

Derivados de oxadiazolina

CAMPO TÉCNICO

5 La presente invención se refiere a derivados de oxadiazolina que pueden usarse como fungicidas.

ANTECEDENTES

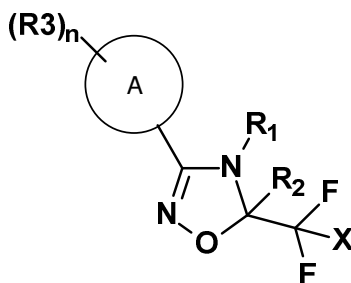
Es sabido que los derivados de oxadiazol son útiles como agentes de protección de cultivos para combatir o prevenir infestaciones de microorganismos. Por ejemplo, WO2018/029242 describen
10 derivados de oxadiazol que pueden usarse como fungicidas.

Hasta ahora se han desarrollado numerosos agentes fungicidas. Sin embargo, sigue existiendo una necesidad de desarrollar nuevos compuestos fungicidas como tales, como para proporcionar compuestos eficaces contra un amplio espectro de hongos, con menor toxicidad, mayor selectividad, que se usan a menores tasas de dosificación a la vez que igual permiten un control eficaz de plagas.
15 También se puede desear tener nuevos compuestos para prevenir la aparición de resistencias a los fungicidas.

La presente invención provee nuevos compuestos fungicidas que tienen ventajas respecto de las composiciones y compuestos conocidos en al menos algunos de estos aspectos.

COMPENDIO

La presente invención se refiere a compuestos de la fórmula (I) o sales, N-óxidos, solvatos de estos:



(I)

25 donde A, R₁, R₂, R₃, X y n son como se describen en la presente y usos de estos para controlar microorganismos fitopatógenos indeseados o en métodos para controlar microorganismos
30 fitopatógenos indeseados.

La presente invención se refiere a una composición que comprende un compuesto de fórmula (I) como se describe en la presente y uno o más portadores aceptables para la agricultura.

La presente invención también se refiere a procesos para la preparación de compuestos de fórmula (I).

5 DESCRIPCIÓN DETALLADA

Definiciones

El término "halógeno", como se usa en la presente, se refiere a un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo.

10

El término "oxo", como se usa en la presente, se refiere a un átomo de oxígeno que está unido a un átomo de carbono o átomo de azufre mediante un enlace doble.

El término "alquilo C₁-C₆", como se usa en la presente, se refiere a cadena de hidrocarburos recta o ramificada, saturada, con 1, 2, 3, 4, 5 o 6 átomos de carbono. Los ejemplos de grupos alquilo C₁-C₆ incluyen, de modo no taxativo, metilo, etilo, propilo (n-propilo), 1-metiletilo (iso-propilo), butilo (n-butilo), 1-metilpropilo (sec-butilo), 2-metilpropilo (iso-butilo), 1,1-dimetiletilo (terc-butilo), pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, hexilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo. En particular, dicha cadena de hidrocarburo tiene 1, 2, 3 o 4 átomos de carbono ("alquilo C₁-C₄"), por ejemplo, metilo, etilo, propilo, iso-propilo, butilo, sec-butilo, iso-butilo o terc-butilo.

El término "alqueno C₂-C₆", como se usa en la presente, se refiere a cadena de hidrocarburos recta o ramificada, insaturada, con 2, 3, 4, 5 o 6 átomos de carbono y que comprende al menos un doble enlace. Ejemplos de alqueno C₂-C₆ incluyen, de modo no taxativo, un grupo etenilo (o "vinilo"), prop-2-en-1-ilo (o "alilo"), prop-1-en-1-ilo, but-3-enilo, but-2-enilo, but-1-enilo, pent-4-enilo, pent-3-enilo, pent-2-enilo, pent-1-enilo, hex-5-enilo, hex-4-enilo, hex-3-enilo, hex-2-enilo, hex-1-enilo, prop-1-en-2-ilo (o "isopropenilo"), 2-metilprop-2-enilo, 1-metilprop-2-enilo, 2-metilprop-1-enilo, 1-metilprop-1-enilo, 3-metilbut-3-enilo, 2-metilbut-3-enilo, 1-metilbut-3-enilo, 3-metilbut-2-enilo, 2-metilbut-2-enilo, 1-metilbut-2-enilo, 3-metilbut-1-enilo, 2-metilbut-1-enilo, 1-metilbut-1-enilo, 1,1-dimetilprop-2-enilo, 1-etilprop-1-enilo, 1-propilvinilo, 1-isopropilvinilo, 4-metilpent-4-enilo, 3-metilpent-4-enilo, 2-metilpent-4-enilo, 1-metilpent-4-enilo, 4-metilpent-3-enilo, 3-metilpent-3-enilo, 2-metilpent-3-enilo, 1-metilpent-3-enilo, 4-metilpent-2-enilo, 3-metilpent-2-enilo, 2-metilpent-2-enilo, 1-metilpent-2-enilo, 4-metilpent-1-enilo, 3-metilpent-1-enilo, 2-metilpent-1-enilo, 1-metilpent-1-enilo, 3-etilbut-3-enilo, 2-etilbut-3-enilo, 1-etilbut-3-enilo, 3-etilbut-2-enilo, 2-etilbut-2-enilo, 1-etilbut-2-enilo, 3-etilbut-1-enilo, 2-etilbut-1-enilo, 1-etilbut-1-enilo, 2-propilprop-2-enilo, 1-propilprop-2-enilo, 2-isopropilprop-2-enilo, 1-isopropilprop-2-enilo, 2-propilprop-1-enilo, 1-propilprop-1-enilo, 2-isopropilprop-1-enilo, 1-isopropilprop-1-enilo, 3,3-dimetilprop-1-enilo, 1-(1,1-dimetiletil)etenilo, buta-1,3-dienilo, penta-1,4-dienilo, hexa-1,5-dienilo o metilhexadienilo.

El término “alquinilo C₂-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a cadena de hidrocarburos recta o ramificada con 2, 3, 4, 5 o 6 átomos de carbono y que comprende al menos un triple enlace. Ejemplos de alquinilo C₂-C₆ incluyen, de modo no taxativo, un grupo etinilo, prop-1-inilo, prop-2-inilo (o “propargilo”), but-1-inilo, but-2-inilo, but-3-inilo, pent-1-inilo, pent-2-inilo, pent-3-inilo, pent-4-inilo, hex-1-inilo, hex-2-inilo, hex-3-inilo, hex-4-inilo, hex-5-inilo, 1-metilprop-2-inilo, 2-metilbut-3-inilo, 1-metilbut-3-inilo, 1-metilbut-2-inilo, 3-metilbut-1-inilo, 1-etilprop-2-inilo, 3-metilpent-4-inilo, 2-metilpent-4-inilo, 1-metil- pent-4-inilo, 2-metilpent-3-inilo, 1-metilpent-3-inilo, 4-metilpent-2-inilo, 1-metil- pent-2-inilo, 4-metilpent-1-inilo, 3-metilpent-1-inilo, 2-etilbut-3-inilo, 1-etilbut-3-inilo, 1-etilbut-2-inilo, 1-propilprop-2-inilo, 1-isopropilprop-2-inilo, 2,2-dimetilbut-3-inilo, 1,1-dimetilbut-3-inilo, 1,1-dimetilbut-2-inilo o 3,3-dimetilbut-1-inilo.

El término “haloalquilo C₁-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo alquilo C₁-C₆ como se define anteriormente donde uno o más átomos de hidrógeno se reemplazan por uno o más átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos de haloalquilo C₁-C₆ incluyen, de modo no taxativo, clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo.

El término “haloalquenilo C₂-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo alquenilo C₂-C₆ como se define anteriormente donde uno o más átomos de hidrógeno se reemplazan por uno o más átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes.

El término “haloalquinilo C₂-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo alquinilo C₂-C₆ como se define anteriormente donde uno o más átomos de hidrógeno se reemplazan por uno o más átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes.

El término “cianoalquilo C₁-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo alquilo C₁-C₆ como se define anteriormente donde uno o más átomos de hidrógeno se reemplazan por uno o más grupos ciano.

El término “cianoalquenilo C₂-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo alquenilo C₂-C₆ como se define anteriormente donde uno o más átomos de hidrógeno se reemplazan por uno o más grupos ciano.

El término “cianoalquinilo C₂-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo alquinilo C₂-C₆ como se define anteriormente donde uno o más átomos de hidrógeno se reemplazan por uno o más grupos ciano.

El término “alcoxi C₁-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo de fórmula (alquilo-C₁-C₆)-O-, donde el término “alquilo C₁-C₆” es como se define en la presente. Ejemplos de alcoxi C₁-C₆ incluyen, de modo no taxativo, metoxi, etoxi, n-propoxi, 1-metiletoxi, n-butoxi, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi, 1,1-dimetiletoxi, n-pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 2,2-dimetilpropoxi,

1-etilpropoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, n-hexiloxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi y 1-etil-2-metilpropoxi.

- 5 El término “haloalcoxi-C₁-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo alcoxi-C₁-C₆ como se define anteriormente donde uno o más átomos de hidrógeno se reemplazan por uno o más átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos de haloalcoxi-C₁-C₆ incluyen, de modo no taxativo, clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 10 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi y 1,1,1-trifluoroprop-2-oxi..

- El término “hidroxialquilo C₁-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo alquilo-C₁-C₆ como se define anteriormente donde al menos un átomo de hidrógeno se reemplaza por un grupo hidroxilo. 15 Ejemplos de hidroxialquilo C₁-C₆ incluyen, de modo no taxativo, hidroximetilo, 1-hidroxietilo, 2-hidroxietilo, 1,2-dihidroxietilo, 3-hidroxipropilo, 2-hidroxipropilo, 1-hidroxipropilo, 1-hidroxipropan-2-ilo, 2-hidroxipropan-2-ilo, 2, 3-dihidroxipropilo y 1,3-dihidroxipropan-2-ilo.

- El término “hidroxialquenilo C₂-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo alquenilo-C₂-C₆ como se define anteriormente donde al menos un átomo de hidrógeno se reemplaza por un grupo 20 hidroxilo.

- El término “hidroxialquinilo C₂-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo alquinilo-C₂-C₆ como se define anteriormente donde al menos un átomo de hidrógeno se reemplaza por un grupo hidroxilo. 25

- El término “alquilsulfanilo C₁-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo de fórmula (alquilo-C₁-C₆)-S-, donde el término “alquilo C₁-C₆” es como se define en la presente. Ejemplos de 30 alquilsulfanilo C₁-C₆ incluyen, de modo no taxativo, un grupo metilsulfanilo, etilsulfanilo, propilsulfanilo, isopropilsulfanilo, butilsulfanilo, *sec*-butilsulfanilo, isobutilsulfanilo, *terc*-butilsulfanilo, pentilsulfanilo, isopentilsulfanilo, hexilsulfanilo.

- El término “haloalquilsulfanilo-C₁-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un alquilsulfanilo-C₁-C₆ como se define anteriormente donde uno o más átomos de hidrógeno se reemplazan por uno o más átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos de haloalquilsulfanilo-C₁-C₆ 35 incluyen, de modo no taxativo, haloalquilsulfanilo-C₁-C₃ como clorometilsulfanilo, bromometilsulfanilo, diclorometilsulfanilo, triclorometilsulfanilo, fluorometilsulfanilo, difluorometilsulfanilo, trifluorometilsulfanilo, clorofluorometilsulfanilo, diclorofluorometilsulfanilo, clorodifluorometilsulfanilo, 1-cloroetilsulfanilo, 1-bromoetilsulfanilo, 1-fluoroetilsulfanilo, 2-fluoroetilsulfanilo, 2,2-difluoroetilsulfanilo, 2,2,2-trifluoroetilsulfanilo, 2-cloro-2-fluoroetilsulfanilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilsulfanilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilsulfanilo, 2,2,2-tricloroetilsulfanilo, pentafluoroetilsulfanilo y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilsulfanilo. 40

El término “alquilsulfonilo C₁-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo de fórmula (alquilo-C₁-C₆)-SO₂-, donde el término “alquilo C₁-C₆” es como se define en la presente. Ejemplos de alquilsulfonilo-C₁-C₆ incluyen, de modo no taxativo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, 1-metiletilsulfonilo, butilsulfonilo, 1-metilpropilsulfonilo, 2-metilpropilsulfonilo, 1,1-dimetiletilsulfonilo, pentilsulfonilo, 1-metilbutilsulfonilo, 2-metilbutilsulfonilo, 3-metilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-etilpropilsulfonilo, 1,1-dimetilpropilsulfonilo, 1,2-dimetilpropilsulfonilo, hexilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentilsulfonilo, 3-metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilsulfonilo, 1,2-dimetilbutilsulfonilo, 1,3-dimetilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilbutilsulfonilo, 2,3-dimetilbutilsulfonilo, 3,3-dimetilbutilsulfonilo, 1-etilbutilsulfonilo, 2-etilbutilsulfonilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonilo, 1-etil-1-metilpropilsulfonilo y 1-etil-2-metilpropilsulfonilo.

El término “alquilcarbonilo-C₁-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo de fórmula (alquilo-C₁-C₆)-C(=O)-, donde el término “alquilo C₁-C₆” es como se define en la presente.

El término “alcoxicarbonilo-C₁-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un grupo de fórmula (alcoxi-C₁-C₆)-C(=O)-, donde el término “alcoxi-C₁-C₆” es como se define en la presente.

El término “alquilamino-C₁-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un radical amino donde uno de los átomos de hidrógeno se reemplaza con un alquilo-C₁-C₆ que es como se define en la presente. Ejemplos de alquilamino-C₁-C₆ incluyen, de modo no taxativo, *N*-metilamino, *N*-etilamino, *N*-isopropilamino y *N*-propilamino.

El término “dialquilamino-C₁-C₆”, como se usa en la presente, se refiere a un radical amino que tiene dos grupos alquilo-C₁-C₆ que se seleccionan independientemente es como se define en la presente. Ejemplos de dialquilamino-C₁-C₆ incluyen, de modo no taxativo, *N,N*-dimetilamino, *N,N*-dietilamino, *N,N*-diisopropilamino, *N*-etil-*N*-metilamino, *N*-metil-*N*-n-propilamino, *N*-isopropil-*N*-n-propilamino y *N*-terc-butil-*N*-metilamino.

El término “carbociclo-C₃-C₁₂ no aromático” o “carbociclilo”, como se usa en la presente, se refieren a un sistema de anillo hidrocarburo saturado o parcialmente insaturado, no aromático, en el que todos los miembros del anillo, que varían de 3 a 12, son átomos de carbono. El sistema de anillo puede ser monocíclico o policíclico (fusionado, espiro o puentado). Carbociclos-C₃-C₁₂ no aromáticos incluyen cicloalquilo C₃-C₁₂; (mono o bicíclico), cicloalquenilo-C₃-C₁₂ (mono o bicíclico) y sistema bicíclico que comprende un arilo (por ejemplo, fenilo) fusionado a un cicloalquilo C₃-C₈ monocíclico (por ejemplo, tetradhironafteno, indanilo). El carbociclo-C₃-C₁₂ no aromático puede estar unido al resto molecular original mediante cualquier átomo de carbono.

El término “cicloalquilo-C₃-C₁₂”, como se usa en la presente, se refiere a un anillo de hidrocarburos monovalente, mono o bicíclico, saturado, que contiene 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono. Ejemplos de cicloalquilos-C₃-C₈ monocíclicos incluyen, de modo no taxativo, ciclopropilo,

ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo o ciclooctilo. Ejemplos de cicloalquilos-C₆-C₁₂ bicíclicos incluyen, de modo no taxativo, biciclo[3.1.1]heptano, biciclo[2.2.1]heptano, biciclo[2.2.2]octano, biciclo[3.2.2]nonano, biciclo[3.3.1]nonano, biciclo[4.2.0]octilo, octahidropentalenilo y biciclo[4.2.1]nonano.

5

El término “cicloalquenilo-C₃-C₁₂”, como se usa en la presente, se refiere a un anillo de hidrocarburos monovalente, mono o bicíclico, parcialmente insaturado que contiene 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11 o 12 átomos de carbono. Ejemplos de un grupo cicloalquenilo-C₃-C₈ monocíclico incluyen, de modo no taxativo, ciclobutenilo, ciclopentenilo, ciclohexenilo, cicloheptenilo y ciclooctenilo. Ejemplos de grupo

10 cicloalquenilo-C₆-C₁₂ bicíclico incluyen, de modo no taxativo, biciclo[2.2.1]hept-2-enilo o biciclo[2.2.2]oct-2-enilo.

El término “carbociclo-C₆-C₁₄ aromático” o “arilo”, como se usa en la presente, se refieren a un sistema de anillo hidrocarburo aromático en el que todos los miembros del anillo, que varían de 6 a 14, preferentemente de 6 a 10, son átomos de carbono. El sistema de anillo puede ser monocíclico o policíclico fusionado (p. ej., bicíclico, tricíclico). Ejemplos de arilo incluyen, de modo no taxativo, fenilo, azuleno, naftilo y fluorenilo. El arilo puede estar unido al resto molecular original mediante cualquier átomo de carbono. Se entiende además que cuando tal grupo arilo está sustituido con uno o más sustituyentes, tal(es) sustituyente(s) pueden estar en cualquier posición en tal(es) anillo(s) arilo.

15

20 Particularmente, en el caso de que el arilo sea un grupo fenilo, tal(es) sustituyente(s) pueden ocupar una o ambas orto posiciones, una o ambas meta posiciones, o la para posición, o cualquier combinación de estas posiciones.

El término “heterociclo no aromático de 3 a 14 miembros” o “heterocíclico”, como se usa en la presente, se refiere a un sistema de anillo no aromático, saturado o insaturado, que comprende 1 a 4 heteroátomos que se seleccionan independientemente del grupo que consiste en oxígeno, nitrógeno y azufre. Si el sistema de anillo contiene más de un átomo de oxígeno, no son directamente adyacentes. Heterociclos no aromáticos incluyen heterociclos no aromáticos monocíclicos de 3 a 7 miembros y heterociclos no aromáticos policíclicos de 6 a 14 miembros (por ejemplo, bicíclicos o tricíclicos). El heterociclo no aromático de 3 o 14 miembros se conecta al resto molecular principal a través de cualquier átomo de carbono o cualquier átomo de nitrógeno dentro del heterociclo.

25

30

El término “heterociclo no aromático monocíclico de 3 a 7 miembros”, como se usa en la presente, se refiere a un sistema de anillo monocíclico de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos que se seleccionan independientemente del grupo que consiste en oxígeno, nitrógeno y azufre, donde el sistema de anillo es saturado o insaturado pero no aromático. Por ejemplo, el heterociclo puede comprender uno a tres átomos de nitrógeno, uno o dos átomos de oxígeno, uno o dos átomos de azufre, uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de oxígeno, uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre o un átomo de azufre y un átomo de oxígeno. Ejemplos de heterociclos no aromáticos saturados incluyen, de modo no taxativo, un anillo de 3 miembros como oxirano, aziridinilo, anillo de 4 miembros como azetidinilo, oxetanilo, tietanilo, anillo de 5 miembros como tetrahidrofuranilo, 1,3-dioxolanilo, tetrahidrotienilo, pirrolidinilo, pirazolidinilo, imidazolidinilo,

35

40

triazolidinilo, isoxazolidinilo, oxazolidinilo, oxadiazolidinilo, tiazolidinilo, isotiazolidinilo, tiadiazolidinilo, anillo de 6 miembros como piperidinilo, hexahidropiridazinilo, hexahidropirimidinilo, piperazinilo, triazinilo, hexahidrotiazinilo, tetrahidropiranilo, dioxanilo, tetrahidrotiopiranilo, ditianilo, morfolinilo, 1,2-oxazinanilo, oxatianilo, tiomorfolinilo o anillo de 7 miembros como oxepanilo, azepanilo, 1,4-diazepanilo y 1,4-oxazepanilo. Ejemplos de heterociclos no aromáticos insaturados incluyen, de modo no taxativo, anillo de 5 miembros como dihidrofurano, 1,3-dioxolilo, dihidrotienilo, pirrolinilo, dihidroimidazolilo, dihidropirazolilo, isoxazolinilo, dihidrooxazolilo, dihidrotiazolilo o anillo de 6 miembros como piranilo, tiopiranilo, tiazinilo y tiadiazinilo.

El término “heterociclo no aromático policíclico de 6 a 14 miembros”, como se usa en la presente, se refiere a un sistema de anillo policíclico de 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13 o 14 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos que se seleccionan independientemente del grupo que consiste en oxígeno, nitrógeno y azufre, donde el sistema de anillo es saturado o insaturado pero no aromático. Los heterociclos bicíclicos no aromáticos pueden consistir en un heteroarilo monocíclico, como se define en la presente, fusionado a un cicloalquilo-C₃-C₈ monocíclico, un cicloalquenilo-C₃-C₈ monocíclico o un heterociclo no aromático monocíclico o pueden consistir en un heterociclo no aromático monocíclico fusionado a un fenilo, un cicloalquilo-C₃-C₈ monocíclico, un cicloalquenilo-C₃-C₈ monocíclico, un heterociclo no aromático monocíclico o un heteroarilo monocíclico. Ejemplos de heterociclo no aromático bicíclico incluyen, de modo no taxativo, un anillo de 9 miembros como indolinilo, isoindolinilo, dihidrobenzofuranilo, tetrahidrobenzotienilo, 1,3-benzodioxolilo o anillo de 10 miembros como dihidroquinolinilo, dihidroisoquinolinilo, tetrahidroquinolinilo, tetrahidroisoquinolinilo, 2,3-dihidro-1,4-benzodioxinilo, cromanilo y cremenilo. Un ejemplo de heterociclo no aromático tricíclico incluye, de modo no taxativo, un anillo de 14 miembros como xantenilo.

El término “heterociclo aromático de 5 a 14 miembros” o “heteroarilo”, como se usa en la presente, se refiere a un sistema de anillo aromático que comprende 1 a 4 heteroátomos que se seleccionan independientemente del grupo que consiste en oxígeno, nitrógeno y azufre. Si el sistema de anillo contiene más de un átomo de oxígeno, no son directamente adyacentes. Heterociclos aromáticos incluyen heterociclos aromáticos monocíclicos de 5 o 6 miembros y heterociclos aromáticos policíclicos de 6 a 14 miembros (por ejemplo, bicíclicos o tricíclicos). El heterociclo aromático de 5 a 14 miembros se puede conectar al resto molecular principal a través de cualquier átomo de carbono o cualquier átomo de nitrógeno dentro del heterociclo.

El término “heterociclo aromático monocíclico de 5 o 6 miembros” o “heteroarilo monocíclico”, como se usa en la presente, se refiere a un sistema de anillo monocíclico de 5 o 6 miembros que contiene 1, 2, 3 o 4 heteroátomos que se seleccionan independientemente del grupo que consiste en oxígeno, nitrógeno y azufre. Ejemplos de heteroarilo monocíclico de 5 miembros incluyen, de modo no taxativo, furilo (furanilo), tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, tetrazolilo, isoxazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, oxatriazolilo, isotiazolilo, tiazolilo, tiadiazolilo y tiatriazolilo. Ejemplos de heteroarilo monocíclico de 6 miembros incluyen, de modo no taxativo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo.

El término “heterociclo aromático policíclico de 6 a 14 miembros” o “heteroarilo policíclico”, como se usa en la presente, se refiere a un sistema de anillo policíclico (por ejemplo, bicíclico o tricíclico) de 6,

7, 8, 9, 10, 11, 12, 13 o 14 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos que se seleccionan independientemente del grupo que consiste en oxígeno, nitrógeno y azufre. Heterociclos bicíclicos aromáticos pueden consistir en un heteroarilo monocíclico como se define en la presente fusionado a un fenilo o a un heteroarilo monocíclico. Ejemplos de heterociclo aromático bicíclico incluyen, de modo no taxativo, un anillo de 9 miembros como indolilo, indolizinilo, isoindolilo, bencimadozolilo, imidazopiridinilo, indazolilo, benzotriazolilo, purinilo, benzofuranilo, benzotiofenilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo y benzisoxazolilo o un anillo de 10 miembros como quinolinilo, isoquinolinilo, cinnolinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, ftalazinilo, naftiridinilo, pteridinilo y benzodioxinilo. Ejemplos de heterociclo aromático tricíclico incluyen, de modo no taxativo, carbazolilo, acridinilo y fenazinilo.

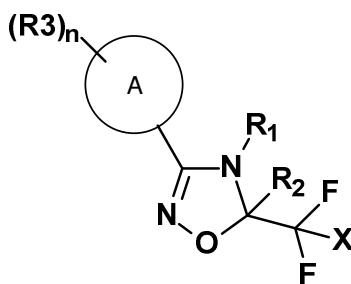
Como se usa en la presente, cuando se dice que un grupo está "sustituido", el grupo puede estar sustituido con uno o más sustituyentes. La expresión "uno o más sustituyentes" se refiere a una cantidad de sustituyentes que varía de uno a la cantidad máxima de sustituyentes posibles con base en la cantidad de sitios de unión disponibles, siempre que se cumplan las condiciones de estabilidad y viabilidad química.

El término "grupo saliente" como se usa en la presente debe entenderse como que significa un grupo que se desplaza de un compuesto en una reacción de sustitución o eliminación, por ejemplo un átomo de halógeno, un grupo trifluorometanosulfonato ("triflato"), alcoxi, metanosulfonato, p-toluenosulfonato, etc.

El término "(halo)alquilo-C₁-C₆", como se usa en la presente en la definición de grupos compuestos (por ejemplo, -(halo)alquilo-C₁-C₆-NR^bC(=S)N(R^b)₂) debe entenderse que significa que el grupo alquilo-C₁-C₆ está opcionalmente sustituido por uno o más átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. En otras palabras, el término halo entre paréntesis designa la presencia opcional de uno o más sustituyentes halógeno.

La expresión "donde cualquier grupo carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo puede estar sustituido por uno o más sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes" indica que cualquier grupo carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo en sí mismo o cualquier grupo carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo como restos de un sustituyente dado (por ejemplo, -alquilo-C₁-C₆-heteroarilo; -O-arilo) puede estar sustituido por uno o más sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes.

La presente invención se refiere a compuestos de la fórmula (I):



(I)

donde:

5

A se selecciona del grupo que consiste en un grupo carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo;

R1 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, haloalquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, haloalquinilo-C₂-C₆, cicloalquilo-C₃-C₈, -C(=O)R^a, -C(=O)OR^a y -C(=O)N(R^a)₂,

10

▪ donde dicho alquilo-C₁-C₆ puede estar sustituido por uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, mercapto, sulfinilo, sulfonilo, nitro, amino, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquilsulfanilo-C₁-C₆, alquilsulfinilo-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, -C(=O)-alquilo-C₁-C₆, -C(=O)-alcoxi-C₁-C₆, -C=O-alquilamino-C₁-C₆, -C=O-dialquilamino-C₁-C₆, carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo,

15

donde dicho carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo pueden estar sustituidos por uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, oxi, ciano, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ y haloalcoxi-C₁-C₆,

20

▪ donde dicho cicloalquilo-C₃-C₈ puede estar sustituido por uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, oxi, ciano, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ y haloalcoxi-C₁-C₆,

▪ donde R^a se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, hidroxialquilo-C₁-C₆, cianoalquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, haloalquenilo-C₂-C₆, hidroxialquenilo-C₂-C₆, cianoalquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, haloalquinilo-C₂-C₆, hidroxialquinilo-C₂-C₆, cianoalquinilo-C₂-C₆, carbociclilo, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -alquil-C₁-C₆-arilo, -alquil-C₁-C₆-heterociclilo, -alquil-C₁-C₆-heteroarilo y -alquil-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆,

25

donde cualquier grupo carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo puede estar sustituido por uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, oxi, ciano, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ y haloalcoxi-C₁-C₆,

30

R2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno y alquilo-C₁-C₆,

donde dicho alquilo-C₁-C₆ puede estar sustituido por uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano,

35

mercapto, sulfinilo, sulfonilo, nitro, amino, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquilsulfanilo-C₁-C₆, alquilsulfinilo-C₁-C₆, alquilsulfonilo-C₁-C₆, -C(=O)-alquilo-C₁-C₆, -C(=O)-alcoxi-C₁-C₆, -C=O-alquilamino-C₁-C₆, -C=O-dialquilamino-C₁-C₆, carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo,

5 donde dicho carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo pueden estar sustituidos por uno o más sustituyentes que se seleccionan independientemente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, oxo, ciano, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆ y haloalcoxi-C₁-C₆;

X es F o Cl;

10 n es 0, 1, 2, 3, 4 o 5;

R3 se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, oxo, ciano, mercapto, sulfinilo, sulfonilo, nitro, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, hidroxialquilo-C₁-C₆, cianoalquilo-C₁-C₆, aminoalquilo-C₁-C₆, alqueno-C₂-C₆, haloalqueno-C₂-C₆, hidroxialqueno-C₂-C₆, cianoalqueno-C₂-C₆, alquino-C₂-C₆, haloalquino-C₂-C₆, hidroxialquino-C₂-C₆, cianoalquino-C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquilsulfanilo-C₁-C₆, arilsulfanilo, alquilsulfinilo-C₁-C₆, arilsulfinilo, alquilsulfonilo-C₁-C₆, arilsulfonilo, amino, carbociclilo, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -O-carbociclilo, -O-heterociclilo, -O-arilo, -O-heteroarilo, =N(OR^b), -N(OR^b)C(=O)OR^b, -N(OR^b)C(=O)R^b, -SO₂N(R^b)₂, -OC(=O)R^b, -N(R^b)₂, -NR^bC(=O)OR^b, -NR^bC(=O)N(R^b)₂, -NR^bC(=O)R^b, -NR^bC(=O)OR^b, -NR^bC(=S)R^b, -NR^bC(=S)N(R^b)₂, -NR^bC(=NR^b)R^b, -N=CR^b-N(R^b)₂, -NR^bS(=O)₂R^b, -OC(=O)N(R^b)₂, -C(=NR^b)R^b, -C(=NOH)R^b, -C(=NOH)N(R^b)₂, -C(=O)R^b, -C(=O)(OR^b), -C(=O)N(R^b)₂, -C(=O)NR^bN(R^b)₂, -C(=O)N(OR^b)R^b, -C(=S)N(R^b)₂, -(halo)alquilo-C₁-C₆-OR^b, -(halo)alquil-C₁-C₆-O-(halo)alquilo-C₁-C₆, -(halo)alquil-C₁-C₆-OC(=O)R^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-N(R^b)₂, -(halo)alquilo-C₁-C₆-NR^bC(=O)OR^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-N(OR^b)C(=O)OR^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-NR^bC(=O)N(R^b)₂, -(halo)alquilo-C₁-C₆-NR^bC(=S)N(R^b)₂, -(halo)alquilo-C₁-C₆-NR^bC(=O)R^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-NR^bC(=S)R^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-NR^bC(=S)N(R^b)₂, -(halo)alquilo-C₁-C₆-NR^bC(=NR^b)R^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-NR^bS(=O)₂R^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-N(OR^b)C(=O)R^b, -(halo)alquil-C₁-C₆-carbociclilo, -(halo)alquil-C₁-C₆-arilo, -(halo)alquil-C₁-C₆-heterociclilo, -(halo)alquil-C₁-C₆-heteroarilo, -(halo)alquil-C₁-C₆-O-carbociclilo, -(halo)alquil-C₁-C₆-O-arilo, -(halo)alquil-C₁-C₆-O-heterociclilo, -(halo)alquil-C₁-C₆-O-heteroarilo, -(halo)alquil-C₁-C₆-C(=O)R^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-C(=O)OR^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-C(=O)N(R^b)₂, -(halo)alquilo-C₁-C₆-C(=O)N(OR^b)R^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-C(=S)N(R^b)₂, -(halo)alquilo-C₁-C₆-OC(=O)N(R^b)₂, -(halo)alquilo-C₁-C₆-S-R^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-S(=O)₂R^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-S(=O)₂N(R^b)₂, -(halo)alquilo-C₁-C₆-C(=NR^b)R^b y alquilo-C₁-C₆-R^c donde el alquilo-C₁-C₆ en dicho alquilo-C₁-C₆-R^c está sustituido por dos sustituyentes en un mismo átomo de carbono que forman junto con el átomo de carbono al que están unidos un carbociclilo (por ejemplo, un ciclopropilo).

▪ donde cualquier grupo carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R³¹ que pueden ser iguales o diferentes,

40 donde R³¹ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, oxo, ciano, mercapto, sulfinilo, sulfonilo, nitro, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, hidroxialquilo-C₁-C₆, cianoalquilo-C₁-C₆, alqueno-C₂-C₆,

haloalquenilo-C₂-C₆, hidroxialquenilo-C₂-C₆, cianoalquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, haloalquinilo-C₂-C₆, hidroxialquinilo-C₂-C₆, cianoalquinilo-C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquilsulfanilo-C₁-C₆, arilsulfanilo, alquilsulfinito-C₁-C₆, arilsulfinito, alquilsulfonilo-C₁-C₆, arilsulfonilo, amino, carbociclilo, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -O-carbociclilo, -O-heterociclilo, -O-arilo, -O-heteroarilo, =N(OR³¹¹), -N(OR³¹¹)C(=O)OR³¹¹, -N(OR³¹¹)C(=O)R³¹¹, -SO₂N(R³¹¹)₂, -OC(=O)R³¹¹, -N(R³¹¹)₂, -NR³¹¹C(=O)OR³¹¹, -NR³¹¹C(=O)N(R³¹¹)₂, -NR³¹¹C(=O)R³¹¹, -NR³¹¹C(=S)R³¹¹, -NR³¹¹C(=S)N(R³¹¹)₂, -NR³¹¹C(=NR³¹¹)R³¹¹, -N=C-N(R³¹¹)₂, -NR³¹¹S(=O)₂R³¹¹, -OC(=O)N(R³¹¹)₂, -C(=NR³¹¹)R³¹¹, -C(=NOH)R³¹¹, -C(=O)R³¹¹, -C(=O)(OR³¹¹), -C(=O)N(R³¹¹)₂, -C(=O)NR³¹¹N(R³¹¹)₂, -C(=O)N(OR³¹¹)R³¹¹, -C(=S)N(R³¹¹)₂, -alquilo-C₁-C₆-OR³¹¹, -alquilo-C₁-C₆-N(R³¹¹)₂, -alquilo-C₁-C₆-NR³¹¹C(=O)OR³¹¹, -alquilo-C₁-C₆-NR³¹¹C(=O)N(R³¹¹)₂, -alquilo-C₁-C₆-NR³¹¹C(=S)N(R³¹¹)₂, -alquilo-C₁-C₆-NR³¹¹C(=O)R³¹¹, -alquilo-C₁-C₆-NR³¹¹C(=S)R³¹¹, -alquilo-C₁-C₆-NR³¹¹C(=S)N(R³¹¹)₂, -alquilo-C₁-C₆-NR³¹¹C(=NR³¹¹)R³¹¹, -alquilo-C₁-C₆-NR³¹¹S(=O)₂R³¹¹, -alquilo-C₁-C₆-N(OR³¹¹)C(=O)R³¹¹, -alquil-C₁-C₆-carbociclilo, -alquil-C₁-C₆-arilo, -alquil-C₁-C₆-heterociclilo, -alquil-C₁-C₆-heteroarilo, -alquilo-C₁-C₆-C(=O)R³¹¹, -alquil-C₁-C₆-C(=O)OR³¹¹, -alquilo-C₁-C₆-C(=O)N(R³¹¹)₂, -alquilo-C₁-C₆-C(=O)N(OR³¹¹)R³¹¹, -alquilo-C₁-C₆-C(=S)N(R³¹¹)₂, -alquilo-C₁-C₆-OC(=O)N(R³¹¹)₂, -alquilo-C₁-C₆-S(=O)₂R³¹¹, -alquilo-C₁-C₆-S(=O)₂N(R³¹¹)₂ y -alquilo-C₁-C₆-C(=NR³¹¹)R³¹¹, donde R³¹¹ es independientemente hidrógeno o alquilo-C₁-C₆,

■ donde R^c se selecciona del grupo que consiste en -OR^b, -OC(=O)R^b, -N(R^b)₂, -NR^bC(=O)OR^b, -N(OR^b)C(=O)OR^b, -NR^bC(=O)N(R^b)₂, -NR^bC(=S)N(R^b)₂, -NR^bC(=O)R^b, -NR^bC(=S)R^b, -NR^bC(=S)N(R^b)₂, -NR^bC(=NR^b)R^b, -NR^bS(=O)₂R^b, -N(OR^b)C(=O)R^b, -carbociclilo, -arilo, -heterociclilo, -heteroarilo, -O-carbociclilo, -O-arilo, -O-heterociclilo, -O-heteroarilo, -C(=O)R^b, -C(=O)OR^b, -C(=O)N(R^b)₂, -C(=O)N(OR^b)R^b, -C(=S)N(R^b)₂, -OC(=O)N(R^b)₂, -S-R^b, -S(=O)₂R^b, -S(=O)₂N(R^b)₂ y -C(=NR^b)R^b,

donde cualquier grupo carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{c1} que pueden ser iguales o diferentes,

donde R^{c1} se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, oxo, ciano, mercapto, sulfinito, sulfonilo, nitro, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, hidroxialquilo-C₁-C₆, cianoalquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, haloalquenilo-C₂-C₆, hidroxialquenilo-C₂-C₆, cianoalquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, haloalquinilo-C₂-C₆, hidroxialquinilo-C₂-C₆, cianoalquinilo-C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquilsulfanilo-C₁-C₆, arilsulfanilo, alquilsulfinito-C₁-C₆, arilsulfinito, alquilsulfonilo-C₁-C₆, arilsulfonilo, amino, carbociclilo, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -O-carbociclilo, -O-heterociclilo, -O-

arilo, -O-heteroarilo, $=N(OR^{c11})$, $-N(OR^{c11})C(=O)OR^{c11}$, $-N(OR^{c11})C(=O)R^{c11}$, $-SO_2N(R^{c11})_2$, $-OC(=O)R^{c11}$, $-N(R^{c11})_2$, $-NR^{c11}C(=O)OR^{c11}$, $-NR^{c11}C(=O)N(R^{c11})_2$, $-NR^{c11}C(=O)R^{c11}$, $-NR^{c11}C(=S)R^{c11}$, $-NR^{c11}C(=S)N(R^{c11})_2$, $-NR^{c11}C(=NR^{c11})R^{c11}$, $-N=C-N(R^{c11})_2$, $-NR^{c11}S(=O)_2R^{c11}$, $-OC(=O)N(R^{c11})_2$, $-C(=NR^{c11})R^{c11}$, $-C(=NOH)R^{c11}$, $-C(=O)R^{c11}$, $-C(=O)(OR^{c11})$, $-C(=O)N(R^{c11})_2$, $-C(=O)NR^{c11}N(R^{c11})_2$, $-C(=O)N(OR^{c11})R^{c11}$, $-C(=S)N(R^{c11})_2$, -alquilo-C₁-C₆-OR^{c11}, -alquilo-C₁-C₆-N(R^{c11})₂, -alquilo-C₁-C₆-NR^{c11}C(=O)OR^{c11}, -alquilo-C₁-C₆-NR^{c11}C(=O)N(R^{c11})₂, -alquilo-C₁-C₆-NR^{c11}C(=S)N(R^{c11})₂,
 , -alquilo-C₁-C₆-NR^{c11}C(=O)R^{c11}, -alquilo-C₁-C₆-NR^{c11}C(=S)R^{c11}, -alquilo-C₁-C₆-NR^{c11}C(=S)N(R^{c11})₂, -alquilo-C₁-C₆-NR^{c11}C(=NR^{c11})R^{c11}, -alquilo-C₁-C₆-NR^{b11}S(=O)₂R^{c11}, -alquilo-C₁-C₆-N(OR^{c11})C(=O)R^{c11}, -alquil-C₁-C₆-carbociclilo, -alquil-C₁-C₆-arilo, -alquil-C₁-C₆-heterociclilo, -alquil-C₁-C₆-heteroarilo, -alquilo-C₁-C₆-C(=O)R^{c11}, -alquilo-C₁-C₆-C(=O)OR^{c11}, -alquilo-C₁-C₆-C(=O)N(R^{c11})₂, -alquilo-C₁-C₆-C(=O)N(OR^{c11})R^{c11}, -alquilo-C₁-C₆-C(=S)N(R^{c11})₂, -alquilo-C₁-C₆-OC(=O)N(R^{c11})₂, -alquilo-C₁-C₆-S(=O)₂R^{c11}, -alquilo-C₁-C₆-S(=O)₂N(R^{c11})₂ y -alquilo-C₁-C₆-C(=NR^{c11})R^{c11}, donde R^{c11} es independientemente hidrógeno o alquilo-C₁-C₆,
 ■ donde R^b se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, mercapto, sulfinilo, sulfonilo, nitro, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, hidroxialquilo-C₁-C₆, cianoalquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, haloalquenilo-C₂-C₆, hidroxialquenilo-C₂-C₆, cianoalquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, haloalquinilo-C₂-C₆, hidroxialquinilo-C₂-C₆, cianoalquinilo-C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquilsulfanilo-C₁-C₆, arilsulfanilo, alquilsulfinilo-C₁-C₆, arilsulfinilo, alquilsulfonilo-C₁-C₆, arilsulfonilo, amino, alquilamino-C₁-C₆, carbociclilo, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -O-carbociclilo, -O-heterociclilo, -O-arilo, -O-heteroarilo, -alquil-C₁-C₆-carbociclilo, -alquil-C₁-C₆-arilo, -alquil-C₁-C₆-heterociclilo, -alquil-C₁-C₆-heteroarilo, -alquil-C₁-C₆-O-carbociclilo, -alquil-C₁-C₆-O-arilo, -alquil-C₁-C₆-O-heterociclilo, -alquil-C₁-C₆-O-heteroarilo y -alquil-C₁-C₆-C₁-C₆-alcoxi,
 donde cualquier grupo carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{b1} que pueden ser iguales o diferentes,
 R^{b1} se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, oxo, ciano, mercapto, sulfinilo, sulfonilo, nitro, alquilo-C₁-C₆, haloalquilo-C₁-C₆, hidroxialquilo-C₁-C₆, cianoalquilo-C₁-C₆, alquenilo-C₂-C₆, haloalquenilo-C₂-C₆, hidroxialquenilo-C₂-C₆, cianoalquenilo-C₂-C₆, alquinilo-C₂-C₆, haloalquinilo-C₂-C₆, hidroxialquinilo-C₂-C₆, cianoalquinilo-C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi-C₁-C₆, alquilsulfanilo-C₁-C₆, arilsulfanilo, alquilsulfinilo-C₁-C₆, arilsulfinilo, alquilsulfonilo-C₁-C₆, arilsulfonilo, amino, carbociclilo, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -O-carbociclilo, -O-heterociclilo,

-O-arilo, -O-heteroarilo, $=N(OR^{b11})$, $-N(OR^{b11})C(=O)OR^{b11}$, $-N(OR^{b11})C(=O)R^{b11}$, $-SO_2N(R^{b11})_2$, $-OC(=O)R^{b11}$, $-N(R^{b11})_2$, $-NR^{b11}C(=O)OR^{b11}$, $-NR^{b11}C(=O)N(R^{b11})_2$, $-NR^{b11}C(=O)R^{b11}$, $-NR^{b11}C(=S)R^{b11}$, $-NR^{b11}C(=S)N(R^{b11})_2$, $-NR^{b11}C(=NR^{b11})R^{b11}$, $-N=C-N(R^{b11})_2$, $-NR^{b11}S(=O)_2R^{b11}$, $-OC(=O)N(R^{b11})_2$, $-C(=NR^{b11})R^{b11}$, $-C(=NOH)R^{b11}$, $-C(=O)R^{b11}$, $-C(=O)(OR^{b11})$, $-C(=O)N(R^{b11})_2$, $-C(=O)NR^{b11}N(R^{b11})_2$, $-C(=O)N(OR^{b11})R^{b11}$, $-C(=S)N(R^{b11})_2$, -alquilo-C₁-C₆-OR^{b11}, -alquilo-C₁-C₆-N(R^{b11})₂, -alquilo-C₁-C₆-NR^{b11}C(=O)OR^{b11}, -alquilo-C₁-C₆-NR^{b11}C(=O)N(R^{b11})₂, -alquilo-C₁-C₆-NR^{b11}C(=S)N(R^{b11})₂, -alquilo-C₁-C₆-NR^{b11}C(=O)R^{b11}, -alquilo-C₁-C₆-NR^{b11}C(=S)R^{b11}, -alquilo-C₁-C₆-NR^{b11}C(=S)N(R^{b11})₂, -alquilo-C₁-C₆-NR^{b11}C(=NR^{b11})R^{b11}, -alquilo-C₁-C₆-NR^{b11}S(=O)₂R^{b11}, -alquilo-C₁-C₆-N(OR^{b11})C(=O)R^{b11}, -alquil-C₁-C₆-carbociclilo, -alquil-C₁-C₆-arilo, -alquil-C₁-C₆-heterociclilo, -alquil-C₁-C₆-heteroarilo, -alquil-C₁-C₆-C(=O)R^{b11}, -alquilo-C₁-C₆-C(=O)OR^{b11}, -alquilo-C₁-C₆-C(=O)N(R^{b11})₂, -alquilo-C₁-C₆-C(=O)N(OR^{b11})R^{b11}, -alquilo-C₁-C₆-C(=S)N(R^{b11})₂, -alquilo-C₁-C₆-OC(=O)N(R^{b11})₂, -alquilo-C₁-C₆-S(=O)₂R^{b11}, -alquilo-C₁-C₆-S(=O)₂N(R^{b11})₂ y -alquilo-C₁-C₆-C(=NR^{b11})R^{b11}, donde R^{b11} es independientemente hidrógeno o alquilo-C₁-C₆;

siempre que el compuesto de fórmula (I) no sea

- (a) 1-{4-[5-metil-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil}metanamina [510772-18-6];
 (b) di-terc-butil{4-[5-metil-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencil}-2-imidodicarbonato [510772-17-5];
 (c) 1-{4-[5,5-bis(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil}metanamina [510772-14-2];
 (d) 2-{6-[3-amino-5-(trifluorometil)fenil]-3-(isopropilamino)-2-oxopirazin-1(2H)-il}-N-{4-[5-metil-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencil}acetamida [510770-08-8];
 (e) 2-{6-[3-amino-5-(trifluorometil)fenil]-3-(isopropilamino)-2-oxopirazin-1(2H)-il}-N-{4-[5,5-bis(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencil}acetamida [510770-03-3];
 (f) fenil[3-fenil-5,5-bis(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-4(5H)-il]metanona [21111-45-5]; y
 (g) 3-fenil-5,5-bis(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol [21111-43-3].

Los compuestos (d) y (e) se conocen como profármacos útiles para la inhibición selectiva de serina proteasas y la cascada de coagulación. Se pueden usar para prevenir y tratar afecciones trombóticas en mamíferos (WO2003/028729). Los compuestos (a), (b) y (c) se conocen como reactivos en la preparación de algunos de estos inhibidores de serina proteasas (WO2003/028729). Los compuestos (f) y (g) se describen en la literatura sin referencia a ningún uso en la agricultura (Simonyan, L. A et ál, Izvestiya Akademii Nauk SSSR, Seriya Khimicheskaya (1968), (8), 1916-18).

En la presente no están abarcados los compuestos que resultan de las combinaciones que van contra las leyes naturales y que, por lo tanto, el experto en la técnica excluiría en función de su conocimiento

experto. Por ejemplo, se excluyen las estructuras de anillo con tres o más átomos de oxígeno adyacentes.

De manera adecuada, el compuesto de fórmula (I) puede estar en su forma libre, forma de sal, forma de N-óxido o forma de solvato (p. ej. hidrato).

5 Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, el compuesto de fórmula (I) puede estar presentes en la forma de estereoisómeros diferentes. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. Por consiguiente, la invención abarca estereoisómeros puros y cualquier mezcla de estos isómeros. Cuando un compuesto puede estar presente en dos o más formas de tautómero en equilibrio, la referencia al compuesto por medio
10 de una descripción tautomérica se considera que incluye todas las formas tautoméricas.

Cualquiera de los compuestos de la presente invención también puede existir en una o más formas de isómero geométrico dependiendo de la cantidad de enlaces dobles en el compuesto. Los isómeros geométricos, en virtud de los sustituyentes alrededor de un enlace doble o un anillo, pueden estar presentes en forma *cis* (= *Z*-) o *trans* (= *E*-). Por lo tanto, la invención se refiere igualmente a todos los
15 isómeros geométricos y a todas las mezclas posibles, en todas las proporciones.

Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, el compuesto de fórmula (I) puede estar presente en la forma del compuesto libre y/o una sal de este, como una sal aceptable desde el punto de vista agroquímico.

20 Las sales activas desde el punto de vista agroquímico incluyen sales de adición de ácido de ácidos inorgánicos y orgánicos, así como sales de bases habituales. Ejemplos de ácidos inorgánicos son ácidos hidrohálicos, como fluoruro de hidrógeno, cloruro de hidrógeno, bromuro de hidrógeno y yoduro de hidrógeno, ácido sulfúrico, ácido fosfórico y ácido nítrico, y sales ácidas, como bisulfato de sodio y bisulfato de potasio. Ácidos orgánicos útiles incluyen, por ejemplo, ácido fórmico, ácido
25 carbónico y ácidos alcanóicos, como ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido tricloroacético y ácido propiónico, y también ácido glicólico, ácido tiociánico, ácido láctico, ácido succínico, ácido cítrico, ácido benzoico, ácido cinámico, ácido oxálico, ácidos grasos saturados o mono o diinsaturados con 6 a 20 átomos de carbono, monoésteres alquilsulfónicos, ácidos alquilsulfónicos (ácidos sulfónicos con radicales alquilo de cadena recta o ramificada de 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilsulfónicos o
30 ácidos arildisulfónicos (radicales aromáticos, como fenilo y naftilo, que contienen uno o dos grupos de ácido sulfónico), ácidos alquilsulfónicos (ácidos sulfónicos con radicales alquilo de cadena recta o ramificada con 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilsulfónicos o ácidos arildifosfónicos (radicales aromáticos, como fenilo y naftilo, que contienen uno o dos radicales de ácido fosfónico), donde los radicales alquilo y arilo pueden contener otros sustituyentes, por ejemplo, ácido p-toluenosulfónico,
35 ácido salicílico, ácido p-aminosalicílico, ácido 2-fenoxibenzoico, ácido 2-acetoxibenzoico, etc.

Solvatos de los compuestos de la invención o sus sales son composiciones estequiométricas de los compuestos con solventes.

Los compuestos de la invención pueden existir en múltiples formas cristalinas y/o amorfas. Las formas cristalinas incluyen formas cristalinas no solvatadas, solvatos e hidratos.

Los compuestos de fórmula (I) se denominan en la presente "ingredientes activos".

5

En la fórmula que antecede, A se selecciona preferentemente del grupo que consiste en heterociclilo bicíclico de 9 o 10 miembros, arilo-C₆-C₁₀, heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros y heteroarilo bicíclico de 9 o 10 miembros.

10 En la fórmula anterior, A se selecciona más preferentemente del grupo que consiste en heterociclo bicíclico de 10 miembros que comprende un átomo de nitrógeno (por ejemplo, dihidroisoquinolinilo, tetrahydroquinolinilo, tetrahydroisoquinolinilo), arilo-C₆-C₁₀ (por ejemplo, fenilo, naftilo), heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros que comprende uno o dos átomos de nitrógeno (por ejemplo, piridinilo, pirimidinilo) y heteroarilo bicíclico de 9 o 10 miembros que comprende uno o
15 dos átomos de nitrógeno (por ejemplo, indolilo, bencimidazolilo, indazolilo).

En algunas modalidades, en la fórmula anterior, A se selecciona del grupo que consiste en dihidroisoquinolinilo, tetrahydroquinolinilo, tetrahydroisoquinolinilo, fenilo, naftilo, indolilo, bencimidazolilo e indazolilo.

20

En la fórmula (I) anterior, cuando R1 es un alquilo-C₁-C₆ sustituido por un carbociclilo, puede preferirse que dicho carbociclilo sea un carbociclilo-C₃-C₄.

En la fórmula (I) anterior, cuando R1 es un alquilo-C₁-C₆ sustituido por un heterociclilo, puede
25 preferirse que dicho heterociclilo sea un heterociclilo de 3 a 6 miembros.

En la fórmula (I) anterior, cuando R1 es un alquilo-C₁-C₆ sustituido por un arilo, puede preferirse que dicho arilo sea un arilo C₆.

30 En la fórmula (I) anterior, cuando R1 es un alquilo-C₁-C₆ sustituido por un heteroarilo, puede preferirse que dicho heteroarilo sea un heteroarilo de 5 o 6 miembros.

En la fórmula (I) anterior, cuando R2 es un alquilo-C₁-C₆ sustituido por un carbociclilo, puede preferirse que dicho carbociclilo sea un carbociclilo-C₃-C₄.

35

En la fórmula (I) anterior, cuando R2 es un alquilo-C₁-C₆ sustituido por un heterociclilo, puede preferirse que dicho heterociclilo sea un heterociclilo de 3 a 6 miembros.

En la fórmula (I) anterior, cuando R2 es un alquilo-C₁-C₆ sustituido por un arilo, puede preferirse que
40 dicho arilo sea un arilo C₆.

En la fórmula (I) anterior, cuando R² es un alquilo-C₁-C₆ sustituido por un heteroarilo, puede preferirse que dicho heteroarilo sea un heteroarilo de 5 o 6 miembros.

En la fórmula (I) anterior, R^a es preferentemente un alquilo-C₁-C₆.

5

En la fórmula (I) anterior, R¹ se selecciona preferentemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo-C₁-C₆ y -C(=O)R^a donde R^a es como se describe en la presente, preferentemente donde R^a es alquilo-C₁-C₆, más preferentemente R¹ es hidrógeno o -C(=O)R^a donde R^a es como se describe en la presente, preferentemente donde R^a es alquilo-C₁-C₆.

10

En la fórmula (I) anterior, R² es preferentemente hidrógeno o alquilo-C₁-C₆, más preferentemente R² es hidrógeno.

15

En la fórmula (I) anterior, R³¹ se selecciona preferentemente del grupo que consiste en halógeno, oxo, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, heteroarilo, -NR³¹¹C(=O)OR³¹¹ y -C(=O)(OR³¹¹) siendo R³¹¹ hidrógeno o alquilo-C₁-C₆.

En algunas modalidades, en la fórmula (I) anterior, R³¹ se selecciona del grupo que consiste en halógeno, oxo y alquilo-C₁₋₆.

20

En la fórmula (I) anterior, R^b se selecciona preferentemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, alquiniilo-C₂-C₆, alquilsulfanilo-C₁-C₆, carbociclilo (por ejemplo, ciclopropilo, hexilo), arilo (por ejemplo, fenilo), heterociclilo, heteroarilo, -alquil-C₁-C₆-carbociclilo, -alquil-C₁-C₆-O-arilo y -alquil-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆, donde cualquier grupo carbociclilo, arilo, heterociclilo y heteroarilo puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{b1} como se describe en la presente, preferentemente donde

25

R^{b1} es halógeno o alquilo-C₁-C₆.

30

En algunas modalidades, en la fórmula (I) anterior, R^b se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, alquilsulfanilo-C₁-C₆, carbociclilo, arilo, heterociclilo, heteroarilo y -alquil-C₁-C₆-carbociclilo, donde cualquier grupo carbociclilo, arilo, heterociclilo y heteroarilo puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{b1} como se describe en la presente, preferentemente donde R^{b1} es halógeno o alquilo-C₁-C₆.

35

En la fórmula (I) anterior, R³ se selecciona preferentemente del grupo que consiste en hidróxi, halógeno, oxo, alquilo-C₁-C₆, alquilsulfanilo-C₁-C₆, arilsulfanilo, arilsulfinilo, alquilsulfonilo-C₁-C₆, arilsulfonilo, carbociclilo, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -NR^bC(=O)R^b, -OC(=O)R^b, -N(R^b)₂, -NR^bC(=O)OR^b, -N=CR^b-N(R^b)₂, -OC(=O)N(R^b)₂, -C(=NOH)R^b, -C(=NOH)N(R^b)₂, -C(=O)R^b, -C(=O)(OR^b), -C(=O)N(R^b)₂, -C(=O)NR^bN(R^b)₂, -C(=S)N(R^b)₂, -(halo)alquilo-C₁-C₆-O-(halo)alquilo-C₁-C₆, -(halo)alquilo-C₁-C₆-NR^bC(=O)OR^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-N(OR^b)C(=O)OR^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-NR^bC(=O)R^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-N(OR^b)C(=O)R^b, -(halo)alquil-C₁-C₆-arilo, -(halo)alquilo-C₁-C₆-C(=O)N(R^b)₂, -alquilo-C₁-C₆-R^c donde el alquilo-C₁-C₆ en dicho alquilo-C₁-C₆-R^c está sustituido por dos sustituyentes en un mismo átomo de carbono que forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un carbociclilo (por ejemplo, un ciclopropilo), donde cualquiera de los grupos

40

carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo citados anteriormente puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{31} como se describe en la presente (preferentemente R^{31} se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, oxo, alquilo- C_1-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 , heteroarilo, $-NR^{31}C(=O)OR^{31}$ y $-C(=O)(OR^{31})$ donde R^{31} es hidrógeno o alquilo- C_1-C_6) y donde R^b y R^c son como se describe en la presente, preferentemente donde R^b se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo- C_1-C_6 , alquino- C_2-C_6 , alquilsulfanilo- C_1-C_6 , carbociclilo, arilo, alquil- C_1-C_6 -carbociclilo, alquil- C_1-C_6 -O-arilo y alquil- C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 (donde cualquiera de los grupos carbociclilo o arilo citados anteriormente puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{b1} como se describe en la presente, preferentemente donde R^{b1} es halógeno o alquilo- C_1-C_6), preferentemente R^c es $-NR^bC(=O)R^b$ donde R^b es un alquilo- C_1-C_6 .

En algunas modalidades, en la fórmula (I) anterior, R_3 se selecciona del grupo que consiste en hidroxilo, oxo, alquilo- C_1-C_6 , alquilsulfanilo- C_1-C_6 , arilsulfanilo, arilsulfonilo, alquilsulfonilo- C_1-C_6 , arilsulfonilo, carbociclilo, heterociclilo, arilo, heteroarilo, $-OC(=O)R^b$, $-N(R^b)_2$, $-NR^bC(=O)OR^b$, $-OC(=O)N(R^b)_2$, $-C(=NOH)R^b$, $-C(=NOH)N(R^b)_2$, $-C(=O)R^b$, $-C(=O)(OR^b)$, $-C(=O)N(R^b)_2$, $-C(=O)NR^bN(R^b)_2$, $-C(=S)N(R^b)_2$, $-(\text{halo})\text{alquilo-}C_1-C_6-NR^bC(=O)OR^b$, $-(\text{halo})\text{alquilo-}C_1-C_6-N(OR^b)C(=O)OR^b$, $-(\text{halo})\text{alquilo-}C_1-C_6-NR^bC(=O)R^b$, $-(\text{halo})\text{alquilo-}C_1-C_6-N(OR^b)C(=O)R^b$ y $-(\text{halo})\text{alquil-}C_1-C_6\text{-arilo}$, donde cualquier grupo carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{31} como se describe en la presente y donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo- C_1-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 , alquilsulfanilo- C_1-C_6 , carbociclilo, heterociclilo, arilo y alquil- C_1-C_6 -carbociclilo, donde cualquier grupo carbociclilo, arilo y heterociclilo puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{b1} como se describe en la presente.

En algunas modalidades, en la fórmula (I) anterior, R_3 se selecciona del grupo que consiste en halógeno; oxo; alquilo- C_1-C_6 ; alquilsulfanilo- C_1-C_6 ; arilsulfanilo que puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{31} como se describe en la presente, preferentemente donde R^{31} es alcoxi- C_1-C_6 ; arilsulfonilo que puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{31} como se describe en la presente, preferentemente donde R^{31} es alcoxi- C_1-C_6 ; arilsulfonilo que puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{31} como se describe en la presente, preferentemente donde R^{31} es oxo o $-C(=O)(OR^{31})$ donde R^{31} es un alquilo- C_1-C_6 ; arilo que puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{31} como se describe en la presente, preferentemente donde R^{31} es $-NR^{31}C(=O)OR^{31}$ donde R^{31} es hidrógeno o alquilo- C_1-C_6 ; heteroarilo que puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{31} como se describe en la presente, preferentemente donde R^{31} es alquilo- C_1-C_6 ; $-NR^bC(=O)R^b$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es hidrógeno, alquilo- C_1-C_6 , carbociclilo (por ejemplo, ciclopropilo) que puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{b1} como se describe en la presente, preferentemente donde R^{b1} es alquilo- C_1-C_6 o R^b es alquil- C_1-C_6 -O-arilo (por ejemplo, alquil- C_1-C_6 -O-fenilo) donde dicho arilo puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{b1} como se describe en la presente, preferentemente donde R^{b1} es halógeno, $-NR^bC(=O)OR^b$ donde R^b es

como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es independientemente hidrógeno o alquilo- C_1-C_6 ; $-N=CR^b-N(R^b)_2$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es independientemente hidrógeno o alquilo- C_1-C_6 ; $-OC(=O)N(R^b)_2$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es independientemente alquilo- C_1-C_6 , arilo (por ejemplo, fenilo) o carbociclilo (por ejemplo, hexilo); $-C(=NOH)R^b$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es hidrógeno o alquilsulfanilo- C_1-C_6 ; $-C(=O)R^b$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es alquilo- C_1-C_6 ; $-C(=O)(OR^b)$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es alquilo- C_1-C_6 ; $-C(=O)N(R^b)_2$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es independientemente hidrógeno, -alquil- C_1-C_6 -carbociclilo, -alquil- C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 , alquilo- C_1-C_6 , carbociclilo (por ejemplo, ciclopropilo) que puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{b1} como se describe en la presente, preferentemente donde R^{b1} es alquilo- C_1-C_6 o R^b es arilo (por ejemplo, fenilo) que puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{b1} como se describe en la presente, preferentemente donde R^{b1} es halógeno; $-C(=O)NR^bN(R^b)_2$ donde R^b como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es hidrógeno o alquilo- C_1-C_6 ; $-C(=S)N(R^b)_2$ donde R^b como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es independientemente hidrógeno, alquilo- C_1-C_6 o -alquil- C_1-C_6 -carbociclilo; $-(halo)alquil-C_1-C_6-O-(halo)alquilo-C_1-C_6$; $-(halo)alquilo-C_1-C_6-NR^bC(=O)OR^b$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es independientemente hidrógeno o alquilo- C_1-C_6 ; $-(halo)alquilo-C_1-C_6-N(OR^b)C(=O)OR^b$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es independientemente alquilo- C_1-C_6 o arilo (por ejemplo, fenilo) que puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{b1} como se describe en la presente, preferentemente donde R^{b1} es halógeno; $-(halo)alquilo-C_1-C_6-NR^bC(=O)R^b$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es independientemente hidrógeno o carbociclilo (por ejemplo, ciclopropilo); $-(halo)alquilo-C_1-C_6-N(OR^b)C(=O)R^b$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es independientemente alquilo- C_1-C_6 o carbociclilo (por ejemplo, ciclopropilo); $-(halo)alquil-C_1-C_6$ -arilo; $-(halo)alquilo-C_1-C_6-C(=O)N(R^b)_2$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es independientemente hidrógeno o alquilo- C_2-C_6 ; -alquilo- $C_1-C_6-R^c$ donde el alquilo- C_1-C_6 en dicho alquilo- $C_1-C_6-R^c$ está sustituido por dos sustituyentes en un mismo átomo de carbono que forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un carbociclilo (por ejemplo, un ciclopropilo) y donde R^c es como se describe en la presente, preferentemente donde R^c es $-NR^bC(=O)R^b$ donde R^b es un alquilo- C_1-C_6 .

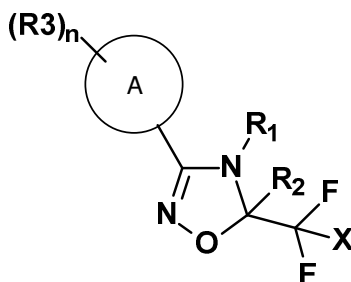
En algunas modalidades, en la fórmula (I) anterior, R_3 se selecciona del grupo que consiste en alquilo- C_1-C_6 ; alquilsulfanilo- C_1-C_6 ; alquilsulfonilo- C_1-C_6 ; heterociclilo que puede estar sustituido por oxo; -alquil- C_1-C_6 -arilo; oxo; $N(R^b)_2$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b es hidrógeno y arilo (por ejemplo, fenilo) que puede estar sustituido por halógeno, o R^b es hidrógeno y heteroarilo; $-OC(=O)N(R^b)_2$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo- C_1-C_6 , carbociclilo y arilo; $-NR^bC(=O)OR^b$ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y

alquilo-C₁-C₆; -C(=S)N(R^b)₂ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo-C₁-C₆ y -alquil-C₁-C₆-cicloalquilo-C₃-C₈; -alquilo-C₁-C₆-N(OR^b)C(=O)R^b donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b se selecciona independientemente del grupo que consiste en alquilo-C₁-C₆ y cicloalquilo-C₃-C₈; -alquilo-C₁-C₆-NR^bC(=O)OR^b donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alcoxi-C₁-C₆ y heterociclilo; -alquilo-C₁-C₆-NR^bC(=O)R^b donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno y cicloalquilo-C₃-C₈; y -C(=O)N(R^b)₂ donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, -alquil-C₁-C₆-cicloalquilo-C₃-C₈ y arilo que puede estar sustituido por uno o más átomos de halógeno.

En la fórmula (I) anterior, cuando n es 2, 3, 4 o 5, al menos (n-1) de dicho R³ se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno y alquilo-C₁-C₃.

En la fórmula (I) anterior, n es preferentemente 0, 1 o 2, más preferentemente 0 o 1.

En algunas modalidades, los compuestos de la presente invención son compuestos de fórmula (I)



(I)

donde

A se selecciona del grupo que consiste en heterociclilo bicíclico de 9 o 10 miembros, arilo-C₆-C₁₀, heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros y heteroarilo bicíclico de 9 o 10 miembros, preferentemente A se selecciona del grupo que consiste en heterociclo bicíclico de 10 miembros que comprende un átomo de nitrógeno (por ejemplo, dihidroisoquinolinilo, tetrahydroquinolinilo, tetrahydroisoquinolinilo), arilo-C₆-C₁₀ (por ejemplo, fenilo, naftilo), heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros que comprende uno o dos átomos de nitrógeno (por ejemplo, piridinilo, pirimidinilo) y heteroarilo bicíclico de 9 o 10 miembros que comprende uno o dos átomos de nitrógeno (por ejemplo, indolilo, bencimidazolilo, indazolilo);

R¹ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo-C₁-C₆ y -C(=O)R^a donde R^a es como se describe en la presente, preferentemente donde R^a es alquilo-C₁-C₆,

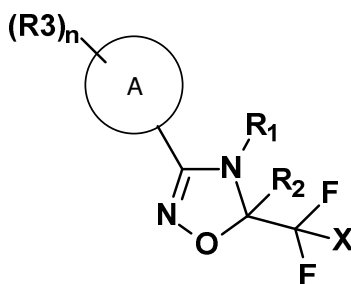
preferentemente es hidrógeno o $-C(=O)R^a$ donde R^a es como se describe en la presente, donde R^a es alquilo- C_1-C_6 ;

R2 es hidrógeno o alquilo C_1-C_6 ,
preferentemente es hidrógeno;

5 n es 0, 1 o 2,
 preferentemente es 0 o 1;

R3 se selecciona del grupo que consiste en hidroxilo, halógeno, oxo, alquilo- C_1-C_6 , alquilsulfanilo- C_1-C_6 , arilsulfanilo, arilsulfonilo, alquilsulfonilo- C_1-C_6 , arilsulfonilo, carbociclilo, heterociclilo, arilo, heteroarilo, $-NR^bC(=O)R^b$, $-OC(=O)R^b$, $-N(R^b)_2$, $-NR^bC(=O)OR^b$, $-N=CR^b-N(R^b)_2$, $-OC(=O)N(R^b)_2$, $-C(=NOH)R^b$, $-C(=NOH)N(R^b)_2$, $-C(=O)R^b$, $-C(=O)(OR^b)$, $-C(=O)N(R^b)_2$, $-C(=O)NR^bN(R^b)_2$, $-C(=S)N(R^b)_2$, $-(halo)alquilo-C_1-C_6-O-(halo)alquilo-C_1-C_6-$, $-(halo)alquilo-C_1-C_6-NR^bC(=O)OR^b$, $-(halo)alquilo-C_1-C_6-N(OR^b)C(=O)OR^b$, $-(halo)alquilo-C_1-C_6-NR^bC(=O)R^b$, $-(halo)alquilo-C_1-C_6-N(OR^b)C(=O)R^b$, $-(halo)alquil-C_1-C_6-arilo$, $-(halo)alquilo-C_1-C_6-C(=O)N(R^b)_2$, $-alquilo-C_1-C_6-R^c$ donde el alquilo- C_1-C_6 en dicho alquilo- $C_1-C_6-R^c$ está sustituido por dos sustituyentes en un mismo átomo de carbono que forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un carbociclilo (por ejemplo, un ciclopropilo), donde cualquiera de los grupos carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo citados anteriormente puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{31} como se describe en la presente (preferentemente R^{31} se selecciona independientemente del grupo que consiste en halógeno, oxo, alquilo- C_1-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 , heteroarilo, $-NR^{311}C(=O)OR^{311}$ y $-C(=O)(OR^{311})$ donde R^{311} es hidrógeno o alquilo- C_1-C_6) y donde R^b y R^c son como se describe en la presente, preferentemente donde R^b se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo- C_1-C_6 , alquilo- C_2-C_6 , alquilsulfanilo- C_1-C_6 , carbociclilo, arilo, $-alquil-C_1-C_6-carbociclilo$, $-alquil-C_1-C_6-O-arilo$ y $-alquil-C_1-C_6-alcoxi-C_1-C_6$ (donde cualquiera de los grupos carbociclilo o arilo citados anteriormente puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{b1} como se describe en la presente, preferentemente donde R^{b1} es halógeno o alquilo- C_1-C_6), preferentemente R^c es $-NR^bC(=O)R^b$ donde R^b es un alquilo- C_1-C_6 .

30 En algunas modalidades, los compuestos de la presente invención son compuestos de fórmula (I)



donde

- A se selecciona del grupo que consiste en heterociclilo bicíclico de 9 o 10 miembros, arilo-C₆-C₁₀, heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros y heteroarilo bicíclico de 9 o 10 miembros, preferentemente A se selecciona del grupo que consiste en heterociclo bicíclico de 10 miembros que comprende un átomo de nitrógeno (por ejemplo, dihidroisoquinolinilo, tetrahidroquinolinilo, tetrahidroisoquinolinilo), arilo-C₆-C₁₀ (por ejemplo, fenilo, naftilo), heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros que comprende uno o dos átomos de nitrógeno (por ejemplo, piridinilo, pirimidinilo) y heteroarilo bicíclico de 9 o 10 miembros que comprende uno o dos átomos de nitrógeno (por ejemplo, indolilo, bencimidazolilo, indazolilo);
- R1 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo-C₁-C₆ y -C(=O)R^a donde R^a es como se describe en la presente, preferentemente donde R^a es alquilo-C₁-C₆,
- R2 es hidrógeno o alquilo C₁-C₆;
- n es 0 o 1;
- R3 se selecciona del grupo que consiste en hidroxilo, oxo, alquilo-C₁-C₆, alquilsulfanilo-C₁-C₆, arilsulfanilo, arilsulinilo, alquilsulfonilo-C₁-C₆, arilsulfonilo, carbociclilo, heterociclilo, arilo, heteroarilo, -OC(=O)R^b, -N(R^b)₂, -NR^bC(=O)OR^b, -OC(=O)N(R^b)₂, -C(=NOH)R^b, -C(=NOH)N(R^b)₂, -C(=O)R^b, -C(=O)(OR^b), -C(=O)N(R^b)₂, -C(=O)NR^bN(R^b)₂, -C(=S)N(R^b)₂, -(halo)alquilo-C₁-C₆-NR^bC(=O)OR^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-N(OR^b)C(=O)OR^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆--NR^bC(=O)R^b, -(halo)alquilo-C₁-C₆-N(OR^b)C(=O)R^b y -(halo)alquil-C₁-C₆-arilo, donde cualquier grupo carbociclilo, heterociclilo, arilo y heteroarilo puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R³¹ como se describe en la presente, preferentemente R³¹ se selecciona del grupo que consiste en halógeno, oxo y alquilo-C₁-C₆,
- donde R^b es como se describe en la presente, preferentemente donde R^b se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo-C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆, alquilsulfanilo-C₁-C₆, carbociclilo, arilo, heterociclilo, heteroarilo y -alquil-C₁-C₆-carbociclilo, donde cualquier grupo carbociclilo, arilo, heterociclilo y heteroarilo puede estar sustituido por uno o más sustituyentes R^{b1} como se describe en la presente.

La presente invención también se refiere a cualquier compuesto de fórmula (I) descrito en la Tabla 1.

Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la presente invención pueden usarse como fungicidas (es decir, para controlar hongos fitopatógenos, en particular hongos que provocan enfermedades de la roya u Oomicetos en la protección de cultivos).

Composiciones y formulaciones

La presente invención se refiere además a una composición, en particular una composición para controlar microorganismos indeseados, que comprende uno o más compuestos de fórmula (I). La composición es preferentemente una composición fungicida.

La composición comprende típicamente uno o más compuestos de fórmula (I) y uno o más portadores aceptables, en particular uno o más portadores aceptables para la agricultura.

Un portador es una sustancia sólida o líquida, natural o sintética, orgánica o inorgánica que es generalmente inerte. El portador generalmente mejora la aplicación de los compuestos, por ejemplo, a plantas, partes de la planta o semillas. Ejemplos de *portadores sólidos* adecuados incluyen, de modo no taxativo, sales de amonio, harinas de roca natural, como caolín, arcillas, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita y tierra diatomácea, y harinas de roca sintética, como sílice finamente dividida, alúmina y silicatos. Ejemplos de portadores sólidos típicamente útiles para preparar gránulos incluyen, de modo no taxativo rocas naturales fraccionadas y rotas como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, y dolomita, gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, y gránulos de material orgánico como papel, aserrín, cáscaras de coco, mazorca de maíz y tallo de tabaco. Ejemplos de *portadores líquidos* adecuados incluyen, de modo no taxativo, agua, solventes orgánicos y combinaciones de estos. Ejemplos de *solventes* adecuados incluyen líquidos químicos polares y no polares, por ejemplo de las clases de hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (como ciclohexano, parafinas, alquilbencenos, xileno, alquilnaftalenos de tolueno, hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno), alcoholes y polioles (que pueden opcionalmente estar también sustituidos, eterificados y/o esterificados, como butanol o glicol), cetonas (como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, ésteres (incluidas grasas y aceites) y (poli)éteres, aminas insustituidas o sustituidas, amidas (como dimetilformamida), lactamas (como N-alquilpirrolidonas) y lactonas, sulfonas y sulfóxidos (como dimetil sulfóxido). El portador puede también ser un extensor gaseoso licuado, es decir, líquido que es gaseoso a temperatura estándar y presión estándar, por ejemplo, gases propulsores en aerosol, como halohidrocarburos, butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono. La cantidad de portador típicamente varía de 1 a 99,99 %, preferentemente de 5 a 99,9 %, más preferentemente de 10 a 99,5 %, y con la máxima preferencia de 20 a 99 % en peso de la composición.

La composición puede además comprender uno o más auxiliares aceptables que son habituales para formular composiciones (p. ej. composiciones agroquímicas), como uno o más tensioactivos.

El tensioactivo puede ser un tensioactivo iónico (catiónico o aniónico) o no iónico, como emulsionante(s), formador(es) de espuma, dispersante(s), agente(s) humectante(s) iónicos o no iónicos y cualquier mezcla de estos. Ejemplos de tensioactivos adecuados incluyen, de modo no taxativo, sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno y/o propileno con alcoholes grasos, ácidos grasos o con aminas grasas (ésteres de ácidos grasos de polioxietileno, éteres de alcohol graso de polioxietileno, por ejemplo éteres de alquilaril poliglicol), fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfosuccínicos, derivados de taurina (preferentemente tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polietoxilados, ésteres grasos de polioles, y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos, fosfatos (por ejemplo alquilsulfonatos, alquil sulfatos, arilsulfonatos) e hidrolisados de proteína, licores de residuo de lignosulfito y metilcelulosa. Un tensioactivo se usa típicamente cuando el compuesto de fórmula (I) y/o el portador es insoluble en agua y la aplicación se hace con agua. Entonces, la cantidad de

tensioactivos típicamente varía de 5 a 40 % en peso de la composición.

Ejemplos adicionales de auxiliares que son habituales para formular composiciones agroquímicas incluyen hidrófugos, secantes, aglutinantes (adhesivo, espesante, agente de fijación, como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex, como goma arábica, polivinil alcohol y polivinil acetato, fosfolípidos naturales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos, polivinilpirrolidona, polivinil acetato, polivinil alcohol y tilosa), espesantes, estabilizantes (p. ej. estabilizantes fríos, conservantes, antioxidantes, estabilizantes livianos, u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física), tintes o pigmentos (como pigmentos inorgánicos, p. ej. óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia; tintes orgánicos, p. ej. alizarina, azo y tintes de metal ftalocianina), antiespumantes (p. ej. antiespumantes de silicona y estearato de magnesio), conservantes (p. ej. diclorofeno y bencil alcohol hemiformal), espesantes secundarios (derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantana, arcillas modificadas y sílice finamente dividida), adhesivos, giberelinas y auxiliares de procesamiento, aceites minerales y vegetales, perfumes, ceras, nutrientes (que incluye nutrientes traza, como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc), coloides protectores, sustancias tixotrópicas, penetrantes, agentes secuestrantes y formadores de complejos.

La elección de los auxiliares se refiere al modo deseado de aplicación del compuesto de fórmula (I) y/o a las propiedades físicas. Asimismo, los auxiliares pueden elegirse para impartir propiedades particulares (propiedades técnicas, físicas y/o biológicas) a las composiciones o formas de uso preparadas a partir de estos. La elección de auxiliares puede permitir personalizar las composiciones a las necesidades específicas.

La composición de la invención puede estar en cualquier forma habitual, como soluciones (p. ej., soluciones acuosas), emulsiones, polvos humectantes, suspensiones a base de agua y aceite, polvos, polvillos, pastas, polvos solubles, gránulos solubles, gránulos para esparcir, concentrados de suspoemulsión, productos naturales o sintéticos impregnados con el compuesto de la invención, fertilizantes y también microencapsulados en sustancias poliméricas. El compuesto de la invención puede estar presente en forma suspendida, emulsionada o disuelta.

La composición de la invención puede proveerse al usuario final como formulación lista para usar, es decir las composiciones pueden aplicarse directamente a las plantas o semillas por un dispositivo adecuado, como un dispositivo de dispersión o pulverización. De manera alternativa, las composiciones pueden proveerse al usuario final en forma de concentrados que deben diluirse, preferentemente con agua, antes de usarse.

La composición de la invención puede prepararse de maneras convencionales, por ejemplo mezclando el compuesto de la invención con uno o más auxiliares adecuados, como los descritos anteriormente en la presente.

La composición de acuerdo con la invención contiene generalmente de 0,01 a 99 % en peso, de 0,05 a 98 % en peso, preferentemente de 0,1 a 95 % en peso, más preferentemente de 0,5 a 90 % en peso, con la máxima preferencia de 1 a 80 % en peso del compuesto de la invención.

El compuesto y la composición de la invención pueden mezclarse con otros ingredientes activos como fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas, insecticidas, herbicidas, fertilizantes, reguladores del crecimiento, protectores o semioquímicos. Esto puede permitir ampliar el espectro de actividad o prevenir el desarrollo de resistencia. Ejemplos de fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas y bactericidas conocidos se describen en el Pesticide Manual, 17a edición.

10 Ejemplos de fungicidas especialmente preferidos que se pueden mezclar con el compuesto y la composición de la invención son:

- 1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1.001) ciproconazol, (1.002) difenoconazol, (1.003) epoxiconazol, (1.004) fenhexamid, (1.005) fenpropidin, (1.006) fenpropimorf, (1.007) fenpirazamina, (1.008) fluquinconazol, (1.009) flutriafol, (1.010) imazalil, (1.011) imazalil sulfato, (1.012) ipconazol, (1.013) metconazol, (1.014) miclobutanil, (1.015) paclobutrazol, (1.016) procloraz, (1.017) propiconazol, (1.018) protioconazol, (1.019) Pirisoxazol, (1.020) espiroxamina, (1.021) tebuconazol, (1.022) tetraconazol, (1.023) triadimenol, (1.024) tridemorf, (1.025) triticonazol, (1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1.028) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.029) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.030) (2R)-2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.031) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.032) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.033) (2S)-2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.034) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.035) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.036) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1.037) 1-[(2R,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il]metil)-1H-1,2,4-triazol, (1.038) 1-[(2S,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il]metil)-1H-1,2,4-triazol, (1.039) 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1.040) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1.041) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1.042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-

hidrox-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.050) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-
 hidrox-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.051) 2-[2-cloro-4-(2,4-
 diclorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.052) 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-
 1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.053) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-
 5 il)butan-2-ol, (1.054) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol,
 (1.055) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.056) 2-[[3-(2-
 clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.057) 2-
 [[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona,
 (1.058) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazole-
 10 3-tione, (1.059) 5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)metil)ciclopentanol,
 (1.060) 5-(alilsulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.061)
 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol,
 (1.062) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-
 triazol, (1.063) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-
 15 metilimidoformamida, (1.064) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-
 metilimidoformamida, (1.065) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(2,2,3,3-tetrafluoropropoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-
 N-metilimidoformamida, (1.066) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(pentafluoroetoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-
 metilimidoformamida, (1.067) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(1,1,2,2-tetrafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-
 metilimidoformamida, (1.068) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-
 20 metilimidoformamida, (1.069) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,3,3-tetrafluoropropil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-
 N-metilimidoformamida, (1.070) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(pentafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-
 metilimidoformamida, (1.071) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.072) N'-(4-
 [[3-(difluorometoxi)fenil]sulfanil]-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.073) N'-(4-{3-
 [(difluorometil)sulfanil]fenoxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.074) N'-[5-bromo-6-
 25 (2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.075) N'-[4-{(4,5-
 dicloro-1,3-tiazol-2-il)oxi}-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.076) N'-[5-bromo-6-[(1R)-1-
 (3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.077) N'-[5-bromo-6-[(1S)-1-
 (3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.078) N'-[5-bromo-6-[(cis-4-
 isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.079) N'-[5-bromo-6-[(trans-
 30 4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.080) N'-[5-bromo-6-[1-
 (3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (1.081) Mefentrifluconazol,
 (1.082) Ipentrifluconazol, (1.083) 2-[6-(4-bromofenoxi)-2-(trifluorometil)-3-piridil]-1-(1,2,4-triazol-1-
 il)propan-2-ol, (1.084) 2-[6-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)-3-piridil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol,
 (1.085) 3-[2-(1-clorociclopropil)-3-(3-cloro-2-fluoro-fenil)-2-hidrox-propil]imidazol-4-carbonitrilo, (1.086)
 35 4-[[6-[rac-(2R)-2-(2,4-difluorofenil)-1,1-difluoro-2-hidrox-3-(5-tioxo-4H-1,2,4-triazol-1-il)propil]-3-
 piridil]oxi]benzonitrilo.

2) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II, por ejemplo (2.001) benzovindiflupir,
 (2.002) bixafen, (2.003) boscalid, (2.004) carboxin, (2.005) fluopiram, (2.006) flutolanil, (2.007)
 40 fluxaproxad, (2.008) furametpir, (2.009) Isofetamid, (2.010) isopirazam (enantiómero anti-epimérico
 1R,4S,9S), (2.011) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2.012) isopirazam (racemato

anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.013) isopirazam (mezcla de racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS y racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.014) isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1R,4S,9R), (2.015) isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1S,4R,9S), (2.016) isopirazam (racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2.017) penflufen, (2.018) pentiopirad, (2.019) pidiflumetofen, (2.020) Piraziflumid, (2.021) sedaxano, (2.022) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.023) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.024) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.025) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.026) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (2.027) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.028) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.029) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.030) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.031) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.032) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.033) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[(4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi)fenil]etil]quinazolin-4-amina, (2.034) N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.035) N-(2-terc-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.036) N-(2-terc-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.037) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.038) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.039) N-[(1R,4S)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.040) N-[(1S,4R)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.041) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.042) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.043) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.044) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.045) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.046) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.047) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.048) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.049) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.050) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.051) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.052) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.053) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.054) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.055) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-

(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida, (2.056) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazolo-4-carboxamida.

3) Inhibidores de la cadena respiratoria en complejo III, por ejemplo (3.001) ametocradin, (3.002) amisulbrom, (3.003) azoxistrobin, (3.004) coumetoxistrobin, (3.005) coumoxistrobin, (3.006) ciazofamid, (3.007) dimoxistrobin, (3.008) enoxastrobin, (3.009) famoxadona, (3.010) fenamidona, (3.011) flufenoxistrobin, (3.012) fluoxastrobin, (3.013) kresoxim-metilo, (3.014) metominostrobin, (3.015) orysastrobin, (3.016) picoxistrobin, (3.017) piraclostrobin, (3.018) pirametostrobin, (3.019) piraoxistrobin, (3.020) trifloxistrobin, (3.021) (2E)-2-{2-[[[(1E)-1-(3-[[[(E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.022) (2E,3Z)-5-[[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.025) (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il]carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-il 2-metilpropanoato (nombre común: fempicoxamid), (3.026) 2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.027) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2-hidroxibenzamida, (3.028) (2E,3Z)-5-[[1-(4-cloro-2-fluorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3.029) metil {5-[3-(2,4-dimetilfenil)-1H-pirazol-1-il]-2-metilbenzil}carbamato, (3.030) (1S)-2,2-bis(4-fluorofenil)-1-metiletil N-[[3-(acetiloxi)-4-metoxi-2-piridil]carbonil]-L-alaninato, (3.031) flirilpicoxamid.

20

4) Inhibidores de la mitosis y división celular, por ejemplo (4.001) carbendazim, (4.002) dietofencarb, (4.003) etaboxam, (4.004) fluopicolida, (4.005) pencicuron, (4.006) tiabendazol, (4.007) tiofanato-metilo, (4.008) zoxamida, (4.009) 3-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-6-metil-5-fenilpiridazina, (4.010) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (4.011) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina, (4.012) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.013) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.014) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.015) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.016) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.017) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.018) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.019) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.020) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.021) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.022) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (4.023) N-(2-bromo-6-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.024) N-(2-bromofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4.025) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina.

5) Compuestos capaces de tener una acción multisitio, por ejemplo (5.001) mezcla bordeaux, (5.002) captafol, (5.003) captan, (5.004) clorotalonil, (5.005) hidróxido de cobre (5.006) naftenato de cobre, (5.007) óxido de cobre, (5.008) oxiclورو de cobre, (5.009) sulfato de cobre(2+), (5.010) ditianon,

- (5.011) dodina, (5.012) folpet, (5.013) mancozeb, (5.014) maneb, (5.015) metiram, (5.016) zinc metiram, (5.017) oxina-cobre, (5.018) propineb, (5.019) azufre y preparaciones de azufre que incluyen polisulfuro de calcio, (5.020) tiram, (5.021) zineb, (5.022) ziram, (5.023) 6-etil-5,7-dioxo-6,7-dihidro-5H-pirrol[3',4':5,6][1,4]ditiino[2,3-c][1,2]tiazol-3-carbonitrilo.
- 5 6) Compuestos capaces de inducir una defensa de hospedador, por ejemplo (6.001) acibenzolar-S-metilo, (6.002) isotianilo, (6.003) probenazol, (6.004) tiadinil.
- 7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y/o proteínas, por ejemplo (7.001) ciprodinil, (7.002) kasugamicina, (7.003) kasugamicina clorhidrato hidrato, (7.004) oxitetraciclina, (7.005) pirimetanilo, 10 (7.006) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina.
- 8) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo (8.001) siltiofam.
- 15 9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, por ejemplo (9.001) bentiavalicarb, (9.002) dimetomorf, (9.003) flumorf, (9.004) iprovalicarb, (9.005) mandipropamid, (9.006) pirimorph, (9.007) valifenalato, (9.008) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (9.009) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona.
- 20 10) Inhibidores de la síntesis de membrana y lípidos, por ejemplo (10.001) propamocarb, (10.002) propamocarb clorhidrato, (10.003) tolclofos-metilo.
- 11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo (11.001) triciclazol, (11.002) 2,2,2-trifluoroetil {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbamato.
- 25 12) Inhibidores de la síntesis de ácido nucleico, por ejemplo (12.001) benalaxil, (12.002) benalaxil-M (kiralaxil), (12.003) metalaxil, (12.004) metalaxil-M (mefenoxam).
- 13) Inhibidores de la transducción de señal, por ejemplo (13.001) fludioxonil, (13.002) iprodiona, 30 (13.003) procimidona, (13.004) proquinazid, (13.005) quinoxifen, (13.006) vinclozolin.
- 14) Compuestos capaces de actuar como desacoplador, por ejemplo (14.001) fluazinam, (14.002) meptildinocap.
- 35 15) Compuestos adicionales, por ejemplo (15.001) ácido abscísico, (15.002) bentiazol, (15.003) betoxazina, (15.004) capsimicina, (15.005) carvona, (15.006) quinometionat, (15.007) cufraneb, (15.008) ciflufenamid, (15.009) cimoxanil, (15.010) ciprosulfamida, (15.011) flutianilo, (15.012) fosetil-aluminio, (15.013) fosetil-calcio, (15.014) fosetil-sodio, (15.015) metil isotiocianato, (15.016) metrafenona, (15.017) mildiomicina, (15.018) natamicina, (15.019) níquel dimetilditiocarbamato, 40 (15.020) nitrotal-isopropilo, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxatiapirolina, (15.023) oxifentiina, (15.024) pentaclorofenol y sales, (15.025) ácido fosforoso y sus sales, (15.026) propamocarb-

fosetilato, (15.027) piriofenona (clazafenona) (15.028) tebufloquina, (15.029) tecloftalam, (15.030) tolnifanida, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.033) 2-(6-bencilpiridin-2-il)quinazolina, (15.034) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrolo-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.035) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.036) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.037) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.038) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.039) 2-[(5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15.040) 2-[(5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15.041) 2-[2-[(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]-6-fluorofenil]propan-2-ol, (15.042) 2-[2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]fenil]propan-2-ol, (15.043) 2-[3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metanosulfonato, (15.044) 2-[3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]fenil metanosulfonato, (15.045) 2-fenilfenol y sales, (15.046) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.047) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.048) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomética: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.049) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butanoico, (15.050) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.051) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofeno 2-sulfonohidrazida, (15.052) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.053) 5-fluoro-2-[(4-metilbencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.054) 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(quinolin-3-il)-2,3-dihidro-1,4-benzoxazepina, (15.055) but-3-in-1-ilo {6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato, (15.056) (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato de etilo, (15.057) ácido fenazina-1-carboxílico, (15.058) 3,4,5-trihidroxibenzoato de propilo, (15.059) quinolin-8-ol, (15.060) quinolin-8-ol sulfato (2:1), (15.061) {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbamato de terc-butilo, (15.062) 5-fluoro-4-imino-3-metil-1-[(4-metilfenil)sulfonil]-3,4-dihidropirimidin-2(1H)-ona, (15.063) Metiltetraprole, (15.064) Aminopirifen, (15.065) Pirapropoyne, (15.066) (N'-[2-cloro-4-(2-fluorofenoxi)-5-metilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida), (15.067) (N'-[2-cloro-5-metil-4-fenoxifenil]-N-etil-N-metilimidoformamida), (15.068) (2-[2-[(7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-il)oxi]-6-fluorofenil]propan-2-ol), (15.069) (5-bromo-1-(5,6-dimetilpiridin-3-il)-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolina), (15.070) (3-(4,4-difluoro-5,5-dimetil-4,5-dihidrotieno[2,3-c]piridin-7-il)quinolina), (15.071) (1-(4,5-dimetil-1H-bencimidazol-1-il)-4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolina), (15.072) 8-fluoro-3-(5-fluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolona, (15.073) 8-fluoro-3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolona, (15.074) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)-8-fluoroquinolina, (15.075) (N-metil-N-fenil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida), (15.076) (metil {4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil}carbamato), (15.077) (N-{4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencil}ciclopropanecarboxamida), (15.078) N-metil-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-

il]benzamida, (15.079) N-[(E)-metoxiiminometil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida, (15.080) N-[(Z)-metoxiiminometil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida, (15.081) N-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]ciclopropanocarboxamida, (15.082) N-(2-fluorofenil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida, (15.083) 2,2-difluoro-N-metil-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida, (15.084) N-allyl-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]acetamida, (15.085) N-[(E)-N-metoxi-C-metil-carbonimidoil]-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida, (15.086) N-[(Z)-N-metoxi-C-metil-carbonimidoil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida, (15.087) N-allyl-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]propanamida, (15.088) 4,4-dimetil-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]pirrolidin-2-ona, (15.089) N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencenocarboxamida, (15.090) 5-metil-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]pirrolidin-2-ona, (15.091) N-((2,3-difluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil)-3,3,3-trifluoro-propanamida, (15.092) 1-metoxi-1-metil-3-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea, (15.093) 1,1-dietil-3-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea, (15.094) N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]propanamida, (15.095) N-metoxi-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]ciclopropanocarboxamida, (15.096) 1-metoxi-3-metil-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea, (15.097) N-metoxi-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]ciclopropanocarboxamida; (15.098) N,2-dimetoxi-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]propanamida, (15.099) N-etil-2-metil-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]propanamida, (15.100) 1-metoxi-3-metil-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea, (15.101) 1,3-dimetoxi-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea, (15.102) 3-etil-1-metoxi-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea, (15.103) 1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]piperidin-2-ona, (15.104) 4,4-dimetil-2-[[4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]isoxazolidin-3-ona, (15.105) 5,5-dimetil-2-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]isoxazolidin-3-ona, (15.106) 3,3-dimetil-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]piperidin-2-ona, (15.107) 1-[[3-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]azepan-2-ona, (15.108) 4,4-dimetil-2-[[4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]isoxazolidin-3-ona y (15.109) 5,5-dimetil-2-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]isoxazolidin-3-ona, (15.110) etil (1-{4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencil}-1H-pirazol-4-il)acetato, (15.111) N,N-dimetil-1-{4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencil}-1H-1,2,4-triazol-3-amina, (15.112) N-{2,3-difluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencil}butanamida.

Todos los compañeros de mezcla mencionados de las clases (1) a (15) como se describe anteriormente pueden estar presentes en forma del compuesto libre y/o, si sus grupos funcionales lo permiten, una sal aceptable para la agricultura de este.

Los compuestos de fórmula (I) y las composiciones que los comprenden también pueden combinarse con uno o más agentes de control biológico.

Ejemplos de agentes de control biológico que pueden combinarse con los compuestos de fórmula (I) y las composiciones que los comprenden son:

(A) Agentes antibacterianos que se seleccionan del grupo de:

(A1) bacterias, como (A1.1) *Bacillus subtilis*, en particular cepa QST713/AQ713 (disponible como
5 SERENADE OPTI o SERENADE ASO de Bayer CropScience LP, US, con n.º de acceso NRRL B21661 y descrito en la patente estadounidense n.º 6,060,051); (A1.2) *Bacillus amyloliquefaciens*, en particular cepa D747 (disponible como Double Nickel™ de Certis, US, con número de acceso FERM BP-8234 y divulgado en la patente estadounidense n.º 7,094,592); (A1.3) *Bacillus pumilus*, en particular cepa BU F-33 (con n.º de acceso NRRL 50185); (A1.4) *Bacillus subtilis* var.
10 *amyloliquefaciens* cepa FZB24 (disponible como Taegro® de Novozymes, US); (A1.5) una cepa *Paenibacillus* sp. con n.º de acceso NRRL B-50972 o n.º de acceso NRRL B-67129 y descrito en la publicación de patente internacional n.º WO 2016/154297; y

(A2) hongos, como (A2.1) *Aureobasidium pullulans*, en particular blastosporas de cepa DSM14940; (A2.2) *Aureobasidium pullulans* blastosporas de cepa DSM 14941; (A2.3) *Aureobasidium pullulans*, en particular mezclas de blastosporas de cepas DSM14940 y DSM14941;
15

(B) Fungicidas que se seleccionan del grupo de:

(B1) bacterias, por ejemplo (B1.1) *Bacillus subtilis*, en particular cepa QST713/AQ713 (disponible como SERENADE OPTI o SERENADE ASO de Bayer CropScience LP, US, con n.º de acceso NRRL B21661 y descrito en la patente estadounidense n.º 6,060,051); (B1.2) *Bacillus pumilus*, en particular
20 cepa QST2808 (disponible como SONATA® de Bayer CropScience LP, US, con n.º de acceso NRRL B-30087 y descrito en la patente estadounidense n.º 6,245,551); (B1.3) *Bacillus pumilus*, en particular cepa GB34 (disponible como Yield Shield® de Bayer AG, DE); (B1.4) *Bacillus pumilus*, en particular cepa BU F-33 (con n.º de acceso NRRL 50185); (B1.5) *Bacillus amyloliquefaciens*, en particular cepa D747 (disponible como Double Nickel™ de Certis, US, con número de acceso FERM BP-8234 y
25 descrito en la patente estadounidense n.º 7,094,592); (B1.6) *Bacillus subtilis* Y1336 (disponible como BIOBAC® WP de Bion-Tech, Taiwan, registrado como fungicida biológico en Taiwán con los n.º de registro 4764, 5454, 5096 y 5277); (B1.7) cepa *Bacillus amyloliquefaciens* MBI 600 (disponible como SUBTILEX de BASF SE); (B1.8) cepa *Bacillus subtilis* GB03 (disponible como Kodiak® de Bayer AG, DE); (B1.9) cepa *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* FZB24 (disponible de Novozymes Biologicals
30 Inc., Salem, Virginia o Syngenta Crop Protection, LLC, Greensboro, North Carolina como el fungicida TAEGRO® o TAEGRO® ECO (n.º de registro EPA 70127-5); (B1.10) *Bacillus mycoides*, aislado J (disponible como BmJ TGAI o WG de Certis USA); (B1.11) *Bacillus licheniformis*, en particular cepa SB3086 (disponible como EcoGuard TM Biofungicide y Green Releaf de Novozymes); (B1.12) una cepa *Paenibacillus* sp. con n.º de acceso NRRL B-50972 o n.º de acceso NRRL B-67129 y descrito
35 en la publicación de patente internacional n.º WO 2016/154297.

En algunas modalidades, el agente de control biológico es una cepa *Bacillus subtilis* o *Bacillus amyloliquefaciens* que produce un compuesto de tipo fengicina o plipastatina, un compuesto de tipo iturina, y/o un compuesto de tipo tensioactivo. Por antecedentes, véase el siguiente artículo de revisión: Ongena, M., et al., “*Bacillus* Lipopeptides: Versatile Weapons for Plant Disease Biocontrol,” Trends in Microbiology, tomo 16, No. 3, marzo de 2008, pp. 115-125. Las cepas *Bacillus* capaces de producir lipopéptidos incluyen *Bacillus subtilis* QST713 (disponible como SERENADE OPTI o SERENADE ASO de Bayer CropScience LP, US, con n.º de acceso NRRL B21661 y descrito en la patente estadounidense n.º 6,060,051), *Bacillus amyloliquefaciens* cepa D747 (disponible como Double Nickel™ de Certis, US, con número de acceso FERM BP-8234 y descrito en la patente estadounidense n.º 7,094,592); *Bacillus subtilis* MBI600 (disponible como SUBTILEX® de Becker Underwood, EUA n.º de reg. EPA 71840-8); *Bacillus subtilis* Y1336 (disponible como BIOBAC® WP de Bion-Tech, Taiwán, registrado como fungicida biológico en Taiwán con los n.º de registro 4764, 5454, 5096 y 5277); *Bacillus amyloliquefaciens*, en particular la cepa FZB42 (disponible como RHIZOVITAL® de ABITEP, DE); y *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* FZB24 (disponible como Novozymes Biologicals Inc., Salem, Virginia o Syngenta Crop Protection, LLC, Greensboro, Carolina del Norte como el fungicida TAEGRO® o TAEGRO® ECO (n.º de registro EPA 70127-5); y

(B2) hongos, por ejemplo: (B2.1) *Coniothyrium minitans*, en particular cepa CON/M/91-8 (n.º acceso DSM-9660; p. ej. Contans ® de Bayer); (B2.2) *Metschnikowia fructicola*, en particular cepa NRRL Y-30752 (p. ej. Shemer®); (B2.3) *Microsphaeropsis ochracea* (p. ej. Microx® de Prophyta); (B2.5) *Trichoderma* spp., que incluye *Trichoderma atroviride*, cepa SC1 descrita en la solicitud internacional n.º PCT/IT2008/000196); (B2.6) *Trichoderma harzianum rifai* cepa KRL-AG2 (también denominada cepa T-22, /ATCC 208479, p. ej. PLANTSHIELD T-22G, Rootshield®, y TurfShield de BioWorks, US); (B2.14) *Gliocladium roseum*, cepa 321U de W.F. Stoneman Company LLC; (B2.35) *Talaromyces flavus*, cepa V117b; (B2.36) *Trichoderma asperellum*, cepa ICC 012 de Isagro; (B2.37) *Trichoderma asperellum*, cepa SKT-1 (p. ej. ECO-HOPE® de Kumiai Chemical Industry); (B2.38) *Trichoderma atroviride*, cepa CNCM I-1237 (p. ej. Esquive® WP de Agrauxine, FR); (B2.39) *Trichoderma atroviride*, cepa n.º V08/002387; (B2.40) *Trichoderma atroviride*, cepa NMI n.º V08/002388; (B2.41) *Trichoderma atroviride*, cepa NMI n.º V08/002389; (B2.42) *Trichoderma atroviride*, cepa NMI n.º V08/002390; (B2.43) *Trichoderma atroviride*, cepa LC52 (p. ej. Tenet por Agrimm Technologies Limited); (B2.44) *Trichoderma atroviride*, cepa ATCC 20476 (IMI 206040); (B2.45) *Trichoderma atroviride*, cepa T11 (IMI352941/ CECT20498); (B2.46) *Trichoderma harmatum*; (B2.47) *Trichoderma harzianum*; (B2.48) *Trichoderma harzianum rifai T39* (p. ej. Trichodex® de Makhteshim, US); (B2.49) *Trichoderma harzianum*, en particular, cepa KD (p. ej. Trichoplus de Biological Control Products, SA (adquirido por Becker Underwood)); (B2.50) *Trichoderma harzianum*, cepa ITEM 908 (p. ej. Trianum-P de Koppert); (B2.51) *Trichoderma harzianum*, cepa TH35 (p. ej. Root-Pro por Mycontrol); (B2.52) *Trichoderma virens* (también denominado *Gliocladium virens*), en particular cepa GL-21 (p. ej. SoilGard 12G por Certis, US); (B2.53) *Trichoderma viride*, cepa TV1(p. ej. Trianum-P por Koppert); (B2.54) *Ampelomyces quisqualis*, en particular cepa AQ 10 (p. ej. AQ 10® por IntrachemBio Italia); (B2.56) *Aureobasidium pullulans*, en particular blastosporas de cepa DSM14940; (B2.57) *Aureobasidium pullulans*, en particular blastosporas de cepa DSM 14941; (B2.58) *Aureobasidium pullulans*, en

particular mezclas de blastosporas de cepas DSM14940 y DSM 14941 (p. ej. Botector® por bio-ferm, CH); (B2.64) *Cladosporium cladosporioides*, cepa H39 (por Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek); (B2.69) *Gliocladium catenulatum* (sinónimo: *Clonostachys rosea f. catenulate*) cepa J1446 (p. ej. Prestop® por AgBio Inc. y también p. ej. Primastop® por Kemira Agro Oy); (B2.70) 5 *Lecanicillium lecanii* (anteriormente conocido como *Verticillium lecanii*) conidia de cepa KV01 (p. ej. Vertalec® por Koppert/Arysta); (B2.71) *Penicillium vermiculatum*; (B2.72) *Pichia anomala*, cepa WRL-076 (NRRL Y-30842); (B2.75) *Trichoderma atroviride*, cepa SKT-1 (FERM P-16510); (B2.76) *Trichoderma atroviride*, cepa SKT-2 (FERM P-16511); (B2.77) *Trichoderma atroviride*, cepa SKT-3 (FERM P-17021); (B2.78) *Trichoderma gamsii* (anteriormente *T. viride*), cepa ICC080 (IMI CC 392151 10 CABI, p. ej. BioDerma por AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V.); (B2.79) *Trichoderma harzianum*, cepa DB 103 (p. ej., T-Gro 7456 por Dagutut Biolab); (B2.80) *Trichoderma polysporum*, cepa IMI 206039 (p. ej. Binab TF WP por BINAB Bio-Innovation AB, Suecia); (B2.81) *Trichoderma stromaticum* (p. ej. Tricovab por Ceplac, Brasil); (B2.83) *Ulocladium oudemansii*, en particular cepa HRU3 (p. ej. Botry-Zen® por Botry-Zen Ltd, NZ); (B2.84) *Verticillium albo-atrum* (anteriormente *V. 15 dahliae*), cepa WCS850 (CBS 276.92; p. ej. Dutch Trig por Tree Care Innovations); (B2.86) *Verticillium chlamydosporium*; (B2.87) mezclas de *Trichoderma asperellum* cepa ICC 012 y *Trichoderma gamsii* cepa ICC 080 (producto conocido como p. ej. BIO-TAM™ de Bayer CropScience LP, US).

Otros ejemplos de agentes de control biológico que pueden combinarse con los compuestos de fórmula (I) y las composiciones que los comprenden son:

20 bacterias seleccionadas del grupo que consiste en *Bacillus cereus*, en particular *B. cereus* cepa CNCM I-1562 y *Bacillus firmus*, cepa I-1582 (número de acceso CNCM I-1582), *Bacillus subtilis* cepa OST 30002 (n.º acceso NRRL B-50421), *Bacillus thuringiensis*, en particular *B. thuringiensis* subespecie *israelensis* (serotipo H-14), cepa AM65-52 (n.º acceso ATCC 1276), *B. thuringiensis* subsp. *aizawai*, en particular cepa ABTS-1857 (SD-1372), *B. thuringiensis* subsp. *kurstaki* cepa HD-1, 25 *B. thuringiensis* subsp. *tenebrionis* cepa NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp.* (Nemátodo de *Rotylenchulus reniformis*)-PR3 (n.º acceso ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* cepa AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550) y *Streptomyces galbus* cepa AQ 6047 (n.º acceso NRRL 30232);

hongos y levaduras seleccionados del grupo que consiste en *Beauveria bassiana*, en particular cepa 30 ATCC 74040, *Lecanicillium spp.*, en particular cepa HRO LEC 12, *Metarhizium anisopliae*, en particular cepa F52 (DSM3884 o ATCC 90448), *Paecilomyces fumosoroseus* (ahora: *Isaria fumosorosea*), en particular cepa IFPC 200613, o cepa Apopka 97 (n.º de acceso ATCC 20874), y *Paecilomyces lilacinus*, en particular *P. lilacinus* cepa 251 (AGAL 89/030550);

35 virus seleccionados del grupo que consiste en *Adoxophyes orana* (tortrix de fruta de verano) virus granulosis (GV), *Cydia pomonella* (polilla del manzano) virus granulosis (GV), *Helicoverpa armigera* (gusano cogollero) virus de la polihedrosis nuclear (NPV), *Spodoptera exigua* (gusano soldado)

mNPV, *Spodoptera frugiperda* (cogollero del maíz) mNPV, y *Spodoptera littoralis* (rosquilla negra) NPV.

bacterias y hongos que pueden agregarse como "inoculante" para plantas o partes de plantas u órganos de plantas y que, en virtud de sus propiedades particulares, promueven el crecimiento de las plantas y la salud de las plantas. Ejemplos son: *Agrobacterium spp.*, *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum spp.*, *Azotobacter spp.*, *Bradyrhizobium spp.*, *Burkholderia spp.*, en particular *Burkholderia cepacia* (anteriormente conocido como *Pseudomonas cepacia*), *Gigaspora spp.*, o *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorius*, *Pseudomonas spp.*, *Rhizobium spp.*, en particular *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon spp.*, *Scleroderma spp.*, *Suillus spp.*, y *Streptomyces spp.*

extractos de plantas y productos formados por microorganismos que incluyen proteínas y metabolitos secundarios que pueden usarse como agentes de control biológico, como *Allium sativum*, *Artemisia absinthium*, azadiractina, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, quitina, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (extracto de saponina *Chenopodium quinoa*), *Pyrethrum/Pyrethrins*, *Quassia amara*, *Quercus*, *Quillaja*, Regalia, "Requiem™ Insecticide", rotenona, *ryania/rianodina*, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, timol, Triact 70, TriCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, Veratrin, *Viscum album*, extracto *Brassicaceae*, en particular polvo de colza oleaginosa o polvo de mostaza.

Ejemplos de insecticidas, acaricidas y nematocidas, respectivamente, que podrían mezclarse con los compuestos de fórmula (I) y las composiciones que los comprenden son:

(1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE), como, por ejemplo, carbamatos, por ejemplo alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomyl, metolcarb, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; u organofosfatos, por ejemplo acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos-metilo, coumafos, cianofos, demeton-S-metilo, diazinon, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotrion, fention, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, isopropil O-(metoxiaminotiofosforilo) salicilato, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration-metilo, fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclofos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclorfon y vamidotion.

(2) Bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA, como, por ejemplo, ciclodieno-organocloruros, por ejemplo, clordano y endosulfan o fenilpirazolos (fipros), por ejemplo etiprol y fipronil.

- (3) Moduladores del canal de sodio, como, por ejemplo piretroides, p. ej. acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, isómero de bioaletrina s-ciclopentenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cialotrina, lambda-cialotrina, gamma-cialotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina
- 5 [(1R)-trans-isómero], deltametrina, empentrina [(EZ)-(1R)-isómero], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kadetrina, momfluorotrina, permetrina, fenotrina [(1R)-trans-isómero], praletrina, piretrinas (piretrum), resmetrina, silafluofen, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [(1R) isómero], tralometrina y transflutrina o DDT o metoxiclor.
- 10 (4) Moduladores competitivos del receptor acetilcolina nicotínico (nAChR), como, por ejemplo, neonicotinoides, p. ej. acetamiprid, clotianidina, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflor o flupiradifurona.
- (5) Moduladores alostéricos del receptor acetilcolina nicotínico (nAChR), como, por ejemplo, espinosinas, p. ej. espinetoram y espinosad.
- 15 (6) Moduladores alostéricos del canal de cloruro controlados por glutamato (GluCl), como, por ejemplo, avermectinas/milbemecinas, por ejemplo abamectina, emamectina benzoato, lepimectina y milbemectina.
- (7) Imitadores de la hormona juvenil, como, por ejemplo, análogos de la hormona juvenil, p. ej. hidropreno, kinopreno y metopreno o fenoxicarb o piriproxifen.
- 20 (8) Inhibidores no específicos diversos (multi-sitio), como, por ejemplo alquil haluros, por ejemplo metil bromuro y otros alquil haluros; o cloropirina o sulfuril fluoruro o bórax o tártaro emético o generadores de metil isocianato, por ejemplo diazomet y metam.
- (9) Moduladores de órganos cordotonaes, como, por ejemplo pimetrozina o flonicamid.
- (10) Inhibidores del crecimiento de ácaros, como, por ejemplo clofentezina, hexitiazox y diflovidazin o
- 25 etoxazol.
- (11) Alteradores microbianos de la membrana intestinal de insectos, como, por ejemplo *Bacillus thuringiensis* subespecie *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *tenebrionis*, y proteínas de plantas *B.t.*: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb,
- 30 Cry34Ab1/35Ab1.

- (12) Inhibidores de ATP sintasa mitocondrial, como, disruptores de ATP, como, por ejemplo, compuestos de diafentiuron u organoestánicos, por ejemplo óxido de azociclotina, cihexatina y fenbutatina o propargita o tetradifon.
- 5 (13) Desacopladores de fosforilación oxidativa por disrupción del gradiente de protones, como, por ejemplo, clorfenapir, DNOC y sulfluramid.
- (14) Bloqueadores del canal de receptor de acetilcolina nicotínica, receptor de acetilcolina nicotinérgica tales como, por ejemplo, bensultap, cartap clorhidrato, tiocilam, y tiosultap-sodio.
- 10 (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, como por ejemplo, bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron y triflumuron.
- (16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, por ejemplo buprofezina.
- (17) Disruptores de muda (en particular para Díptera, es decir dípteros) como, por ejemplo, ciromazina.
- 15 (18) Agonistas del receptor de ecdisona como, por ejemplo, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.
- (19) Agonistas del receptor de octopamina, como, por ejemplo, amitraz.
- (20) Inhibidores del transporte de electrones de complejo III mitocondrial, como, por ejemplo hidrametilnona o acequinocilo o fluacripirim.
- 20 (21) Inhibidores del transporte de electrones de complejo I mitocondrial, como, por ejemplo del grupo de los acaricidas METI, p. ej. fenazaquin, fenpiroximato, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona (Derris).
- (22) Bloqueadores del canal de sodio dependientes del voltaje, como, por ejemplo indoxacarb o metaflumizona.
- 25 (23) Inhibidores de acetil CoA carboxilasa como, por ejemplo, derivados de ácido tetrónico y tetrámico, p. ej., espiroclufen, espiromesifen y espirotetramat.

(24) Inhibidores del transporte de electrones del complejo IV mitocondrial, como, por ejemplo fosfinas, p. ej. fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de zinc, o cianuros, p. ej. cianuro de calcio, cianuro de potasio y cianuro de sodio.

5 (25) Inhibidores del transporte de electrones del complejo II mitocondrial, como, por ejemplo derivados de beta-cetonitrilo, por ejemplo cienopirafen y ciflumetofen y carboxanilidas, como, por ejemplo, piflubumida.

(28) Moduladores del receptor de rianodina, como, por ejemplo, diamidas, p. ej. clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida,

10 otros compuestos activos como, por ejemplo, Afidopiropen, Afoxolaner, Azadiractina, Bencloctiaz, Benzoximato, Bifenazato, Broflanilida, Bromopropilato, Quinometionato, Cloropraetrina, Criolita, Ciclaniliprol, Cicloxaprid, Cihalodiamida Dicloromezotiaz, Dicofol, epsilon-metoflutrina, epsilon-momflutrina, Flometoquin, Fluazaindolizina, Fluensulfona, Flufenerim, Flufenoxistrobin, Flufiprol, Fluhexafon, Fluopiram, Fluralaner, Fluxametamida, Fufenozida, Guadipir, Heptaflutrina, Imidacloz, Iprodiona, kappa-bifentrina, kappa-teflutrina, Lotilaner, Meperflutrina, Paichongding, Piflubumida, Piridailil, Pirifluquinazon, Piriminostrobin, Espirobudiclofen, Tetrametilflutrina, Tetraniliprol, Tetraclorantraniliprol, Tigolaner, Tioxazafen, Tiofluoximato, Triflumezopirim y yodometano; asimismo preparaciones basadas en Bacillus firmus (-1582, BioNeem, Votivo), y también los siguientes compuestos: 1-{2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil}-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-
15 amina (conocido de WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluorospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocido de WO2003/106457) (CAS 637360-23-7), 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocido de WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocido de WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il etil
20 carbonato (conocido de EP2647626) (CAS 1440516-42-6), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocido de WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (conocido de JP2010/018586) (CAS 1204776-60-2), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (conocido de WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3E)-3-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridilideno]-1,1,1-trifluoro-propan-2-ona (conocido de WO2013/144213) (CAS 1461743-
30 15-6), N-[3-(bencilcarbamoil)-4-clorofenil]-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-cloro-N-[4-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)pirazol-3-carboxamida (conocido de CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-tietanil)-benzamida, 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(trans-1-oxido-3-tietanil)-benzamida y 4-[(5S)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(cis-1-oxido-3-tietanil)benzamida (conocido de WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]-

propanamida, (+)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]-propanamida y (-)-N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]-propanamida (conocido de WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[(2E)-3-cloro-2-propen-1-il]amino]-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-[(trifluorometil)sulfinil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo (conocido de CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-N-[4-cloro-2-metil-6-[(metilamino)tioxometil]fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida, (Liudaibenjiakuanan, conocido de CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); N-[4-cloro-2-[[1,1-dimetiletil]amino]carbonil]-6-metilfenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloro-2-propen-1-il)oxi]fenoxi]propoxi]-2-metoxi-6-(trifluorometil)-pirimidina (conocido de CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (2E)- y (2Z)-2-[2-(4-cianofenil)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etilideno]-N-[4-(difluorometoxi)fenil]-hidrazinacarboxamida (conocido de CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); éster del ácido 3-(2,2-dicloroetenil)-2,2-dimetil-4-(1H-benzimidazol-2-il)fenil-ciclopropanocarboxílico (conocido de CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); metil éster del ácido (4aS)-7-cloro-2,5-dihidro-2-[[[metoxicarbonil]4-[(trifluorometil)ti]fenil]amino]carbonil]-indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazina-4a(3H)-carboxílico (conocido de CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-desoxi-3-O-etil-2,4-di-O-metil-, 1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetoxi)fenil]-1H-1,2,4-triazol-3-il]fenil]carbamato]-α-L-mannopiranosas (conocido de US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometil-piridazin-3-il)-3-aza-biciclo[3.2.1]octano (CAS 1253850-56-4), (8-anti)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometil-piridazin-3-il)-3-aza-biciclo[3.2.1]octano (CAS 933798-27-7), (8-syn)-8-(2-ciclopropilmetoxi-4-trifluorometilfenoxi)-3-(6-trifluorometil-piridazin-3-il)-3-aza-biciclo[3.2.1]octano (conocido de WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8), N-[3-cloro-1-(3-piridinil)-1H-pirazol-4-il]-N-etil-3-[(3,3,3-trifluoropropil)ti]-propanamida (conocido de WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9) y N-[4-(aminotioxometil)-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido de CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7), 5-(1,3-dioxan-2-il)-4-[[4-(trifluorometil)fenil]metoxi]-pirimidina (conocido de WO 2013/115391 A1) (CAS 1449021-97-9), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1-metil-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocido de WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-34-0), 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-1-metil-1,8-diazaspiro[4.5]decano-2,4-diona (conocido de WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8), etil éster del ácido 3-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-8-metoxi-1-metil-2-oxo-1,8-diazaspiro[4.5]dec-3-en-4-il-carbónico (conocido de WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-00-0), N-[1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2(1H)-piridiniliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida (conocido de DE 3639877 A1, WO 2012029672 A1) (CAS 1363400-41-2), [N(E)]-N-[1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2(1H)-piridiniliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida, (conocido de WO 2016005276 A1) (CAS 1689566-03-7), [N(Z)]-N-[1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2(1H)-piridiniliden]-2,2,2-trifluoro-acetamida, (CAS 1702305-40-5), 3-endo-3-[2-propoxi-4-(trifluorometil)fenoxi]-9-[[5-(trifluorometil)-2-piridinil]oxi]-9-azabicyclo[3.3.1]nonano (conocido de WO 2011/105506 A1, WO 2016/133011 A1) (CAS 1332838-17-1).

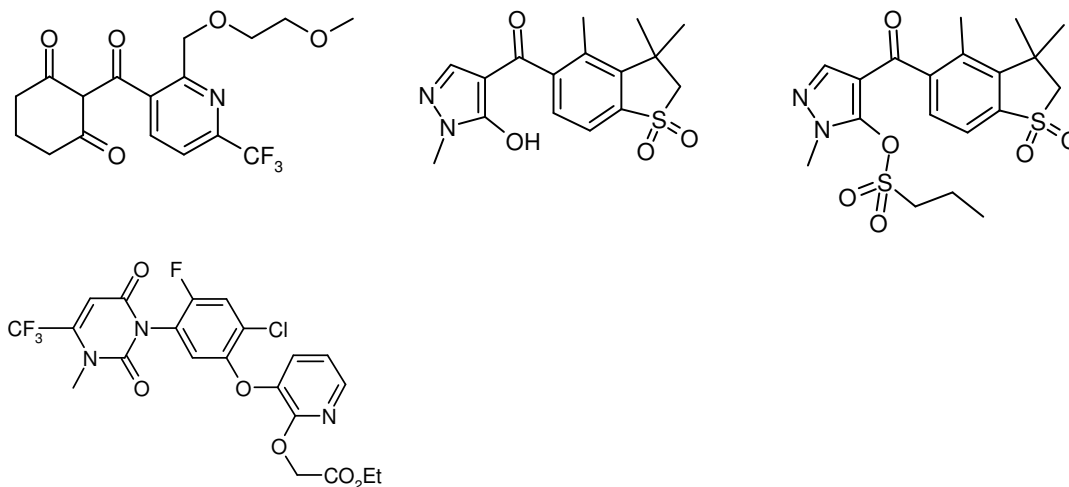
Ejemplos de protectores que podrían mezclarse con los compuestos de fórmula (I) y las composiciones que los comprenden son, por ejemplo, benoxacor, cloquintocet (-mexilo), ciometrinilo, ciprosulfamida, diclormid, fenclorazol (-etilo), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifen (-etilo), mefenpir (-dietilo), anhídrido naftálico, oxabetrinilo, 2-metoxi-N-({4-
5 [(metilcarbamoil)amino]fenil}sulfonil)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaspiro[4.5]decano (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dicloroacetil)-1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

Ejemplos de herbicidas que podrían mezclarse con los compuestos de fórmula (I) y las composiciones que los comprenden son:

- 10 Acetoclor, acifluorfen, acifluorfen-sodio, aclonifen, alaclor, alidoclor, aloxidim, aloxidim-sodio, ametrin, amicarbazona, amidoclor, amidosulfurón, ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metilfenil)-5-fluoropiridina-2-carboxílico, aminociclopiraclor, aminociclopiraclor-potasio, aminociclopiraclor-metilo, aminopirialid, amitrol, amoniosulfamato, anilofós, asulam, atrazina, azafenidina, azimsulfurón, beflubutamid, benazolina, benazolina-etilo, benfluralin, benfuresato, bensulfurón, bensulfurón-metilo,
15 bensulida, bentazona, benzobiciclón, benzofenap, biciclopirón, bifenox, bilanafós, bilanafós-sodio, bispiribac, bispiribac-sodio, bromacilo, bromobutida, bromofenoxim, bromoxinilo, bromoxinil-butirato, -potasio, -heptanoato, y -octanoato, busoxinona, butaclor, butafenacilo, butamifós, butenaclor, butralina, butroxidim, butilato, cafenstrol, carbetamida, carfentrazona, carfentrazona-etilo, cloramben, clorbromurón, clorfenac, clorfenac-sodio, clorfenprop, clorflurenol, clorflurenol-metilo, cloridazon,
20 clorimurón, clorimurón-etilo, cloroftalim, clorotolurón, clortal-dimetilo, clorsulfurón, cinidon, cinidon-etil, cinmetilina, cinosulfurón, clacifos, cletodim, clodinafop, clodinafop-propargilo, clomazona, clomeprop, clopiralid, cloransulám, cloransulám-metilo, cumilurón, cianamida, cianazina, cicloato, ciclopirimorato, ciclosulfamurón, cicloxidima, cihalofof, cihalofof-butilo, ciprazina, 2,4-D, 2,4-D-butotilo, -butilo, -dimetilamonio, -diolamina, -etilo, -2-etilhexilo, -isobutilo, -isooctilo, -isopropilamonio, -potasio, -
25 triisopropanolamonio, y -trolamina, 2,4-DB, 2,4-DB-butilo, -dimetilamonio, -isooctilo, -potasio, y -sodio, daimurón (dimron), dalapon, dazomet, n-decanol, desmedifam, detosil-pirazolato (DTP), dicamba, diclobenilo, 2-(2,4-diclorobencil)-4,4-dimetil-1,2-oxazolidin-3-ona, 2-(2,5-diclorobencil)-4,4-dimetil-1,2-oxazolidin-3-ona, diclorprop, diclorprop-P, diclofop, diclofop-metilo, diclofop-P-metilo, diclosulám, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, diflufenzopir-sodio, dimefurón, dimepiperato, dimetaclor,
30 dimetametrin, dimetenamid, dimetenamid-P, dimetrasulfurón, dinitramina, dinoterb, difenamid, diquat, diquat-dibromuro, ditiopir, diurón, DNOC, endotal, EPTC, esprocarb, etalfluralina, etametsulfurón, etametsulfurón-metilo, etiozina, etofumesato, etoxifen, etoxifen-etilo, etoxisulfurón, etobenzanid, F-9600, F-5231, es decir, N-{2-cloro-4-fluoro-5-[4-(3-fluoropropil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-tetrazol-1-il]fenil}etanosulfonamida, F-7967, es decir, 3-[7-cloro-5-fluoro-2-(trifluorometil)-1H-benzimidazol-4-il]-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidina-2,4(1H,3H)-diona, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etilo, fenoxaprop-P-etilo, fenoxasulfona, fenquinotriona, fentrazamida, flamprop, flamprop-M-isopropilo, flamprop-M-metilo, flazasulfurón, florasulám, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butilo, fluazifop-P-butilo, flucarbazona, flucarbazona-sodio, flucetosulfurón, flucloralin, flufenacet, flufenpir, flufenpir-etilo, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentilo, flumioxazin, fluometurón, flurenol, flurenol-butilo, -
40 dimetilamonio y -metilo, fluoroglicofen, fluoroglicofen-etilo, flupropanato, flupirsulfurón, flupirsulfurón-metil-sodio, fluridona, flurocloridona, fluroxipir, fluroxipir-meptiol, flurtamona, flutiacet, flutiacet-metilo,

fomesafén, fomesafén-sodio, foramsulfurón, fosamina, glufosinato, glufosinato-amonio, glufosinato-P-sodio, glufosinato-P-amonio, glufosinato-P-sodio, glifosato, glifosato-amonio, □isopropilamonio, □diamonio, □dimetilamonio, -potasio, -sodio, y □trimesio, H-9201, es decir, O-(2,4-dimetil-6-nitrofenil) O-etil isopropilfosforamidatoato, halauxifen, halauxifen-metilo, halosafen, halosulfurón, halosulfurón-metilo, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-etoxietilo, haloxifop-P-etoxietilo, haloxifop-metilo, haloxifop-P-metilo, hexazinona, HW-02, es decir, 1-(dimetoxifosforil) etil-(2,4-diclorofenoxi)acetato, imazametabenz, imazametabenz-metilo, imazamox, imazamox-amonio, imazapic, imazapic-amonio, imazapir, imazapir-isopropilamonio, imazaquin, imazaquin-amonio, imazetapir, imazetapir-imonio, imazosulfurón, indanofan, indaziflam, iodosulfurón, iodosulfurón-metil-sodio, ioxinilo, ioxinil-octanoato, -potasio y -sodio, ipfencarbazona, isoproturón, isourón, isoxaben, isoxaflutol, karbutilato, KUH-043, es decir, 3-([5-(difluorometil)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-il]metil)sulfonil)-5,5-dimetil-4,5-dihidro-1,2-oxazol, ketospiradox, lactofen, lenacil, linurón, MCPA, MCPA-butotilo, -dimetilamonio, -2-etilhexilo, -isopropilamonio, -potasio, y -sodio, MCPB, MCPB-metilo, -etilo y -sodio, mecoprop, mecoprop-sodio, y -butotil, mecoprop-P, mecoprop-P-butotil, -dimetilamonio, -2-etilhexilo, y -potasio, mefenacet, mefluidida, mesosulfurón, mesosulfurón-metilo, mesotriona, metabenzthiazurón, metam, metamifop, metamitron, metazaclor, metazosulfurón, methbenzthiazurón, metiopirsulfurón, metiozolin, metil isotiocianato, metobromurón, metolaclor, S-metolaclor, metosulam, metoxurón, metribuzin, metsulfurón, metsulfurón-metilo, molinat, monolinurón, monosulfurón, monosulfurón-éster, MT-5950, es decir, N-(3-cloro-4-isopropilfenil)-2-metilpentan amida, NGGC-011, napropamida, NC-310, es decir, [5-(benciloxi)-1-metil-1H-pirazol-4-il](2,4-diclorofenil)metanona, neburón, nicosulfurón, ácido nonanoico (ácido pelargónico), norflurazon, ácido oleico (ácidos grasos), orbencarb, ortosulfamurón, orizalin, oxadiargilo, oxadiazon, oxasulfurón, oxaziclomefon, oxifluorfen, paraquat, paraquat dicloruro, pebulato, pendimetalina, penoxsulam, pentaclorfenol, pentoxazona, petoxamid, aceites de petróleo, fenmedifam, picloram, picolinafen, pinoxaden, piperofos, pretilaclor, primisulfurón, primisulfurón-metilo, prodiamina, profoxidim, prometon, prometrin, propaclor, propanilo, propaquizafop, propazina, profam, propisoclor, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sodio, propirisulfurón, propizamida, prosulfocarb, prosulfurón, piraclonil, piraflufén, piraflufen-etilo, pirasulfotol, pirazolate (pirazolato), pirazosulfurón, pirazosulfurón-etilo, pirazoxifen, piribambenz, piribambenz-isopropilo, piribambenz-propilo, piribenzoxim, piributicarb, piridafol, piridato, piriftalid, piriminobac, piriminobac-metilo, pirimisulfan, piritiobac, piritiobac-sodio, piroxasulfona, piroxsulam, quinclozac, quinmerac, quincloclamina, quizalofop, quizalofop-etilo, quizalofop-P, quizalofop-P-etilo, quizalofop-P-tefurilo, rimsulfurón, saflufenacil, setoxidim, sidurón, simazina, simetrina, SL-261, sulcotrion, sulfentrazona, sulfometurón, sulfometurón-metilo, sulfosulfurón, SYN-523, SYP-249, es decir, 1-etoxi-3-metil-1-oxobut-3-en-2-il 5-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]-2-nitrobenzoato, SYP-300, es decir, 1-[7-fluoro-3-oxo-4-(prop-2-in-1-il)-3,4-dihidro-2H-1,4-benzoxazin-6-il]-3-propil-2-tioxiimidazolidina-4,5-diona, 2,3,6-TBA, TCA (ácido tricloroacético), TCA-sodio, tebutiurón, tefuriltriona, tembotriona, tepraloxidim, terbacil, terbucarb, terbumeton, terbutilazin, terbutrin, tenilclor, tiazopir, tiencarbazona, tiencarbazona-metilo, tifensulfurón, tifensulfurón-metilo, tiobencarb, tiafenacilo, tolpiralato, topamezona, tralkoxidim, triafamona, tri-alato, triasulfurón, triaziflam, tribenurón, tribenurón-metilo, triclopir, trietazina, trifloxisulfurón, trifloxisulfurón-sodio, trifludimoxazin, trifluralina, triflusulfurón, triflusulfurón-metilo,

tritosulfurón, sulfato de urea, vernolato, XDE-848, ZJ-0862, es decir, 3,4-dicloro-N-{2-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)oxi]bencil}anilina y los siguientes compuestos:



Ejemplos de reguladores del crecimiento de las plantas son:

- Acibenzolar, acibenzolar-S-metilo, ácido 5-aminolevulínico, ancimidol, 6-bencilaminopurina, 5
Brassinolid, catequina, cloromequat cloruro, cloprop, ciclanilida, ácido 3-(cicloprop-1-enil) propiónico, daminozida, dazomet, n-decanol, dikegulac, dikegulac-sodio, endotal, endotal-dipotasio, -disodio, y -
mono(N,N-dimetilalquilamonio), etefon, flumetralin, flurenol, flurenol-butilo, flurprimidol, forclorfenuron, ácido giberélico, inabenfida, ácido indol-3-acético (IAA), ácido 4-indol-3-ilbutírico, isoprotiolano, probenazol, ácido jasmónico, hidrazida maleica, mepiquat cloruro, 1-metilciclopropeno, metil
10 jasmonato, 2-(1-naftil)acetamida, ácido 1-naftilacético, ácido 2- naftiloxiacético, nitrofenolato-mezcla, paclobutrazol, N-(2-feniletil)-beta-alanina, ácido N-fenilftalámico, prohexadiona, prohexadiona-calcio, prohidrojasmona, ácido salicílico, strigolactona, tecnazeno, tidiazuron, triacontanol, trinexapac, trinexapac-etilo, tsitodef, uniconazol, uniconazol-P.

15

Métodos y usos

- Los compuestos de fórmula (I) y las composiciones que los comprenden tienen una potente actividad microbiocida. Pueden usarse para controlar microorganismos no deseados, como hongos y bacterias indeseadas. Pueden ser particularmente útiles en la protección de cultivos (controlan los
20 microorganismos que causan enfermedades en las plantas) o para proteger materiales (por ejemplo, materiales industriales, madera, bienes almacenados) como se describe en más detalle a continuación. Más específicamente, los compuestos de fórmula (I) y las composiciones de la invención se pueden usar para proteger semillas, semillas germinantes, plántulas eclosionadas,

plantas, partes de plantas, frutas, productos de la cosecha y/o el suelo donde crecen las plantas contra microorganismos no deseados.

Controlar o que controla como se usa en la presente abarca el tratamiento protector, curativo y erradicativo de microorganismos no deseados. Los microorganismos no deseados pueden ser
5 bacterias patógenas, virus patógenos, oomicetos patógenos u hongos patógenos, más específicamente bacterias fitopatógenas, virus fitopatógenos, oomicetos fitopatógenos u hongos fitopatógenos. Como se detalla en la presente a continuación, estos microorganismos fitopatógenos son los agentes causales de un amplio espectro de enfermedades de plantas.

Más específicamente, el compuesto de fórmula (I) y la composición de la invención se pueden usar
10 como fungicidas. Para los fines de la memoria descriptiva, el término “fungicida” hace referencia a un compuesto o composición que se puede usar en la protección de cultivos para el control de hongos no deseados, como Plasmodiophoromycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes y Deuteromycetes y/o para el control de Oomicetos, más preferentemente el control de Basidiomycetes (que provocan enfermedades de la roya).

15 La presente invención también hace referencia a un método para controlar microorganismos no deseados, como hongos, oomicetos y bacterias fitopatógenos, que comprende el paso de aplicar al menos un compuesto de fórmula (I) o al menos una composición de la invención a los microorganismos y/o su hábitat (a las plantas, partes de plantas, semillas, frutas o al suelo en donde crecen las plantas).

20 Típicamente, cuando el compuesto y la composición de la invención se usan en métodos curativos o protectores para controlar hongos fitopatógenos y/u oomicetos fitopatógenos, se aplica una cantidad eficaz y compatible con la planta a las plantas, partes de la planta, frutas, semillas o al suelo o sustratos en donde crecen las plantas. Los sustratos adecuados que se pueden usar para cultivar plantas incluyen sustratos de base inorgánica, como lana mineral, en particular lana de piedra, perlita,
25 arena o grava; sustratos orgánicos, como turba, corteza de pino o aserrín; y sustratos a base de petróleo como espumas poliméricas o cuentas plásticas. La cantidad eficaz y compatible con la planta significa una cantidad que es suficiente para controlar o destruir el hongo presente o que puede aparecer en el cultivo y que no implica ningún síntoma apreciable de fitotoxicidad para tales cultivos. Tal cantidad puede variar dentro de un amplio intervalo según el hongo que se desea
30 controlar, el tipo de cultivo, la etapa de crecimiento del cultivo, las condiciones climáticas y los compuestos o composiciones correspondientes de la invención usados. Esta cantidad puede determinarse por ensayos de campo sistemáticos que se encuentran dentro de las capacidades de un experto en la técnica.

35 Plantas y partes de plantas

Los compuestos de fórmula (I) y composiciones que los comprenden pueden aplicarse a cualquier planta o parte de la planta.

Las plantas son todas las plantas y poblaciones de plantas, como plantas salvajes deseadas e indeseadas o plantas de cultivo (inclusive plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener por métodos de reproducción y optimización convencionales o por métodos de ingeniería genética y biotecnológicos o combinaciones de estos métodos, inclusive las plantas genéticamente modificadas (GMO o plantas transgénicas) y las variedades cultivadas de plantas que pueden o no estar protegidas por derechos de cultivadores de plantas.

Partes de plantas se refieren a todas las partes y órganos de las plantas por encima y debajo de la tierra, como tallo, hoja, flor y raíz, algunos ejemplos que se dan son hojas, acículas, caña, tallo, flores, cuerpos de frutas, frutas y semillas y también raíces tubérculos y rizomas. Las partes de las plantas también incluyen el material de cosecha y el material de propagación generativa y vegetativa, por ejemplo, esquejes, tubérculos, rizomas, retoños y semillas.

Las plantas que se pueden tratar de acuerdo con los métodos de la invención incluyen las siguientes: algodón, lino, parra, frutas, vegetales, como *Rosaceae sp.* (por ejemplo, frutas pomáceas como manzanas y peras pero también frutas de carozo tales como damascos, cerezas, almendras y duraznos y frutas dulces tales como frutillas), *Ribesioideae sp.*, *Juglandaceae sp.*, *Betulaceae sp.*, *Anacardiaceae sp.*, *Fagaceae sp.*, *Moraceae sp.*, *Oleaceae sp.*, *Actinidaceae sp.*, *Lauraceae sp.*, *Musaceae sp.* (por ejemplo plantaciones y árboles de plátanos), *Rubiaceae sp.* (por ejemplo, café), *Theaceae sp.*, *Sterculiaceae sp.*, *Rutaceae sp.* (por ejemplo limones, naranjas y pomelos); *Solanaceae sp.* (por ejemplo, tomates), *Liliaceae sp.*, *Asteraceae sp.* (por ejemplo, lechuga), *Umbelliferae sp.*, *Cruciferae sp.*, *Chenopodiaceae sp.*, *Cucurbitaceae sp.* (por ejemplo, pepino), *Alliaceae sp.* (por ejemplo puerro, cebolla), *Papilionaceae sp.* (por ejemplo, guisantes); cultivos grandes tales como *Gramineae sp.* (por ejemplo, maíz, forraje, cereales tales como trigo, centeno, arroz, cebada, avena, mijo y triticale), *Asteraceae sp.* (por ejemplo, girasol), *Brassicaceae sp.* (por ejemplo, repollo blanco, repollo colorado, brócoli, coliflor, col de Bruselas, pak choi, colinabo, rábanos y colza, mostaza, rábano picante y berro), *Fabaceae sp.* (por ejemplo, guisantes, maní), *Papilionaceae sp.* (por ejemplo, soja), *Solanaceae sp.* (por ejemplo, papas), *Chenopodiaceae sp.* (por ejemplo, remolacha azucarera, remolacha forrajera, acelga, remolacha); plantas útiles y plantas ornamentales para jardines y áreas boscosas y variedades genéticamente modificadas de cada una de estas plantas.

En algunas modalidades preferidas, las especies de plantas silvestres y variedades cultivadas de plantas, o las que se obtienen mediante métodos convencionales biológicos de reproducción, como cruzamiento o fusión de protoplastos y también sus partes, se tratan de acuerdo con los métodos de la invención.

En algunas otras modalidades preferidas, las plantas transgénicas y variedades cultivadas de plantas obtenidas por métodos de ingeniería genética, si corresponde en combinación con métodos convencionales (organismos genéticamente modificados) y partes de estos, se tratan de acuerdo con los métodos de la invención. Más preferentemente, las plantas de las variedades cultivadas de plantas que están comercialmente disponibles o están en uso se tratan de acuerdo con la invención. Se entiende como variedades cultivadas de plantas aquellas plantas con nuevas propiedades ("rasgos") y que se obtuvieron por técnicas de reproducción convencional, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinante. Pueden ser variedades cultivadas, variedades, biotipos o genotipos.

Los métodos de acuerdo con la invención pueden usarse en el tratamiento de organismos genéticamente modificados (GMO), por ejemplo, plantas o semillas. Las plantas genéticamente modificadas (GMO o plantas transgénicas) son plantas en las que un gen heterólogo se integró de forma estable en el genoma. La expresión “gen heterólogo” básicamente significa un gen que se proporciona o arma fuera de la planta y que, cuando se introduce en el genoma nuclear, cloroplástico o mitocondrial, le otorga a la planta transformada propiedades agronómicas o de otro tipo, nuevas o mejoradas, al expresar una proteína o polipéptido de interés o disminuir o silenciar otros genes que se encuentran presentes en la planta (utilizando, por ejemplo, tecnología antisentido, tecnología de cosupresión, tecnología de interferencia de ARN – iARN – o tecnología de microARN – miARN) Un gen heterólogo que se ubica en el genoma también se denomina transgén. Un transgén que se define por su ubicación particular en el genoma vegetal se denomina evento de transformación o transgénico.

Las plantas y variedades cultivadas de plantas que pueden tratarse por los métodos descritos anteriormente incluyen todas las plantas con material genético que imparte rasgos útiles y particularmente útiles a estas plantas (ya sea obtenidos por medios de reproducción y/o biotecnológicos).

Las plantas y variedades cultivadas de plantas que pueden ser tratadas mediante los métodos antes descritos incluyen plantas y variedades cultivadas de plantas que son resistentes a una o más causas de estrés biótico, es decir que esas plantas muestran una mejor defensa en contra de plagas animales y microbianas, como por ejemplo en contra de nemátodos, insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacteria, virus y/o viroides.

Otras plantas y variedades cultivadas de plantas que pueden ser tratadas mediante los métodos antes descritos incluyen aquellas plantas resistentes a una o más causas de estrés abiótico. Las condiciones de estrés abiótico pueden incluir, por ejemplo, sequía, exposición a temperaturas frías, exposición al calor, estrés osmótico, inundaciones, aumento de la salinidad del suelo, aumento de la exposición mineral, exposición de ozono, exposición a la luz alta, disponibilidad limitada de nutrientes de nitrógeno, disponibilidad limitada de nutrientes de fósforo, evitar la sombra.

Otras plantas y variedades cultivadas de plantas que pueden ser tratadas mediante los métodos antes descritos incluyen aquellas plantas caracterizadas por características de rendimiento mejorado. El aumento de rendimiento en dichas plantas puede ser el resultado de, por ejemplo, mejora de la fisiología, crecimiento y desarrollo de la planta, como eficacia del uso del agua, eficacia de la retención del agua, mejor uso de nitrógeno, mejor asimilación de carbono, mejor fotosíntesis, mayor eficacia de la germinación y maduración acelerada. El rendimiento también puede verse afectado por una mejor arquitectura de la planta (en condiciones de estrés y sin estrés), inclusive entre otras cosas, floración temprana, control de la floración para la producción de semillas híbridas, vigor de las plántulas, tamaño de la planta, número y distancia de entrenudos, crecimiento de la raíz, tamaño de la semilla, tamaño de la fruta, tamaño de la vaina, cantidad de vainas o espigas, cantidad de semillas por vaina o espiga, masa de semillas, mejor relleno de semillas, menor dispersión de semillas, menor dehiscencia de vaina y resistencia al encorvamiento. Otros rasgos de rendimiento incluyen composición de la semilla como contenido y composición de carbohidratos, por ejemplo algodón o almidón, contenido de proteína, contenido de aceite y composición, valor nutricional, reducción de

compuestos antinutricionales, mejor capacidad de procesamiento y mejor estabilidad al almacenamiento,

Las plantas y variedades cultivadas de plantas que pueden ser tratadas mediante los métodos antes descritos incluyen plantas y variedades cultivadas de plantas que son plantas híbridas que ya expresan características de heterosis o vigor híbrido, que dan como resultado, en general, un mayor rendimiento, vigor, salud y resistencia al estrés biótico y abiótico.

Las plantas y variedades cultivadas de plantas (obtenidas mediante métodos de biotecnología vegetal como la ingeniería genética) que pueden ser tratadas mediante los métodos antes descritos incluyen plantas y variedades cultivadas de plantas que son tolerantes a los herbicidas, es decir, plantas que se han hecho tolerantes a uno o más herbicidas dados. Tales plantas pueden obtenerse por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que imparte tal tolerancia a los herbicidas.

Las plantas y variedades cultivadas de plantas (obtenidas mediante métodos de biotecnología vegetal como la ingeniería genética) que pueden ser tratadas mediante los métodos antes descritos incluyen plantas y variedades cultivadas de plantas que son plantas transgénicas resistentes a insectos, es decir, plantas que se han hecho resistentes al ataque de determinados insectos diana. Tales plantas pueden obtenerse por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que imparte tal resistencia a insectos.

Las plantas y variedades cultivadas de plantas (obtenidas mediante métodos de biotecnología vegetal como la ingeniería genética) que pueden ser tratadas mediante los métodos antes descritos incluyen plantas y variedades cultivadas de plantas que son tolerantes al estrés abiótico. Tales plantas pueden obtenerse por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que imparte tal resistencia al estrés.

Las plantas y variedades cultivadas de plantas (obtenidas mediante métodos de biotecnología vegetal como la ingeniería genética) que pueden ser tratadas mediante los métodos antes descritos incluyen plantas y variedades cultivadas de plantas que muestran una alteración en la cantidad, calidad y/o estabilidad de almacenamiento del producto cosechado y/o una alteración en las propiedades de ingredientes específicos del producto cosechado.

Las plantas y variedades cultivadas de plantas (obtenidas mediante métodos de biotecnología vegetal como la ingeniería genética) que pueden ser tratadas mediante los métodos antes descritos incluyen plantas y variedades cultivadas de plantas, como plantas de algodón con características de fibra alteradas. Tales plantas pueden obtenerse por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que imparte tales características de fibra alteradas.

Las plantas y variedades cultivadas de plantas (obtenidas mediante métodos de biotecnología vegetal como la ingeniería genética) que pueden ser tratadas mediante los métodos antes descritos incluyen plantas y variedades cultivadas de plantas, como colza oleaginosa o plantas de Brassica relacionadas, con características de perfil oleoso alteradas. Tales plantas pueden obtenerse por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que imparte tales características de perfil oleoso alteradas.

Las plantas y variedades cultivadas de plantas (obtenidas mediante métodos de biotecnología vegetal como la ingeniería genética) que pueden ser tratadas mediante los métodos antes descritos incluyen

plantas y variedades cultivadas de plantas, como colza oleaginosa o plantas de Brassica relacionadas, con características de dehiscencia de semillas alteradas. Tales plantas pueden obtenerse por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que imparte tales características de dehiscencia de semillas alteradas e incluyen plantas como plantas de colza oleaginosa con dehiscencia de semillas retrasada o reducida.

Las plantas y variedades cultivadas de plantas (obtenidas mediante métodos de biotecnología vegetal como la ingeniería genética) que pueden ser tratadas mediante los métodos antes descritos incluyen plantas y variedades cultivadas de plantas, como plantas de tabaco, con patrones de modificación de proteína posttraduccional alterados.

Patógenos y enfermedades

Los métodos descritos anteriormente pueden usarse para controlar microorganismos, en particular, microorganismos fitopatógenos como hongos fitopatógenos, que provocan enfermedades, como:

enfermedades provocadas por patógenos del mildiu polvoriento, como especie *Blumeria* (por ejemplo *Blumeria graminis*); especie *Podosphaera* (por ejemplo *Podosphaera leucotricha*); especie *Sphaerotheca* (por ejemplo *Sphaerotheca fuliginea*); especie *Uncinula* (for example *Uncinula necator*); enfermedades provocadas por patógenos de la enfermedad de la roya, como especie *Gymnosporangium* (por ejemplo *Gymnosporangium sabinae*); especie *Hemileia* (por ejemplo *Hemileia vastatrix*); especie *Phakopsora* (por ejemplo *Phakopsora pachyrhizi* o *Phakopsora meibomia*); especie *Puccinia* (por ejemplo *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* o *Puccinia striiformis*); especie *Uromyces* (por ejemplo *Uromyces appendiculatus*);

enfermedades provocadas por patógenos del grupo de Oomycetes, por ejemplo especie *Albugo* (por ejemplo, *Albugo candida*); especie *Bremia* (por ejemplo, *Bremia lactucae*); especie *Peronospora* (por ejemplo, *Peronospora pisi* o *P. brassicae*); especie *Phytophthora* (por ejemplo, *Phytophthora infestans*); especie *Plasmopara* (por ejemplo, *Plasmopara viticola*); especie *Pseudoperonospora* (por ejemplo, *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*); especie *Pythium* (por ejemplo, *Pythium ultimum*);

enfermedades de la mancha foliar y marchitez foliar causadas, por ejemplo, por la especie *Alternaria* (por ejemplo, *Alternaria solani*); especie *Cercospora* (por ejemplo, *Cercospora beticola*); especie *Cladosporium* (por ejemplo, *Cladosporium cucumerinum*); especie *Cochliobolus* (por ejemplo, *Cochliobolus sativus* (forma conidial: *Drechslera*, syn: *Helminthosporium*) o *Cochliobolus miyabeanus*), especie *Colletotrichum*, (por ejemplo, *Colletotrichum lindemuthianum*), especie *cicloconium* (por ejemplo *cicloconium oleaginum*), especie *Diaporthe* (por ejemplo, *Diaporthe citri*), especie *Elsinoe* (por ejemplo, *Elsinoe fawcettii*), especie *Gloeosporium*, (por ejemplo, *Gloeosporium laeticolor*), especie *Glomerella* (por ejemplo, *Glomerella cingulate*), especie *Guignardia* (por ejemplo, *Guignardia bidwelli*), especie *Leptosphaeria* (por ejemplo, *Leptosphaeria maculans*), especie *Magnaporthe* (por ejemplo, *Magnaporthe grisea*), especie *Microdochium* (por ejemplo, *Microdochium nivale*), especie *Mycosphaerella* (por ejemplo, *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola* o *Mycosphaerella fijiensis*), especie *Phaeosphaeria* (por ejemplo, *Phaeosphaeria nodorum*), especie *Pyrenophora* (por ejemplo, *Pyrenophora teres* o *Pyrenophora tritici repens*), especie *Ramularia* (por ejemplo, *Ramularia collo-cygni* o *Ramularia areola*), especie *Rhynchosporium*,

(por ejemplo, *Rhynchosporium secalis*), especie *Septoria* (por ejemplo, *Septoria apii* o *Septoria lycopersici*), especie *Stagonospora* (por ejemplo, *Stagonospora nodorum*), especie *Typhula* (por ejemplo, *Typhula incarnata*), especie *Venturia* (por ejemplo, *Venturia inaequalis*), enfermedades de la raíz y el tallo provocadas, por ejemplo, por la especie *Corticium* (por ejemplo, *Corticium graminearum*), especie *Fusarium* (por ejemplo, *Fusarium oxysporum*),; especie *Gaeumannomyces* (por ejemplo, *Gaeumannomyces graminis*), especie *Plasmodiophora*, por ejemplo, *Plasmodiophora brassicae*;; especie *Rhizoctonia* (por ejemplo, *Rhizoctonia solani*), especie *Sarocladium* (por ejemplo, *Sarocladium oryzae*), especie *Sclerotium* (por ejemplo, *Sclerotium oryzae*;; especie *Tapesia* (por ejemplo, *Tapesia acuformis*), especie *Thielaviopsis* (por ejemplo, *Thielaviopsis basicola*);

enfermedades de espigas y panojas (inclusive mazorcas de maíz) causadas, por ejemplo, por la especie *Alternaria*, (por ejemplo *Alternaria spp.*), especie *Aspergillus* (por ejemplo, *Aspergillus flavus*), especie *Cladosporium* (por ejemplo, *Cladosporium cladosporioides*), especie *Claviceps* (por ejemplo, *Claviceps purpurea*), especie *Fusarium* (por ejemplo, *Fusarium culmorum*), especie *Gibberella* (por ejemplo, *Gibberella zeae*), especie *Monographella* (por ejemplo, *Monographella nivalis*), especie *Stagonospora* (por ejemplo, *Stagonospora nodorum*);

enfermedades causadas por hongos del carbón, por ejemplo, especie *Sphacelotheca* (por ejemplo, *Sphacelotheca reiliana*), especie *Tilletia* (por ejemplo, *Tilletia caries* o *Tilletia controversa*), especie *Urocystis* (por ejemplo, *Urocystis occulta*), especie *Ustilago* (por ejemplo, *Ustilago nuda*);

putrefacción de la fruta causada, por ejemplo, por la especie *Aspergillus* (por ejemplo, *Aspergillus flavus*); especie *Botrytis* (por ejemplo, *Botrytis cinerea*), especie *Penicillium* (por ejemplo, *Penicillium expansum* o *Penicillium purpurogenum*); especie *Rhizopus* (por ejemplo, *Rhizopus stolonifer*); especie *Sclerotinia* (por ejemplo, *Sclerotinia sclerotiorum*), especie *Verticillium* (por ejemplo, *Verticillium alboatrum*);

enfermedades de marchitez y putrefacción de semillas y suelo y también enfermedades de las plántulas, causadas, por ejemplo, por la especie *Alternaria* (por ejemplo, *Alternaria brassicicola*); especie *Aphanomyces* (por ejemplo, *Aphanomyces euteiches*); especie *Ascochyta* (por ejemplo, *Ascochyta lentis*); especie *Aspergillus* (por ejemplo, *Aspergillus flavus*); especie *Cladosporium* (por ejemplo, *Cladosporium herbarum*); especie *Cochliobolus* (por ejemplo, *Cochliobolus sativus* (forma conidial: *Drechslera*, *Bipolaris* Syn: *Helminthosporium*)); especie *Colletotrichum* (por ejemplo, *Colletotrichum coccodes*); especie *Fusarium* (por ejemplo, *Fusarium culmorum*),; especie *Gibberella* (por ejemplo, *Gibberella zeae*), especie *Macrophomina* (por ejemplo, *Macrophomina phaseolina*), especie *Microdochium* (por ejemplo, *Microdochium nivale*), especie *Monographella* (por ejemplo, *Monographella nivalis*), especie *Penicillium* (por ejemplo, *Penicillium expansum*), especie *Phoma* (por ejemplo, *Phoma lingam*), especie *Phomopsis* (por ejemplo, *Phomopsis sojæ*), especie *Phytophthora* (por ejemplo, *Phytophthora cactorum*), especie *Pyrenophora* (por ejemplo, *Pyrenophora graminea*), especie *Pyricularia* (por ejemplo, *Pyricularia oryzae*), especie *Pythium* (por ejemplo, *Pythium ultimum*), especie *Rhizoctonia* (por ejemplo, *Rhizoctonia solani*), especie *Rhizopus* (por ejemplo, *Rhizopus oryzae*), especie *Sclerotium* (por ejemplo, *Sclerotium rolfsii*), especie *Septoria* (por ejemplo, *Septoria nodorum*), especie *Typhula* (por ejemplo, *Typhula incarnata*), especie *Verticillium* (por ejemplo, *Verticillium dahlia*);

- cánceres, agallas y escoba de bruja causadas, por ejemplo, por la especie *Nectria* (por ejemplo, *Nectria galligena*);
- enfermedades de marchitez provocadas, por ejemplo, por la especie *Monilinia* (por ejemplo, *Monilinia laxa*);
- 5 deformaciones de hojas, flores y frutas causadas, por ejemplo, por la especie *Exobasidium* (por ejemplo, *Exobasidium vexans*), especie *Taphrina* (por ejemplo, *Taphrina deformans*);
- enfermedades degenerativas en plantas boscosas causadas, por ejemplo, por la especie *Esca* (por ejemplo, *Phaeomoniella chlamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* o *Fomitiporia mediterranea*), especie *Ganoderma* (por ejemplo, *Ganoderma boninense*);
- 10 enfermedades de flores y semillas causadas, por ejemplo, por la especie *Botrytis* (por ejemplo, *Botrytis cinerea*);
- enfermedades de tubérculos de plantas causadas, por ejemplo, por la especie *Rhizoctonia* (por ejemplo, *Rhizoctonia solani*), especie *Helminthosporium* (por ejemplo, *Helminthosporium solani*);
- enfermedades causadas por patógenos bacterianos, por ejemplo, la especie *Xanthomonas* (por ejemplo, *Xanthomonas campestris* pv. *Oryzae*), especie *Pseudomonas* (por ejemplo, *Pseudomonas syringae* pv. *Lachrymans*), especie *Erwinia* (por ejemplo, *Erwinia amylovora*).
- 15 En particular, los compuestos de fórmula (I) y las composiciones que los comprenden son eficaces para controlar hongos fitopatógenos que provocan enfermedades de la roya.

20 Tratamiento de semillas

- El método para controlar microorganismos no deseados puede usarse para proteger semillas de microorganismos fitopatógenos, como hongos.
- El término “semilla(s)” como se usa en la presente incluye semillas inactivas, semillas cebadas, semillas pregerminadas y semillas con raíces y hojas brotadas.
- 25 Por ende, la presente invención también se refiere a un método para proteger las semillas y/o cultivos de microorganismos no deseados, como bacterias u hongos, que comprende el paso de tratar las semillas con uno o más compuestos de fórmula (I) o una composición que los comprende. El tratamiento de las semillas con el o los compuestos de fórmula (I) o una composición que los comprende no solo protege las semillas de microorganismos fitopatógenos sino también las plantas
- 30 en germinación, las plántulas emergentes y las plantas luego del brote.
- El tratamiento de las semillas puede realizarse antes de la siembra, al momento de la siembra o poco después.
- Cuando el tratamiento de las semillas se realiza antes de la siembra (p. ej. las denominadas aplicaciones sobre la semilla), el tratamiento de las semillas puede realizarse del siguiente modo: las
- 35 semillas pueden colocarse en un mezclador con una cantidad deseada del o los compuestos de fórmula (I) o una composición que los comprende (ya sea como están o después de diluirlos), las semillas y el o los compuestos de fórmula (I) o la composición que los comprende se mezclan hasta lograr una distribución homogénea sobre las semillas. Si corresponde, las semillas pueden luego secarse.
- 40 La invención también hace referencia a semillas tratadas con uno o más compuestos de fórmula (I) o una composición que los comprende. Como se mencionó anteriormente, el uso de semillas tratadas

permite no solo proteger las semillas antes y después de la siembra contra microorganismos no deseados, como hongos fitopatógenos, sino que también permite proteger las plantas en germinación y plántulas jóvenes que emergen de dichas semillas tratadas. Una gran parte del daño a las plantas de cultivo provocado por organismos dañinos es provocado por la infección de las semillas antes de la siembra o después de la germinación de la planta. Esta fase es particularmente importante debido a que las raíces y los tallos de la planta en crecimiento son particularmente sensibles e incluso un pequeño daño puede provocar la muerte de la planta.

Por ende, la presente invención también se refiere a un método para proteger las semillas, plantas en germinación y plántulas emergidas, más generalmente a un método para proteger a los cultivos de microorganismos fitopatógenos, que comprende el paso de usar semillas tratadas con uno o más compuestos de fórmula (I) o una composición que los comprende.

Preferentemente, la semilla se trata en un estado en el que es suficientemente estable para que no se produzca daño en el transcurso del tratamiento. En general, las semillas pueden ser tratadas en cualquier momento entre la cosecha y poco después de la siembra. Es habitual usar semillas que fueron separadas de la planta y sin mazorcas, cáscaras, tallos, testas, pelos o de la pulpa de la fruta. Por ejemplo, es posible usar semillas que se cultivaron, limpiaron y secaron hasta un contenido húmedo menor que 15% en peso. De manera alternativa, también es posible usar semillas que, después de secarse, por ejemplo, se trataron con agua y luego se secaron de nuevo, o semillas inmediatamente después del cebado o semillas almacenadas en condiciones cebadas o semillas pregerminadas, o semillas sembradas en bandejas, cintas o papel de viveros.

La cantidad de uno o más compuestos de fórmula (I) o composición que los comprende aplicada a las semillas es típicamente tal que la germinación de la semilla no se obstaculiza o que la planta resultante no se daña. Esto debe garantizarse particularmente en el caso de que los ingredientes activos presenten efectos fitotóxicos con ciertas dosis de aplicación. Los fenotipos intrínsecos de plantas transgénicas deberían también tomarse en cuenta al determinar la cantidad de uno o más compuestos de fórmula (I) o composición que los comprende que se debe aplicar a la semilla para lograr una protección óptima de la semilla y la planta en germinación empleando una cantidad mínima de uno o más compuestos de fórmula (I) o composición que los comprende.

Como se indicó anteriormente, los compuestos de fórmula (I) pueden aplicarse como tal, directamente a las semillas, es decir, sin el uso de otros componentes y sin diluirse, o una composición que comprende los compuestos de fórmula (I) puede aplicarse. Preferentemente, las composiciones se aplican a la semilla de cualquier forma adecuada. Ejemplos de formulaciones adecuadas incluyen soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, lechadas o combinaciones con otras composiciones de recubrimiento para semillas, como materiales formadores de película, materiales de sedimentación, hierro fino u otros polvos de metal, gránulos, material de recubrimiento para semillas inactivadas y también formulaciones de ULV. Las formulaciones pueden ser formulaciones listas para usarse o pueden ser concentrados que deben diluirse antes de usarse.

Estas formulaciones se preparan de forma conocida, por ejemplo, mezclando el ingrediente activo o mezcla de este, con aditivos habituales, por ejemplo, extensores habituales y también solventes o diluyentes, colorantes, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también agua.

- Estas formulaciones se preparan de forma conocida mezclando los ingredientes activos o combinaciones de ingredientes activos con aditivos habituales, por ejemplo, extensores habituales y también solventes o diluyentes, colorantes, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también agua.
- 5 Los colorantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semilla son colorantes habituales a tales fines. Es posible usar pigmentos, que son moderadamente solubles en agua, o colorantes, que son solubles en agua. Ejemplos incluyen los colorantes conocidos por los nombres Rhodamine B, C.I. Pigmento rojo 112 y C.I. Solvente Rojo 1. Agentes humectantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas son todas sustancias
- 10 que promueven la humectación y que se usan convencionalmente para la formulación de ingredientes activos desde el punto de vista agroquímico. Con preferencia se usan alquilnaftalenosulfonatos, como diisopropil- o diisobutilnaftalenosulfonatos. Dispersantes y/o emulsionantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas son todos dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos que se usan convencionalmente para la formulación de ingredientes activos
- 15 desde el punto de vista agroquímico. Con preferencia se usan dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Los dispersantes no iónicos útiles incluyen especialmente polímeros de bloque de óxido de etileno/óxido de propileno, éteres de alquilfenolpoliglicol y éter de tristirilfenol poliglicol y los derivados fosfatados o sulfatados de estos. Los dispersantes aniónicos adecuados son especialmente lignosulfonatos, sales de ácido poliacrílico
- 20 y condensados de arilsulfonato/formaldehído. Antiespumantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas son todas sustancias que inhiben la espuma que se usan convencionalmente para la formulación de ingredientes activos desde el punto de vista agroquímico. Con preferencia pueden usarse antiespumantes de silicona y estearato de magnesio. Los conservantes que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas son
- 25 todas sustancias útiles a tales fines en composiciones agroquímicas. Ejemplos incluyen diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal. Los espesantes secundarios que pueden estar presentes en las formulaciones de recubrimiento de semillas son todas sustancias útiles a tales fines en composiciones agroquímicas. Ejemplos preferidos incluyen derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantana, arcillas modificadas y sílice finamente dividida. Los adhesivos que pueden estar presentes
- 30 en las formulaciones de recubrimiento de semillas son todos aglutinantes habituales útiles en los productos de recubrimiento de semillas. Ejemplos preferidos incluyen polivinilpirrolidona, polivinil acetato, alcohol polivinílico y tilosa.
- Los compuestos de la fórmula (I) y las composiciones que los comprenden son adecuados para proteger semillas de cualquier variedad vegetal que se usa en agricultura, en invernaderos, en
- 35 bosques o en la horticultura. Más particularmente, las semillas preferidas son las de cereales (como el trigo, la cebada, el centeno, el mijo, triticale y la avena), colza, maíz, algodón, soja, arroz, papas, girasol, habas, café, frijoles, remolacha (p. ej., remolacha azucarera o remolacha forrajera), maní, verduras (como tomate, pepino, cebolla y lechuga), céspedes y plantas ornamentales. Particularmente importante es el tratamiento de la semilla de trigo, soja, colza, maíz y arroz.
- 40 Los compuestos de fórmula (I) o las composiciones que los comprenden pueden usarse para tratar semillas transgénicas, en particular semillas de plantas capaces de expresar una proteína que actúa

contra plagas, daño de herbicidas o estrés abiótico, aumentando así el efecto protector. También pueden producirse efectos sinérgicos en interacción con las sustancias formadas por expresión.

Aplicación

5 El compuesto de la invención se pueden aplicar como está, o por ejemplo en la forma de soluciones prontas para usar, emulsiones, suspensiones a base de agua o aceite, polvos, polvos humectantes, pastas, polvos solubles, polvillo, gránulos solubles, gránulos para esparcir, concentrados en suspoemulsión, productos naturales impregnados con el compuesto de la invención, sustancias sintéticas impregnadas con el compuesto de la invención, fertilizantes o microencapsulados en
10 sustancias poliméricas.

La aplicación se logra de forma habitual, por ejemplo al regar, pulverizar, atomizar, esparcir, espolvorear, formar espuma, extender y similares. También es posible implementar el compuesto de la invención por el método de volumen ultra bajo, por un sistema de riego por goteo o aplicación de inundación, para aplicar en surco o para inyectar en el suelo, tallo o tronco. También es posible
15 aplicar el compuesto de la invención por medio de un cierre para heridas, pintura u otro vendaje para heridas.

La cantidad eficaz y compatible con plantas del compuesto de la invención que se aplica a las plantas, partes de la planta, frutas, semillas o suelo dependerá de varios factores, como el compuesto/composición empleado, el objeto del tratamiento (planta, parte de la planta, fruta, semilla o
20 suelo), el tipo de tratamiento (pulverización, rociado, recubrimiento de semillas), el propósito del tratamiento (curativo y protector), el tipo de microorganismos, la etapa de desarrollo de microorganismos, la sensibilidad de los microorganismos, la etapa de crecimiento de los cultivos y las condiciones ambientales.

Al usar el compuesto de la invención como fungicida, las tasas de aplicación pueden variar dentro de
25 un intervalo relativamente amplio dependiendo del tipo de aplicación. Para el tratamiento de partes de plantas, tales como hojas, la tasa de aplicación puede variar de 0,1 a 10 000 g/ha, preferentemente de 10 a 1000 g/ha, más preferentemente de 50 a 300 g/ha (en el caso de aplicación por riego o goteo, es incluso posible reducir la tasa de aplicación, especialmente cuando se usan sustratos inertes tales como lana de roca o perlita); Para el tratamiento de semillas, la tasa de aplicación puede variar de 0,1
30 a 200 g por 100 kg de semillas, preferentemente de 1 a 150 g por 100 kg de semilla, más preferentemente de 2,5 a 25 g por 100 kg de semillas, incluso más preferentemente de 2,5 a 12,5 g por 100 kg de semillas. Para el tratamiento del suelo, la tasa de aplicación puede variar de 0,1 a 10 000 g/ha, preferentemente de 1 a 5000 g/ha.

Estas tasas de aplicación son meramente ejemplos y no se pretende que limiten el alcance de la
35 presente invención.

Protección del material

El compuesto y la composición de la invención también pueden utilizarse en la protección de materiales, especialmente para la protección de materiales industriales contra ataque y destrucción por parte de microorganismos no deseados.

- 5 Además, el compuesto y la composición de la invención pueden utilizarse como composiciones anticontaminantes, por sí solas o en combinaciones con otros ingredientes activos.

10 Materiales industriales en el contexto de la presente se refieren a materiales inanimados que se prepararon para usarse en la industria. Por ejemplo, los materiales industriales que se desea proteger contra alteración o destrucción microbiana pueden ser adhesivos, pegamentos, papel, papel tapiz y cartón/cartulina, telas, alfombras, cuero, madera, fibras y tejidos, pinturas y artículos plásticos, lubricantes de enfriamiento y otros materiales que puedan infectarse o ser destruidos por microorganismos. Partes de edificios y plantas de producción, por ejemplo circuitos de enfriamiento de agua, sistemas de calefacción y refrigeración y unidades de ventilación y aire acondicionado, que pueden verse perjudicados por la proliferación de microorganismos también pueden mencionarse
15 dentro del alcance de los materiales que se desea proteger. Los materiales industriales dentro del alcance de la presente invención preferentemente incluyen adhesivos, colas, papel y cartón, cuero, madera, pinturas, lubricantes de refrigeración y fluidos de transferencia de calor, más preferentemente madera.

20 El compuesto y la composición de la invención pueden evitar efectos adversos, como putrefacción, descomposición, decoloración o formación de moho.

En el caso del tratamiento de la madera, el compuesto y la composición de la invención también pueden utilizarse contra enfermedades fúngicas que pueden crecer sobre o dentro de la madera.

25 Madera significa todos los tipos de especies de madera y todas las formas de trabajar esta madera con el objetivo de construcción, por ejemplo, maderas sólidas, maderas de alta-densidad, maderas laminadas y maderas contrachapadas. Además, el compuesto y la composición de la invención pueden usarse para proteger objetos que entran en contacto con agua salada o agua salobre, especialmente cascos, pantallas, redes, edificios, amarraderos y sistemas de señalización, contra contaminaciones.

30 El compuesto y la composición de la invención se pueden también emplear para proteger productos de almacenamiento. Se entiende que los productos de almacenamiento significan sustancias naturales de origen vegetal o animal o productos procesados de estos que son de origen natural y para los que se desea una protección de largo plazo. Los bienes almacenados de origen vegetal, por ejemplo, plantas o partes de plantas, tales como tallos, hojas, tubérculos, semillas, frutas, granos, se pueden proteger cosechados de forma fresca o luego de su procesamiento mediante (pre)secado,
35 humectación, molienda, trituración, prensado o tostado. Los productos de almacenamiento también incluyen madera no procesada, como madera de construcción, postes y barreras de electricidad o en

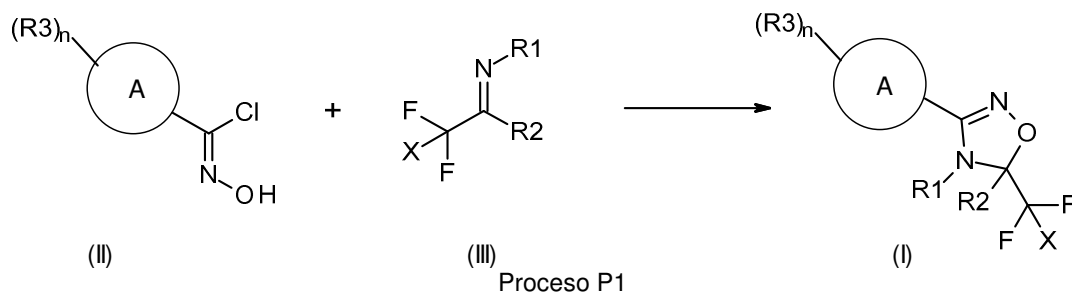
la forma de productos acabados, como muebles. Los productos de almacenamiento de origen animal son, por ejemplo, cueros y pieles. El compuesto y la composición de la invención pueden evitar efectos adversos, como putrefacción, descomposición, decoloración o formación de moho.

Los microorganismos capaces de degradar o alterar los materiales industriales incluyen, por ejemplo, bacterias, hongos, levaduras, algas y organismos mucilaginosos. El compuesto y la composición de la invención preferentemente actúan contra hongos, especialmente mohos, hongos que decoloran y destruyen maderas (*Ascomycetes*, *Basidiomycetes*, *Deuteromycetes* y *Zygomycetes*), y contra organismos mucilaginosos y algas. Ejemplos incluyen microorganismos de los siguientes géneros: *Alternaria*, como *Alternaria tenuis*; *Aspergillus*, como *Aspergillus niger*; *Chaetomium*, como *Chaetomium globosum*; *Coniophora*, como *Coniophora puetana*; *Lentinus*, como *Lentinus tigrinus*; *Penicillium*, como *Penicillium glaucum*; *Polyporus*, como *Polyporus versicolor*; *Aureobasidium*, como *Aureobasidium pullulans*; *Sclerophoma*, como *Sclerophoma pityophila*; *Trichoderma*, como *Trichoderma viride*; *Ophiostoma spp.*, *Ceratocystis spp.*, *Humicola spp.*, *Petriella spp.*, *Trichurus spp.*, *Coriolus spp.*, *Gloeophyllum spp.*, *Pleurotus spp.*, *Poria spp.*, *Serpula spp.* y *Tyromyces spp.*, *Cladosporium spp.*, *Paecilomyces spp.*, *Mucor spp.*, *Escherichia*, como *Escherichia coli*; *Pseudomonas*, como *Pseudomonas aeruginosa*; *Staphylococcus*, como *Staphylococcus aureus*, *Candida spp.* y *Saccharomyces spp.*, como *Saccharomyces cerevisiae*.

20 Vías sintéticas generales a los compuestos de la fórmula general I

La presente invención también se refiere a procesos para la preparación de compuestos de fórmula (I). A menos que se indique de otro modo, n y los radicales A, R1, R2, R3 y X tienen los significados mencionados anteriormente para los compuestos de fórmula (I). Estas definiciones aplican no solo a los productos finales de la fórmula (I) sino que del mismo modo a todos los intermedios.

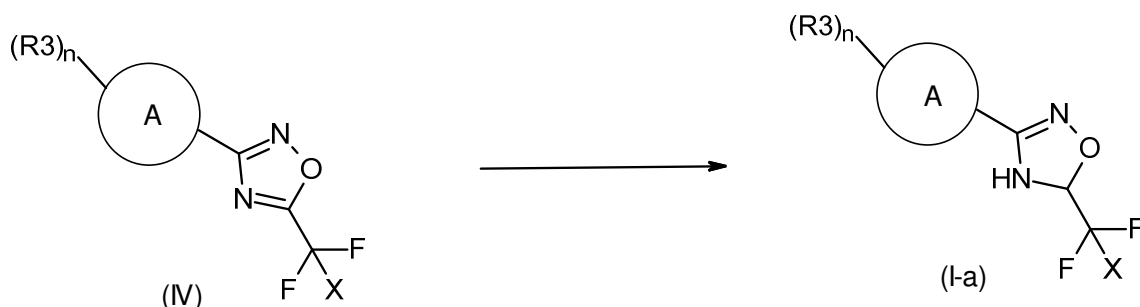
Los compuestos de fórmula (I) pueden prepararse, de acuerdo con el proceso P1, haciendo reaccionar cloroximas de fórmula (II) con iminas de fórmula (III) en un solvente adecuado como dietiléter o tetrahidrofurano opcionalmente en presencia de una base como trietilamina, preferentemente a temperatura ambiente, como se describe anteriormente en WO2003028729 o Synthesis, 2011, 21, 9426.



Los compuestos de fórmula (II) pueden estar comercialmente disponibles o pueden prepararse a partir de compuestos fácilmente disponibles de acuerdo con procedimientos conocidos.

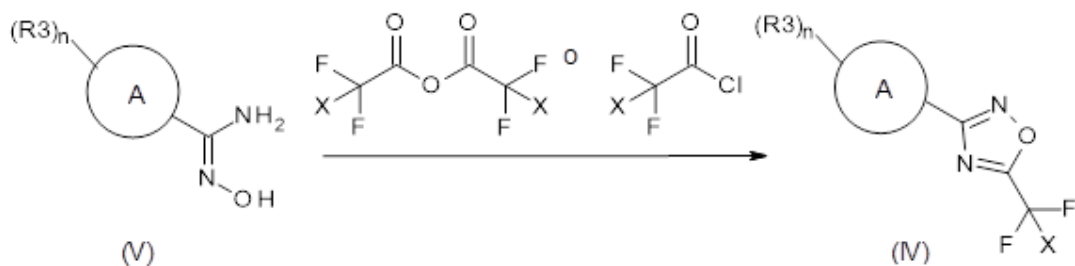
Los compuestos de fórmula (III) pueden estar comercialmente disponibles o pueden prepararse a partir de compuestos comercialmente disponibles de acuerdo con procedimientos conocidos.

De manera alternativa, los compuestos de fórmula (I-a) pueden prepararse de acuerdo con el proceso P2, al hacer reaccionar oxadiazoles de fórmula (IV) con un agente reductor como borohidruro de sodio en un solvente adecuado como metanol, preferentemente a 0 °C como se describió anteriormente en WO2001007436.



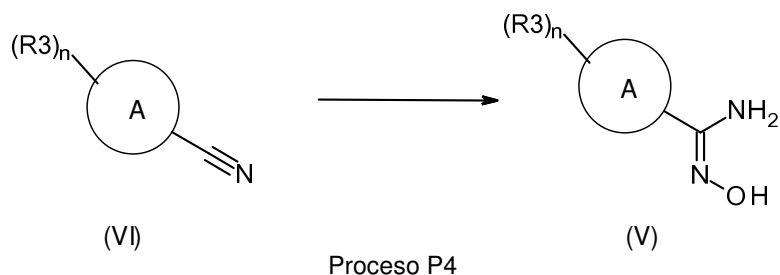
Proceso P2

Los compuestos de fórmula (IV) pueden prepararse, de acuerdo con el proceso P3, haciendo reaccionar amidoximas de fórmula (V) con anhídrido difluorohaloalquilacético o cloruro de difluorohaloalquilacetilo en un solvente adecuado como tetrahidrofurano o diclorometano, opcionalmente en presencia de una base como trietilamina o piridina, preferentemente a temperatura ambiente, como se describe anteriormente en WO2013080120.



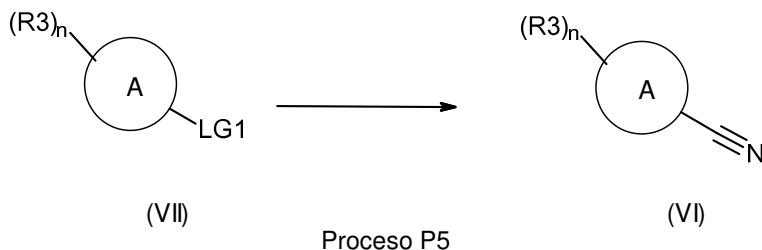
Proceso P3

Las amidoximas de fórmula (V) pueden prepararse de acuerdo con procedimientos conocidos (véase por ejemplo WO2013080120), como se muestra en el proceso P4 al tratar nitrilos de fórmula (VI) con hidroxilamina (o su sal de clorhidrato) en presencia de una base como trietilamina en un solvente como etanol.



Los compuestos de fórmula (VI) pueden estar comercialmente disponibles o pueden prepararse a partir de compuestos comercialmente disponibles de acuerdo con procedimientos conocidos.

De manera alternativa los compuestos de fórmula (VI) pueden prepararse, de acuerdo con el proceso P5, a partir de compuestos de fórmula (VII), donde LG1 es un grupo saliente como por ejemplo bromuro con un reactivo de cianuro adecuado como por ejemplo cianuro de zinc en presencia de una fuente de paladio (0) como *tetrakis*(trifenilfosfina)paladio (0) en un solvente como N,N-dimetilformamida como se describe por ejemplo en ACS Medicinal Chemistry Letters, 8(9), 919-924, 2017.



Los compuestos de fórmula (VII) pueden estar comercialmente disponibles o pueden prepararse a partir de compuestos fácilmente disponibles de acuerdo con procedimientos conocidos.

De acuerdo con la invención, los procesos P1 a P5 pueden realizarse si corresponde en presencia de un solvente y si corresponde en presencia de una base.

Los solventes adecuados para llevar a cabo los procesos P1 a P5 de acuerdo con la invención son solventes orgánicos inertes habituales. Se le da preferencia a usar opcionalmente hidrocarburos halogenados alifáticos, alicíclicos o aromáticos, como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalin ; clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano o tricloroetano ; éteres, como dietil éter, diisopropil éter, metil terc-butil éter, metil terc-amil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol ; nitrilos, como acetonitrilo, propionitrilo, n- o iso-butironitrilo o benzonitrilo ; amidas, como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida hexametilfosfórica; ésteres, como metil acetato o etil acetato, sulfóxidos, como dimetil sulfóxido o sulfonas, como sulfolano.

Bases adecuadas para llevar a cabo los procesos P1 a P5 de acuerdo con la invención son bases inorgánicas y orgánicas que son habituales para tales reacciones. Se le da preferencia al uso de metal alcalinotérreo, hidruro de metal alcalino, hidróxidos de metal alcalino o alcóxidos de metal alcalino, como hidróxido de sodio, hidruro de sodio, hidróxido de calcio, hidróxido de potasio, terc-butóxido de potasio u otro hidróxido de amonio, carbonatos de metal alcalino, como carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, carbonato de cesio, acetatos de metal alcalino o metal alcalinotérreo, como acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio y también aminas terciarias, como trietilamina, diisopropiletilamina, tributilamina, *N,N*-dimetilnilina, piridina, *N*-metilpiperidina, *N,N*-dimetilaminopiridina, 1,4-diazabicyclo[2.2.2]octano (DABCO), 1,5-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno (DBN) o 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno (DBU).

Al llevar a cabo los procesos P1 a P5, de acuerdo con la invención, la temperatura de reacción puede variar independientemente dentro de un intervalo relativamente amplio. Generalmente, los procesos de acuerdo con la invención se llevan a cabo a temperaturas entre -20°C y 160°C.

Los procesos P1 a P5 de acuerdo con la invención generalmente se llevan a cabo independientemente a presión atmosférica. Sin embargo, también es posible operar a presión elevada o reducida.

El seguimiento se lleva a cabo por métodos habituales. Generalmente, la mezcla de reacción se trata con agua y la fase orgánica se separa y, luego de secarse, se concentra a presión reducida. Si corresponde, el residuo restante puede liberarse por métodos habituales, como cromatografía o recristalización, de cualquier impureza que aún esté presente.

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden prepararse de acuerdo con los procesos descritos anteriormente. Igualmente se entenderá que, en función de su conocimiento general y de publicaciones disponibles, el experto en la técnica podrá adaptar estos procesos de acuerdo con los detalles de cada uno de los compuestos de acuerdo con la invención que se desea sintetizar.

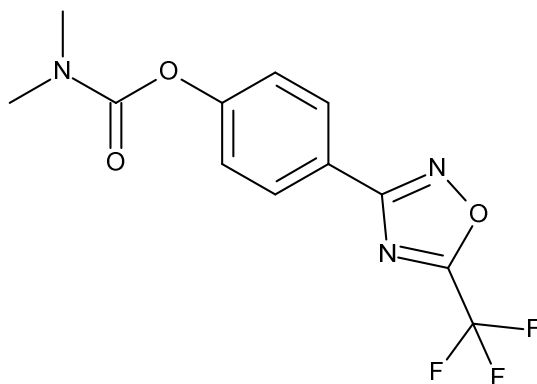
Aspectos de la presente enseñanza pueden además entenderse a la luz de los siguientes ejemplos, que no deberían considerarse como que limitan el alcance de la presente enseñanza de ningún modo.

EJEMPLOS

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

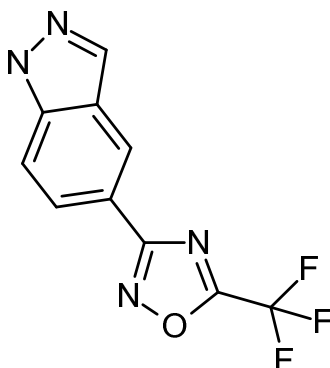
Síntesis de intermedios de fórmula IV

4-[5-(Trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil dimetilcarbamato (Intermedio IV-05)



A una suspensión de 4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenol (0,8 g, 3,5 mmol) en acetonitrilo (15 ml), se agregó carbonato de potasio (0,72 g, 5,2 mmol) y cloruro de dimetilcarbamilo (0,49 ml, 5,2 mmol). La mezcla se sometió a reflujo durante 3 horas. Luego el solvente se evaporó y el residuo se disolvió en agua y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fracciones orgánicas combinadas se lavaron con una solución de hidruro de sodio 1M, se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para proporcionar 4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil dimetilcarbamato (0,96 g, 89 % de rendimiento) como un sólido blanco.

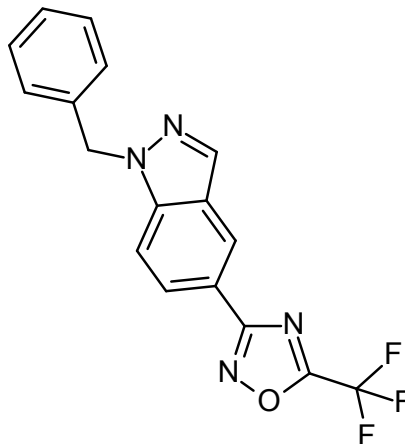
5-[5-(Trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-indazol



A una suspensión de 1H-indazol-5-carbonitrilo (1,0 g, 7,2 mmol) en etanol (25 ml) se agregó clorhidrato de hidroxilamina (1,0 g, 14 mmol), seguido de trietilamina (4,5 ml, 33 mmol). La solución anaranjada se agitó a temperatura ambiente durante 18 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se suspendió en tetrahidrofurano (30 ml). Luego se agregó anhídrido trifluoroacético (1,9 ml, 14 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 5 h. Luego se agregó anhídrido trifluoroacético (1,0 ml, 6,8 mmol) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 h. El solvente se evaporó a presión reducida y el residuo se diluyó con acetato de etilo y se lavó con agua, con una solución de carbonato de hidrógeno de sodio saturado y luego con salmuera. La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida para proporcionar 5-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-indazol (0,62 g, 34% rendimiento) como un sólido amarillo.

MS (ESI): 255 ([M+H]⁺)

1-Bencil-5-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-indazol (Intermedio IV-17)

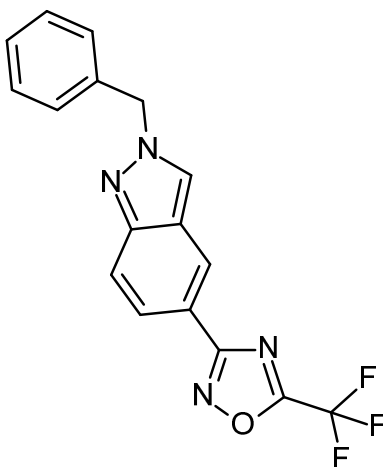


5

A una solución de 5-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-indazol (0,12 g, 0,47 mmol) en N,N-dimetilformamida (3 ml) y se agregó carbonato de potasio (0,16 g, 1,2 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Luego se agregó bromuro de bencilo (62 μ l, 0,51 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 2 días. Se agregó agua y se extrajo la mezcla de reacción dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas se combinaron, se lavaron con salmuera, se secaron en sulfato de magnesio y se concentraron al vacío. El residuo se purificó por cromatografía en columna para proporcionar el compuesto del título 1-bencil-5-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-indazol (75 mg, 46 % de rendimiento) como un aceite amarillo y su regioisómero 2-(2-metoxietil)-5-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-2H-indazol (40 mg, 24 % de rendimiento) como un sólido amarillo.

20 2-Bencil-5-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-indazol (Intermedio IV-15)

MS (ESI): 345 ([M+H]⁺)

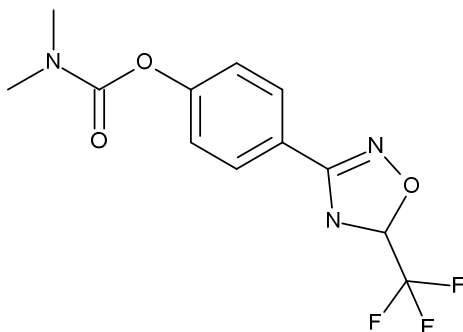


MS (ESI): 345 ([M+H]⁺)

5

Síntesis de los compuestos de la fórmula (I)

4-[5-(Trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil dimetilcarbamato (Compuesto I-03)



10

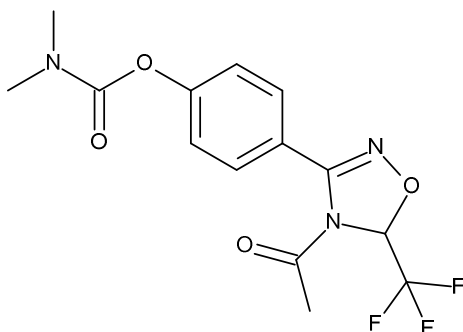
A una suspensión de 4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil dimetilcarbamato (120 mg, 0,39 mmol) en metanol (15 ml) se agregó borohidruro de sodio (72 mg, 1,9 mmol) a 0 °C. La reacción se agitó a 0 °C durante 30 minutos. El solvente se evaporó a presión reducida y el residuo se diluyó en agua y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fracciones orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para proporcionar 4-[5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil dimetilcarbamato (29 mg, 22 % de rendimiento).

15

MS (ESI): 304 ([M+H]⁺)

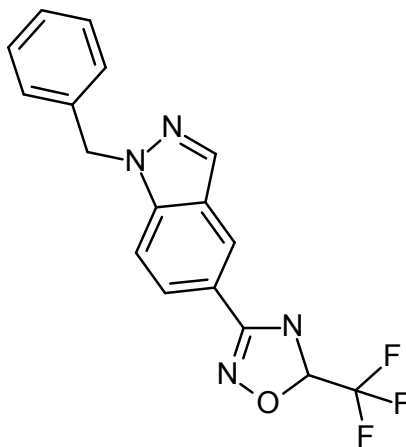
20

4-[Acetil-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil dimetilcarbamato (Compuesto I-16)



A una solución de 4-[5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil dimetilcarbamato (Compuesto I-03) (60 mg, 0,19 mmol) en diclorometano (4 ml) se agregó trietilamina (55 μ l, 0,39 mmol) en anhídrido acético (24 μ l, 0,25 mmol). La reacción se agitó a 40 °C durante 90 minutos. La mezcla de reacción se diluyó luego en diclorometano, se lavó dos veces con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante HPLC para proporcionar 4-[acetil-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil dimetilcarbamato (41 mg, 59 % de rendimiento).

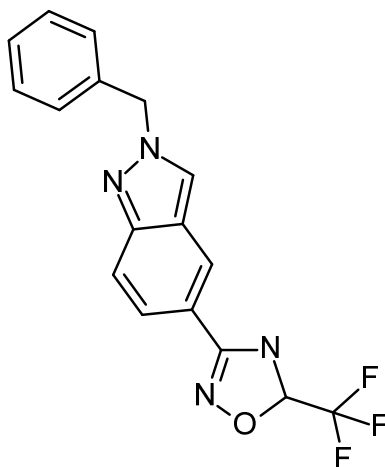
1-Bencil-5-[(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]-2H-indazol (Compuesto I-23)



A una solución de 1-bencil-5-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-indazol (Intermedio IV-17) (0,26 g, 0,74 mmol) en metanol (4 ml) se agregó borohidruro soportado por polímero (2,5 mmol BH_4^- /g resina) (0,6 g, 1,5 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 22 horas. La mezcla de reacción se filtró, se lavó con metanol y se concentró al vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para proporcionar el compuesto del título 1-bencil-5-[(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]-2H-indazol (0,12 g, 45 % de rendimiento) como un sólido blanco.

MS (ESI): 347 ($[\text{M}+\text{H}]^+$)

2-Bencil-5-[(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]-2H-indazol (Compuesto I-24)

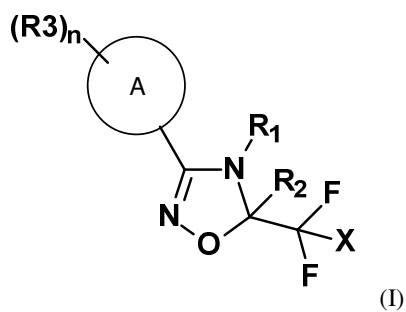


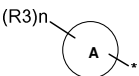
A una solución de 2-bencil-5-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-1H-indazol (Intermedio IV-15) (50 mg, 0,14 mmol) en metanol (4 ml) se agregó borohidruro soportado por polímero (2,5 mmol BH₄/g resina) (0,11 g, 0,29 mmol) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 22 horas. La mezcla de reacción se filtró, se lavó con metanol y se concentró al vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna para proporcionar el compuesto del título 2-bencil-5-[(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2,4-oxadiazol-3-il]-2H-indazol (40 mg, 78% de rendimiento) como un sólido blanco.

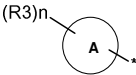
MS (ESI): 347 ([M+H]⁺)

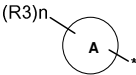
Los compuestos que se muestran en tabla 1 más adelante se prepararon en analogía con los ejemplos provistos anteriormente

Tabla 1: Compuestos de acuerdo con fórmula (I)



Ej. n. ^o	R ₁	R ₂		X	LogP
I-01	H	H	4-[(metoxicarbonil)amino]fenilo	F	1,99 ^[a]
I-02	H	H	4-[[[(ciclopropilcarbonil)amino]metil]fenilo	F	1,86 ^[a]
I-03	H	H	4-(dimetilaminocarbonil)oxifenilo	F	2,19 ^[a]

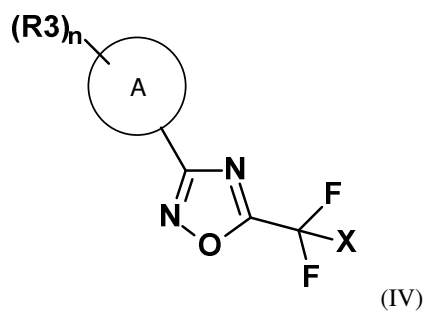
Ej. n.º	R ₁	R ₂		X	LogP
I-04	H	H	4-[[ciclopropilcarbonil)-metoxiamino]metil]fenilo	F	2,42 ^[a]
I-05	H	H	3-metil-3H-bencimidazol-5-ilo	F	0,95 ^[a]
I-06	H	H	4-metilfenilo	F	2,59 ^[a]
I-07	H	H	1-metil-1H-bencimidazol-5-ilo	F	0,99 ^[a]
I-08	H	H	4-[[acetil(metoxi)amino]metil]fenilo	F	1,98 ^[a]
I-09	H	H	3H-bencimidazol-5-ilo	F	0,80 ^[a]
I-10	H	H	4-[(2,4-difluoroanilino)carbonil]fenilo	F	2,68 ^[a]
I-11	H	H	4-[[1-metilciclopropil)amino]carbonil]fenilo	F	2,01 ^[a]
I-12	H	H	4-(metilcarbamoil)fenilo	F	1,47 ^[a]
I-13	H	H	4-[(ciclopropilmetilamino)carbonil]fenilo	F	2,11 ^[a]
I-14	H	H	4-(metilcarbamoil)fenilo	F	2,30 ^[a]
I-15	H	H	4-(ciclopropilmetilcarbamoil)fenilo	F	2,92 ^[a]
I-16	Acetilo	H	4-(dimetilaminocarbonil)oxifenilo	F	2,62 ^[a]
I-17	H	H	4-[(N-metilanolino)carbonil]oxifenilo	F	3,06 ^[a]
I-18	H	H	4-[[etil(metil)amino]carbonil]oxifenilo	F	2,66 ^[a]
I-19	H	H	1-(2-metoxietil)-1H-indazol-6-ilo	F	2,19 ^[a]
I-20	H	H	2-(metoxicarbonil)-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-7-ilo	Cl	2,50 ^[a]
I-21	H	H	1-bencil-6-fluoro-1H-indazol-5-ilo	F	3,02 ^[a]
I-22	H	H	2-bencil-6-fluoro-2H-indazol-5-ilo	F	2,75 ^[a]
I-23	H	H	1-bencil-1H-indazol-5-ilo	F	3,00 ^[a]
I-24	H	H	2-bencil-2H-indazol-5-ilo	F	2,69 ^[a]
I-25	H	H	4-[[isopropil(metil)amino]carbonil]oxifenilo	F	2,86 ^[a]
I-26	H	H	4-[[metoxicarbonil)amino]metil]fenilo	F	1,91 ^[a]
I-27	H	H	4-[[[(4-fluorofenoxi)carbonil)-metoxiamino]metil]fenilo	F	3,21 ^[a]
I-28	H	H	4-(hidroxiiminometil)fenilo	F	1,88 ^[a]
I-29	H	H	4-[(2S)-2-(terc-butoxicarbonil)-5-oxopirrolidin-1-il]fenilo	F	2,78 ^[a]
I-30	H	H	4-[(2-metoxietilamino)carbonil]fenilo	F	1,63 ^[a]
I-31	H	H	1-propionil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-6-ilo	F	2,40 ^[a]
I-32	H	H	6-(dimetilaminocarbonil)oxinaftalen-2-ilo	F	2,84 ^[a]
I-33	H	H	1H-indol-6-ilo	Cl	2,30 ^[a]
I-34	H	H	4-metilsulfanilfenilo	F	2,70 ^[a]
I-35	H	H	1-oxo-1,2-dihidroisoquinolin-6-ilo	F	1,63 ^[a]
I-36	H	H	1H-indol-6-ilo	F	2,19 ^[a]
I-37	H	H	4-metilsulfanilfenilo	Cl	2,82 ^[a]
I-38	H	H	4-(dimetilaminometilenamino)fenilo	F	0,84 ^[a]
I-39	H	H	3-bencil-3H-benzimidazol-5-ilo	F	2,01 ^[a]
I-40	H	H	4-[hidroxiimino(metilsulfanil)metil]fenilo	F	2,08 ^[a]
I-41	H	H	4-[[ciclohexil(metil)amino]carbonil]oxifenilo	F	3,71 ^[a]
I-42	H	H	2-propionil-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-7-ilo	Cl	2,23 ^[a]
I-43	H	H	4-[1-(acetilamino)ciclopropil]fenilo	F	1,65 ^[a]
I-44	H	H	4-[[metil-[(4-tiofen-2-iloxan-4-il)metil]amino]carbonil]fenilo	F	2,70 ^[a]
I-45	H	H	4-(propionilamino)fenilo	F	1,91 ^[a]
I-46	H	H	1-(metoxicarbonil)-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-6-ilo	Cl	2,77 ^[a]

Ej. n.º	R ₁	R ₂		X	LogP
I-47	H	H	4-[[2-(4-chlorofenoxi)-2-metilpropanoil]amino]fenilo	F	3,81 ^[a]
I-48	H	H	4-[[1-(1-metilciclopropil)carbonil]amino]fenilo	F	2,36 ^[a]
I-49	H	H	4-[(N-metilanilino)carbonil]fenilo	F	2,57 ^[a]
I-50	H	H	4-(metoxicarbonil)fenilo	F	2,46 ^[a]
I-51	H	H	4-[3-[(metoxicarbonil)amino]fenil]fenilo	F	2,91 ^[a]
I-52	H	H	4-[2-[(metoxicarbonil)amino]fenil]fenilo	F	2,80 ^[a]
I-53	H	H	4-[(4-metoxifenil)tio]fenilo	F	3,81 ^[a]
I-54	H	H	4-(4-metoxifenil)sulfinilfenilo	F	2,39 ^[a]
I-55	H	H	4-[(2,2-dimetilhidrazino)carbonil]fenilo	F	1,31 ^[a]
I-56	H	H	4-(3-etil-1,2,4-oxadiazol-5-il)fenilo	F	2,94 ^[a]
I-57	H	H	4-[1,1-difluoro-2-oxo-2-(prop-2-in-1-ilamino)etil]fenilo	F	2,36 ^[a]
I-58	H	H	4-(4-metoxifenil)sulfonylfenilo	F	2,89 ^[a]

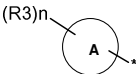
Los intermedios que se muestran en tabla 2 más adelante se prepararon en analogía con los ejemplos provistos anteriormente.

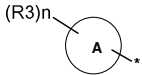
5

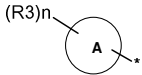
Tabla 2: Intermedios de acuerdo con fórmula (IV)



10

Ej. n.º		X	LogP
IV-01	4-[[ciclopropilcarbonil)-metoxiamino]metil]fenilo	F	3,53 ^[a]
IV-02	4-metilfenilo	F	4,33 ^[a]
IV-03	3-metil-3H-benzimidazol-5-ilo	F	1,67 ^[a]
IV-04	4-[[acetil(metoxi)amino]metil]fenilo	F	2,96 ^[a]
IV-05	4-(dimetilaminocarbonil)oxifenilo	F	3,37 ^[a]
IV-06	1-metil-1H-benzimidazol-5-ilo	F	1,70 ^[a]
IV-07	4-[[ciclopropilcarbonil)amino]metil]fenilo	F	2,71 ^[a]
IV-08	4-[(metoxicarbonil)amino]fenilo	F	3,06 ^[a]
IV-09	3H-benzimidazol-5-ilo	F	1,46 ^[a]
IV-10	4-(metoxicarbonil)fenilo	F	

Ej. n.º		X	LogP
IV-11	4-[3-[(metoxicarbonil)amino]fenil]fenilo	F	4,20 ^[a]
IV-12	4-[2-[(metoxicarbonil)amino]fenil]fenilo	F	3,94 ^[a]
IV-13	6-(dimetilaminocarbonil)oxinaftalen-2-ilo	F	4,18 ^[a]
IV-14	1-(2-metoxietil)-1H-indazol-6-ilo	F	3,35 ^[a]
IV-15	2-bencil-2H-indazol-5-ilo	F	4,03 ^[a]
IV-16	1-propionil-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-6-ilo	F	3,68 ^[a]
IV-17	1-bencil-1H-indazol-5-ilo	F	4,39 ^[a]
IV-18	4-(dimetilaminometilenamino)fenilo	F	1,79 ^[b]
IV-19	1H-indol-6-ilo	F	3,50 ^[a]
IV-20	3-bencil-3H-benzimidazol-5-ilo	F	3,06 ^[a]
IV-21	1-bencil-6-fluoro-1H-indazol-5-ilo	F	4,28 ^[a]
IV-22	2-bencil-6-fluoro-2H-indazol-5-ilo	F	3,92 ^[a]
IV-23	4-[[ciclohexil(metil)amino]carbonil]oxifenilo	F	5,17 ^[a]
IV-24	1-(metoxicarbonil)-1,2,3,4-tetrahidroquinolin-6-ilo	Cl	4,27 ^[a]
IV-25	2-(metoxicarbonil)-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-7-ilo	Cl	3,83 ^[a]
IV-26	2-propionil-1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-7-ilo	Cl	3,31 ^[a]
IV-27	1H-indol-6-ilo	Cl	3,68 ^[a]
IV-28	4-metilsulfanilfenilo	Cl	4,61 ^[a]
IV-29	4-[[2-(4-chlorofenoxi)-2-metilpropanoil]amino]fenilo	F	5,11 ^[a]
IV-30	4-[[metil-[(4-tiofen-2-iloxan-4-il)metil]amino]carbonil]fenilo	F	3,71 ^[a]
IV-31	1-oxo-1,2-dihidroisoquinolin-6-ilo	F	2,39 ^[a]
IV-32	4-[(N-metilanilino)carbonil]oxifenilo	F	4,27 ^[a]
IV-33	4-[(2S)-2-(terc-butoxicarbonil)-5-oxopirrolidin-1-il]fenilo	F	3,95 ^[a]
IV-34	4-(4-metoxifenil)sulfonilfenilo	F	3,72 ^[a]
IV-35	4-[[[(4-fluorofenoxi)carbonil]-metoxiamino]metil]fenilo	F	4,40 ^[a]
IV-36	4-(4-metoxifenil)sulfinilfenilo	F	3,26 ^[a]
IV-37	4-[(N-metilanilino)carbonil]fenilo	F	3,50 ^[a]
IV-38	4-[(ciclopropilmetilamino)carbonil]fenilo	F	3,04 ^[a]
IV-39	4-[[[(1-metilciclopropil)carbonil]amino]fenilo	F	3,60 ^[a]
IV-40	4-(metilcarbamoil)fenilo	F	2,21 ^[a]
IV-41	4-(propionilamino)fenilo	F	3,00 ^[a]
IV-42	4-[(4-metoxifenil)tio]fenilo	F	5,37 ^[a]
IV-43	4-[(2-metoxietilamino)carbonil]fenilo	F	2,42 ^[a]
IV-44	4-[[etil(metil)amino]carbonil]oxifenilo	F	3,79 ^[a]
IV-45	4-[1,1-difluoro-2-oxo-2-(prop-2-in-1-ilamino)etil]fenilo	F	
IV-46	4-(3-etil-1,2,4-oxadiazol-5-il)fenilo	F	
IV-47	4-[(2,2-dimetilhidrazino)carbonil]fenilo	F	
IV-48	4-[1-(acetilamino)ciclopropil]fenilo	F	
IV-49	4-[(2,4-difluoroanilino)carbonil]fenilo	F	3,72 ^[a]
IV-50	4-[[[(1-metilciclopropil)amino]carbonil]fenilo	F	2,92 ^[a]
IV-51	4-(metilcarbamoitioil)fenilo	F	3,19 ^[a]
IV-52	4-metilsulfanilfenilo	F	4,24 ^[a]
IV-53	4-(hidroxiiminometil)fenilo	F	2,90 ^[a]

Ej. n.º		X	LogP
IV-54	4-[hidroxiimino(metilsulfanil)metil]fenilo	F	3,08 ^[a]
IV-55	4-(ciclopropilmetilcarbamoiloil)fenilo	F	4,03 ^[a]
IV-56	4-[[isopropil(metil)amino]carbonil]oxifenilo	F	4,18 ^[a]

La medición de valores LogP se realizó de acuerdo con la directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento) en columnas de fase inversa con los siguientes métodos:

- ^[a] El valor LogP se determina por medición de LC-UV, en un intervalo ácido, con 0,1% de ácido fórmico en agua y acetonitrilo como eluyente (gradiente lineal de 10 % de acetonitrilo a 95 % de acetonitrilo).
- ^[b] El valor LogP se determina por medición de LC-UV, en un intervalo neutro, con 0,001 de solución de acetato de amonio molar en agua y acetonitrilo como eluyente (gradiente lineal de 10 % de acetonitrilo a 95 % de acetonitrilo).
- ^[c] El valor LogP se determina por medición de LC-UV, en un intervalo ácido, con 0,1% de ácido fosfórico y acetonitrilo como eluyente (gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 95% de acetonitrilo).

- Si más de un valor LogP está disponible en el mismo método, todos los valores se brindan y separan por “+”.

La calibración se hizo con alcan2-onas de cadena recta (con 3 a 16 átomos de carbono) con valores LogP conocidos (medición de valores LogP usando tiempos de retención con interpolación lineal entre alcanonas sucesivas). Se determinaron los valores máximos lambda usando espectros UV de 200 nm a 400 nm y los valores pico de las señales cromatográficas.

Listas de picos NMR

- Los datos de 1H-NMR de ejemplos seleccionados se escriben en forma de listas de picos 1H-NMR. Para cada pico de la señal se enumeran el valor δ en ppm y la intensidad de la señal entre paréntesis. Entre el valor de δ – los pares de intensidad de señal hay punto y coma como delimitadores.

La lista de picos de un ejemplo tiene entonces la forma:

δ_1 (intensidad₁); δ_2 (intensidad₂);.....; δ_i (intensidad_i);.....; δ_n (intensidad_n)

- La intensidad de las señales agudas se correlaciona con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro NMR en cm y muestra las relaciones reales de intensidades de señal. De señales anchas se puede mostrar varios picos o la mitad de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensa en el espectro.

Para la calibración del cambio químico de espectros ^1H , usamos tetrametilsilano y/o el cambio químico del solvente usado, especialmente en el caso de los espectros medidos en DMSO. Por lo tanto, en las listas de picos NMR, el pico de tetrametilsilano puede ocurrir pero no es necesario que lo haga.

- 5 Las listas de picos ^1H -NMR son similares a las impresiones de ^1H -NMR clásicas y por lo tanto contienen habitualmente todos los picos, que se enumeran en la interpretación de NMR clásica.

Además, pueden mostrar, al igual que las impresiones clásicas de ^1H -NMR, señales de solventes, estereoisómeros de los compuestos diana, que también son objeto de la invención y/o picos de impurezas.

- 10 Para mostrar las señales del compuesto en el intervalo delta de los solventes y/o agua, los picos habituales de solventes, por ejemplo, picos de DMSO en DMSO- D_6 y el pico de agua se muestran en nuestras listas de picos ^1H -NMR y habitualmente tienen en promedio una alta intensidad.

El pico de estereoisómeros de los compuestos diana y/o los picos de impurezas habitualmente tienen, en promedio, una menor intensidad que los picos de los compuestos diana (por ejemplo, con una

- 15 pureza > 90 %).

Estos estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos para el proceso de preparación específico. Por lo tanto, sus picos pueden ayudar a reconocer la reproducción de nuestro proceso de preparación mediante “huellas de productos secundarios”.

- 20 Un experto, que calcula los picos de los compuestos diana con métodos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores de expectativa evaluados empíricamente) puede aislar los picos de los compuestos diana según sea necesario, usando opcionalmente filtros de intensidad adicionales. El aislamiento sería similar a la elección de picos relevantes en una interpretación clásica de ^1H -NMR.

- 25 Otros detalles de la descripción de datos NMR con listas de picos los encontrará en la publicación “Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications” de la base de datos de divulgación de investigación número 564025.

I-01: ^1H -NMR(499,9 MHz, d_6 -DMSO): δ = 7,6426 (3,3); 7,6250 (5,3); 7,5718 (4,4); 7,5543 (2,8); 6,2412 (0,4); 6,2321 (1,4); 6,2225 (1,5); 6,2128 (0,6); 3,7089 (0,5); 3,7004 (0,3); 3,6879 (16,0); 3,6740 (0,6); 3,6661 (0,5); 3,3218 (2,0); 3,0940 (7,8); 3,0513 (11,6); 2,5013 (8,3); -0,0002 (5,9)
I-02: ^1H -NMR(499,9 MHz, d_6 -DMSO): δ = 8,6499 (1,9); 8,6382 (3,3); 8,6265 (1,8); 7,7377 (0,9); 7,7212 (1,0); 7,6925 (11,0); 7,6760 (11,8); 7,3803 (10,5); 7,3639 (9,0); 7,3214 (0,7); 7,3050 (0,6); 6,3006 (1,6); 6,2913 (4,4); 6,2818 (4,5); 6,2722 (1,6); 4,3871 (0,4); 4,3706 (0,5); 4,3398 (9,7); 4,3279 (10,0); 4,3159 (0,9); 3,3355 (12,0); 3,1773 (0,4); 3,1023 (13,2); 3,0787 (16,0); 2,5162 (4,5); 2,5127 (8,5); 2,5091 (11,1); 2,5056 (7,8); 2,5021 (3,6); 1,6442 (1,1); 1,6345 (2,1); 1,6288 (2,3); 1,6240 (1,8); 1,6193 (3,8); 1,6124 (1,7); 1,6097 (2,2); 1,6039 (2,1); 1,5941 (1,0); 0,7273 (1,8); 0,7170 (5,1); 0,7113 (10,3); 0,7076 (8,5); 0,7019 (9,2); 0,6975 (8,5); 0,6935 (10,0); 0,6881 (4,5); 0,6822 (4,9); 0,6779 (8,0); 0,6724 (3,8); 0,6623 (1,1); 0,6573 (0,5)
I-03: ^1H -NMR(300,2 MHz, d_6 -DMSO): δ = 8,6247 (0,6); 7,7644 (1,8); 7,7577 (0,6); 7,7419 (0,6); 7,7351 (2,1); 7,3026 (2,1); 7,2957 (0,6); 7,2800 (0,6); 7,2733 (1,8); 6,3328 (0,7); 6,3169 (0,8); 3,3388 (16,0); 3,0742 (3,4); 2,9418 (3,3); 2,5344 (2,8); 2,5284 (6,0); 2,5223 (8,2); 2,5162 (5,8); 2,5102 (2,6); 0,0320 (0,5); 0,0212 (15,0); 0,0102 (0,5)

I-04: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,7307 (2,9); 7,7031 (3,4); 7,5913 (0,4); 7,4047 (0,4); 7,3656 (2,5); 7,3384 (2,2); 7,2986 (2,8); 5,8988 (0,4); 5,8841 (1,3); 5,8694 (1,4); 5,8547 (0,5); 4,8513 (0,9); 4,8299 (4,0); 3,7659 (2,2); 3,7549 (16,0); 3,2587 (4,5); 3,1761 (1,2); 2,2346 (0,3); 2,2229 (0,4); 2,2088 (0,6); 2,1943 (0,5); 2,1827 (0,4); 1,4645 (0,4); 1,0705 (0,6); 1,0555 (1,5); 1,0457 (2,2); 1,0362 (1,4); 1,0307 (1,8); 1,0199 (0,7); 0,9413 (0,7); 0,9304 (2,0); 0,9208 (1,4); 0,9154 (1,5); 0,9038 (2,2); 0,8940 (1,4); 0,8794 (0,6); 0,0329 (3,0)
I-05: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,3437 (3,1); 7,9785 (1,8); 7,9751 (1,8); 7,7638 (1,2); 7,7353 (1,8); 7,6289 (1,4); 7,6236 (1,4); 7,6006 (1,0); 7,5954 (0,9); 6,3327 (0,4); 6,3163 (1,1); 6,3003 (1,2); 6,2841 (0,4); 3,9078 (10,5); 3,8820 (0,5); 3,3398 (16,0); 3,1137 (3,7); 3,0595 (7,9); 2,5343 (6,7); 2,5284 (13,9); 2,5223 (19,0); 2,5162 (13,7); 2,5103 (6,4); 0,0321 (0,6); 0,0213 (18,4); 0,0104 (0,8)
I-06: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,6539 (4,3); 7,6265 (5,2); 7,3059 (4,5); 7,2993 (13,0); 7,2795 (3,5); 5,9395 (0,5); 5,9245 (1,5); 5,9086 (2,2); 5,8934 (1,7); 5,8784 (0,5); 5,1048 (0,8); 2,4437 (16,0); 1,6088 (4,3); 1,2917 (1,8); 0,0485 (0,4); 0,0377 (10,2); 0,0268 (0,4)
I-07: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,3274 (4,6); 8,0283 (3,1); 7,7285 (0,5); 7,7025 (3,9); 7,6999 (4,3); 7,6976 (3,9); 7,6928 (3,0); 7,6645 (0,4); 6,3249 (0,5); 6,3091 (1,8); 6,2931 (1,9); 6,2771 (0,6); 3,9145 (0,3); 3,8972 (15,1); 3,8752 (1,3); 3,8677 (0,4); 3,3422 (16,0); 3,1140 (5,8); 3,0607 (12,0); 2,5344 (5,2); 2,5283 (11,3); 2,5222 (15,6); 2,5161 (11,3); 2,5101 (5,2); 0,0319 (0,7); 0,0211 (23,8); 0,0101 (0,8)
I-08: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,7503 (2,0); 7,7230 (2,4); 7,4418 (1,5); 7,4160 (1,4); 7,2982 (35,7); 5,9441 (0,5); 5,9293 (1,5); 5,9146 (1,6); 5,8998 (0,6); 4,8788 (0,3); 4,8485 (5,0); 3,6935 (16,0); 3,3304 (3,6); 3,2681 (0,6); 2,2307 (11,6); 0,0479 (1,6); 0,0372 (46,7); 0,0294 (1,5); 0,0279 (1,4); 0,0263 (1,7)
I-09: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,3394 (1,2); 8,2794 (2,8); 8,1924 (1,2); 8,0253 (0,6); 7,9504 (1,5); 7,9470 (1,5); 7,6581 (0,9); 7,6300 (1,6); 7,5769 (0,6); 7,5718 (0,6); 7,5606 (0,9); 7,5539 (1,2); 7,5486 (1,1); 7,5258 (0,7); 7,5205 (0,7); 6,2746 (1,0); 6,2586 (1,0); 6,2424 (0,4); 5,7774 (0,6); 3,1130 (7,5); 3,0980 (16,0); 2,5341 (2,9); 2,5282 (6,5); 2,5221 (9,1); 2,5160 (6,8); 2,5101 (3,4); 0,0208 (10,2); 0,0099 (0,5)
I-10: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,1194 (1,0); 8,0912 (1,3); 7,9101 (1,4); 7,8818 (1,1); 7,6354 (0,4); 7,6147 (0,4); 6,4057 (0,5); 6,3898 (0,5); 3,3489 (16,0); 2,5345 (0,8); 2,5286 (1,8); 2,5225 (2,6); 2,5165 (1,9); 2,5106 (0,9); 0,0203 (3,1)
I-11: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,8103 (1,1); 8,7254 (0,8); 8,7108 (0,8); 7,9498 (1,5); 7,9214 (2,2); 7,8030 (2,3); 7,7747 (1,5); 6,3756 (0,5); 6,3602 (0,7); 6,3449 (0,5); 3,3481 (16,0); 2,5345 (1,0); 2,5285 (2,1); 2,5225 (3,0); 2,5164 (2,2); 2,5105 (1,0); 1,3904 (5,8); 0,7864 (0,4); 0,7627 (1,3); 0,7494 (0,6); 0,6563 (0,7); 0,6423 (1,4); 0,6362 (1,2); 0,6179 (0,4); 0,0200 (4,5)
I-12: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,7171 (1,0); 8,6156 (1,2); 8,6006 (1,2); 7,9740 (4,2); 7,9516 (1,9); 7,9456 (6,5); 7,8317 (6,5); 7,8033 (4,3); 6,3923 (0,7); 6,3766 (2,3); 6,3608 (2,5); 6,3448 (0,8); 3,3498 (16,0); 2,8251 (9,0); 2,8099 (9,0); 2,5345 (2,0); 2,5285 (4,3); 2,5224 (6,1); 2,5164 (4,4); 2,5106 (2,1); 0,0197 (8,3)
I-13: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,7563 (1,0); 8,7289 (3,5); 8,0017 (5,0); 7,9734 (7,2); 7,8393 (7,2); 7,8110 (5,1); 6,3925 (0,6); 6,3778 (1,6); 6,3622 (1,7); 6,3463 (0,6); 3,3523 (16,0); 3,1958 (2,9); 3,1748 (4,4); 3,1543 (3,0); 2,5344 (1,1); 2,5285 (2,4); 2,5225 (3,3); 2,5165 (2,4); 2,5106 (1,2); 1,0852 (0,6); 1,0817 (0,7); 1,0749 (0,7); 1,0699 (0,6); 1,0589 (1,2); 1,0482 (0,6); 1,0428 (0,7); 1,0362 (0,7); 1,0325 (0,7); 1,0164 (0,4); 0,4917 (1,0); 0,4775 (3,0); 0,4714 (3,4); 0,4655 (1,6); 0,4581 (1,7); 0,4504 (3,2); 0,4443 (3,0); 0,4315 (1,3); 0,2799 (1,3); 0,2659 (3,6); 0,2618 (3,7); 0,2506 (3,2); 0,2456 (3,7); 0,2306 (0,9); 0,0187 (4,4)
I-14: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,7213 (0,4); 8,7067 (0,4); 7,8976 (0,7); 7,8755 (0,3); 7,8691 (1,2); 7,7885 (1,2); 7,7598 (0,7); 6,3690 (0,4); 3,3474 (16,0); 3,1851 (1,6); 3,1698 (1,6); 2,5346 (1,0); 2,5286 (2,1); 2,5226 (2,9); 2,5165 (2,1); 2,5108 (1,0); 0,0207 (3,1)
I-15: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 10,5592 (0,4); 8,7293 (0,8); 8,7148 (0,8); 7,8638 (1,2); 7,8418 (0,7); 7,8352 (3,0); 7,7898 (2,9); 7,7673 (0,5); 7,7611 (1,3); 6,3846 (0,5); 6,3692 (0,7); 6,3539 (0,5); 3,6131 (1,0); 3,5947 (1,2); 3,5901 (1,2); 3,5718 (1,0); 3,3479 (16,0); 2,5345 (0,9); 2,5286 (2,1); 2,5225 (2,9); 2,5165 (2,1); 2,5106 (1,0); 1,2635 (0,4); 0,5402 (0,9); 0,5341 (1,1); 0,5207 (0,6); 0,5132 (1,0); 0,5070 (1,0); 0,4941 (0,4); 0,3621 (0,4); 0,3479 (1,2); 0,3443 (1,2); 0,3328 (1,0); 0,3277 (1,2); 0,0207 (3,5)
I-16: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,7103 (0,5); 7,7018 (3,3); 7,6952 (1,2); 7,6794 (1,3); 7,6727 (3,8); 7,6642 (0,6); 7,3590 (4,1); 7,3523 (1,3); 7,3361 (1,2); 7,3297 (3,4); 7,2986 (11,3); 6,6422 (0,6); 6,6260 (1,7); 6,6097 (1,8); 6,5935 (0,6); 3,1630 (10,0); 3,0735 (10,0); 1,9781 (16,0); 1,5897 (8,9); 0,0476 (0,6); 0,0369 (13,1); 0,0260 (0,6)
I-17: ¹H-NMR(400,1 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,6262 (4,5); 7,7508 (11,3); 7,7293 (13,1); 7,4989 (7,1); 7,4794 (16,0); 7,4597 (12,3); 7,4413 (14,8); 7,4209 (7,0); 7,3188 (9,6); 7,3009 (11,6); 7,2837 (4,6); 6,3348 (2,0); 6,3234 (6,2); 6,3117 (6,9); 6,2997 (2,8); 4,0459 (0,5); 4,0281 (0,5); 3,3577 (12,8); 3,3428 (53,5); 3,2238 (0,8); 3,0836 (0,3); 2,5146 (16,7); 2,5104 (23,3); 2,5061 (18,2); 1,9977 (2,0); 1,2004 (0,6); 1,1825 (1,1); 1,1648 (0,5)
I-18: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,7264 (2,7); 7,6976 (3,1); 7,2996 (12,2); 7,2296 (1,6); 7,2072 (1,4); 5,8970 (0,8); 5,8813 (1,3); 5,8661 (1,0); 5,4011 (0,9); 5,3852 (0,8); 5,3551 (0,8); 3,5114 (0,9); 3,4900 (0,6); 3,4680 (0,8); 3,4439 (0,8); 3,1212 (3,2); 3,0418 (3,4); 1,5869 (16,0); 1,3186 (0,9); 1,2947 (1,9); 1,2691 (1,6); 1,2441 (1,7); 1,2204 (0,8); 0,0487 (0,6); 0,0392 (14,8)

I-19: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 8,0966 (2,6); 7,8913 (2,0); 7,8318 (1,4); 7,8036 (1,6); 7,5672 (1,2); 7,5630 (1,4); 7,5391 (0,9); 7,5349 (1,1); 7,2997 (17,2); 5,9882 (0,6); 5,9723 (0,9); 5,9569 (0,6); 5,3393 (6,7); 5,2171 (0,5); 4,6403 (1,5); 4,6223 (2,8); 4,6049 (1,7); 3,9036 (1,8); 3,8858 (3,3); 3,8681 (1,6); 3,5400 (1,3); 3,5217 (1,3); 3,3308 (12,0); 2,0841 (0,8); 1,5971 (16,0); 1,2980 (0,5); 0,1081 (0,4); 0,0496 (0,8); 0,0387 (22,2)
I-20: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,5698 (0,6); 7,5452 (0,7); 7,4735 (1,7); 7,2995 (1,7); 7,2487 (1,6); 7,2221 (1,4); 5,9643 (0,6); 5,9494 (1,3); 5,9304 (1,4); 5,9154 (0,7); 4,6397 (5,4); 3,7764 (16,0); 3,7405 (1,1); 3,7210 (2,0); 3,7022 (1,2); 2,9183 (1,5); 2,8987 (2,6); 2,8791 (1,4); 2,0763 (1,0); 1,7330 (3,4); 1,3153 (0,4); 1,2916 (0,9); 0,9151 (0,4); 0,0335 (1,9)
I-21: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,3015 (0,4); 7,3178 (0,3); 7,2765 (0,3); 5,6860 (0,6); 3,3419 (16,0); 2,5343 (1,5); 2,5286 (3,0); 2,5226 (4,1); 2,5166 (3,1); 0,0213 (5,0)
I-22: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 8,2915 (2,0); 8,2682 (2,0); 8,0393 (3,4); 7,4909 (1,7); 7,4479 (2,0); 7,4346 (1,7); 7,4161 (3,7); 7,4107 (4,2); 7,4016 (1,2); 7,3538 (2,3); 7,3442 (1,8); 7,3284 (1,5); 7,3224 (1,2); 7,2993 (18,9); 5,9809 (1,0); 5,9671 (1,3); 5,9551 (1,0); 5,9408 (0,3); 5,6274 (8,2); 2,0841 (0,9); 1,5866 (16,0); 1,2983 (0,6); 0,0484 (1,0); 0,0387 (25,1)
I-23: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,6202 (0,4); 8,6050 (0,4); 8,2922 (0,9); 8,1897 (0,7); 7,8739 (0,3); 7,8442 (0,6); 7,7591 (0,4); 7,7543 (0,5); 7,3325 (0,6); 7,3084 (0,8); 7,2978 (0,5); 7,2919 (0,3); 7,2755 (0,3); 7,2516 (0,7); 7,2460 (0,7); 7,2254 (0,4); 6,3170 (0,4); 5,7285 (1,5); 3,3432 (16,0); 2,5287 (3,1); 2,5228 (4,4); 2,5169 (3,4); 0,0213 (5,9)
I-24: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,7220 (0,8); 8,5538 (0,3); 8,1571 (0,6); 7,6761 (0,5); 7,5864 (0,4); 7,5812 (0,4); 7,3791 (0,3); 7,3647 (1,6); 7,3608 (1,6); 5,6981 (1,4); 3,3451 (16,0); 2,5285 (3,6); 2,5226 (4,9); 2,5168 (3,7); 0,0212 (5,0)
I-25: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,7140 (4,2); 7,6854 (4,9); 7,3002 (13,5); 7,2227 (2,2); 7,1945 (2,1); 5,9033 (0,4); 5,8874 (1,2); 5,8722 (1,9); 5,8571 (1,4); 5,8416 (0,4); 5,4945 (1,2); 4,5286 (0,6); 4,5053 (0,6); 4,4837 (0,4); 4,1718 (0,4); 4,1481 (0,4); 2,9776 (4,6); 2,9151 (2,9); 2,0841 (1,8); 1,5951 (16,0); 1,3222 (0,7); 1,2970 (3,9); 1,2739 (4,1); 1,2501 (5,4); 1,2275 (4,8); 0,0389 (17,5)
I-26: ¹H-NMR(499,9 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,6117 (2,3); 7,8017 (2,0); 7,7364 (5,8); 7,7204 (6,3); 7,4339 (6,2); 7,4180 (5,6); 6,3416 (2,8); 6,3325 (2,8); 6,3234 (1,1); 4,2944 (5,4); 4,2826 (5,4); 3,6123 (16,0); 3,3753 (4,9); 2,5582 (4,5)
I-27: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,7527 (3,0); 7,7252 (4,0); 7,6850 (0,4); 7,5057 (3,5); 7,4784 (2,9); 7,2996 (2,1); 7,1239 (0,7); 7,1076 (6,3); 7,0937 (3,4); 7,0825 (3,7); 7,0726 (0,6); 7,0513 (0,4); 5,8859 (1,0); 5,8697 (1,6); 5,8546 (1,3); 5,8398 (0,4); 5,4682 (1,2); 5,4517 (1,2); 4,8288 (6,9); 4,7106 (0,6); 3,8345 (1,4); 3,7811 (16,0); 3,6601 (1,4); 1,6614 (4,1); 1,3029 (0,7); 1,2945 (0,6); 0,9200 (0,6); 0,0382 (2,4)
I-28: ¹H-NMR(499,9 MHz, d₆-DMSO): δ= 11,4973 (16,0); 8,6274 (3,9); 8,6188 (3,7); 8,2018 (12,7); 7,7552 (5,0); 7,7420 (4,4); 7,7381 (15,9); 7,7231 (15,1); 7,7193 (3,4); 7,7060 (4,3); 6,3384 (0,8); 6,3296 (2,2); 6,3204 (3,1); 6,3113 (2,1); 6,3019 (0,6); 3,3257 (84,8); 2,5142 (4,2); 2,5106 (8,0); 2,5070 (10,5); 2,5034 (7,4); 2,4998 (3,4); 1,9934 (0,5)
I-29: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,7632 (1,2); 7,7538 (1,2); 7,7342 (1,8); 7,7245 (1,7); 7,5945 (2,3); 7,5668 (1,5); 7,2993 (1,8); 5,9047 (0,7); 5,8900 (1,0); 5,8753 (0,7); 4,7137 (0,4); 4,7028 (0,4); 4,6846 (0,6); 4,6779 (0,6); 4,6488 (0,5); 4,6390 (0,3); 2,8209 (0,3); 2,7922 (0,5); 2,7648 (0,8); 2,6613 (0,4); 2,6492 (0,4); 2,6300 (0,6); 2,6183 (0,7); 2,5747 (0,8); 2,5664 (0,6); 2,5594 (0,5); 2,5278 (0,5); 2,5175 (0,4); 2,4970 (0,4); 2,2445 (0,5); 2,2356 (0,3); 2,2147 (0,7); 2,2040 (0,4); 2,1720 (0,3); 1,6980 (0,5); 1,4362 (16,0); 1,4153 (15,5); 0,0336 (1,8)
I-30: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 7,9939 (0,7); 7,9661 (1,0); 7,8348 (1,0); 7,8071 (0,7); 6,3757 (0,4); 6,3602 (0,4); 3,4883 (0,8); 3,4759 (1,3); 3,4646 (0,6); 3,4463 (0,4); 3,3461 (16,0); 3,2910 (4,0); 3,1125 (0,4); 3,0763 (0,5); 2,5283 (4,0); 2,5226 (5,4); 2,5170 (4,1); 0,0208 (5,4)
I-31: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,5729 (4,8); 7,5361 (4,0); 7,2984 (19,7); 5,9178 (1,2); 5,9043 (1,7); 5,8906 (1,2); 5,3306 (1,4); 3,8592 (0,4); 3,8380 (2,4); 3,8295 (2,2); 3,8173 (4,3); 3,8080 (4,2); 3,7956 (2,3); 3,7874 (2,4); 3,7659 (0,4); 2,9951 (1,3); 2,9188 (1,1); 2,8301 (3,0); 2,8079 (6,2); 2,7862 (3,4); 2,6487 (1,1); 2,6095 (2,2); 2,5848 (7,4); 2,5603 (7,6); 2,5358 (2,5); 2,0818 (0,6); 2,0611 (1,3); 2,0395 (4,2); 2,0180 (5,6); 1,9966 (3,8); 1,9746 (1,0); 1,6154 (4,2); 1,2956 (0,4); 1,2512 (7,8); 1,2267 (16,0); 1,2020 (7,2); 0,0465 (0,7); 0,0358 (19,2); 0,0249 (0,7)
I-32: ¹H-NMR(400,1 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,7199 (3,7); 8,7092 (3,6); 8,5018 (0,4); 8,3274 (6,7); 8,1410 (0,5); 8,1192 (0,6); 8,0844 (4,3); 8,0622 (4,6); 8,0094 (3,9); 7,9878 (4,9); 7,8350 (4,4); 7,8132 (3,2); 7,7476 (5,7); 7,4336 (3,1); 7,4294 (3,0); 7,4116 (2,9); 7,4072 (2,8); 6,3677 (2,1); 6,3567 (3,1); 6,3451 (2,2); 3,3110 (20,2); 3,1149 (16,0); 2,9614 (15,9); 2,8987 (0,6); 2,7405 (0,5); 2,5481 (0,5); 2,5090 (14,4)
I-33: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,8602 (1,0); 7,7506 (0,7); 7,7230 (0,8); 7,5040 (0,7); 7,4991 (0,7); 7,4765 (0,6); 7,4715 (0,6); 7,4010 (0,6); 7,3907 (0,9); 7,3822 (0,6); 7,2989 (20,5); 6,6601 (0,5); 6,6530 (0,7); 6,6461 (0,5); 5,9751 (0,6); 5,9699 (0,4); 5,9602 (0,4); 5,9551 (0,6); 5,9402 (0,3); 3,9886 (0,3); 3,9338 (1,1); 1,5891 (16,0); 1,2918 (1,5); 0,0492 (0,8); 0,0384 (21,3); 0,0276 (0,8)
I-34: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,6746 (0,5); 7,6676 (3,1); 7,6611 (1,0); 7,6452 (1,2); 7,6388 (3,6); 7,6317 (0,6); 7,3347 (0,6); 7,3279 (3,7); 7,3215 (1,2); 7,2985 (17,2); 5,9273 (1,0); 5,9122 (1,2); 5,8951 (1,0); 5,0473 (0,5); 5,0317 (0,5); 2,5546 (16,0); 1,5818 (14,0); 0,0488 (0,7); 0,0380 (18,4); 0,0271 (0,7)

I-35: ¹H-NMR(499,9 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,2625 (2,6); 8,2458 (2,8); 8,1777 (0,5); 8,1609 (0,6); 8,1439 (0,3); 8,0146 (4,4); 7,8448 (0,4); 7,8280 (0,4); 7,7833 (2,2); 7,7802 (2,4); 7,7666 (2,2); 7,7634 (2,4); 7,2587 (3,2); 7,2444 (3,5); 7,2025 (0,7); 7,1883 (0,7); 6,6458 (3,0); 6,6314 (3,0); 6,5706 (0,7); 6,5563 (0,6); 6,3779 (1,6); 6,3688 (1,7); 6,3595 (0,7); 3,3274 (4,0); 3,2372 (0,5); 3,1702 (0,8); 3,0954 (16,0); 2,5244 (0,5); 2,5208 (0,8); 2,5066 (22,2); 2,5031 (30,5); 2,4997 (23,8); -0,0002 (0,4)
I-36: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 7,7961 (0,7); 7,6576 (0,5); 7,6298 (0,6); 7,5525 (0,4); 7,5436 (0,6); 7,5342 (0,4); 7,4010 (0,5); 7,3960 (0,5); 7,3734 (0,4); 7,3683 (0,4); 6,5325 (0,4); 3,3381 (16,0); 2,5343 (2,6); 2,5283 (5,7); 2,5223 (7,9); 2,5162 (5,7); 2,5103 (2,6); 0,0322 (0,4); 0,0213 (12,9); 0,0103 (0,5)
I-37: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,7301 (0,5); 8,7167 (0,5); 7,6737 (1,1); 7,6674 (0,4); 7,6515 (0,4); 7,6449 (1,4); 7,3989 (1,4); 7,3925 (0,4); 7,3764 (0,4); 7,3701 (1,1); 6,2896 (0,4); 6,2754 (0,3); 3,3384 (16,0); 2,5408 (6,2); 2,5347 (2,3); 2,5285 (4,2); 2,5223 (5,8); 2,5163 (4,2); 2,5103 (1,9); 0,0213 (9,4); 0,0103 (0,3)
I-38: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,6553 (0,4); 7,6473 (2,7); 7,6408 (1,1); 7,6252 (1,0); 7,6185 (2,9); 7,6104 (0,5); 7,5999 (2,7); 7,2987 (10,2); 7,0544 (0,5); 7,0463 (2,8); 7,0398 (0,9); 7,0239 (0,9); 7,0175 (2,5); 7,0097 (0,3); 5,8975 (0,7); 5,8814 (0,9); 5,8658 (0,7); 5,1212 (0,5); 5,1058 (0,5); 3,1175 (0,8); 3,0937 (16,0); 1,6475 (1,8); 1,2925 (0,7); 0,1071 (1,9); 0,0373 (7,2); 0,0264 (0,3)
I-39: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,9842 (5,6); 7,8344 (3,0); 7,8316 (3,0); 7,7965 (1,8); 7,7953 (1,8); 7,7682 (2,9); 7,6813 (2,2); 7,6762 (2,1); 7,6530 (1,4); 7,6479 (1,4); 7,3810 (0,5); 7,3750 (0,5); 7,3635 (0,7); 7,3560 (1,1); 7,3432 (3,1); 7,3392 (3,0); 7,3282 (4,9); 7,3207 (6,0); 7,3066 (1,1); 7,2986 (12,6); 7,1860 (0,4); 7,1697 (2,2); 7,1584 (2,1); 7,1452 (1,8); 7,1380 (1,5); 5,9323 (0,6); 5,9175 (1,8); 5,9026 (1,9); 5,8876 (0,7); 5,3836 (0,4); 5,3524 (0,4); 5,3119 (7,3); 3,7772 (0,8); 3,2145 (16,0); 3,1892 (0,5); 3,0550 (2,6); 0,1046 (0,4); 0,0320 (4,1)
I-40: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,9280 (1,1); 7,8384 (2,7); 7,8109 (3,5); 7,6393 (3,4); 7,6118 (2,6); 7,2989 (17,7); 5,9720 (0,8); 5,9565 (1,3); 5,9411 (0,9); 5,1516 (0,7); 5,1356 (0,7); 2,1742 (13,2); 2,0840 (0,3); 1,5949 (16,0); 1,2948 (0,7); 0,1076 (1,3); 0,0490 (0,8); 0,0382 (19,1)
I-41: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,7286 (1,6); 7,6999 (1,9); 7,2997 (13,7); 7,2350 (1,1); 7,2101 (1,0); 5,9032 (0,6); 5,8870 (0,9); 5,8718 (0,7); 5,3696 (0,6); 5,3528 (0,6); 4,0454 (0,5); 4,0336 (0,4); 2,9969 (2,2); 2,9378 (1,5); 2,0844 (0,5); 1,8852 (0,9); 1,8800 (0,9); 1,8491 (0,9); 1,7968 (0,5); 1,7424 (0,4); 1,7038 (0,4); 1,5888 (16,0); 1,5284 (0,6); 1,4831 (0,8); 1,4386 (0,9); 1,3964 (0,7); 0,0494 (0,7); 0,0386 (17,9)
I-42: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 8,1375 (0,4); 8,0538 (0,8); 7,6446 (0,9); 7,6271 (2,6); 7,6003 (3,0); 7,5396 (7,8); 7,4877 (0,4); 7,4117 (0,4); 7,3831 (0,4); 7,3626 (0,6); 7,2988 (129,4); 7,2740 (6,0); 7,2465 (3,4); 7,1846 (0,4); 6,9474 (0,6); 5,9807 (1,8); 5,9672 (3,9); 5,9480 (4,1); 5,9343 (2,0); 5,6372 (1,9); 5,5857 (0,4); 5,3206 (1,3); 5,2740 (0,3); 4,8593 (0,8); 4,8020 (10,3); 4,7397 (0,6); 4,6816 (6,8); 3,9763 (0,9); 3,9311 (0,3); 3,9053 (2,2); 3,8861 (4,2); 3,8667 (2,5); 3,8080 (0,4); 3,7799 (0,7); 3,7545 (2,8); 3,7378 (5,7); 3,7186 (3,1); 3,6861 (0,8); 3,6685 (0,6); 3,6508 (0,5); 3,6309 (0,5); 3,6099 (0,5); 3,5837 (0,5); 3,5689 (0,6); 3,5214 (0,4); 3,4509 (0,3); 3,1996 (0,4); 3,1035 (0,6); 3,0259 (1,9); 3,0115 (1,3); 2,9963 (8,2); 2,9791 (6,0); 2,9599 (3,7); 2,9226 (7,0); 2,9091 (2,1); 2,8570 (0,4); 2,8195 (0,4); 2,6547 (6,2); 2,5108 (2,8); 2,4860 (8,2); 2,4617 (8,6); 2,4369 (3,4); 2,2149 (0,3); 2,1834 (0,5); 2,1584 (0,4); 1,7788 (0,4); 1,6213 (7,5); 1,4542 (0,6); 1,4386 (0,6); 1,3611 (0,5); 1,3120 (0,7); 1,2909 (2,5); 1,2720 (1,3); 1,2533 (8,3); 1,2414 (6,4); 1,2286 (16,0); 1,2173 (10,5); 1,2040 (8,4); 1,1924 (5,3); 1,1659 (1,1); 1,1405 (1,1); 1,1223 (0,9); 1,1090 (0,7); 0,9489 (0,3); 0,9147 (0,5); 0,8896 (0,4); 0,8773 (0,3); 0,2314 (0,5); 0,0479 (4,0); 0,0369 (128,5); 0,0262 (6,1); -0,0289 (0,8); -0,1616 (0,6)
I-43: ¹H-NMR(400,1 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,6049 (3,7); 8,5191 (2,6); 7,6188 (4,4); 7,5984 (4,8); 7,2328 (4,8); 7,2123 (4,3); 6,2838 (0,8); 6,2725 (1,9); 6,2608 (1,9); 6,2495 (0,7); 3,3117 (15,2); 2,8992 (0,9); 2,7405 (0,8); 2,5090 (7,2); 1,8690 (16,0); 1,7769 (0,8); 1,3677 (0,6); 1,2477 (1,1); 1,2258 (4,3); 1,2180 (3,5); 1,1887 (3,5); 1,1810 (4,2); 1,1591 (0,9)
I-44: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 8,0453 (1,9); 7,6579 (3,3); 7,6450 (0,8); 7,6306 (3,8); 7,5193 (0,4); 7,4915 (0,4); 7,3574 (2,0); 7,3423 (2,3); 7,3195 (4,2); 7,2989 (17,8); 7,2928 (3,8); 7,1137 (1,4); 7,1018 (1,8); 7,0971 (1,5); 7,0849 (1,5); 7,0037 (2,1); 6,9946 (1,7); 6,9034 (0,4); 6,8785 (0,4); 6,4063 (0,8); 5,9347 (1,2); 5,9227 (1,2); 3,9641 (0,9); 3,9523 (1,7); 3,9392 (1,0); 3,9258 (1,2); 3,9132 (2,1); 3,9009 (1,1); 3,7933 (0,9); 3,7489 (2,7); 3,7094 (2,6); 3,6909 (1,0); 3,6648 (2,0); 3,6524 (1,5); 3,6269 (0,9); 3,6141 (0,7); 3,5170 (0,7); 3,4507 (0,3); 3,0228 (1,4); 2,9931 (16,0); 2,9159 (13,3); 2,6471 (3,6); 2,4022 (13,9); 2,1526 (3,9); 1,9311 (0,4); 1,6439 (0,9); 0,0464 (0,8); 0,0356 (21,1); 0,0246 (0,7)
I-46: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,6787 (0,4); 8,6654 (0,4); 7,8298 (0,6); 7,7990 (0,7); 7,5208 (0,6); 7,5136 (0,8); 7,5066 (0,7); 7,4976 (0,5); 6,2709 (0,3); 3,7559 (0,5); 3,7454 (6,0); 3,7375 (0,9); 3,7265 (0,7); 3,7154 (0,4); 3,7073 (0,4); 3,3462 (16,0); 2,9111 (1,6); 2,7953 (0,5); 2,7878 (0,5); 2,7521 (1,4); 2,7504 (1,2); 2,5342 (1,1); 2,5282 (2,4); 2,5221 (3,3); 2,5160 (2,4); 2,5101 (1,1); 1,9049 (0,5); 1,8845 (0,7); 1,8644 (0,5); 0,0203 (2,5)
I-47: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 10,3128 (0,5); 7,8639 (1,0); 7,8344 (1,5); 7,6916 (1,5); 7,6622 (1,1); 7,3821 (1,5); 7,3747 (0,5); 7,3597 (0,5); 7,3522 (1,7); 6,9761 (1,7); 6,9686 (0,5); 6,9536 (0,4); 6,9462 (1,4); 6,2924 (0,4); 6,2765 (0,5); 3,3468 (16,0); 2,9107 (1,1); 2,7520 (0,9); 2,7503 (0,9); 2,5342 (1,4); 2,5282 (2,9); 2,5221 (4,0); 2,5160 (2,9); 2,5101 (1,4); 1,5652 (7,1); 0,0199 (2,9)
I-48: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,4246 (1,6); 8,5253 (0,5); 7,8123 (2,4); 7,7827 (3,6); 7,6706 (3,6); 7,6643 (1,1); 7,6412 (2,4); 6,2952 (0,4); 6,2793 (1,2); 6,2633 (1,3); 6,2473 (0,4); 3,3478 (16,0); 2,9105 (0,6); 2,7517 (0,6); 2,5339 (1,6); 2,5279 (3,4); 2,5218 (4,6); 2,5158 (3,3); 2,5099 (1,5); 1,4336 (9,6); 1,1479 (0,8); 1,1354 (2,3); 1,1264 (2,5); 1,1146 (0,9); 0,6960 (1,0); 0,6836 (3,0); 0,6744 (2,9); 0,6617 (0,9); 0,0196 (6,1)

I-49: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 7,5751 (0,6); 7,5472 (0,9); 7,3953 (0,8); 7,3675 (0,6); 7,2983 (0,5); 7,2943 (0,6); 7,2703 (0,7); 7,2204 (1,0); 7,2130 (0,6); 7,1937 (0,6); 7,1865 (0,4); 6,3069 (0,3); 6,2909 (0,4); 3,4038 (3,5); 3,3460 (16,0); 2,9107 (0,4); 2,7518 (0,4); 2,5339 (1,4); 2,5279 (2,9); 2,5219 (3,9); 2,5158 (2,8); 2,5099 (1,3); 0,0201 (4,0)
I-50: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,8080 (0,4); 8,1167 (0,5); 8,1110 (2,3); 8,1048 (0,9); 8,0887 (1,0); 8,0822 (3,0); 8,0767 (0,7); 7,9079 (0,6); 7,9025 (3,1); 7,8961 (1,0); 7,8800 (0,9); 7,8736 (2,3); 7,8681 (0,5); 6,4199 (0,4); 6,4042 (1,1); 6,3883 (1,2); 6,3725 (0,4); 3,9256 (0,5); 3,9062 (10,5); 3,3467 (16,0); 2,5341 (1,6); 2,5281 (3,2); 2,5220 (4,3); 2,5158 (3,1); 2,5099 (1,5); 0,0191 (4,0)
I-51: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,8021 (0,6); 7,8541 (1,8); 7,8260 (2,2); 7,7714 (2,1); 7,7428 (1,0); 7,5267 (0,4); 7,5000 (0,6); 7,4532 (0,5); 7,4278 (1,0); 7,4018 (0,6); 7,3855 (0,6); 7,3806 (0,9); 7,3757 (0,5); 7,3551 (0,4); 6,3595 (0,6); 6,3437 (0,6); 3,7086 (6,7); 3,3476 (16,0); 2,9103 (0,4); 2,5338 (1,5); 2,5279 (3,1); 2,5219 (4,2); 2,5158 (3,0); 2,5099 (1,4); 0,0194 (3,5)
I-52: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,8448 (0,4); 7,9733 (0,5); 7,8012 (1,1); 7,7730 (1,3); 7,5289 (1,3); 7,5007 (1,1); 7,4468 (0,5); 7,4367 (0,4); 7,4288 (0,3); 7,4158 (0,4); 7,4082 (0,4); 7,3817 (0,3); 7,3562 (0,7); 7,3470 (0,9); 7,3208 (0,3); 6,3607 (0,4); 6,3448 (0,4); 3,5111 (1,8); 3,3469 (16,0); 2,9110 (3,8); 2,7522 (3,2); 2,7506 (3,0); 2,5342 (1,4); 2,5283 (2,8); 2,5222 (3,9); 2,5161 (2,8); 2,5102 (1,3); 0,0207 (4,0)
I-53: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,5530 (0,4); 7,6380 (1,4); 7,6317 (0,5); 7,6154 (0,5); 7,6092 (1,6); 7,5228 (1,5); 7,5157 (0,5); 7,5006 (0,5); 7,4933 (1,7); 7,1911 (1,6); 7,1848 (0,5); 7,1684 (0,5); 7,1624 (1,4); 7,0982 (1,7); 7,0909 (0,5); 7,0758 (0,5); 7,0686 (1,5); 6,3036 (0,6); 6,2877 (0,6); 3,8300 (6,8); 3,3459 (16,0); 2,5342 (1,7); 2,5282 (3,6); 2,5222 (5,0); 2,5161 (3,6); 2,5103 (1,7); 0,0202 (4,8)
I-54: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,7073 (0,8); 7,8890 (1,8); 7,8827 (0,8); 7,8668 (1,1); 7,8602 (4,4); 7,8222 (4,4); 7,8157 (1,1); 7,7994 (0,8); 7,7934 (1,7); 7,7006 (0,3); 7,6911 (2,6); 7,6858 (1,0); 7,6626 (2,9); 7,6533 (0,4); 7,1319 (0,4); 7,1222 (3,6); 7,1153 (1,1); 7,0993 (1,0); 7,0925 (3,2); 7,0826 (0,4); 6,3913 (0,3); 6,3757 (1,0); 6,3599 (1,1); 6,3440 (0,4); 3,8044 (14,1); 3,3476 (16,0); 2,5342 (1,7); 2,5282 (3,6); 2,5222 (4,9); 2,5161 (3,5); 2,5102 (1,6); 0,0192 (7,0)
I-55: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 9,5609 (1,3); 8,7280 (0,4); 7,9140 (1,1); 7,8857 (2,1); 7,8191 (2,1); 7,7908 (1,1); 6,3752 (0,7); 6,3594 (0,7); 3,3472 (16,0); 2,9108 (0,6); 2,7518 (0,5); 2,6121 (11,2); 2,5341 (1,6); 2,5281 (3,2); 2,5221 (4,4); 2,5161 (3,1); 2,5102 (1,5); 0,0199 (3,1)
I-56: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 8,2669 (6,2); 8,2606 (2,1); 8,2443 (2,5); 8,2379 (6,9); 8,2327 (1,3); 7,9344 (7,5); 7,9279 (2,3); 7,9116 (2,3); 7,9053 (5,8); 7,8999 (1,0); 7,2984 (22,8); 5,9818 (1,2); 5,1853 (1,1); 2,9317 (2,2); 2,9064 (7,1); 2,8811 (7,4); 2,8559 (2,5); 1,5990 (5,1); 1,4637 (7,8); 1,4384 (16,0); 1,4131 (7,3); 0,0475 (0,9); 0,0367 (25,2); 0,0258 (0,9)
I-57: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,8700 (0,6); 7,8412 (1,0); 7,7670 (1,1); 7,7381 (0,6); 7,2986 (22,6); 4,1844 (0,6); 4,1759 (0,6); 4,1668 (0,6); 4,1587 (0,6); 2,3644 (0,4); 2,3559 (0,9); 2,3474 (0,4); 1,5836 (16,0); 0,0484 (0,8); 0,0376 (23,5); 0,0267 (0,9)
I-58: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 7,9714 (2,5); 7,9656 (1,0); 7,9490 (1,2); 7,9427 (4,4); 7,9155 (0,4); 7,9057 (3,7); 7,8990 (1,2); 7,8825 (1,2); 7,8757 (4,1); 7,8643 (4,6); 7,8580 (1,4); 7,8355 (2,5); 7,2989 (10,9); 7,0429 (0,4); 7,0330 (3,9); 7,0263 (1,2); 7,0097 (1,1); 7,0029 (3,6); 6,9933 (0,4); 5,9762 (0,7); 5,9608 (1,0); 5,9449 (0,8); 5,4173 (0,8); 5,4004 (0,8); 3,8907 (16,0); 2,9950 (1,1); 2,9135 (0,9); 1,6018 (3,0); 0,0481 (0,4); 0,0372 (11,5); 0,0262 (0,5)

IV-01: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 8,1395 (2,8); 8,1337 (1,0); 8,1175 (1,0); 8,1116 (3,0); 7,5304 (2,6); 7,5023 (2,4); 7,2987 (5,9); 4,9172 (6,1); 3,7785 (16,0); 2,2550 (0,3); 2,2435 (0,4); 2,2284 (0,6); 2,2131 (0,4); 2,2018 (0,4); 1,5962 (1,4); 1,4701 (0,4); 1,1268 (0,5); 1,1127 (1,6); 1,1030 (2,1); 1,0975 (1,5); 1,0876 (2,0); 1,0767 (0,7); 0,9502 (0,6); 0,9391 (1,9); 0,9292 (1,4); 0,9124 (1,9); 0,9024 (1,3); 0,8887 (0,5); 0,0377 (7,8); 0,0268 (0,3)
IV-02: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 8,0439 (4,8); 8,0384 (1,7); 8,0164 (5,2); 7,5902 (0,4); 7,5629 (0,5); 7,3653 (4,2); 7,3387 (3,9); 7,3150 (0,4); 7,3134 (0,4); 7,2982 (0,4); 7,2870 (0,3); 2,4719 (16,0); 2,4554 (1,7); 0,0515 (0,4)
IV-03: ¹H-NMR(499,9 MHz, CDCl₃): δ= 8,1969 (2,3); 8,0811 (1,4); 8,0783 (1,3); 8,0642 (1,6); 8,0615 (1,5); 7,9981 (1,9); 7,9205 (1,6); 7,9036 (1,3); 7,2653 (2,2); 3,9371 (16,0); 1,7329 (0,6); -0,0002 (2,4)
IV-04: ¹H-NMR(300,2 MHz, CDCl₃): δ= 8,1404 (2,8); 8,1345 (1,0); 8,1185 (1,0); 8,1125 (3,1); 7,5272 (2,7); 7,4991 (2,5); 7,2989 (13,4); 4,8948 (6,1); 3,7077 (16,0); 2,2545 (13,3); 1,5849 (6,7); 1,4707 (0,7); 0,0491 (0,7); 0,0383 (17,7); 0,0273 (0,7)
IV-05: ¹H-NMR(300,2 MHz, d₆-DMSO): δ= 8,1320 (0,5); 8,1232 (4,2); 8,1163 (1,4); 8,1007 (1,4); 8,0937 (4,6); 8,0850 (0,6); 7,4339 (0,6); 7,4250 (4,7); 7,4181 (1,4); 7,4025 (1,3); 7,3956 (4,2); 7,3867 (0,5); 3,3377 (16,0); 3,1118 (0,7); 3,0930 (7,8); 3,0042 (0,6); 2,9589 (7,7); 2,5345 (2,6); 2,5285 (5,4); 2,5224 (7,5); 2,5163 (5,4); 2,5103 (2,5); 0,0320 (0,4); 0,0211 (11,3); 0,0102 (0,4)
IV-06: ¹H-NMR(499,9 MHz, CDCl₃): δ= 8,5866 (2,5); 8,1062 (1,5); 8,1043 (1,6); 8,0893 (1,7); 8,0874 (1,7); 7,9734 (2,6); 7,5250 (2,0); 7,5080 (2,0); 7,2650 (2,2); 3,9091 (16,0); 1,7349 (0,5); -0,0002 (2,3)

IV-07: ¹ H-NMR(300,2 MHz, CDCl ₃): δ= 8,1393 (7,8); 8,1115 (8,6); 7,5026 (7,4); 7,4745 (6,8); 7,2987 (45,2); 7,2322 (0,4); 6,0119 (1,0); 4,6019 (8,7); 4,5820 (8,5); 2,0831 (0,6); 1,5841 (16,0); 1,4809 (0,7); 1,4655 (1,5); 1,4542 (1,7); 1,4394 (3,1); 1,4240 (1,9); 1,4130 (1,8); 1,3979 (1,0); 1,1081 (1,6); 1,0939 (5,4); 1,0842 (6,2); 1,0791 (5,0); 1,0693 (5,5); 1,0573 (1,7); 0,8654 (1,8); 0,8533 (5,7); 0,8434 (4,7); 0,8271 (5,6); 0,8170 (4,5); 0,8030 (1,5); 0,0490 (2,2); 0,0382 (59,9); 0,0273 (2,7); -0,0282 (0,6)
IV-08: ¹ H-NMR(499,9 MHz, CDCl ₃): δ= 8,0785 (0,5); 8,0738 (4,0); 8,0701 (1,3); 8,0600 (1,4); 8,0563 (4,3); 8,0517 (0,6); 7,5646 (2,6); 7,5473 (2,5); 7,2624 (3,6); 6,8409 (0,9); 3,8162 (16,0); 1,5938 (13,6); -0,0002 (3,2)
IV-09: ¹ H-NMR(300,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12,8685 (0,4); 8,4604 (0,4); 8,4465 (16,0); 8,3062 (6,0); 8,3029 (6,2); 7,9548 (3,6); 7,9495 (3,5); 7,9267 (5,7); 7,9214 (5,6); 7,8361 (6,5); 7,8081 (4,1); 3,3580 (1,4); 2,5343 (2,5); 2,5284 (5,3); 2,5223 (7,3); 2,5163 (5,3); 2,5103 (2,5); 2,0082 (0,4); 0,0170 (7,8)
IV-11: ¹ H-NMR(400,1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,7911 (2,2); 8,1851 (4,0); 8,1642 (4,6); 7,8952 (2,4); 7,8754 (4,6); 7,8545 (4,0); 7,5294 (1,1); 7,5100 (1,7); 7,4561 (1,1); 7,4370 (2,5); 7,4177 (1,8); 7,4056 (2,4); 7,3864 (0,9); 3,7039 (16,0); 3,3104 (5,3); 2,8979 (1,2); 2,7395 (1,2); 2,5126 (3,5); 2,5086 (4,6); 2,5047 (3,5)
IV-12: ¹ H-NMR(400,1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,8891 (11,5); 8,1285 (14,6); 8,1078 (16,0); 7,6353 (15,8); 7,6146 (14,6); 7,4559 (1,8); 7,4372 (10,5); 7,4212 (5,5); 7,4177 (6,1); 7,3992 (5,7); 7,3837 (8,6); 7,3548 (4,7); 7,3501 (3,9); 7,3350 (4,8); 7,3194 (1,6); 7,3152 (1,7); 3,4822 (19,3); 3,3097 (19,6); 2,8985 (0,5); 2,7400 (0,4); 2,5125 (11,3); 2,5086 (14,7); 2,5047 (11,1)
IV-13: ¹ H-NMR(300,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,7918 (1,2); 8,2698 (1,0); 8,2401 (1,0); 8,1484 (2,9); 8,1449 (2,8); 7,8310 (1,0); 7,8232 (1,0); 7,4954 (0,7); 7,4877 (0,7); 7,4658 (0,7); 7,4580 (0,7); 3,3387 (16,0); 3,1368 (3,4); 2,9805 (3,4); 2,5342 (3,0); 2,5283 (6,0); 2,5222 (8,1); 2,5161 (5,8); 2,5102 (2,7); 0,0317 (0,5); 0,0210 (10,8); 0,0100 (0,4)
IV-14: ¹ H-NMR(499,9 MHz, CDCl ₃): δ= 8,3035 (2,3); 8,3021 (2,3); 8,0879 (2,9); 8,0866 (2,9); 7,8960 (1,0); 7,8936 (0,9); 7,8791 (2,1); 7,8767 (2,1); 7,8556 (2,4); 7,8551 (2,4); 7,8388 (1,0); 7,8383 (1,0); 7,2609 (2,6); 4,6493 (2,3); 4,6384 (4,3); 4,6275 (2,2); 3,8849 (2,5); 3,8741 (4,3); 3,8632 (2,2); 3,3065 (16,0); 1,5892 (3,0); 0,0719 (0,5); -0,0002 (2,6)
IV-15: ¹ H-NMR(499,9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,7477 (8,2); 8,5930 (5,6); 7,8608 (2,3); 7,8576 (2,3); 7,8427 (4,9); 7,8395 (5,2); 7,8142 (5,7); 7,7961 (2,5); 7,3940 (1,4); 7,3838 (16,0); 7,3777 (10,0); 7,3735 (10,0); 7,3617 (1,2); 7,3583 (1,4); 7,3566 (1,5); 7,3519 (0,7); 7,3425 (1,6); 7,3368 (1,9); 7,3326 (1,6); 7,3295 (1,5); 7,3251 (2,0); 7,3189 (1,0); 7,3149 (0,8); 7,3135 (0,7); 7,3081 (0,4); 5,7167 (15,8); 3,3477 (5,7); 3,3441 (5,7); 2,5162 (0,5); 2,5127 (1,1); 2,5091 (1,6); 2,5055 (1,2); 2,5020 (0,6)
IV-16: ¹ H-NMR(400,1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 7,8768 (6,5); 7,8405 (12,2); 3,7642 (4,7); 3,7488 (7,3); 3,7332 (4,9); 3,3075 (9,0); 2,8531 (3,9); 2,8368 (7,7); 2,8206 (4,2); 2,6057 (2,2); 2,5875 (7,3); 2,5692 (7,5); 2,5510 (2,5); 2,5126 (5,9); 2,5086 (7,7); 2,5046 (5,8); 1,9519 (1,2); 1,9357 (4,0); 1,9200 (5,5); 1,9044 (3,8); 1,8883 (1,1); 1,0814 (7,7); 1,0632 (16,0); 1,0449 (7,5)
IV-17: ¹ H-NMR(400,1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,5803 (6,6); 8,3355 (9,1); 8,0484 (2,6); 8,0449 (2,7); 8,0264 (4,6); 8,0228 (4,7); 7,9647 (5,6); 7,9425 (3,5); 7,3418 (1,7); 7,3234 (4,7); 7,3062 (7,1); 7,2825 (3,8); 7,2705 (11,0); 7,2513 (5,9); 5,7404 (16,0); 3,3083 (19,8); 2,5067 (4,1); 2,5025 (5,7); 2,4983 (4,5); -0,0002 (2,1)
IV-18: ¹ H-NMR(300,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 7,9408 (6,0); 7,9253 (6,2); 7,9187 (2,1); 7,9029 (2,1); 7,8963 (6,5); 7,8883 (0,9); 7,1536 (0,9); 7,1455 (6,5); 7,1389 (2,1); 7,1231 (2,0); 7,1165 (6,0); 7,1085 (0,8); 3,3397 (16,0); 3,0798 (8,3); 2,9813 (8,3); 2,5338 (2,4); 2,5278 (5,1); 2,5217 (7,0); 2,5156 (5,0); 2,5096 (2,4); 0,0308 (0,4); 0,0199 (10,2); 0,0089 (0,4)
IV-19: ¹ H-NMR(499,9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 11,5342 (5,5); 8,1444 (15,7); 7,7638 (9,4); 7,7472 (16,0); 7,7057 (13,1); 7,7028 (12,7); 7,6892 (7,5); 7,6862 (7,4); 7,6136 (8,6); 7,6083 (13,5); 7,6028 (8,4); 6,5783 (10,1); 3,3737 (0,4); 3,3232 (138,3); 2,5128 (7,5); 2,5093 (14,9); 2,5057 (20,0); 2,5021 (14,4); 2,4987 (6,9)
IV-20: ¹ H-NMR(499,9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,6331 (15,6); 8,2472 (7,0); 8,2454 (7,2); 7,9301 (2,7); 7,9270 (2,5); 7,9131 (6,8); 7,9100 (6,8); 7,8922 (9,2); 7,8753 (3,5); 7,3706 (2,8); 7,3675 (1,2); 7,3557 (6,9); 7,3453 (2,4); 7,3413 (7,5); 7,3318 (0,3); 7,3107 (10,0); 7,3057 (2,6); 7,3027 (3,6); 7,2968 (5,9); 7,2908 (2,2); 7,2865 (3,9); 7,2818 (0,9); 7,2750 (0,9); 7,2722 (1,3); 5,6720 (16,0); 3,3267 (39,8); 2,5259 (0,4); 2,5222 (0,6); 2,5181 (0,8); 2,5116 (9,8); 2,5080 (20,5); 2,5044 (27,9); 2,5007 (19,8); 2,4972 (9,0); 2,0763 (1,2); -0,0002 (0,6)
IV-21: ¹ H-NMR(499,9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,6158 (5,4); 8,6024 (5,5); 8,3561 (9,3); 8,3544 (9,0); 8,0160 (3,8); 7,9932 (3,9); 7,3568 (1,4); 7,3544 (2,2); 7,3513 (0,9); 7,3421 (4,0); 7,3399 (5,8); 7,3375 (4,3); 7,3304 (2,1); 7,3258 (7,8); 7,3163 (0,7); 7,3075 (10,0); 7,3011 (4,0); 7,2939 (4,7); 7,2905 (3,1); 7,2846 (3,4); 7,2788 (0,7); 7,2741 (0,6); 7,2708 (1,0); 7,2676 (0,5); 5,7002 (16,0); 3,3273 (19,5); 2,5171 (1,7); 2,5135 (3,6); 2,5099 (5,0); 2,5062 (3,6); 2,5026 (1,6)
IV-22: ¹ H-NMR(499,9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,8112 (6,0); 8,8098 (6,0); 8,6761 (3,7); 8,6620 (3,8); 8,3321 (0,4); 8,3303 (0,4); 7,6603 (2,8); 7,6360 (2,8); 7,3955 (0,4); 7,3869 (12,2); 7,3780 (16,0); 7,3710 (0,8); 7,3675 (0,5); 7,3631 (0,5); 7,3603 (0,6); 7,3579 (0,6); 7,3501 (1,5); 7,3422 (2,0); 7,3393 (0,9); 7,3333 (1,8); 7,3299 (0,8); 7,3254 (0,9); 7,3223 (0,6); 7,3157 (0,6); 7,2810 (0,4); 5,7066 (12,9); 5,6827 (0,7); 3,3290 (25,9); 2,5172 (1,3); 2,5136 (2,7); 2,5099 (3,8); 2,5062 (2,7); 2,5026 (1,2)

IV-23: ¹ H-NMR(300,2 MHz, CDCl ₃): δ= 8,1760 (7,6); 8,1471 (8,0); 7,3493 (4,5); 7,3228 (4,6); 7,2989 (24,9); 4,1148 (0,6); 4,1039 (1,1); 4,0916 (0,9); 4,0763 (1,1); 4,0650 (2,0); 4,0536 (1,4); 4,0395 (0,8); 4,0258 (1,0); 3,0096 (8,7); 2,9524 (5,6); 1,8955 (3,9); 1,8549 (4,2); 1,8131 (2,2); 1,7491 (1,5); 1,7083 (1,6); 1,5848 (16,0); 1,5358 (2,2); 1,4876 (3,3); 1,4457 (3,8); 1,4030 (2,7); 1,3703 (0,8); 1,3594 (0,9); 1,2166 (0,6); 1,1748 (1,2); 1,1387 (1,0); 0,0486 (1,6); 0,0379 (32,4); 0,0272 (1,8)
IV-24: ¹ H-NMR(400,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 7,9528 (1,4); 7,9399 (0,4); 7,9297 (2,0); 7,8361 (1,8); 7,8278 (2,1); 7,8230 (2,2); 3,7637 (2,0); 3,7486 (16,0); 3,7335 (2,1); 3,3261 (50,2); 2,8619 (1,4); 2,8459 (2,7); 2,8299 (1,5); 2,5074 (36,7); 2,5034 (45,9); 1,9256 (0,5); 1,9097 (1,5); 1,8943 (1,9); 1,8792 (1,4); 1,8633 (0,4)
IV-25: ¹ H-NMR(300,2 MHz, CDCl ₃): δ= 7,9581 (0,9); 7,9316 (1,2); 7,9094 (1,2); 7,3404 (1,2); 7,3140 (1,1); 7,2987 (3,4); 4,7419 (2,6); 3,8008 (16,0); 3,7819 (1,2); 2,9836 (1,0); 2,9643 (1,7); 2,9453 (0,9); 1,6212 (0,7); 1,4689 (0,6); 0,1076 (2,6); 0,0366 (4,0)
IV-26: ¹ H-NMR(400,1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12,0508 (2,2); 11,8731 (0,4); 8,1631 (1,2); 8,0151 (0,7); 8,0113 (0,7); 7,9953 (0,8); 7,9440 (4,0); 7,8986 (5,2); 7,8850 (2,8); 7,8685 (4,1); 7,8531 (3,3); 7,4808 (1,0); 7,4604 (1,0); 7,4389 (5,3); 7,4192 (4,8); 6,8929 (0,3); 6,6269 (1,4); 4,7832 (8,0); 4,7248 (10,2); 3,7274 (6,6); 3,7127 (13,4); 3,6979 (7,4); 3,3094 (21,3); 3,1954 (0,3); 3,1837 (0,4); 2,9771 (3,1); 2,9632 (5,3); 2,9488 (3,2); 2,8782 (2,7); 2,8637 (4,3); 2,8497 (2,5); 2,8134 (0,4); 2,7260 (0,3); 2,7036 (0,5); 2,6851 (0,5); 2,6283 (0,5); 2,6095 (0,6); 2,5876 (0,5); 2,5125 (8,3); 2,5087 (10,7); 2,5047 (8,4); 2,4651 (4,5); 2,4466 (14,2); 2,4281 (14,7); 2,4097 (4,9); 1,0518 (8,3); 1,0453 (8,0); 1,0338 (16,0); 1,0274 (13,1); 1,0157 (8,4)
IV-27: ¹ H-NMR(300,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 11,5477 (1,2); 8,1573 (3,0); 8,1550 (3,3); 8,1528 (3,1); 7,7837 (1,7); 7,7560 (3,9); 7,7187 (3,5); 7,7137 (3,4); 7,6910 (1,6); 7,6861 (1,5); 7,6348 (2,2); 7,6255 (3,2); 7,6163 (2,3); 6,6031 (1,3); 6,6002 (1,6); 6,5968 (1,8); 6,5935 (2,5); 6,5902 (1,7); 6,5868 (1,6); 6,5839 (1,3); 3,3427 (16,0); 2,5339 (1,8); 2,5279 (3,8); 2,5218 (5,2); 2,5156 (3,7); 2,5097 (1,8); 0,0191 (6,3)
IV-28: ¹ H-NMR(300,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,0120 (0,6); 8,0048 (3,9); 7,9984 (1,4); 7,9824 (1,5); 7,9759 (4,4); 7,9689 (0,7); 7,5117 (0,7); 7,5047 (4,4); 7,4984 (1,5); 7,4823 (1,4); 7,4759 (3,9); 7,4689 (0,6); 3,3390 (16,0); 2,5796 (19,0); 2,5560 (1,0); 2,5342 (2,1); 2,5284 (4,4); 2,5222 (5,8); 2,5161 (4,3); 2,5101 (2,1); 2,5049 (1,1); 1,3761 (0,3); 0,0203 (8,2); 0,0093 (0,3)
IV-29: ¹ H-NMR(300,2 MHz, CDCl ₃): δ= 8,8217 (0,9); 8,1319 (2,1); 8,1256 (0,7); 8,1090 (0,8); 8,1027 (2,5); 8,0951 (0,4); 7,8306 (0,4); 7,8231 (2,6); 7,8166 (0,8); 7,8000 (0,7); 7,7937 (2,1); 7,3180 (2,4); 7,3106 (0,8); 7,2957 (0,9); 7,2882 (2,8); 6,9825 (2,9); 6,9750 (0,9); 6,9601 (0,8); 6,9527 (2,4); 1,6110 (16,0)
IV-30: ¹ H-NMR(400,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,1219 (4,7); 8,1014 (5,2); 7,9886 (0,7); 7,9693 (0,7); 7,9539 (0,7); 7,5862 (5,0); 7,5657 (4,8); 7,5129 (2,6); 7,5005 (2,8); 7,4743 (0,4); 7,1775 (0,7); 7,1511 (2,7); 7,1437 (3,0); 7,0897 (2,1); 7,0774 (2,5); 7,0683 (1,8); 7,0466 (0,5); 6,8303 (0,5); 3,8080 (2,2); 3,7982 (1,4); 3,7880 (1,6); 3,7789 (2,6); 3,6666 (6,9); 3,6009 (0,5); 3,5744 (0,5); 3,5292 (1,1); 3,4639 (1,5); 3,4391 (2,6); 3,4145 (1,4); 3,3249 (24,9); 3,2466 (0,3); 3,2179 (0,6); 2,9041 (2,0); 2,8936 (5,1); 2,7350 (3,9); 2,5265 (0,9); 2,5217 (1,6); 2,5131 (18,0); 2,5087 (35,7); 2,5041 (47,0); 2,4995 (34,8); 2,4951 (17,3); 2,3861 (16,0); 2,3309 (0,4); 2,0916 (1,5); 2,0570 (2,8); 2,0075 (1,5); 1,9980 (1,6); 1,9822 (1,6); 1,9728 (2,1); 1,9477 (0,9); 1,9379 (0,8); 1,8892 (0,5); 1,8558 (0,6); 1,6599 (0,4); 1,2393 (0,8); -0,0002 (2,6)
IV-31: ¹ H-NMR(300,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,4573 (0,5); 8,4525 (0,5); 8,4131 (0,4); 8,3853 (0,5); 8,1360 (0,4); 8,1305 (0,3); 6,8253 (0,3); 3,3409 (16,0); 2,5337 (1,3); 2,5277 (2,6); 2,5217 (3,6); 2,5156 (2,6); 2,5097 (1,2); 0,0199 (3,8)
IV-32: ¹ H-NMR(300,2 MHz, CDCl ₃): δ= 8,1629 (4,8); 8,1344 (5,2); 7,4903 (2,0); 7,4628 (5,6); 7,4394 (6,3); 7,4102 (6,8); 7,3858 (3,3); 7,3580 (2,6); 7,3352 (4,4); 7,2994 (31,4); 3,4806 (5,7); 1,5803 (16,0); 0,0498 (1,4); 0,0392 (38,7)
IV-33: ¹ H-NMR(300,1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,1062 (1,4); 8,0998 (0,5); 8,0830 (0,6); 8,0766 (1,8); 7,7819 (1,7); 7,7755 (0,5); 7,7585 (0,5); 7,7522 (1,4); 4,9716 (0,4); 4,9604 (0,3); 4,9424 (0,5); 3,3259 (2,4); 2,6010 (0,5); 2,5952 (0,4); 2,5780 (0,4); 2,5655 (0,6); 2,5522 (0,4); 2,5144 (1,6); 2,5089 (3,2); 2,5028 (4,0); 2,4970 (2,6); 1,3669 (16,0); -0,0002 (0,7)
IV-34: ¹ H-NMR(400,1 MHz, CDCl ₃): δ= 8,2749 (3,2); 8,2705 (1,3); 8,2580 (1,4); 8,2534 (4,0); 8,1000 (4,1); 8,0955 (1,4); 8,0829 (1,3); 8,0785 (3,2); 7,9525 (0,5); 7,9451 (3,7); 7,9401 (1,3); 7,9278 (1,3); 7,9227 (3,9); 7,9154 (0,5); 7,2843 (1,9); 7,0394 (0,5); 7,0321 (3,9); 7,0271 (1,3); 7,0147 (1,3); 7,0097 (3,7); 7,0024 (0,5); 3,8807 (16,0)
IV-35: ¹ H-NMR(300,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,3543 (0,4); 8,1397 (3,6); 8,1339 (1,3); 8,1176 (1,3); 8,1118 (4,0); 7,6586 (3,5); 7,6307 (3,0); 7,2862 (8,1); 7,2639 (12,4); 4,9481 (5,5); 3,7686 (16,0); 3,3387 (8,3); 2,5343 (2,0); 2,5283 (4,2); 2,5222 (5,8); 2,5161 (4,2); 2,5101 (1,9); 0,0203 (6,0)
IV-36: ¹ H-NMR(400,1 MHz, CDCl ₃): δ= 8,1579 (0,4); 8,1538 (0,7); 8,1496 (3,3); 8,1449 (1,2); 8,1381 (0,3); 8,1327 (1,3); 8,1280 (3,6); 8,1238 (0,7); 7,7126 (0,7); 7,7085 (3,7); 7,7038 (1,3); 7,6915 (1,2); 7,6869 (3,3); 7,6827 (0,6); 7,5508 (0,5); 7,5435 (3,6); 7,5383 (1,2); 7,5264 (1,2); 7,5212 (3,8); 7,5140 (0,5); 7,1911 (1,4); 6,9266 (0,5); 6,9194 (3,9); 6,9142 (1,4); 6,9023 (1,2); 6,8971 (3,5); 6,8899 (0,5); 3,7851 (1,1); 3,7575 (16,0)
IV-37: ¹ H-NMR(499,9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 7,9042 (13,1); 7,8879 (13,9); 7,4883 (12,3); 7,4722 (11,3); 7,2879 (5,7); 7,2721 (14,4); 7,2572 (12,4); 7,2228 (16,0); 7,2078 (9,5); 7,1824 (5,7); 7,1679 (8,5); 7,1535 (3,4); 3,9149 (0,5); 3,5507 (0,4); 3,4132 (65,1); 3,3922 (0,7); 3,3781 (0,4); 3,3373 (20,7); 3,2712 (0,4); 2,8931 (1,1); 2,7354 (1,0); 2,5120 (19,3); 2,5085 (25,1); 2,5051 (18,7); 1,2425 (0,5); 1,0938 (0,4); 0,8591 (0,8); 0,8453 (0,4)

IV-38: ¹ H-NMR(300,2 MHz, CDCl ₃): δ= 8,2472 (2,0); 8,2416 (12,4); 8,2355 (5,0); 8,2194 (4,9); 8,2130 (16,0); 7,9834 (15,2); 7,9772 (5,3); 7,9609 (4,5); 7,9548 (12,4); 7,2989 (8,8); 6,3808 (1,9); 3,4056 (8,1); 3,3876 (8,8); 3,3818 (9,3); 3,3637 (8,2); 1,6716 (8,4); 1,1758 (0,5); 1,1670 (0,8); 1,1601 (0,5); 1,1502 (1,6); 1,1411 (1,4); 1,1358 (1,2); 1,1253 (2,7); 1,1150 (1,2); 1,1091 (1,5); 1,0992 (1,9); 1,0908 (0,5); 1,0831 (1,0); 1,0748 (0,7); 1,0587 (0,4); 0,6557 (2,3); 0,6402 (6,3); 0,6358 (7,6); 0,6207 (3,4); 0,6133 (7,2); 0,6093 (6,3); 0,5942 (2,8); 0,5708 (0,4); 0,5452 (0,3); 0,3641 (2,7); 0,3486 (8,6); 0,3292 (8,7); 0,3134 (1,9); 0,0438 (0,4); 0,0329 (11,5); 0,0221 (0,4)
IV-39: ¹ H-NMR(400,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,5010 (2,8); 8,0157 (0,6); 8,0102 (4,1); 8,0055 (1,6); 7,9931 (1,9); 7,9881 (7,0); 7,9827 (1,2); 7,9276 (1,1); 7,9222 (6,7); 7,9172 (2,0); 7,9049 (1,4); 7,9000 (4,2); 7,8945 (0,6); 3,3285 (12,6); 2,8937 (0,5); 2,7347 (0,4); 2,5273 (0,5); 2,5226 (0,7); 2,5140 (7,3); 2,5095 (14,4); 2,5050 (19,0); 2,5004 (14,0); 2,4959 (6,9); 1,4322 (16,0); 1,1480 (1,4); 1,1385 (4,2); 1,1318 (4,3); 1,1227 (1,6); 0,6896 (1,8); 0,6803 (5,4); 0,6735 (5,4); 0,6636 (1,6)
IV-40: ¹ H-NMR(400,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,6762 (1,9); 8,6651 (1,9); 8,1661 (7,5); 8,1495 (3,5); 8,1448 (11,6); 8,0610 (11,3); 8,0566 (3,6); 8,0441 (2,9); 8,0397 (7,6); 3,3366 (37,2); 2,8269 (16,0); 2,8155 (15,8); 2,7974 (0,5); 2,7860 (0,3); 2,5567 (0,4); 2,5286 (0,6); 2,5151 (11,0); 2,5108 (21,4); 2,5062 (27,9); 2,5017 (20,9); 2,4973 (10,6); 1,2375 (0,4); -0,0002 (1,3)
IV-41: ¹ H-NMR(400,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,2419 (3,3); 8,0197 (0,8); 8,0138 (6,3); 8,0090 (2,2); 7,9967 (2,3); 7,9918 (8,4); 7,9861 (1,2); 7,8535 (1,2); 7,8477 (7,9); 7,8428 (2,4); 7,8304 (2,0); 7,8255 (6,3); 7,8198 (0,8); 3,3285 (23,4); 2,5277 (0,6); 2,5229 (0,9); 2,5143 (10,0); 2,5098 (20,1); 2,5052 (26,5); 2,5006 (19,5); 2,4960 (9,6); 2,4081 (2,0); 2,3892 (6,7); 2,3704 (6,8); 2,3516 (2,2); 1,1222 (7,5); 1,1035 (16,0); 1,0846 (7,2)
IV-42: ¹ H-NMR(400,3 MHz, CDCl ₃): δ= 7,8588 (3,6); 7,8544 (1,4); 7,8418 (1,4); 7,8374 (3,8); 7,8326 (0,8); 7,4323 (0,4); 7,4246 (3,6); 7,4195 (1,3); 7,4078 (1,3); 7,4026 (3,9); 7,3951 (0,5); 7,1793 (0,6); 7,1017 (3,8); 7,0972 (1,5); 7,0847 (1,3); 7,0803 (3,7); 7,0757 (0,8); 6,9074 (0,4); 6,8999 (3,9); 6,8947 (1,4); 6,8830 (1,2); 6,8779 (3,6); 6,8703 (0,4); 3,7796 (16,0); 1,5018 (1,6)
IV-43: ¹ H-NMR(499,9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,7699 (2,0); 8,7594 (3,6); 8,7501 (2,0); 8,1692 (10,7); 8,1558 (5,1); 8,1523 (16,0); 8,0792 (15,9); 8,0757 (5,5); 8,0622 (10,8); 3,5020 (1,5); 3,4968 (2,7); 3,4925 (2,1); 3,4863 (11,6); 3,4780 (12,2); 3,4723 (7,8); 3,4637 (9,3); 3,4531 (6,2); 3,4474 (2,3); 3,4423 (1,5); 3,4379 (1,1); 3,4201 (0,4); 3,3197 (37,0); 3,2817 (65,0); 3,1388 (0,3); 2,5253 (0,4); 2,5215 (0,5); 2,5108 (10,3); 2,5073 (21,6); 2,5037 (29,8); 2,5002 (22,2); 2,4968 (11,2); 2,0755 (0,4); -0,0002 (0,8)
IV-44: ¹ H-NMR(300,2 MHz, CDCl ₃): δ= 8,1780 (6,1); 8,1497 (6,6); 7,3562 (2,7); 7,3464 (3,1); 7,3271 (2,9); 7,3185 (2,9); 7,3002 (28,1); 7,2983 (28,5); 3,5722 (0,6); 3,5475 (1,8); 3,5245 (2,0); 3,5065 (1,1); 3,4834 (2,0); 3,4592 (1,9); 3,4360 (0,6); 3,1340 (7,1); 3,0562 (7,5); 1,5816 (15,8); 1,5797 (16,0); 1,3283 (1,9); 1,3049 (3,9); 1,2783 (3,3); 1,2529 (3,8); 1,2289 (1,8); 0,0481 (1,6); 0,0394 (37,3); 0,0374 (37,5)
IV-45: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,6982 (0,3); 9,6046 (6,9); 8,2429 (14,6); 8,2237 (16,0); 8,0172 (0,3); 7,9967 (0,3); 7,9454 (0,4); 7,9101 (0,5); 7,9005 (0,3); 7,8945 (1,9); 7,8374 (16,0); 7,8181 (15,2); 7,6593 (0,3); 3,9483 (15,7); 3,7782 (0,3); 3,4225 (10,0); 3,3122 (0,7); 3,1690 (8,6); 2,7177 (0,4); 2,6643 (0,7); 2,5381 (10,3); 2,4994 (58,9); 2,3271 (0,4); 1,2561 (0,9); 1,2432 (0,9)
IV-46: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,3332 (4,0); 8,3140 (14,8); 8,3047 (16,0); 8,2841 (4,6); 7,8960 (0,8); 3,3176 (27,7); 2,8611 (2,3); 2,8426 (6,4); 2,8239 (6,8); 2,8055 (2,9); 2,6664 (0,3); 2,5386 (5,5); 2,4990 (35,1); 2,3290 (0,3); 1,3276 (6,3); 1,3088 (12,2); 1,2902 (6,7)
IV-47: ¹ H-NMR(400,0 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9,6259 (2,3); 8,1534 (2,6); 8,1339 (3,2); 8,0878 (0,3); 8,0707 (0,3); 7,9978 (3,2); 7,9781 (2,7); 3,3204 (8,2); 2,6041 (16,0); 2,5390 (2,0); 2,4995 (10,9)
IV-48: ¹ H-NMR(499,9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8,5603 (0,4); 7,9668 (0,4); 7,9503 (0,5); 7,3307 (0,4); 7,3147 (0,4); 3,1570 (16,0); 2,5157 (2,2); 1,8965 (1,5); 1,2756 (0,5); 1,2530 (0,6)
IV-49: ¹ H-NMR(300,2 MHz, CDCl ₃): δ= 8,4859 (0,5); 8,4656 (0,7); 8,4539 (1,2); 8,4342 (1,2); 8,4246 (0,8); 8,4048 (0,7); 8,3344 (4,9); 8,3284 (1,8); 8,3122 (1,9); 8,3059 (6,2); 8,0914 (6,2); 8,0853 (2,0); 8,0689 (1,8); 8,0629 (4,8); 8,0016 (1,2); 7,2987 (14,2); 7,0374 (0,5); 7,0228 (1,4); 7,0127 (1,1); 6,9982 (2,1); 6,9850 (2,0); 6,9731 (1,4); 6,9635 (0,4); 6,9571 (1,2); 6,9480 (0,8); 1,5881 (16,0); 0,0486 (0,6); 0,0378 (17,2); 0,0268 (0,6)
IV-50: ¹ H-NMR(300,2 MHz, CDCl ₃): δ= 8,2284 (4,7); 8,2225 (1,8); 8,2059 (2,2); 8,1999 (5,6); 7,9275 (5,7); 7,8990 (4,5); 7,2985 (9,0); 6,5382 (1,2); 1,6084 (4,4); 1,5459 (16,0); 1,2920 (0,4); 0,9514 (1,0); 0,9282 (4,0); 0,9125 (1,8); 0,8815 (0,6); 0,8621 (0,6); 0,8316 (2,1); 0,8160 (4,2); 0,7921 (1,1); 0,0468 (0,6); 0,0363 (11,8); 0,0254 (0,5)
IV-51: ¹ H-NMR(300,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 10,5649 (1,4); 10,5504 (1,4); 8,1535 (8,0); 8,1476 (2,9); 8,1315 (3,4); 8,1252 (11,5); 7,9994 (11,8); 7,9931 (3,5); 7,9770 (2,8); 7,9709 (7,8); 3,8170 (1,1); 3,8101 (0,6); 3,3970 (4,3); 3,2026 (16,0); 3,1873 (16,0); 2,5343 (5,1); 2,5283 (11,1); 2,5223 (15,6); 2,5162 (11,3); 2,5103 (5,4); 0,0311 (0,5); 0,0201 (18,2); 0,0091 (0,7)
IV-52: ¹ H-NMR(499,9 MHz, CDCl ₃): δ= 8,0253 (0,5); 8,0211 (3,4); 8,0174 (1,1); 8,0077 (1,2); 8,0039 (3,5); 7,9998 (0,5); 7,3540 (0,5); 7,3499 (3,5); 7,3462 (1,1); 7,3364 (1,1); 7,3327 (3,3); 7,3286 (0,4); 7,2597 (3,4); 2,5435 (16,0); 2,5121 (0,7); 2,0052 (1,2); 1,5518 (0,4); -0,0002 (3,3)
IV-53: ¹ H-NMR(300,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 11,6193 (1,2); 8,2811 (0,9); 8,1326 (0,7); 8,1047 (0,8); 7,8677 (0,8); 7,8397 (0,7); 3,3391 (16,0); 2,5281 (3,4); 2,5221 (4,8); 2,5162 (3,6); 0,0208 (5,0)
IV-54: ¹ H-NMR(300,2 MHz, CDCl ₃): δ= 8,2475 (2,3); 8,2254 (0,8); 8,2191 (2,5); 7,8491 (0,7); 7,7201 (2,5); 7,6917 (2,2); 7,2987 (40,4); 2,2012 (11,7); 1,5879 (16,0); 1,5235 (0,4); 0,1072 (0,7); 0,0488 (1,5); 0,0380 (47,8); 0,0271 (1,7); -0,0287 (0,4)

IV-55: ¹ H-NMR(300,2 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 10,6627 (0,9); 8,1550 (2,6); 8,1491 (1,1); 8,1327 (1,3); 8,1265 (3,5); 7,9639 (3,6); 7,9578 (1,2); 7,9414 (1,1); 7,9353 (2,6); 3,6206 (2,5); 3,5972 (2,6); 3,3471 (16,0); 2,5338 (1,2); 2,5279 (2,3); 2,5219 (3,0); 2,5159 (2,2); 2,5102 (1,0); 1,3020 (0,4); 1,2921 (0,4); 1,2870 (0,3); 1,2761 (0,6); 1,2602 (0,4); 1,2500 (0,4); 0,5644 (0,5); 0,5500 (1,4); 0,5439 (1,6); 0,5303 (0,9); 0,5228 (1,5); 0,5170 (1,4); 0,5038 (0,6); 0,3731 (0,7); 0,3590 (1,8); 0,3559 (1,8); 0,3437 (1,6); 0,3388 (1,7); 0,3235 (0,4); 0,0197 (3,0)
IV-56: ¹ H-NMR(300,2 MHz, CDCl ₃): δ = 8,1850 (2,4); 8,1765 (14,5); 8,1699 (5,9); 8,1538 (5,4); 8,1470 (16,0); 8,1387 (2,7); 7,3506 (6,9); 7,3231 (6,8); 7,2991 (12,5); 4,5771 (1,2); 4,5539 (2,0); 4,5313 (2,2); 4,5091 (1,4); 4,4867 (0,6); 2,9883 (12,6); 2,9288 (7,8); 1,6028 (9,2); 1,3019 (9,1); 1,2797 (11,0); 1,2558 (16,0); 1,2333 (13,9); 1,1503 (0,3); 0,0480 (0,7); 0,0373 (15,3); 0,0265 (1,0)

DATOS BIOLÓGICOS

Ejemplo A: Prueba preventiva *in vivo* sobre *Puccinia recondita* (roya marrón del trigo)

- 5 Solvente: 5% en volumen de sulfóxido de dimetilo
10% en volumen de acetona
Emulsionante: 1µl de Tween® 80 por mg de ingrediente activo

Los ingredientes activos se solubilizaron y homogenizaron en una mezcla de sulfóxido de dimetilo/acetona/Tween® 80 y luego se diluyeron en agua hasta la concentración deseada.

Las plantas jóvenes de trigo se trataron rociando el ingrediente activo preparado como se describe anteriormente. Las plantas de control se trataron únicamente con una solución acuosa de acetona/sulfóxido de dimetilo/Tween® 80.

15 Luego de 24 horas, las plantas se contaminaron rociando las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Puccinia recondita*. Las plantas de trigo contaminadas se incubaron durante 24 horas a 20°C a 100% de humedad relativa y luego durante 10 días a 20°C y a 70-80% de humedad relativa.

La prueba se evaluó 11 días luego de la inoculación. 0 % significa una eficacia que corresponde con la de las plantas de control, mientras que una eficacia del 100 % significa que no se observa ninguna enfermedad.

En esta prueba, el siguiente compuesto de acuerdo con la invención mostraron una eficacia de entre 70% y 79% a una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I-08.

En esta prueba, los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia de entre 80 % y 89 % a una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I-17; I-35.

En esta prueba los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia entre 90% y 100% a una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I-02; I-03; I-04; I-07; I-11; I-12; I-13; I-14; I-15; I-18; I-27; I-34.

En esta prueba, los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia de entre 80 % y 89 % a una concentración de 100 ppm de ingrediente activo: I-15; I-18; I-30; I-38.

5 En esta prueba los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia entre 90% y 100% a una concentración de 100 ppm de ingrediente activo: I-03; I-11; I-12; I-13; I-14; I-16; I-26; I-28; I-34.

Ejemplo B: Prueba preventiva in vivo sobre *Uromyces appendiculatus* (roya del frijol)

Solvente: 5% en volumen de sulfóxido de dimetilo

10% en volumen de acetona

5 Emulsionante: 1µl de Tween® 80 por mg de ingrediente activo

Los ingredientes activos se solubilizaron y homogenizaron en una mezcla de sulfóxido de dimetilo/acetona/Tween® 80 y luego se diluyeron en agua hasta la concentración deseada.

10 Las plantas jóvenes de frijol se trataron rociando el ingrediente activo preparado como se describe anteriormente. Las plantas de control se trataron únicamente con una solución acuosa de acetona/sulfóxido de dimetilo/Tween® 80.

Luego de 24 horas, las plantas se contaminaron rociando las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Uromyces appendiculatus*. Las plantas de frijol contaminadas se incubaron durante 24 horas a 20°C a 100% de humedad relativa y luego durante 10 días a 20°C y a 70-80% de humedad relativa.

La prueba se evaluó 11 días luego de la inoculación. 0 % significa una eficacia que corresponde con la de las plantas de control, mientras que una eficacia del 100 % significa que no se observa ninguna enfermedad.

20 En esta prueba, el siguiente compuesto de acuerdo con la invención mostraron una eficacia de entre 80% y 89% a una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I-21.

En esta prueba los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia entre 90% y 100% a una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I-01; I-02; I-03; I-04; I-07; I-08; I-10; I-11; I-12; I-13; I-14; I-15; I-17; I-18; I-19; I-20; I-27; I-34; I-35; I-37.

25 En esta prueba, el siguiente compuesto de acuerdo con la invención mostraron una eficacia de entre 80% y 89% a una concentración de 100 ppm de ingrediente activo: I-36.

En esta prueba los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia entre 90% y 100% a una concentración de 100 ppm de ingrediente activo: I-03; I-10; I-11; I-12; I-13; I-14; I-15; I-16; I-17; I-18; I-20; I-27; I-34.

Ejemplo C: Prueba preventiva *in vivo* sobre *Phakospora pachyrhizi* (roya de la soja)

Solvente: 5% en volumen de sulfóxido de dimetilo

10% en volumen de acetona

5 Emulsionante: 1µl de Tween® 80 por mg de ingrediente activo

Los ingredientes activos se solubilizaron y homogenizaron en una mezcla de sulfóxido de dimetilo/acetona/Tween® 80 y luego se diluyeron en agua hasta la concentración deseada.

10 Las plantas jóvenes de soja se trataron rociando el ingrediente activo preparado como se describe anteriormente. Las plantas de control se trataron únicamente con una solución acuosa de acetona/sulfóxido de dimetilo/Tween® 80.

15 Luego de 24 horas, las plantas se contaminaron rociando las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Phakospora pachyrhizi*. Las plantas de soja contaminadas se incubaron durante 24 horas a 24 °C a 100% de humedad relativa y luego durante 11 días a 24 °C y a 70-80% de humedad relativa.

La prueba se evaluó 12 días luego de la inoculación. 0 % significa una eficacia que corresponde con la de las plantas de control, mientras que una eficacia del 100 % significa que no se observa ninguna enfermedad.

20 En esta prueba, el siguiente compuesto de acuerdo con la invención mostraron una eficacia de entre 80% y 89% a una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I-14.

En esta prueba los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia entre 90% y 100% a una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I-03; I-10; I-11; I-12; I-13; I-15; I-17; I-18; I-19; I-20; I-22; I-24; I-27; I-34.

25 En esta prueba, los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia de entre 80 % y 89 % a una concentración de 100 ppm de ingrediente activo: I-27; I-38; I-43.

En esta prueba los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia entre 90% y 100% a una concentración de 100 ppm de ingrediente activo: I-03; I-10; I-11; I-12; I-13; I-14; I-15; I-16; I-17; I-18; I-22; I-24; I-25; I-26; I-28; I-29; I-30; I-34.

30

Ejemplo D: Prueba preventiva *in vivo* sobre *Phakospora* (semillas de soja)

Solvente: 24,5 partes en peso de acetona
 24,5 partes en peso de dimetilacetamida

5 Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicol éter

Para producir una preparación adecuada del ingrediente activo, se mezcló 1 parte en peso de ingrediente activo con las cantidades establecidas de solvente y emulsionante y el concentrado se diluyó con agua a la concentración deseada.

10 Para probar la actividad preventiva, las plantas jóvenes se pulverizaron con la preparación de ingredientes activo a la velocidad de aplicación establecida. Luego de secarse el recubrimiento pulverizado, las plantas se inocularon con una suspensión acuosa de esporas del agente causal de la roya de la soja (*Phakopsora pachyrhizi*) y se dejaron durante 24 horas sin luz en un gabinete de incubación a aproximadamente 24°C y una humedad atmosférica relativa de 95%.

15 Las plantas permanecieron en el gabinete de incubación a aproximadamente 24°C y una humedad atmosférica relativa de aproximadamente 80% y un intervalo día/noche de 12 horas.

20 La prueba se evaluó 7 días luego de la inoculación. 0 % significa una eficacia que corresponde con la del control no tratado, mientras que una eficacia del 100 % significa que no se observa ninguna enfermedad.

En esta prueba, los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia entre 90% y 100% a una concentración de 250 ppm de ingrediente activo: I-01; I-02; I-03; I-04; I-08; I-35; I-37

Ejemplo E: Prueba celular de *Pyricularia oryzae* in vitro

Solvente: DMSO

Medio de cultivo: 14,6g de D-glucosa anhidra (VWR), 7,1g de peptona micológica (Oxoid), 1,4g de extracto de levadura granulada (Merck), QSP 1litro

Inóculo: suspensión de esporas

Los ingredientes activos se solubilizaron en DMSO y la solución se usó para preparar el rango de concentraciones necesario. La concentración final de DMSO usada en el ensayo fue $\leq 1\%$.

Una suspensión de esporas de *P. oryzae* se preparó y diluyó a la densidad de esporas deseada.

Los ingredientes activos se evaluaron para determinar su capacidad de inhibir la germinación de esporas y el crecimiento de micelios en ensayo de cultivo líquido. Los ingredientes activos se agregaron en la concentración deseada al medio de cultivo con esporas. Luego de 5 días de incubación, la hongo-toxicidad de compuestos se determinó por medición espectrométrica del crecimiento de micelios. La inhibición del crecimiento fúngico se determinó comparando los valores de absorbancia en pocillos que contienen el ingrediente activo con la absorbancia en pocillos de control sin ingrediente activo.

En esta prueba, los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia de entre 80 % y 89 % a una concentración de 20 ppm de ingrediente activo: I-32

En esta prueba, los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia de entre 90% y 100% a una concentración de 20 ppm de ingrediente activo: I-17; I-27; I-39

Ejemplo F: Prueba celular de *Colletotrichum lindemuthianum* in vitro

Solvente: DMSO

Medio de cultivo: 14,6g de D-glucosa anhidra (VWR), 7,1g de peptona micológica (Oxoid), 1,4g de extracto de levadura granulada (Merck), QSP 1litro

Inóculo: suspensión de esporas

Los ingredientes activos se solubilizaron en DMSO y la solución se usó para preparar el rango de concentraciones necesario. La concentración final de DMSO usada en el ensayo fue $\leq 1\%$.

Una suspensión de esporas de *C. lindemuthianum* se preparó y diluyó a la densidad de esporas deseada.

Los ingredientes activos se evaluaron para determinar su capacidad de inhibir la germinación de esporas y crecimiento de micelios en ensayo de cultivo líquido. Los ingredientes activos se agregaron en la concentración deseada al medio de cultivo con esporas. Luego de 6 días de incubación, la hongo-toxicidad de compuestos se determinó por medición espectrométrica del crecimiento de micelios. La inhibición del crecimiento fúngico se determinó comparando los valores de absorbancia en pocillos que contienen el ingrediente activo con la absorbancia en pocillos de control sin ingrediente activo.

En esta prueba, los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia de entre 70% y 79% a una concentración de 20 ppm de ingrediente activo: I-06; I-07; I-17; I-33; I-34

En esta prueba, los siguientes compuestos de acuerdo con la invención mostraron una eficacia de entre 80 % y 89 % a una concentración de 20 ppm de ingrediente activo: I-02; I-04; I-14; I-15; I-27