enfermedad, o curativa, que se refiere a después del desarrollo de la enfermedad.

Las composiciones de la invención se pueden emplear en cualquier forma convencional, por ejemplo, en forma de un paquete doble, un polvo para el tratamiento de semillas en seco (SS), una emulsión para el tratamiento de semillas (ES), un concentrado fluido para el tratamiento de semillas (CF), una solución para el tratamiento de semillas (LS), un polvo dispersable en agua para el tratamiento de semillas

(DS), una suspensión de cápsulas para el tratamiento de semillas (FC), un gel para el tratamiento de semillas (GF), un concentrado emulsionable (CE), un concentrado en suspensión (CS), una suspoemulsión (SE), una suspensión de cápsulas (SC), un gránulo dispersable en agua (GD), un gránulo emulsionable (GE), una emulsión de agua en aceite (EAc), una emulsión de aceite en agua (EAg), una microemulsión (ME), una dispersión oleosa (DO), un fluido miscible en aceite (FAC), un líquido miscible en aceite (LAc), un concentrado soluble (SL), una suspensión de volumen ultrabajo (SU), un líquido de volumen ultrabajo (LU), un concentrado técnico (CT), un concentrado dispersable (CD), un polvo humectable (PH) o cualquier formulación técnicamente factible combinada con adyuvantes aceptables en agricultura.

Estas composiciones se pueden producir empleando métodos convencionales, p. ej., mezclando los principios activos con materiales inertes de formulación adecuados (diluyentes, disolventes, rellenos y opcionalmente otros ingredientes de formulación tales como surfactantes, biocidas, anticongelantes, adherentes, espesantes y compuestos que proporcionen efectos adyuvantes). Cuando se desee obtener una eficacia de duración prolongada, también se pueden emplear formulaciones de liberación lenta convencionales. En particular, las formulaciones que se van a aplicar en formas de pulverización, tales como los concentrados dispersables en agua (p. ej., CE, CS, CD, DO, SE, EAg, EAc y análogos), polvos humectables y gránulos, pueden contener surfactantes tales como agentes humectantes y dispersantes y otros compuestos que proporcionen efectos adyuvantes, p. ej., el producto de condensación del

formaldehído con sulfonato de naftaleno, un sulfonato de alquilarilo, un sulfonato de lignina, un sulfato de alquilo graso, alquilfenol etoxilado y un alcohol graso etoxilado.

Una formulación para el revestimiento de semillas se aplica con métodos conocidos por sí mismos a las semillas, empleando la combinación de la invención y un diluyente en una forma de formulación para el revestimiento de semillas adecuada, p. ej., como una suspensión acuosa o en una forma de polvo seco que tenga una adherencia satisfactoria a las semillas. Estas formulaciones para el revestimiento de semillas son de uso común en la técnica. Las formulaciones para el revestimiento de semillas pueden contener los principios activos individuales o la combinación de principios activos en forma encapsulada, p. ej., como microcápsulas o cápsulas de liberación lenta.

En general, las formulaciones incluyen entre un 0.01 y un 90% en peso de agente activo, entre un 0 y un 20% de tensioactivo aceptable en agricultura y entre un 10 y un 99.99% de un adyuvante o adyuvantes y materiales inertes de formulación sólidos o líquidos, estando constituido el agente activo por al menos el compuesto de Fórmula (I) junto con, opcionalmente, otros agentes activos, particularmente microbicidas, conservantes o similares. Las formas concentradas de las composiciones contienen generalmente entre aproximadamente un 2 y un 80%, preferentemente entre aproximadamente un 5 y un 70% en peso de agente activo. Las formas de aplicación de la formulación pueden contener, por ejemplo, de un 0.01 a un 20% en peso, preferentemente de un 0.01 a un 5% en peso de agente activo. Aunque los productos comerciales se

1.008	prop-2-inilo	1.028	aliloxi
1.009	ciclopropilo	1.029	benciloxi
1.010	ciclopropilmetilo	1.030	metoxi
1.011	2-acetamidoetilo	1.031	etoxi
1.012	2-dimetilaminoetilo	1.032	fenilo
1.013	2-etil-3-oxoisoxazolidin-4-ilo	1.033	(3-metil-2-tienil)metilo
1.014	2-fluoroetilo	1.034	2-(<i>tert</i> -butoxicarbonilamino)etilo
1.015	2-metilsulfaniletilo	1.035	1,4-dioxan-2-ilmetilo
1.016	hidrógeno	1.036	2,2-difluoroetoxi
1.017	2,2-difluorociclopentilo	1.037	2,2-difluoroetilo
1.018	2-metoxi-2-oxoetilo	1.038	2,2-dimetoxietilo
1.019	prop-2-inoxi	1.039	2-(metilamino)-2-oxoetilo
1.020	prop-2-inilo	1.040	isobutilo

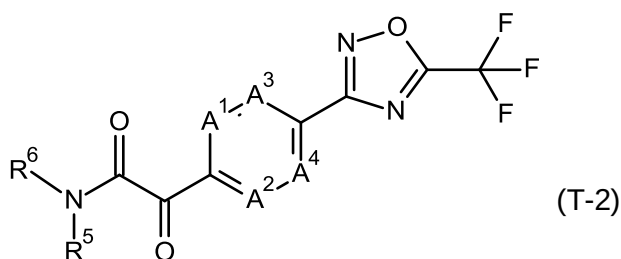
Tabla 1.2: Esta tabla describe 40 compuestos específicos de Fórmula (T-1) donde A¹ es C-R¹, A² es C-R², A³ es C-R³, A⁴ es C-R⁴ y R², R³, R⁴ y R⁵ son hidrógeno, R¹ es flúor y R⁶ es como se ha definido anteriormente en la Tabla 1.

Tabla 1.3: Esta tabla describe 40 compuestos específicos de Fórmula (T-1) donde A^1 es $C-R^1$, A^2 es $C-R^2$, A^3 es $C-R^3$, A^4 es $C-R^4$ y R^1 , R^2 , R^4 y R^5 son hidrógeno, R^3 es flúor y R^6 es como se ha definido anteriormente en la Tabla 1.

Tabla 1.4: Esta tabla describe 40 compuestos específicos de Fórmula (T-1) donde A^1 es $C-R^1$, A^2 es $C-R^2$, A^3 es $C-R^3$, A^4 es $C-R^4$ y R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son hidrógeno, R^5 es metilo y R^6 es como se ha definido anteriormente en la Tabla 1.

Tabla 1.5: Esta tabla describe 40 compuestos específicos de Fórmula (T-1) donde A^1 es $C-R^1$, A^2 es $C-R^2$, A^3 es $C-R^3$, A^4 es $C-R^4$ y R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son hidrógeno, R^5 es metoxi y R^6 es como se ha definido anteriormente en la Tabla 1.

Tabla 2.1: Esta tabla describe 5 compuestos específicos de Fórmula (T-2):



donde A^1 es $C-R^1$, A^2 es $C-R^2$, A^3 es $C-R^3$, A^4 es $C-R^4$ y R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son hidrógeno, y R^5-N-R^6 es como se define a continuación en la Tabla 2.

Cada una de las Tablas 2.2-2.3 (que siguen a la Tabla 2.1) proporciona 5 compuestos individuales de Fórmula (T-2) en los cuales A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son como se definen específicamente en las Tablas 2.2-2.3, que hacen referencia a la Tabla 2 donde se define específicamente R^5-N-R^6 .

Tabla 2

Compuest o N.º	R ⁵ -N-R ⁶	Compuest o N.º	R ⁵ -N-R ⁶
2.001	4- metoxipiperazinilo	2.004	1,2-oxazinanilo
2.002	morfolinilo	2.005	1,4-oxazinanilo
2.003	pirrolidinilo		

Tabla 2.2: Esta tabla describe 5 compuestos
específicos de Fórmula (T-2) donde A¹ es C-R¹, A² es C-R²,
A³ es C-R³, A⁴ es C-R⁴ y R², R³ y R⁴ son hidrógeno, R¹ es
flúor y R⁵-N-R⁶ es como se ha definido anteriormente en la
Tabla 1.

Tabla 2.3: Esta tabla describe 5 compuestos
específicos de Fórmula (T-2) donde A¹ es C-R¹, A² es C-R²,
A³ es C-R³, A⁴ es C-R⁴ y R¹, R² y R⁴ son hidrógeno, R³ es
flúor y R⁶ es como se ha definido anteriormente en la Tabla
2.

EJEMPLOS

Los siguientes Ejemplos sirven para ilustrar la
invención.

Los compuestos de la invención se pueden diferenciar
de los compuestos conocidos debido a su mayor eficacia con
tasas de aplicación bajas, que puede ser verificada por un
experto en la técnica utilizando los procedimientos
experimentales que se exponen en los Ejemplos, empleando
tasas de aplicación más bajas, cuando proceda, por ejemplo,
50 ppm, 12.5 ppm, 6 ppm, 3 ppm, 1.5 ppm, 0.8 ppm o 0.2 ppm.

Los compuestos de Fórmula (I) pueden presentar varios
beneficios que incluyen, entre otros, unos niveles
favorables de actividad biológica para proteger a las

plantas contra enfermedades provocadas por hongos o unas propiedades mejores para su uso como principios activos agroquímicos (por ejemplo, una actividad biológica mayor, un espectro de actividad favorable, un perfil de seguridad más amplio (que incluye una tolerancia mejor del cultivo), unas propiedades fisicoquímicas mejores o una mayor biodegradabilidad).

A lo largo de esta descripción, las temperaturas se proporcionan en grados Celsius (°C) y "pf" quiere decir punto de fusión. LC/MS quiere decir cromatografía líquida/espectrometría de masas, y la descripción del equipo y el método (Método A) es la siguiente:

La descripción del equipo de LC/MS y el método A es:

Detector SQ 2 de Waters

Método de ionización: Electronebulización

Polaridad: iones positivos y negativos

Capilaridad (kV) 3.0, Cono (V) 30.00, Extractor (V) 2.00, Temperatura de la fuente (°C) 150, Temperatura de desolvatación (°C) 350, Flujo de gas del cono (L/h) 0, Flujo del gas de desolvatación (L/h) 650

Intervalo de masas: 100-900 Da

Intervalo de longitudes de onda del DAD (nm): 210-500

Método ACQUITY UPLC de Waters con las siguientes condiciones de gradiente de HPLC:

(Disolvente A: Agua/metanol 20:1 + 0.05% de ácido fórmico y Disolvente B: Acetonitrilo + 0.05% de ácido fórmico)

Tiempo (minutos)	A (%)	B (%)	Tasa de flujo (mL/min)
0	100	0	0.85
1.2	0	100	0.85
1.5	0	100	0.85

Tipo de columna: ACQUITY UPLC HSS T3 de Waters;
Longitud de la columna: 30 mm; Diámetro interno de la
columna: 2.1 mm; Tamaño de partícula: 1.8 micras;
Temperatura: 60 °C.

5 Cuando sea necesario, pueden obtenerse los compuestos
finales enantioméricamente puros a partir de los materiales
racémicos según proceda mediante técnicas de separación
físicas habituales tales como cromatografía quiral de fase
inversa o mediante técnicas sintéticas estereoselectivas,
10 p. ej., utilizando materiales de partida quirales.

Ejemplos de formulaciones

<u>Polvos humectables</u>		a)	b)	c)
principio activo [compuesto de		25%	50%	75%
Fórmula (I)]				
15	lignosulfonato de sodio	5%	5%	-
	laurilsulfato de sodio	3%	-	5%
	diisobutilnaftalenosulfonato de	-	6%	10%
	sodio			
	éter fenólico del polietilenglicol	-	2%	-
20	(7-8 mol de óxido de etileno)			
	ácido silícico muy dispersado	5%	10%	10%
	caolín	62%	27%	-

25 El principio activo se mezcla completamente con los
adyuvantes y la mezcla se muele completamente en un molino
adecuado para obtener polvos humectables que se pueden
diluir con agua para obtener suspensiones de la
concentración deseada.

<u>Polvos para el tratamiento de</u>		a)	b)	c)
<u>semillas en seco</u>				
30	principio activo [compuesto de	25%	50%	75%

Fórmula (I)]

	aceite mineral ligero	5%	5%	5%
	ácido silícico muy dispersado	5%	5%	-
	caolín	65%	40%	-
5	talco	-	-	20%

El principio activo se mezcla completamente con los adyuvantes y la mezcla se muele completamente en un molino adecuado, para obtener polvos que se pueden utilizar directamente para el tratamiento de semillas.

Concentrado emulsionable

principio activo [compuesto de Fórmula 10%
(I)]

éter octilfenólico del 3%

polietilenglicol

(4-5 mol de óxido de etileno)

dodecilbencenosulfonato de calcio 3%

éter poliglicólico de aceite de ricino 4%

(35 mol de óxido de etileno)

ciclohexanona 30%

mezcla de xilenos 50%

Se pueden obtener emulsiones con cualquier dilución requerida, que se pueden utilizar para proteger plantas, a partir de este concentrado diluyendo con agua.

<u>Polvos finos</u>	a)	b)	c)
principio activo	5%	6%	4%
[Compuesto de Fórmula (I)]			
talco	95%	-	-
5 caolín	-	94%	-
relleno mineral	-	-	96%

Los polvos finos listos para usar se obtienen mezclando el principio activo con el portador y moliendo la mezcla en un molino adecuado. Tales polvos también se pueden utilizar para revestimientos en seco de las semillas.

Gránulos extrusores

principio activo [compuesto de	15%
Fórmula (I)]	
15 lignosulfonato de sodio	2%
carboximetilcelulosa	1%
caolín	82%

El principio activo se mezcla y muele con los adyuvantes, y la mezcla se humedece con agua. Se extruye la mezcla y después se seca en una corriente de aire.

Gránulos recubiertos

principio activo [compuesto de	8%
Fórmula (I)]	
polietilenglicol (peso	3%
25 molecular 200)	
caolín	89%

El principio activo finamente molido se aplica uniformemente, en una mezcladora, sobre el caolín humedecido con polietilenglicol. De esta forma se obtienen gránulos recubiertos que no generan polvo.

Concentrado en suspensión

	principio activo [compuesto de Fórmula (I)]	40%
	propilenglicol	10%
	éter nonilfenólico del polietilenglicol (15 mol de óxido de etileno)	6%
5	lignosulfonato de sodio	10%
	carboximetilcelulosa	1%
	aceite de silicona (en forma de una emulsión al 75% en agua)	1%
	agua	32%

10 El principio activo finamente molido se mezcla íntimamente con los adyuvantes para obtener un concentrado en suspensión a partir del cual se pueden obtener suspensiones de cualquier dilución deseada diluyendo con agua. Utilizando tales diluciones se pueden tratar y
15 proteger contra la infestación por parte de microorganismos tanto plantas vivas como el material de propagación vegetal mediante pulverización, vertido o inmersión.

Concentrado fluido para el tratamiento de semillas

	principio activo [compuesto de Fórmula (I)]	40%
20	propilenglicol	5%
	copolímero de butanol PO/EO	2%
	triestirenofenol con 10-20 moles de EO	2%
	1,2-bencisotiazolin-3-ona (en forma de una disolución al 20% en agua)	0.5%
25	sal cálcica de pigmento monoazo	5%
	aceite de silicona (en forma de una emulsión al 75% en agua)	0.2%
	agua	45.3%

30 El principio activo finamente molido se mezcla íntimamente con los adyuvantes para obtener un concentrado en suspensión a partir del cual se pueden obtener

suspensiones de cualquier dilución deseada diluyendo con agua. Utilizando tales diluciones se pueden tratar y proteger contra la infestación por parte de microorganismos tanto plantas vivas como el material de propagación vegetal mediante pulverización, vertido o inmersión.

Suspensión de cápsulas de liberación lenta

Se mezclan 28 partes de una combinación del compuesto de Fórmula (I) con 2 partes de un disolvente aromático y 7 partes de una mezcla de diisocianato de tolueno/polimetileno-polifenilisocianato (8:1). Se emulsiona esta mezcla en una mezcla de 1.2 partes de alcohol polivinílico, 0.05 partes de un desespumante y 51.6 partes de agua, hasta que se obtiene el tamaño de partícula deseado. Se añade a esta emulsión una mezcla de 2.8 partes de 1,6-diaminohexano en 5.3 partes de agua. Se agita la mezcla hasta que finaliza la reacción de polimerización.

La suspensión de cápsulas obtenida se estabiliza añadiendo 0.25 partes de un espesante y 3 partes de un agente dispersante. La formulación de la suspensión de cápsulas contiene un 28% de los principios activos. El diámetro medio de las cápsulas es de 8-15 micrómetros.

La formulación resultante se aplica a las semillas como una suspensión acuosa en un equipo adecuado para dicho fin.

Lista de abreviaturas:

AIBN	= azobisisobutironitrilo
CDCl ₃	= cloroformo-d
°C	= grados Celsius
DCM	= diclorometano
D	= doblete
EtOAc	= acetato de etilo

H = hora(s)

HCl = ácido clorhídrico

M = molar

min = minutos

5 MHz = megahercios

pf = punto de fusión

NBS = *N*-bromosuccinimida

Ppm = partes por millón

t_R = tiempo de retención

10 TA = temperatura ambiente

S = singlete

T = triplete

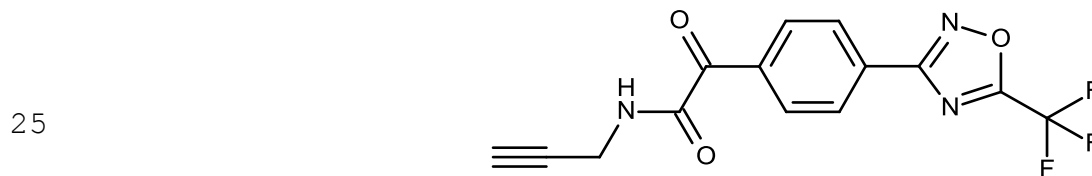
THF = tetrahidrofurano

TFAA = anhídrido del ácido trifluoroacético

15 LC/MS = Cromatografía líquida/espectroscopía de masas (la descripción del equipo y los métodos utilizados para el análisis por LC/MS se han proporcionado anteriormente)

Ejemplos de preparación

20 **Ejemplo 1:** Este ejemplo ilustra la preparación de 2-oxo-*N*-prop-2-ynil-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida (Compuesto 1.41 de la Tabla T1).

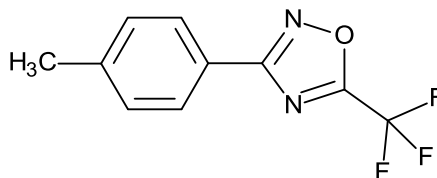


Paso 1: Preparación de *N*'-hidroxi-4-metilbenzamidina



A una suspensión de 4-metilbenzonitrilo (35.0 g, 0.29 mol) en etanol (220 mL) y agua (440 mL) a TA, se añadieron clorhidrato de hidroxilamina (41.1 g, 0.58 mol), carbonato de potasio (65.4 g, 0.47 mol) y 8-hidroxiquinolina (0.22 g, 1.5 mmol). La mezcla de reacción se calentó a 80 °C durante 4 horas, a continuación se enfrió hasta TA y se diluyó con HCl 2 N hasta obtener un pH de 8. Se evaporó el etanol a presión reducida. La mezcla se filtró, se lavó con agua y se secó al vacío para proporcionar 39.1 g de N'-hidroxi-4-metilbenzamidina como una goma de color pálido, que se utilizó a continuación directamente en el siguiente paso de preparación sin purificación adicional. LC/MS tiempo de retención = 0.23 minutos, 151.0 (M+H).

Paso 2: Preparación de 3-(p-tolil)-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol



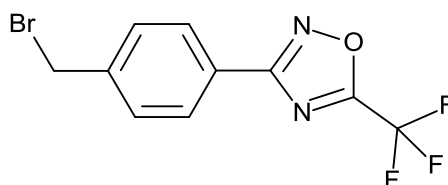
A una solución de N'-hidroxi-4-metilbenzamidina (38.7 g, 0.25 mol) en 2-metiltetrahidrofurano (750 mL), se añadió TFAA a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó a 15 °C durante 2 horas y se diluyó con agua. Las fases orgánicas se separaron, se lavaron sucesivamente con una solución de bicarbonato de sodio, una solución acuosa saturada de cloruro de amonio y agua, a continuación se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se evaporaron a sequedad. El residuo crudo se sometió a cromatografía flash en gel de sílice utilizando un gradiente de eluyente de heptano/EtOAc de 99:1 a 90:10 para proporcionar 54.1 g del compuesto del título como un aceite transparente, el cual solidificó

después de almacenarlo. LC/MS tiempo de retención = 1.15 minutos, masa no detectada.

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: 8.00 (d, 2H), 7.32 (d, 2H), 2.45 (s, 3H).

^{19}F RMN (376 MHz, CDCl_3) δ ppm: -65.41 (s).

Paso 3a: Preparación de 3-[4-(bromometil)fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol

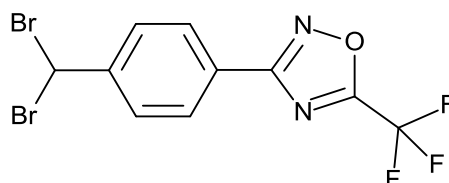


Una mezcla de 3-(p-tolil)-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol (56.0 g, 0.24 mol) y NBS (45.4 g, 0.25 mol) en tetraclorometano (480 mL) en argón se calentó hasta 70 °C. Se añadió AIBN (4.03 g, 24 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a 65 °C durante 18 horas. La mezcla se enfrió hasta TA, se diluyó con diclorometano y agua, y las fases se separaron. La fase orgánica se lavó con una solución de bicarbonato de sodio, se secó con sulfato de sodio, se filtró y se evaporó a sequedad. El residuo crudo se sometió a cromatografía flash en gel de sílice utilizando un gradiente de eluyente de ciclohexano/EtOAc de 100:0 a 95:5 para proporcionar 44.7 g del compuesto del título como un sólido blanco, pf: 58-63 °C.

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: 8.11 (d, 2H), 7.55 (d, 2H), 4.53 (s, 2H).

^{19}F RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: -65.32 (s).

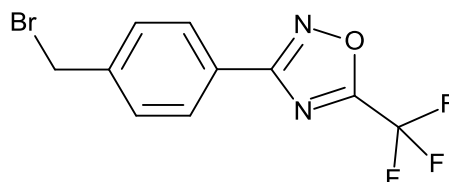
Se aisló un producto secundario, 3-[4-(dibromometil)fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol, como un sólido blanco, pf: 61-66 °C.



5 ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 8.15 (d, 2H), 7.73 (d, 2H), 6.68 (s, 1H).

¹⁹F RMN (376 MHz, CDCl₃) δ ppm: -65.34 (s).

Paso 3b: Preparación de 3-[4-(bromometil)fenil]-5-
(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol

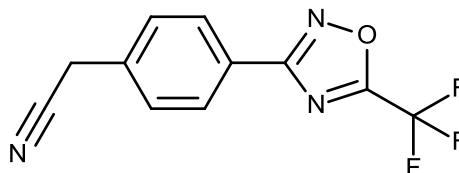


10 A una mezcla de 3-[4-(bromometil)fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol y 3-[4-(dibromometil)fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol (10.2 g), relación 1:9, en acetonitrilo (95 mL), se añadieron agua (1.9 mL), DIPEA (6.20 mL, 35.7 mmol) y fosfito de dietilo (4.7 mL, 35.7 mmol) a 5 °C. La mezcla se agitó a 5-10 °C durante dos horas, se añadieron agua y HCl 1 M y el acetonitrilo se evaporó a presión reducida. La suspensión de color blanco se extrajo tres veces con diclorometano y las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de sodio y se filtraron. El disolvente se eliminó a presión reducida y el residuo crudo resultante se sometió a cromatografía flash en gel de sílice con ciclohexano/EtOAc, de 99:1 a 9:1, para proporcionar 7.10 g de 3-[4-(bromometil)fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol.

30 ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 8.11 (d, 2H), 7.55 (d, 2H), 4.53 (s, 2H).

^{19}F RMN (376 MHz, CDCl_3) δ ppm: -65.32 (s).

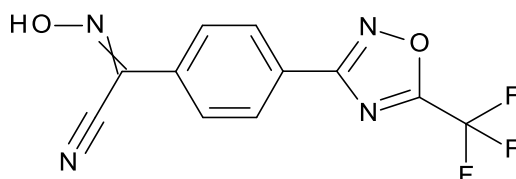
Paso 4: Preparación de 2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetonitrilo



A una solución de 3-[4-(bromometil)fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol (3.0 g, 9.8 mmol) en acetonitrilo (12 mL), se añadió trimetilsililformonitrilo (1.3 g, 13 mmol). La mezcla de reacción se enfrió hasta 0 °C y se introdujo hidrófluoruro de tetrabutilamonio (3.3 g, 13 mmol) durante 30 minutos. Se continuó agitando durante 6 horas a la vez que se calentaba hasta 25 °C. Tras completarse, la mezcla de reacción se diluyó con agua (100 mL), se extrajo con acetato de etilo y la fase orgánica se lavó con agua, solución de salmuera y se secó con sulfato de sodio. Se eliminó el disolvente a presión reducida y el residuo crudo resultante se sometió a cromatografía flash en gel de sílice utilizando un gradiente de eluyente de ciclohexano/EtOAc de 99:1 a 8:2 para proporcionar el producto deseado 2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetonitrilo (1.45 g, 59% de rendimiento), que se obtuvo como un sólido blanco. LC/MS tiempo de retención = 1.01 minutos, 253 (M+H).

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: 8.14 (d, 2H), 7.52 (d, 2H), 3.86 (s, 2H).

Paso 5: Preparación de 2-hidroxiimino-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetonitrilo

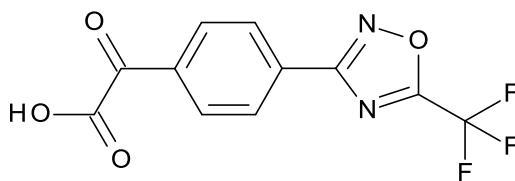


Una solución de 2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetonitrilo (300 mg, 1.18 mmol) y HCl en dioxano (10 mL, 40 mmol) se enfrió en un baño de hielo y a continuación se añadió gota a gota nitrito de *tert*-butilo (0.25g, 2.37 mmol). Se retiró el baño de hielo y se permitió que la reacción se agitara durante toda la noche. A continuación, la mezcla de reacción se vertió sobre salmuera y se extrajo con acetato de etilo. La fracción orgánica se secó con sulfato de sodio, se filtró y se concentró a presión reducida para obtener 2-hidroxiimino-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetonitrilo (307 mg, 92% de rendimiento) como un sólido de color amarillo pálido.

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: 14.14 (s, 1H), 8.20 (d, 2H), 7.95 (d, 2H)

^{19}F RMN (376 MHz, CDCl_3) δ ppm: -64.7 (s).

Paso 6: Preparación del ácido 2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acético



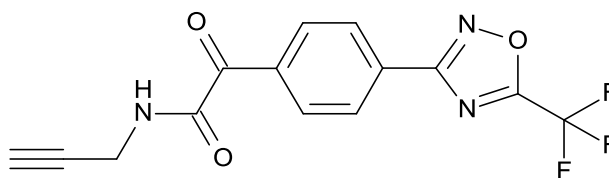
A un recipiente que contenía 2-hidroxiimino-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetonitrilo (1.3 g, 4.6 mmol) suspendido en HCl acuoso 37% (39 mL, 460 mmol) y calentado hasta 90 °C, se añadió ácido acético (7.9 mL, 140 mmol). El recipiente se selló y se continuó

calentando durante 4.5 horas. Se retiró la fuente de calor y el contenido de la reacción se enfrió hasta TA. La mezcla de reacción se filtró y el filtrado se extrajo con acetato de etilo, se lavó con salmuera, se secó con sulfato de sodio, se filtró y se concentró a presión reducida para obtener un sólido de color amarillo pálido (2.0 g). A continuación, este sólido se lavó disgregándolo con ciclohexano para proporcionar el ácido 2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acético, que se utilizó sin purificación adicional en el siguiente paso de síntesis. LC/MS tiempo de retención = 0.74 minutos, 285 (M-H).

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: 8.56(d, 2H), 8.30 (d, 2H).

^{19}F RMN (376 MHz, CDCl_3) δ ppm: -65.26 (s).

Paso 7: Preparación de 2-oxo-N-prop-2-inil-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida



Se diluyó el ácido 2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acético (50 mg, 0.175 mmol) en dimetilformamida (0.7 mL), a continuación se añadió hexafluorofosfato de 3-óxido de 1-[bis(dimetilamino)metilen]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]piridinio (HATU) (0.262 mmol, 0.100 g) y diisopropiletilamina (0.8 mL, 0.44 mmol), y la mezcla se agitó durante 5 min. Se añadió propargilamina (0.02 mL, 0.26 mmol), la reacción se agitó durante toda la noche a temperatura ambiente, se desactivó con agua y se extrajo

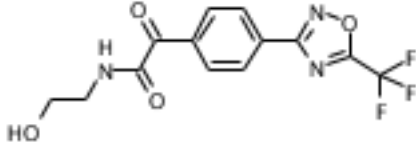
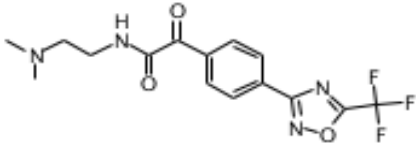
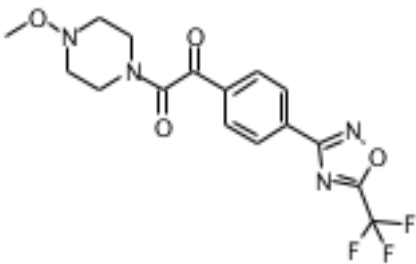
con acetato de etilo. Se separaron las fases y la fracción orgánica combinada se lavó con salmuera, se secó con MgSO_4 , se filtró y se concentró a presión reducida para obtener un sólido de color amarillo pálido. El producto crudo se purificó mediante cromatografía flash en gel de sílice con un gradiente de eluyente de acetato de etilo:ciclohexano para obtener 2-oxo-*N*-prop-2-inil-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida (0.01 g, 18% de rendimiento) como un polvo de color blanco. pf: 79-84 °C. LC/MS tiempo de retención = 1.00 minutos, 322 (M-1).

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: 8.52 (d, 2H), 8.25 (d, 2H), 7.30 (s a, 1H), 4.19 (d, 2H), 2.32 (s, 1H).

^{19}F RMN (376 MHz, CDCl_3) δ ppm: -65.26 (s).

Cuando sea necesario, pueden obtenerse los compuestos finales enantioméricamente puros a partir de los materiales racémicos según proceda mediante técnicas de separación físicas habituales tales como cromatografía quirál de fase inversa o mediante técnicas sintéticas estereoselectivas, p. ej., utilizando materiales de partida quirales.

Tabla T1: Datos de puntos de fusión (pf) y/o datos de LC/MS (incl. tiempos de retención (t_R)) para compuestos de acuerdo con la Fórmula (I):

Entrada	Nombre	Estructura	t_R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.1	N-(2-hidroxietil)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					147 - 148
1.2	N-[2-(dimetilamino)etil]-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		0.79	357	A	
1.3	1-(4-metoxipiperazin-1-il)-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]etan-1,2-diona		1.02	385	A	

30

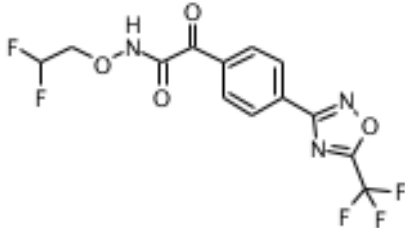
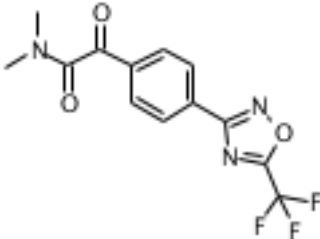
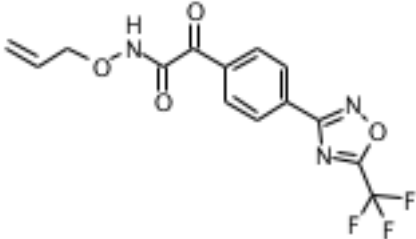
25

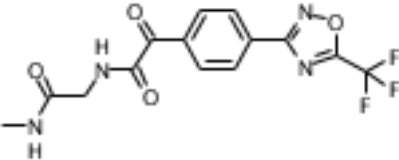
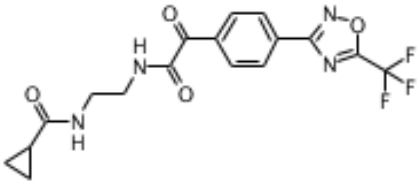
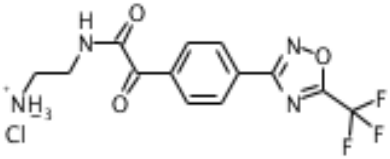
20

15

10

5

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.4	<i>N</i> -(2,2-difluoroetoxi)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		0.9	366	A	
1.5	<i>N,N</i> -dimetil-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		0.97	314	A	
1.6	<i>N</i> -aliloxi-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		0.98	342	A	

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.7	N-[2-(metilamino)-2-oxoetil]-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					167 - 168
1.8	N-[2-[[2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetil]amino]etil]ciclopropanocarboxamida					209 - 210
1.9	cloruro de 2-[[2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetil]amino]etilammonio					213 - 214

30

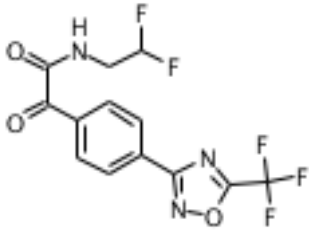
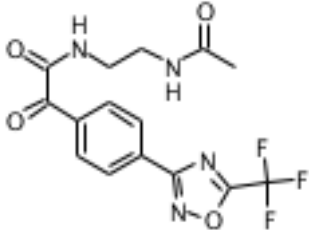
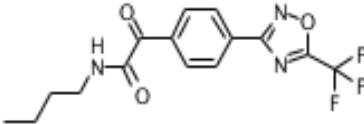
25

20

15

10

5

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.10	N-(2,2-difluoroetil)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		1.04	348	A	
1.11	N-(2-acetamidoetil)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		0.87	371	A	
1.12	N-butil-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					65.1 - 68.2

30

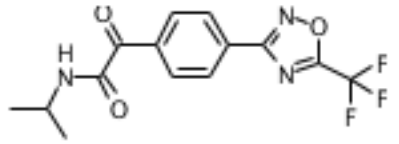
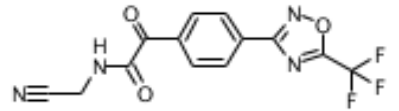
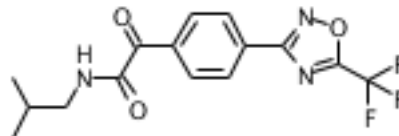
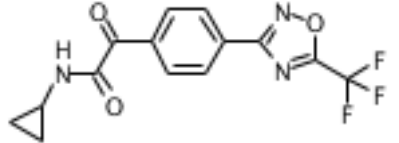
25

20

15

10

5

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.13	N-isopropil-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					96 - 97.7
1.14	N-(cianometil)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					143. 6 - 147. 6
1.15	N-isobutil-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					83 - 85.3
1.16	N-ciclopropil-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					113. 1 - 116

30

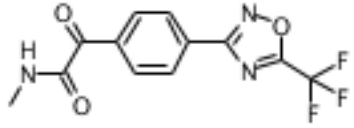
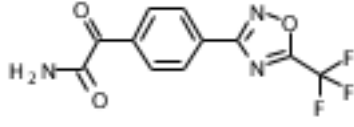
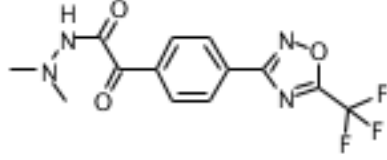
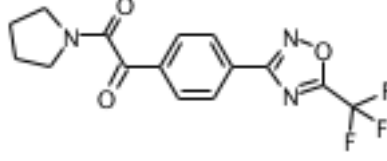
25

20

15

10

5

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.17	N-metil-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					128. 1 - 130. 8
1.18	2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					146. 7 - 149. 7
1.19	N',N'-dimetil-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetohidrazida					134 - 138
1.20	1-pirrolidin-1-il-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]etano-1,2-diona					104 - 110

30

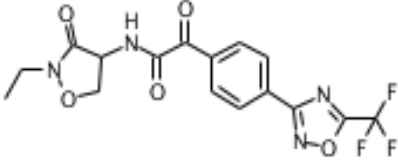
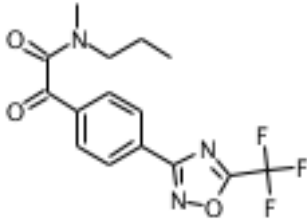
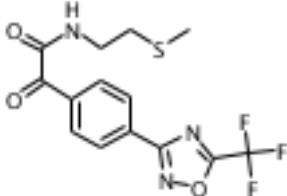
25

20

15

10

5

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.21	N-(2-etil-3-oxoisoxazolidin-4-il)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					162 - 165
1.22	N-metil-2-oxo-N-propil-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		1.12	342	A	
1.23	N-(2-metilsulfaniletíl)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		1.09	360	A	

30

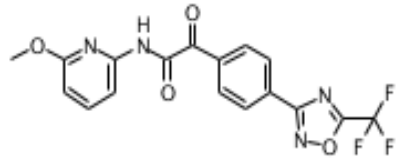
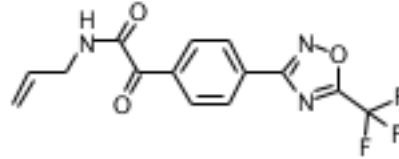
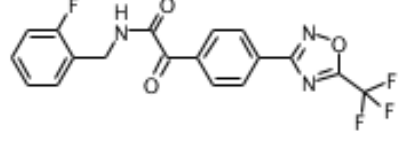
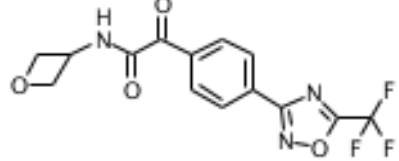
25

20

15

10

5

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.24	<i>N</i> -(6-metoxi-2-piridil)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					118 - 120
1.25	<i>N</i> -alil-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					71 - 74
1.26	<i>N</i> -[(2-fluorofenil)metil]-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					84 - 86
1.27	<i>N</i> -(oxetan-3-il)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					131 - 136

30

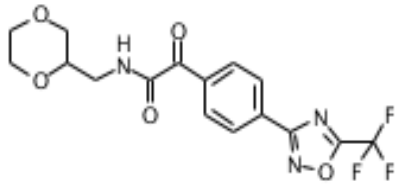
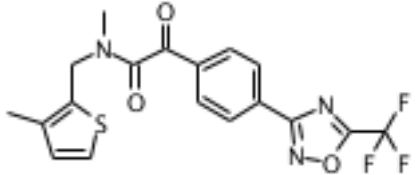
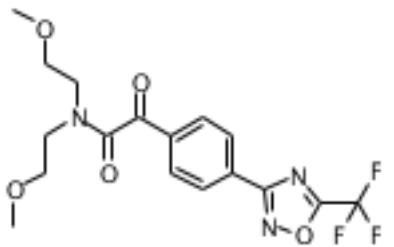
25

20

15

10

5

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.28	<i>N</i> -(1,4-dioxan-2-ilmetil)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		1.03	384 (M-H)	A	
1.29	<i>N</i> -metil- <i>N</i> [(3-metil-2-tienil)metil]-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		1.22	410	A	
1.30	<i>N,N</i> -bis(2-metoxietil)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		1.12	402	A	

30

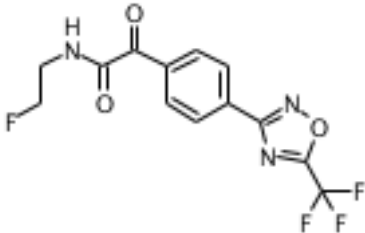
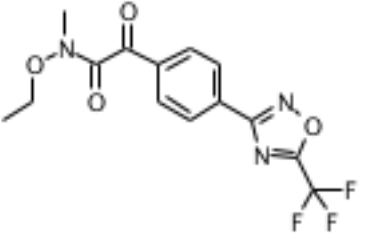
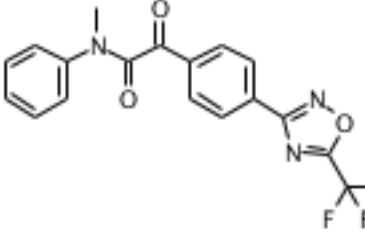
25

20

15

10

5

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.31	<i>N</i> -(2-fluoroetil)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					94 - 100
1.32	<i>N</i> -etoxi- <i>N</i> -metil-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		1.1	344	A	
1.33	<i>N</i> -metil-2-oxo- <i>N</i> -fenil-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		1.13	376	A	

30

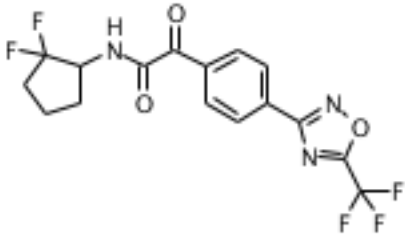
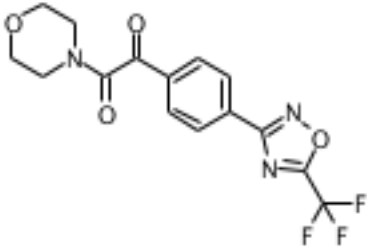
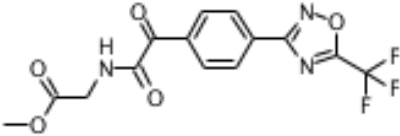
25

20

15

10

5

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.34	N-(2,2-difluorociclopentil)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					64 - 70
1.35	1-morfolino-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]etano-1,2-diona					140 - 144
1.36	2-[[2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetil]amino]acetato de metilo					89 - 90

30

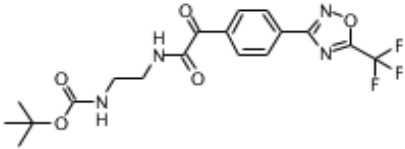
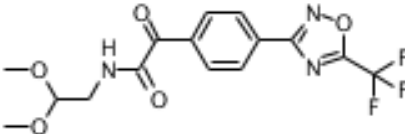
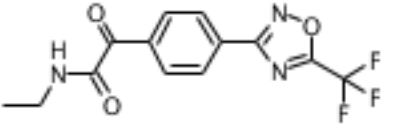
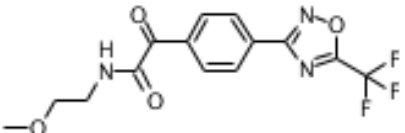
25

20

15

10

5

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.37	N-[2-[[2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetil]amino]etil]carbamato de <i>tert</i> -butilo					155 - 156
1.38	N-(2,2-dimetoxietil)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					88 - 89
1.39	N-etil-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					105 - 110
1.40	N-(2-metoxietil)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		0.99	344	A	

30

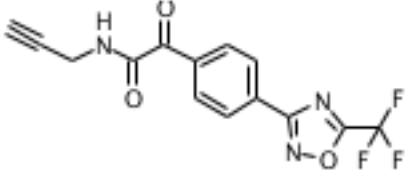
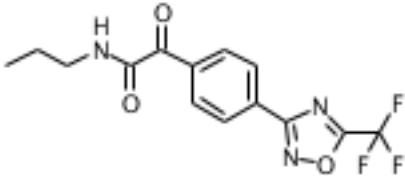
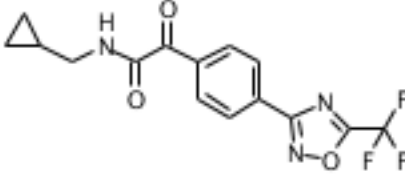
25

20

15

10

5

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
	il]fenil]acetamida					
1.41	2-oxo- <i>N</i> -prop-2-ynil-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					79 - 84
1.42	2-oxo- <i>N</i> -propil-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					78 - 83
1.43	<i>N</i> -(ciclopropilmetil)-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida					86 - 95

30

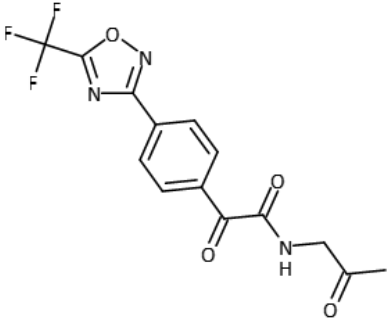
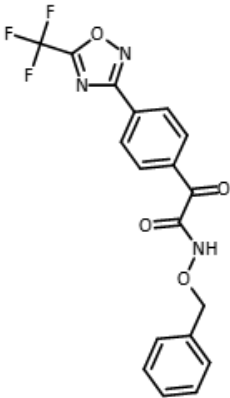
25

20

15

10

5

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.44	N-acetonil-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		0.97	340	A	
1.45	N-benciloxi-2-oxo-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		1.11	390	A	

5

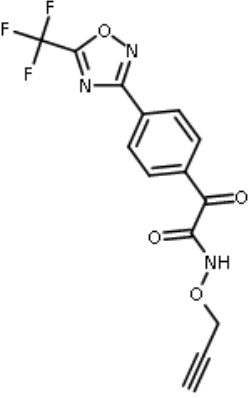
10

15

20

25

30

Entrada	Nombre	Estructura	t _R (min)	[M+H] (experimental)	Método	pf (°C)
1.46	2-oxo-N-prop-2-inoxi-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida		0.97	340	A	

5

10

15

20

25

30

EJEMPLOS BIOLÓGICOS

Ejemplos generales de pruebas en disco foliar en placas de pocillos:

Se cortan discos foliares o segmentos foliares de varias especies vegetales a partir de plantas cultivadas en un invernadero. Los discos o segmentos foliares cortados se colocan en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) sobre agua-agar. Se pulveriza una solución de prueba sobre los discos foliares antes (prevención) o después (curación) de la inoculación. Los compuestos que se van a probar se preparan como soluciones en DMSO (máx. de 10 mg/mL), que se diluyen hasta la concentración apropiada con Tween20 al 0.025% justo antes de la pulverización. Los discos o segmentos foliares inoculados se incuban en condiciones definidas (temperatura, humedad relativa, luz, etc.) de acuerdo con el sistema de prueba respectivo. Se realiza una única evaluación del nivel de la enfermedad de 3 a 14 días después de la inoculación, dependiendo del patosistema. A continuación, se calcula el porcentaje de control de la enfermedad respecto a los discos o segmentos foliares de control no tratados.

Ejemplos generales de pruebas en cultivo líquido en placas de pocillos:

En un caldo de nutrientes se mezclan directamente fragmentos de micelios o suspensiones de conidios de un hongo, recién preparados a partir de cultivos líquidos del hongo o preparados a partir de un depósito criogénico. Las soluciones del compuesto de prueba en DMSO (máx. de 10 mg/ml) se diluyen con Tween20 al 0.025% en un factor de 50 y se pipetea 10 µl de esta solución en una placa de microvaloración (formato de 96 pocillos). A continuación,

se añade el caldo de nutrientes que contiene las esporas/fragmentos de micelios fúngicos para obtener la concentración final del compuesto de prueba. Las placas de prueba se incuban en la oscuridad a 24 °C y un 96% de humedad relativa. La inhibición del crecimiento fúngico se determina fotométricamente después de 2 a 7 días, dependiendo del patosistema, y se calcula el porcentaje de actividad antifúngica respecto a la muestra de control no tratada.

Ejemplo 1: Actividad fungicida contra *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* / trigo / prevención en disco foliar (roya parda)

Se colocaron segmentos foliares de trigo cv. Kanzler sobre agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizó el compuesto de prueba formulado diluido en agua sobre estos. Los discos foliares se inocularon con una suspensión de esporas del hongo 1 día después de la aplicación. Los segmentos foliares inoculados se incubaron a 19 °C y un 75% de humedad relativa (HR) con un régimen de luz de 12 h de luz / 12 h de oscuridad en una cámara climática, y se evaluó la actividad de un compuesto como el porcentaje de control de la enfermedad en comparación con los segmentos foliares no tratados cuando apareció un nivel apropiado de daños debidos a la enfermedad en segmentos foliares de control no tratados (de 7 a 9 días después de la aplicación).

Los siguientes compuestos proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad en esta prueba con 200 ppm en la formulación aplicada cuando se comparan con los discos foliares de control no tratados en las mismas condiciones,

los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Compuestos (de la Tabla T1) 1.1, 1.3, 1.4, 1.5, 1.6, 1.7, 1.8, 1.9, 1.10, 1.11, 1.12, 1.13, 1.14, 1.15, 1.16, 1.17, 1.18, 1.19, 1.20, 1.21, 1.22, 1.23, 1.24, 1.25, 1.26, 1.27, 1.28, 1.31, 1.32, 1.34, 1.35, 1.37, 1.38, 1.39, 1.40, 1.41, 1.42 y 1.43.

Ejemplo 2: Actividad fungicida contra *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* / trigo / curación en discos foliares (roya parda)

Se colocan segmentos foliares de trigo cv. Kanzler sobre agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos). A continuación, los segmentos foliares se inoculan con una suspensión de esporas del hongo. Las placas se almacenaron en la oscuridad a 19 °C y un 75% de humedad relativa. El compuesto de prueba formulado diluido en agua se aplicó 1 día después de la inoculación. Los segmentos foliares se incubaron a 19 °C y un 75% de humedad relativa con un régimen de luz de 12 h de luz / 12 h de oscuridad en una cámara climática, y se evaluó la actividad de un compuesto como el porcentaje de control de la enfermedad en comparación con los segmentos foliares no tratados cuando apareció un nivel apropiado de daños debidos a la enfermedad en segmentos foliares de control no tratados (de 6 a 8 días después de la aplicación).

Los siguientes compuestos proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad en esta prueba con 200 ppm en la formulación aplicada cuando se comparan con los discos foliares de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Compuestos (de la Tabla T1) 1.1, 1.5, 1.7, 1.9, 1.10, 1.11, 1.12, 1.13, 1.14, 1.15, 1.16, 1.17, 1.18, 1.19, 1.20, 1.21, 1.22, 1.23, 1.25, 1.26, 1.27, 1.28, 1.30, 1.31, 1.32, 1.34, 1.35, 1.36, 1.38, 1.39, 1.40, 1.41, 1.42 y 1.43.

5 Ejemplo 3: Actividad fungicida contra *Phakopsora pachyrhizi* / soja / prevención en discos foliares (roya asiática de la soja)

10 Se colocan discos foliares de soja en agua-agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulveriza el compuesto de prueba formulado diluido en agua sobre estos. Un día después de la aplicación los discos foliares se inoculan pulverizando una suspensión de esporas sobre su superficie foliar más baja. Tras un periodo de incubación en una cámara climática de 24-36 horas en la oscuridad a 20 °C y un 75% de HR, los discos foliares se

15 mantienen a 20 °C con 12 h de luz/día y un 75% de HR. La actividad de un compuesto se evalúa como el porcentaje de control de la enfermedad en comparación con los discos foliares no tratados cuando aparece un nivel apropiado de daños debidos a la enfermedad en los discos foliares de control no tratados (de 12 a 14 días después de la aplicación).

20 Los siguientes compuestos proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad en esta prueba con 200 ppm en la formulación aplicada cuando se comparan con los discos foliares de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

25 Los siguientes compuestos proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad en esta prueba con 200 ppm en la formulación aplicada cuando se comparan con los discos foliares de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

30 Compuestos (de la Tabla T1) 1.21, 1.24, 1.25, 1.31, 1.34, 1.37, 1.39, 1.41, 1.42 y 1.43.

Ejemplo 4: Actividad fungicida contra *Glomerella lagenarium* (*Colletotrichum lagenarium*) en cultivo líquido / pepino / prevención (antracnosis)

Se mezclan conidios del hongo procedentes de un depósito criogénico directamente en un caldo de nutrientes (PDB - caldo de dextrosa de papa). Después de colocar una solución (DMSO) del compuesto de prueba en una placa de microvaloración (formato de 96 pocillos), se añade el caldo de nutrientes que contiene las esporas fúngicas. Las placas de prueba se incuban a 24 °C y la inhibición del crecimiento se mide fotométricamente de 3 a 4 días después de la aplicación.

Los siguientes compuestos proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad en esta prueba con 20 ppm en la formulación aplicada cuando se comparan con las muestras de control no tratadas en las mismas condiciones, las cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Compuestos (de la Tabla T1) 1.1, 1.2, 1.3, 1.4, 1.5, 1.7, 1.8, 1.9, 1.10, 1.11, 1.12, 1.13, 1.14, 1.15, 1.16, 1.17, 1.18, 1.19, 1.20, 1.21, 1.22, 1.23, 1.24, 1.25, 1.26, 1.27, 1.28, 1.29, 1.30, 1.31, 1.32, 1.33, 1.34, 1.35, 1.36, 1.38, 1.39, 1.40, 1.41, 1.42 y 1.43.

Se hace constar que con relación a esta fecha, el mejor método conocido por la solicitante para llevar a la práctica la citada invención, es el que resulta claro de la presente descripción de la invención.