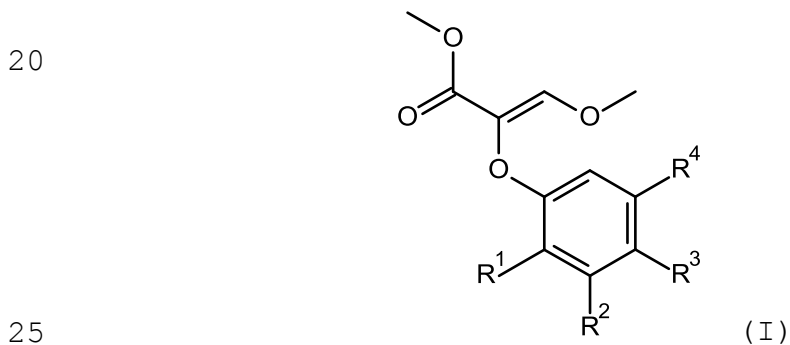


Compuestos fungicidas

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

Los documentos EP 0 212 859 y WO 98/03464 describen el uso de derivados de metoxiacrilato sustituidos para combatir hongos fitopatógenos.

Según la presente invención, se proporciona un compuesto de fórmula (I)



en donde

R^1 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, metilo y metoxilo;

R^2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, metilo y metoxilo;

R^3 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, metilo y metoxilo;

R^4 es cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquenilo C_3-C_7 , donde

dicho cicloalquilo o cicloalquenilo está opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 sustituyentes de R^5 , que pueden ser iguales o diferentes;

R^5 se selecciona del grupo que consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , haloalquenilo C_2-C_4 , ciano-alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 -alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 -alquenilo C_2-C_6 , alcoxilo C_1-C_4 , alqueniloxilo C_3-C_4 , alquiniloxilo C_3-C_4 , haloalcoxilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 - alcoxilo C_1-C_4 , alcoxilo C_1-C_3 -alcoxilo C_1-C_3 , alcoxilo C_1-C_5 -alquilo C_1-C_3 , (=NOR⁶), (=O), fenoxi-alquilo C_1-C_3 , heteroariloxi-alquilo C_1-C_3 , fenoxilo y heteroariloxilo, donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 ó 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados individualmente de nitrógeno, oxígeno y azufre, y donde dichos restos fenilo o heteroarilo están opcionalmente sustituidos por 1, 2 o 3 sustituyentes de R^7 , que pueden ser iguales o diferentes;

R^6 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 -alquilo C_1-C_2 , alquinilo C_3-C_6 , alquenilo C_3-C_6 y haloalquenilo C_3-C_6 ;

R^7 se selecciona del grupo que consiste en fluoro, cloro, ciano, hidroxilo, metilo, etilo, metoxilo, etoxilo, difluorometilo, trifluorometilo, difluorometoxilo y trifluorometoxilo,

o una sal agronómicamente aceptable del mismo;

o un N-óxido del mismo.

Se ha descubierto que los compuestos novedosos de fórmula (I) tienen un nivel muy favorable de actividad biológica para proteger a las plantas contra enfermedades provocadas por hongos.

Según un segundo aspecto de la invención, se

proporciona una composición agroquímica que comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de fórmula (I) y un diluyente o portador agroquímicamente aceptable. Una composición agrícola de este tipo puede comprender
5 además al menos un principio activo adicional.

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

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

Como se usa en el presente documento, el término "halógeno" o "halo" se refiere a flúor (fluoro), cloro, bromo o yodo, preferiblemente flúor, cloro o bromo.
20

Como se usa en el presente documento, ciano se refiere a un grupo -CN.

Como se usa en el presente documento, "hidroxi" se refiere a un grupo -OH.

25 La expresión "alquilo C₁-C₆", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de cadena hidrocarbonada lineal o ramificada constituido únicamente por átomos de carbono e hidrógeno, que no contiene insaturaciones, que tiene de uno a seis átomos de carbono y
30 que está unido al resto de la molécula mediante un enlace sencillo. Los términos "alquilo C₁-C₄" y "alquilo C₁-C₂" se deben interpretar con el mismo significado. Los ejemplos de alquilo C₁-C₆ incluyen, pero sin limitación, metilo, etilo,

n-propilo, 1-metiletilo (isopropilo), n-butilo y 1-dimetiletilo (t-butilo).

Como se usa en el presente documento, el término "cianoalquilo C₁-C₆" se refiere a un radical alquilo C₁-C₆,
 5 como se ha definido anteriormente de manera general, sustituido con uno o más grupos ciano. "Ciano-alquilo C₁-C₄" debe interpretarse con el mismo sentido.

La expresión "alcoxilo C₁-C₆", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical de fórmula -OR_a donde
 10 R_a es un radical alquilo C₁-C₆ como se ha definido anteriormente de manera general. El término "alcoxilo C₁-C₄" se ha de interpretar con el mismo sentido. Los ejemplos de alcoxilo C₁-C₆ incluyen, sin carácter limitante, metoxilo, etoxilo, propoxilo, *iso*-propoxilo y t-butoxilo.

15 Como se usa en el presente documento, la expresión "haloalquilo C₁-C₆" se refiere a un radical alquilo C₁-C₆ como se ha definido anteriormente de forma general, sustituido con uno o más de los mismos o diferentes átomos de halógeno. La expresión "haloalquilo C₁-C₄" se debe
 20 interpretar con el mismo significado. Los ejemplos de haloalquilo C₁-C₆ incluyen, sin carácter limitante, clorometilo, fluorometilo, fluoroetilo, difluorometilo, trifluorometilo y 2,2,2-trifluoroetilo.

Como se usa en el presente documento, el termino
 25 "haloalcoxilo C₁-C₆" se refiere a un grupo alcoxilo C₁-C₆, como se ha definido anteriormente, sustituido con uno o más átomos de halógeno idénticos o diferentes. La expresión haloalcoxilo C₁-C₄ se debe interpretar con el mismo significado. Los ejemplos de haloalcoxilo C₁-C₆ incluyen,
 30 sin carácter limitante, fluorometoxilo, difluorometoxilo, fluoroetoxilo, trifluorometoxilo y trifluoroetoxilo.

Tal como se usa en el presente documento, el término "cicloalquilo C₃-C₆-alcoxilo C₁-C₄" se refiere a un radical

alcoxilo C_1-C_4 tal como se definió anteriormente de forma general, sustituido por uno o más grupos cicloalquilo C_3-C_6 tal como se define de forma general a continuación.

Como se usa en el presente documento, el término
 5 "alqueno C_2-C_6 " se refiere a un radical de cadena hidrocarburo lineal o ramificada que consiste únicamente en átomos de carbono e hidrógeno, que contiene al menos un doble enlace que puede ser de la configuración (E)- o (Z)-, que tiene de dos a seis átomos de carbono, que está unido
 10 al resto de la molécula por un solo enlace. La expresión "alqueno C_2-C_4 " se debe interpretar de manera correspondiente. Los ejemplos de alqueno C_2-C_6 incluyen, pero sin limitación, prop-1-eno, alilo (prop-2-eno) y but-1-eno.

15 Como se usa en el presente documento, el término "haloalqueno C_2-C_6 " se refiere a un radical alqueno C_2-C_6 , como se ha definido anteriormente en general, sustituido por uno o más de los mismos átomos de halógeno iguales o diferentes.

20 La expresión "alquino C_2-C_6 ", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un grupo radical de cadena hidrocarbonada lineal o ramificada constituido únicamente por átomos de carbono e hidrógeno, que contiene al menos un triple enlace, que tiene de dos a seis átomos de carbono y
 25 que está unido al resto de la molécula mediante un enlace sencillo. Los ejemplos de alquino C_2-C_6 incluyen, pero sin limitación, prop-1-ino y propargilo (prop-2-ino).

Como se usa en el presente documento, el término
 30 "alcoxilo C_1-C_3 -alquilo C_1-C_3 -" se refiere a un radical de la fórmula R_a-O-R_b -, donde R_a es un radical alquilo C_2-C_3 como se ha definido de manera general anteriormente, y R_b es un radical alquilo C_1-C_2 como se ha definido de manera general anteriormente.

Como se usa en el presente documento, el término "alcoxilo C₁-C₃-alcoxilo C₁-C₃-" se refiere a un radical de la fórmula R_a-O-R_b-O-, donde R_a es un radical alquilo C₁-C₃ como se ha definido anteriormente en general, y R_b es un radical alquilo C₁-C₃ como se ha definido anteriormente en general.

Tal como se usa en el presente documento, el término "cicloalquilo C₃-C₇" se refiere a un radical de anillo monocíclico, estable que está completamente saturado y contiene de 3 a 7 átomos de carbono. El término cicloalquilo C₃-C₄ se debe interpretar consecuentemente. Los ejemplos de cicloalquilo C₃-C₇ incluyen, sin carácter limitante, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

La expresión "cicloalqueno C₃-C₇", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un radical anular monocíclico estable que está parcialmente insaturado y que contiene de 3 a 7 átomos de carbono. El término cicloalqueno C₃-C₄ se debe interpretar consecuentemente. Los ejemplos de cicloalqueno C₃-C₇ incluyen, pero no se limitan a, ciclopenten-1-ilo, ciclohexen-1-ilo y ciclohepten-1-ilo.

Tal como se usa en el presente documento, el término "cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄" se refiere a un radical alquilo C₁-C₄ tal como se definió anteriormente de forma general, sustituido por uno o más grupos cicloalquilo C₃-C₆ tal como se define de forma general a continuación.

Tal como se usa en el presente documento, el término "cicloalquilo C₃-C₆-alqueno C₂-C₆" se refiere a un radical alqueno C₂-C₆ tal como se definió anteriormente de forma general, sustituido por uno o más grupos cicloalquilo C₃-C₆ tal como se define de forma general a continuación.

Tal como se usa en el presente documento, el término

"cicloalquilo C₃-C₆-alquinilo C₂-C₃" se refiere a un radical alquinilo C₂-C₃ tal como se definió anteriormente de forma general, sustituido por uno o más grupos cicloalquilo C₃-C₆ tal como se define de forma general a continuación.

5 Como se usa en el presente documento, el término "halocicloalquilo C₃-C₆" se refiere a un radical cicloalquilo C₃-C₆, como se ha definido anteriormente en general, sustituido por uno o más de los átomos de halógeno iguales o diferentes. La expresión "halocicloalquilo C₃-C₄"
10 se debe interpretar con el mismo significado.

Tal como se usa en el presente documento, el término "alcoxilo C₁-C₆-cicloalquilo C₃-C₆" se refiere a un grupo cicloalquilo C₃-C₆ tal como se definió anteriormente, sustituido por uno o más grupos alcoxilo C₁-C₆ tal como se
15 definió de forma general anteriormente.

Como se usa en el presente documento, el término "alquilo C₁-C₂-cicloalquilo C₃-C₆-" se refiere a un grupo cicloalquilo C₃-C₆ como se ha definido anteriormente sustituido por uno o más grupos alquilo C₁-C₂ como se ha
20 definido anteriormente.

Tal como se usa en el presente documento, el término "fenoxi-alquilo C₁-C₃" se refiere a un anillo fenilo unido a un radical alquilenilo C₁-C₃ tal como se definió de forma general anteriormente a través de un átomo de oxígeno.

25 El término "heteroarilo", tal como se utiliza en la presente, a menos que se indique explícitamente lo contrario, se refiere a un anillo aromático monocíclico de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados individualmente entre nitrógeno, oxígeno y
30 azufre. El radical heteroarilo puede estar unido al resto de la molécula mediante un átomo de carbono o un heteroátomo. Los ejemplos de heteroarilo incluyen, furilo, pirrolilo, imidazolilo, tienilo, pirazolilo, tiazolilo,

isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, triazolilo, tetrazolilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidilo o piridilo.

Tal como se usa en el presente documento, el término
5 "heteroariloxi-alquilo C_1-C_3 " se refiere a un anillo de heteroarilo tal como se definió anteriormente que se une a un radical alquilenos C_1-C_3 tal como se definió de forma general anteriormente a través de un átomo de oxígeno.

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

En cada caso, los compuestos de fórmula (I) según la
25 invención se encuentran en forma libre, en forma hidratada covalentemente, o en forma salina, por ejemplo, una forma salina que se puede utilizar agronómicamente o agroquímicamente aceptable.

La siguiente lista proporciona definiciones, incluidas
30 las definiciones preferidas, para los sustituyentes R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 que hacen referencia a los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención. Para uno cualquiera de estos sustituyentes, se puede combinar

cualquiera de las definiciones proporcionadas a continuación con cualquier definición de cualquier otro sustituyente proporcionado a continuación o en otra parte del presente documento.

5 R^1 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, metilo y metoxilo. Preferiblemente, R^1 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, cloro, fluoro, bromo, metilo y metoxilo. Más preferiblemente, R^1 se selecciona del grupo que consiste en cloro, fluoro,
10 bromo, metilo y metoxilo. Incluso más preferiblemente, R^1 se selecciona del grupo que consiste en cloro, bromo y metilo. Más preferiblemente, R^1 es metilo.

R^2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, metilo y metoxilo. Preferiblemente, R^2 se
15 selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, flúor, metilo y metoxilo. Más preferiblemente, R^2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, flúor y metilo. Incluso más preferiblemente, R^2 es hidrógeno o fluoro. Más preferiblemente, R^2 es hidrógeno.

20 R^3 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, metilo y metoxilo. Preferiblemente, R^3 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, flúor, metilo y metoxilo. Más preferiblemente, R^3 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, flúor y metilo.
25 Incluso más preferiblemente, R^3 es hidrógeno o fluoro. Más preferiblemente, R^3 es hidrógeno.

R^4 es cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquenilo C_3-C_7 , donde dicho cicloalquilo o cicloalquenilo está opcionalmente
30 sustituido por 1, 2 o 3 sustituyentes de R^5 , que pueden ser iguales o diferentes; Preferiblemente, R^4 es cicloalquilo C_3-C_7 , donde dicho cicloalquilo está opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 sustituyentes de R^5 , que pueden ser iguales o diferentes. Más preferiblemente, R^4 es

cicloalquilo C₃-C₇opcionalmente sustituido por 1 o 2
sustituyentes de R⁵, que pueden ser iguales o diferentes.
Incluso más preferiblemente, R⁴ es cicloalquilo C₃-
C₇opcionalmente sustituido por 1 sustituyente de R⁵. Sin
5 embargo, aún más preferiblemente, R⁴ se selecciona del
grupo que consiste en ciclopropilo, ciclobutilo,
ciclopentilo y ciclohexilo opcionalmente sustituido por 1
sustituyente de R⁵. Sin embargo, aún más preferiblemente,
R⁴ se selecciona del grupo que consiste en ciclopropilo,
10 ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. Además aún más
preferiblemente, R⁴ es ciclopentilo o ciclohexilo. Más
preferiblemente R⁴ es ciclohexilo.

En una realización R⁴ es ciclohexilo opcionalmente
sustituido por 1 sustituyente de R⁵.

15 Cada R⁵ se selecciona independientemente del grupo que
consiste en halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁-C₄,
alqueno C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalqueno C₂-C₄,
ciano-alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo
C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-
20 alqueno C₂-C₆, alcoxilo C₁-C₄, alquenoiloxilo C₃-C₄,
alquenoiloxilo C₃-C₄, haloalcoxilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-
alcoxilo C₁-C₄, alcoxilo C₁-C₃-alcoxilo C₁-C₃, alcoxilo C₁-
C₅-alquilo C₁-C₃, (=NOR⁶), (=O), fenoxi-alquilo C₁-C₃,
heteroariloxi-alquilo C₁-C₃, fenoxilo y heteroariloxilo,
25 donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 ó 6
miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos
seleccionados individualmente de nitrógeno, oxígeno y
azufre, y donde dichos restos fenilo o heteroarilo están
opcionalmente sustituidos por 1, 2 o 3 sustituyentes de R⁷,
30 que pueden ser iguales o diferentes;

Prefeferiblemente, cada R⁵ se selecciona
independientemente del grupo que consiste en halógeno,
hidroxilo, ciano, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄,

haloalquilo C₁-C₄, haloalqueno C₂-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄,
 cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-
 C₆-alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-alqueno C₂-C₆,
 alcoxilo C₁-C₄, alquenoiloxilo C₃-C₄, alquinoiloxilo C₃-C₄,
 5 haloalcoxilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆- alcoxilo C₁-C₄,
 alcoxilo C₁-C₃-alcoxilo C₁-C₃, alcoxilo C₁-C₅-alquilo C₁-C₃,
 (=NOR⁶), (=O), fenoxi-alquilo C₁-C₃, heteroariloxi-alquilo
 C₁-C₃, fenoxilo y heteroariloxilo, donde el resto
 heteroarilo es un anillo aromático de 5 ó 6 miembros que
 10 comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados
 individualmente de nitrógeno, oxígeno y azufre, y donde
 dichos restos fenilo o heteroarilo están opcionalmente
 sustituidos por 1 sustituyente de R⁷.

Más preferiblemente, cada R⁵ se selecciona
 15 independientemente del grupo que consiste en halógeno,
 hidroxilo, ciano, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄,
 haloalquilo C₁-C₄, haloalqueno C₂-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄,
 cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-
 C₆-alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-alqueno C₂-C₆,
 20 alcoxilo C₁-C₄, alquenoiloxilo C₃-C₄, alquinoiloxilo C₃-C₄,
 haloalcoxilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆-alcoxilo C₁-C₄,
 alcoxilo C₁-C₃-alcoxilo C₁-C₃, alcoxilo C₁-C₅-alquilo C₁-C₃,
 (=NOR⁶) y (=O).

Incluso más preferiblemente, cada R⁵ se selecciona
 25 independientemente del grupo que consiste en halógeno,
 hidroxilo, ciano, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄,
 haloalquilo C₁-C₄, haloalqueno C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆,
 halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₄,
 cicloalquilo C₃-C₆-alqueno C₂-C₆, alcoxilo C₁-C₄,
 30 haloalcoxilo C₁-C₄, (=NOR⁶) y (=O).

Incluso aún más preferiblemente, cada R⁵ se selecciona
 del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₄,
 haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, (=NOR⁶) y (=O).

Incluso aún más preferiblemente, cada R^5 se selecciona del grupo que consiste en fluoro, metilo, trifluorometilo, ciclopropilo, ($=NOCH_3$) y ($=O$).

En una realización R^5 se selecciona del grupo que
 5 consiste en fluoro, hidroxilo, ciano, metilo, *iso*-propilo, difluorometilo, trifluorometilo, ciclopropilo, difluorometoxilo, ($=NOCH_3$), ($=NOCH_2CH_3$) y ($=O$).

R^6 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 -alquilo C_1-C_2 ,
 10 alquinilo C_3-C_6 , alquenilo C_3-C_6 y haloalquenilo C_3-C_6 . Preferiblemente, R^6 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquinilo C_3-C_6 y alquenilo C_3-C_6 . Más preferiblemente, R^6 es alquilo C_1-C_6 . Incluso más preferiblemente, R^6 es alquilo C_1-C_3 , lo más
 15 preferiblemente R^6 es metilo.

Cada R^7 se selecciona independientemente del grupo que consiste en fluoro, cloro, ciano, hidroxilo, metilo, etilo, metoxilo, etoxilo, difluorometilo, trifluorometilo, difluorometoxilo y trifluorometoxilo, Preferiblemente, cada
 20 R^7 se selecciona independientemente del grupo que consiste en fluoro, cloro, metilo, etilo, metoxilo, etoxilo, difluorometilo y trifluorometilo. Incluso más preferiblemente, cada R^7 se selecciona independientemente del grupo que consiste en fluoro, cloro, metilo y etilo.

25 Preferentemente, en un compuesto de acuerdo con la fórmula (I) de la invención;

R^1 se selecciona del grupo que consiste en cloro, fluoro, bromo, metilo y metoxilo;

R^2 es hidrógeno o fluoro;

30 R^3 es hidrógeno o fluoro;

R^4 es cicloalquilo C_3-C_7 o cicloalquenilo C_3-C_7 , donde dicho cicloalquilo o cicloalquenilo está opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 sustituyentes de R^5 , que pueden ser

iguales o diferentes;

cada R^5 se selecciona del grupo que consiste en halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , ($=NOR^6$) y ($=O$); y

5 R^6 es alquilo C_1-C_3 .

Más preferiblemente, en un compuesto según la fórmula (I) de la invención;

R^1 es metilo;

R^2 es hidrógeno;

10 R^3 es hidrógeno o fluoro;

R^4 es cicloalquilo C_3-C_7 opcionalmente sustituido por 1, 2 o 3 sustituyentes de R^5 , que pueden ser iguales o diferentes; y

15 cada R^5 se selecciona del grupo que consiste en fluoro, metilo, trifluorometilo, ciclopropilo, ($=NOCH_3$) y ($=O$).

Incluso más preferiblemente, en un compuesto según la fórmula (I) de la invención;

R^1 es metilo;

20 R^2 es hidrógeno;

R^3 es hidrógeno;

R^4 se selecciona del grupo que consiste en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo, donde dicho ciclopropilo está opcionalmente sustituido por 1 sustituyente de R^5 ; y

R^5 es ciclopropilo.

Incluso aún más preferiblemente, en un compuesto según la fórmula (I) de la invención;

R^1 es metilo;

30 R^2 es hidrógeno;

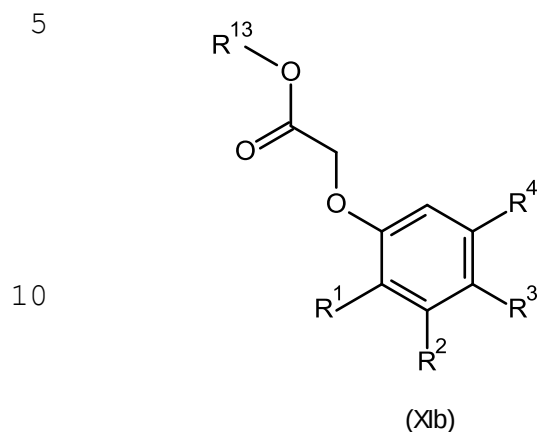
R^3 es hidrógeno;

R^4 es ciclopentilo o ciclohexilo.

En un conjunto de realizaciones, el compuesto según la

fórmula (I) se selecciona de un compuesto E.1 a E.23 o F.1 a F.10 listado en las tablas E y F a continuación.

Según la invención también se proporciona un producto intermedio de de fórmula (XIb),



donde,

R^1 es metilo;

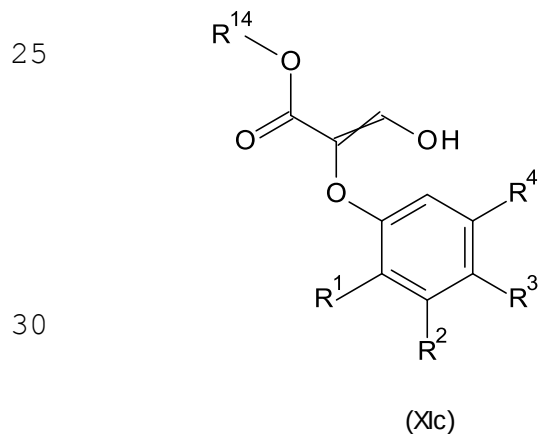
15 R^2 es hidrógeno;

R^3 es hidrógeno;

R^4 se selecciona del grupo que consiste en ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo (preferiblemente, R^4 es ciclopentilo o ciclohexilo); y

20 R^{13} is H o alquilo C_1-C_4 (preferiblemente, R^{13} es metilo).

En otra realización de la invención, también se proporciona un producto intermedio de fórmula (XIc),



donde,

R¹ es metilo;

R² es hidrógeno;

R³ es hidrógeno;

R⁴ se selecciona del grupo que consiste en
 5 ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo
 (preferiblemente, R⁴ es ciclopentilo o ciclohexilo); y

R¹⁴ is H o alquilo C₁-C₄ (preferiblemente, R¹⁴ es metilo).

En una realización, los compuestos de fórmula (I) de
 10 acuerdo con la invención pueden ser útiles para combatir
 hongos fitopatógenos (por ejemplo, *Alternaria alternata*,
Phakopsora pachyrhizi, *Plasmopara viticola*, *Sclerotinia*
sclerotiorum o *Septoria tritici* también conocida como
Mycosphaerella graminicola) que contienen una mutación en
 15 el citocromo b mitocondrial que les confiere resistencia a
 los inhibidores de Qo (por ejemplo, estrobilurinas tales
 como azoxistrobina, piraclostrobina, picoxistrobina y
 trifloxistrobina o fenamidona o famoxadona).

En una realización adicional, los compuestos de
 20 fórmula (I) de acuerdo con la invención pueden ser útiles
 para combatir hongos fitopatógenos (por ejemplo, *Alternaria*
alternata, *Plasmopara viticola*, *Sclerotinia sclerotiorum* o
Septoria tritici también conocido como *Mycosphaerella*
graminicola) que contienen una mutación en el citocromo b
 25 mitocondrial que les confiere resistencia a los inhibidores
 de Qo (por ejemplo, estrobilurinas tales como
 azoxistrobina, piraclostrobina, picoxistrobina y
 trifloxistrobina o fenamidona o famoxadona), donde la
 mutación es G143A.

30 En una realización adicional, los compuestos de
 fórmula (I) de acuerdo con la invención pueden ser útiles
 para combatir hongos fitopatógenos (por ejemplo, *Phakopsora*
pachyrhizi) que contienen una mutación en el citocromo b

mitocóndrico que les confiere resistencia a los inhibidores de Qo (por ejemplo, estrobilurinas tales como azoxistrobina, piraclostrobina, picoxistrobina y trifloxistrobina o fenamidona o famoxadona), donde la
5 mutación es F129L.

En otra realización, la invención también se refiere a un método para controlar o prevenir la infestación por hongos fitopatógenos en una planta (por ejemplo, *Alternaria alternate*, *Plasmopara viticola*, *Sclerotinia sclerotiorum* o
10 *Septoria tritici* también conocido como *Mycosphaerella graminicola*), donde dichos hongos fitopatógenos contienen una mutación en el citocromo b mitocóndrico que les confiere resistencia a los inhibidores de Qo (por ejemplo, estrobilurinas tales como azoxistrobina, piraclostrobina,
15 picoxistrobina y trifloxistrobina o fenamidona o famoxadona), comprendiendo dicho método aplicar a la planta, a partes de la misma o al emplazamiento de la misma, una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de fórmula (I). Preferiblemente, un método para controlar o
20 prevenir la infestación por hongos fitopatógenos (por ejemplo, *Phakopsora pachyrhizi*) en una planta de soja, donde dichos hongos fitopatógenos contienen una mutación en el citocromo b mitocóndrico que les confiere resistencia a los inhibidores de Qo (por ejemplo, estrobilurinas tales
25 como azoxistrobina, piraclostrobina, picoxistrobina y trifloxistrobina o fenamidona o famoxadona), comprendiendo dicho método aplicar a la planta, a partes de la misma o al emplazamiento de la misma, una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de fórmula (I). Más
30 preferiblemente, un método para controlar o prevenir la infestación por hongos fitopatógenos (por ejemplo, *Phakopsora pachyrhizi*) en una planta de soja, donde dichos hongos fitopatógenos contienen una mutación F129L en el

citocromo b mitocondrial que les confiere resistencia a los inhibidores de Qo (por ejemplo, estrobilurinas tales como azoxistrobina, piraclostrobina, picoxistrobina y trifloxistrobina o fenamidona o famoxadona), comprendiendo
5 dicho método aplicar a la planta, a partes de la misma o al emplazamiento de la misma, una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de fórmula (I).

El nivel de resistencia y, por consiguiente, el impacto sobre el rendimiento del fungicida se pueden medir
10 utilizando un "factor de resistencia" (FR). El factor de resistencia se puede calcular dividiendo la concentración de un fungicida que proporciona un nivel determinado de control de la enfermedad (es decir, un 50 por ciento) para la cepa fúngica "resistente" por la concentración del mismo
15 fungicida que proporciona el mismo nivel de control de la enfermedad para la cepa "susceptible" de la misma especie fúngica ($FR = \text{valor de CE50 de la cepa resistente} / \text{valor de CE50 de la cepa sensible}$). Aunque no existen reglas determinadas, se pueden definir tres categorías: 1) $FR \geq 50$
20 = cepa resistente, 2) $5 \leq FR < 50$ = cepa menos sensible (cambio en la sensibilidad), y 3) $FR < 5$ = cepa sensible.

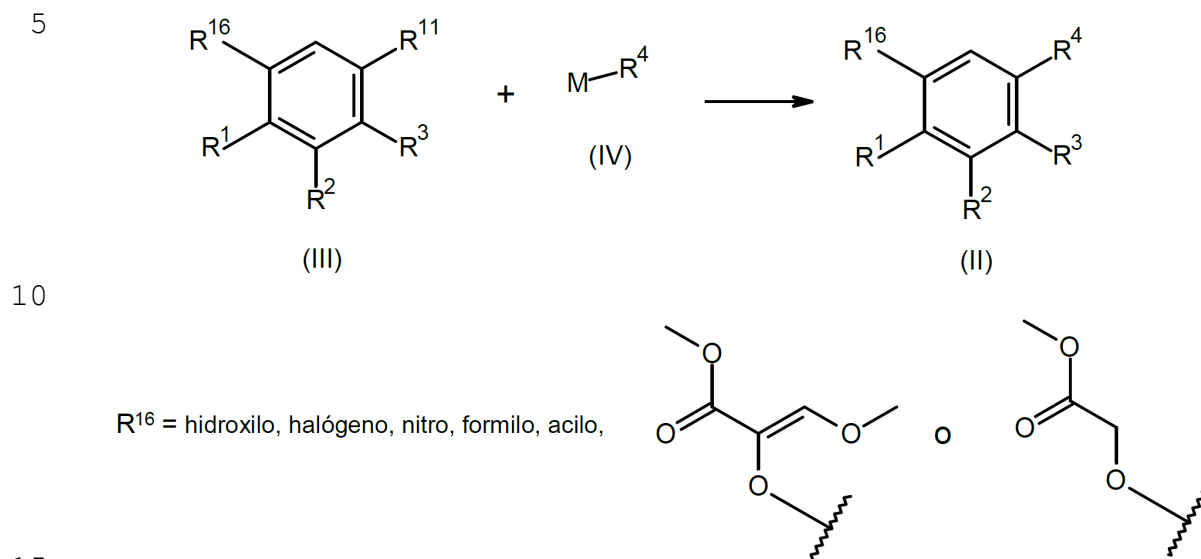
Con el fin de obtener cepas fúngicas resistentes, un investigador debe localizar un cultivo hospedador y una región geográfica en los que se ha descrito una resistencia
25 relevante en la bibliografía o se ha observado en la práctica agronómica. A continuación, se recolectan o bien muestras foliares infectadas por la enfermedad diana o esporas o bien micelio de la enfermedad diana a partir de las ubicaciones/cultivos hospedadores y se envían a un
30 laboratorio, donde se aislarían cultivos puros. El fenotipo resistente de los cultivos fúngicos se determina llevando a cabo un bioensayo completo de respuesta a la dosis y comparando los resultados del bioensayo con los resultados

de un bioensayo similar para una cepa sensible de la misma especie. Como alternativa, el genotipo de resistencia de la cepa fúngica se puede determinar mediante técnicas moleculares (p. ej., qPCR) si el mecanismo de resistencia para la especie relevante es conocido.

Los compuestos de fórmula (I) según la invención pueden prerarse tal como se muestra en los siguientes esquemas 1 a 16, donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son tal como se definen para un compuesto de formula (I), a menos que se indique lo contrario.

Los compuestos de fórmula (II) donde R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son tal como se definieron anteriormente, y R^{16} es tal como se define en el esquema 1, pueden obtenerse a través de la transformación de acoplamiento entre los compuestos de fórmula (III), donde R^1 , R^2 y R^3 son tal como se definen para los compuestos de fórmula (I), R^{16} es tal como se define en el esquema 1 y R^{11} es un haluro o pseudohaluro tal como cloro, bromo, yodo, $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ o $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, y compuestos de fórmula (IV), donde R^4 es tal como se define para los compuestos de fórmula (I) y M es una especie metaloide o especie pseudometalloide (por ejemplo M incluye pero no se limita a MgCl , ZnCl o $\text{B}(\text{OH})_2$), opcionalmente en presencia de una sal metálica tal como LiCl o ZnCl_2 , y un complejo de catalizador de metal adecuado, tal como cloro(2-diciclohexilfosfino-2',4',6'-triisopropil-1,1'-bifenil)[2-(2'-amino-1,1'-bifenil)]paladio(II), en un disolvente orgánico tal como tetrahidrofurano o 1,4-dioxano a temperaturas entre 20°C - 150°C . Para ejemplos relacionados, véase: *Journal of Organic Chemistry*, **2010**, 75, 6677 - 6680, *Journal of the American Chemical Society*, **2009**, 131, 7532-7533, *European Journal of Medicinal Chemistry*, **2018**, 147, 238-252, y "Cross-Coupling Reactions: A Practical Guide (Topics in Current Chemistry)", editado

por Norio Miyaura und S. L. Buchwald (ediciones Springer), o "Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions", editado por Armin de Meijere and François Diederich (ediciones WILEY-VCH). Esto se muestra en el esquema 1.



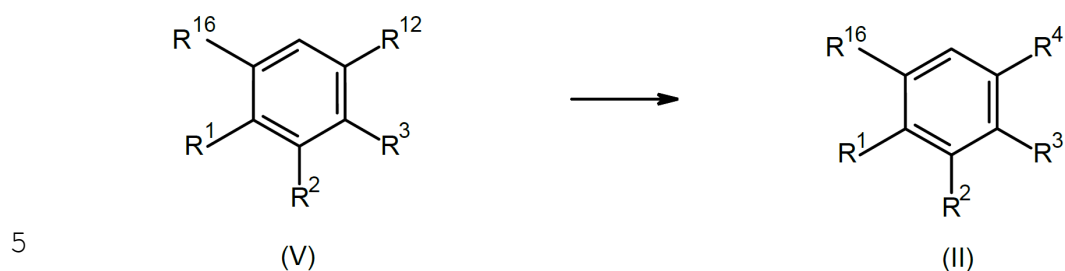
Esquema 1

Alternativamente los compuestos de formula (II) pueden obtenerse haciendo reaccionar los compuestos de fórmula (V), donde R^1 , R^2 y R^3 son tal como se definen para los compuestos de fórmula (I), R^{16} es tal como se define en el Esquema 2 y R^{12} es un cicloalqueno C_3-C_7 opcionalmente sustituido, parcialmente insaturado, a través de un método de reducción, tal como hidrogenación usando una fuente de hidrógeno en presencia de un complejo de catalizador tal como, paladio sobre carbono, en un disolvente orgánico tal como metanol, tetrahidrofurano o acetato de etilo a temperaturas entre 0°C - 150°C . Para ejemplos relacionados, véase: *ACS Medicinal Chemistry Letters*, **2016**, 7, 508-51. 'Handbook of Heterogeneous Catalytic Hydrogenation for Organic Synthesis' by Shigeo Nishimura (publicado por Wiley-VCH), o 'The Handbook of Homogeneous Hydrogenation' ed. Johannes de Vries and Cornelis Elsevier (publicado por Wiley-VCH). Esto se muestra en el esquema 2.

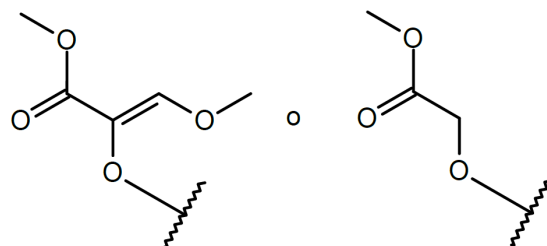
20

25

30



10 R_{16} = hidroxilo, halógeno, nitro, formilo, acilo,

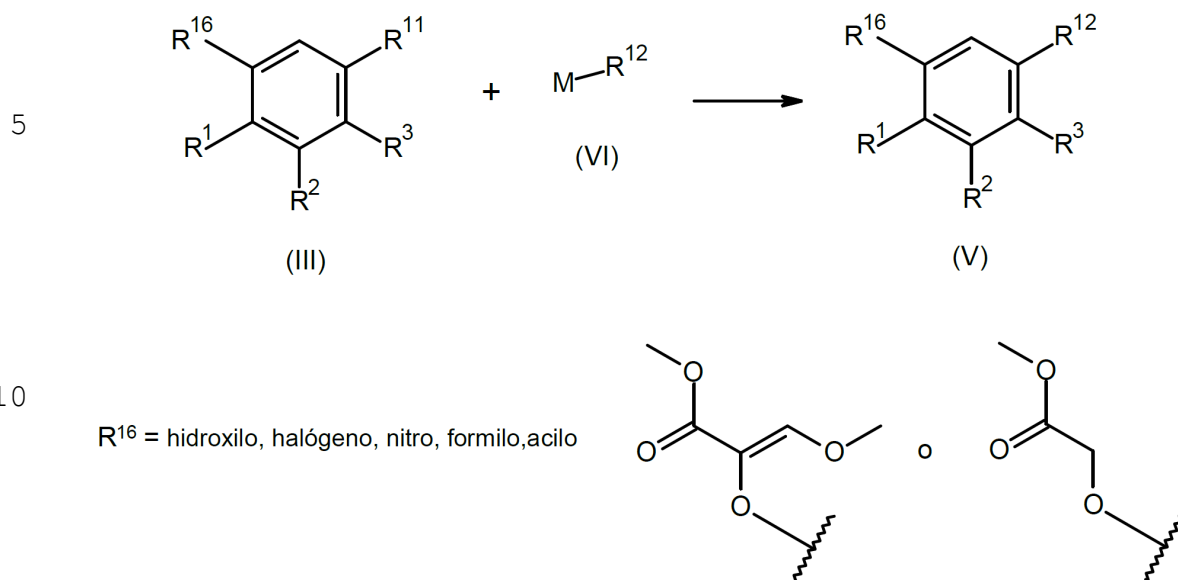


Esquema 2

Los compuestos de fórmula (V), donde R^1 , R^2 y R^3 son tal como se definen para los compuestos de fórmula (I), R^{16} es tal como se define en el Esquema 3 y R^{12} es un cicloalqueno C_3-C_7 opcionalmente sustituido y parcialmente saturado, pueden obtenerse a través de una reacción de acoplamiento cruzada entre los compuestos de fórmula (III), donde R^{11} es un haluro o pseudohaluro tal como cloro, bromo, yodo, $-OSO_2CF_3$ o $-OSO_2(CF_2)_3CF_3$, y compuestos de fórmula (VI), donde M representa una especie de metaloide o pseudometaloide (por ejemplo M incluye pero no se limita a, $B(OH)_2$, BPin, $SnBu_3$) o hidrógeno, usando un complejo de catalizador adecuado, tal como paladio(tetrakis(trifenilfosfina)), en un disolvente tal como 1,4-dioxano, dimetilformamida o tetrahidrofurano a temperaturas entre $0^\circ C$ - $150^\circ C$, y opcionalmente en presencia de una base (por ejemplo fosfato de potasio). Para ejemplos relacionados, véase: *ACS Medicinal Chemistry Letters*, **2016**, 7, 508-513 y "Cross-Coupling Reactions: A Practical Guide (Topics in Current Chemistry)", editado por Norio Miyaura y S.L. Buchwald (ediciones Springer), o "Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions", editado por

15
20
25
30

Armin de Meijere y François Diederich (ediciones WILEY-VCH). Esto se muestra en el esquema 3.



Esquema 3

15 Los compuestos de fórmula (VII), donde R^1 , R^2 y R^3 con tal como se definen para los compuestos de fórmula (I) y R^{11} es un haluro o pseudohaluro tal como cloro, bromo, yodo, $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ o $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, pueden obtenerse a partir de los compuestos de fórmula (VIII), donde R^1 , R^2 y R^3 son tal como se definen para los compuestos de fórmula (I), R^{11} es tal como se definió anteriormente y R^{13} es H o $\text{C}_1\text{-C}_4$ alquilo, a través de tratamiento con una base adecuada, tal como metóxido de sodio, y un agente de formulación, tal como formiato de metilo, opcionalmente en un disolvente adecuado

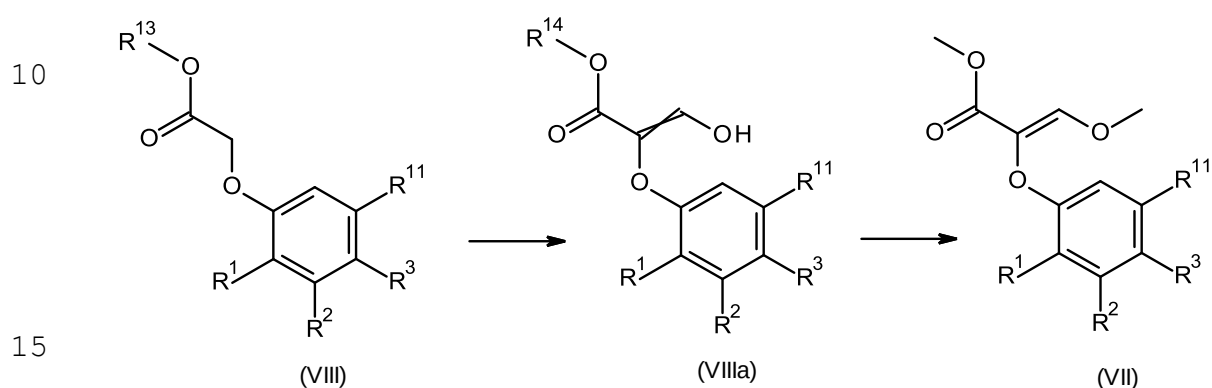
20 (por ejemplo tetrahidrofurano) para generar los compuestos de fórmula (VIIIa), donde R^1 , R^2 y R^3 son tal como se definen para los compuestos de fórmula (I), R^{11} es tal como se definió anteriormente y R^{14} es H o metilo, seguido por metilación con un reactivo, tal como sulfato de dimetilo, opcionalmente en presencia de una base tal como K_2CO_3 . Alternativamente, los compuestos de fórmula (VII) también pueden obtenerse directamente a partir de los compuestos de

25

30

fórmula (VIII) a través del tratamiento con un ortoéster, tal como HC(OMe)_3 , opcionalmente en presencia de un ácido, tal como H_2SO_4 o ZnCl_2 , en un disolvente adecuado (por ejemplo, metanol). Para ejemplos relacionados, véase:

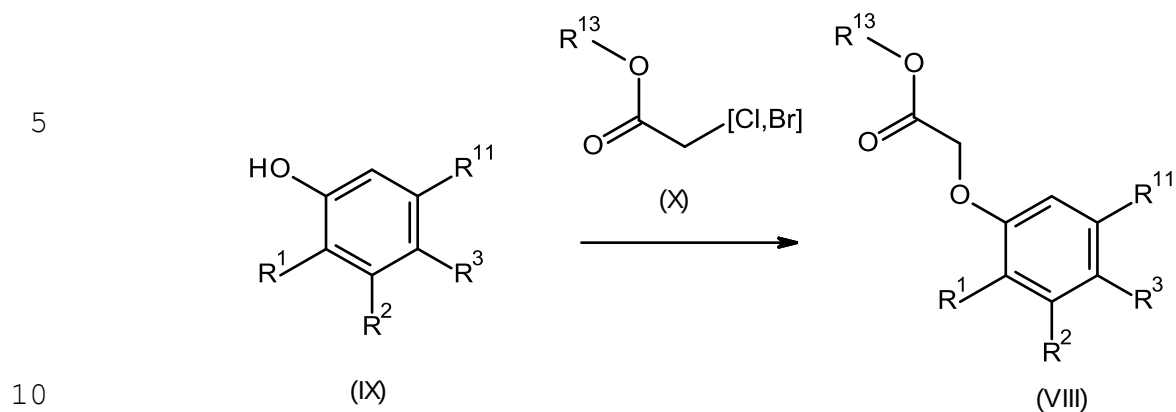
5 *Journal of Agricultural and Food Chemistry*, **2007**, 55, 5697-5700, *Molecules*, **2010**, 15, 9024-9034 y *Organic Process Research and Development*, **2015**, 19, 639-645. Esto se muestra en el esquema 4.



Esquema 4

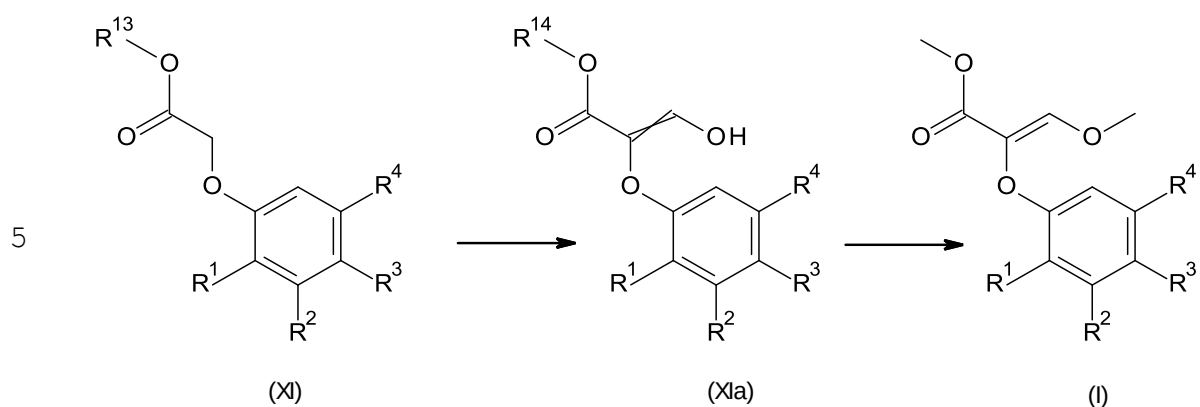
Los compuestos de fórmula (VIII), donde R¹, R² y R³ son tal como se definen para los compuestos de fórmula (I), R¹¹ es tal como se definió anteriormente y R¹³ es H o alquilo C₁-C₄, pueden obtenerse a partir de los compuestos de fórmula (IX) donde R¹, R² y R³ con tal como se definen para los compuestos de fórmula (I) y R¹¹ es tal como se definió anteriormente, mediante tratamiento con una base tal como K₂CO₃ y un agente de alquilación de fórmula (X), donde R¹³ es H o alquilo C₁-C₄, en un disolvente orgánico tal como dimetilformamida o N-metilpirrolidona. Los compuestos de fórmula (X) están disponibles comercialmente o se preparan fácilmente a partir de los compuestos disponibles comercialmente mediante transformaciones de grupo funcional estándar tal como se describe en *March's Advanced Organic Chemistry*, Smith and March, 6^a edición, Wiley, 2007. Esto se muestra en el esquema 5. El experto apreciaría que los

compuestos de fórmula (XI) pueden prepararse de manera análoga.



Esquema 5

Los compuestos de fórmula (I) donde R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son tal como se definen para los compuestos de fórmula (I), también pueden obtenerse a partir de los compuestos de fórmula (XI) donde R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son tal como se definen para los compuestos de fórmula (I) y R^{13} is H o alquilo C_1 - C_4 , mediante tratamiento con una base tal como metóxido de sodio y un agente de formilación tal como formiato de metilo para generar compuestos de fórmula (XIa), donde R^1 , R^2 , R^3 y R^4 son tal como se definen para los compuestos de fórmula (I) y R^{14} es H o metilo, seguido por metilación con un reactivo tal como sulfato de dimetilo en presencia de una base tal como K_2CO_3 . Alternativamente, los compuestos de fórmula (I) también pueden obtenerse directamente a partir de los compuestos de fórmula (XI) a través del tratamiento con un ortoéster, tal como $HC(OMe)_3$, opcionalmente en presencia de un ácido, tal como H_2SO_4 o $ZnCl_2$, en un disolvente adecuado (por ejemplo, metanol). Para ejemplos relacionados, véase: *Journal of Agricultural and Food Chemistry*, **2007**, 55, 5697-5700, *Molecules*, **2010**, 15, 9024-9034 y *Organic Process Research and Development*, **2015**, 19, 639-645. Esto se muestra en el esquema 6.

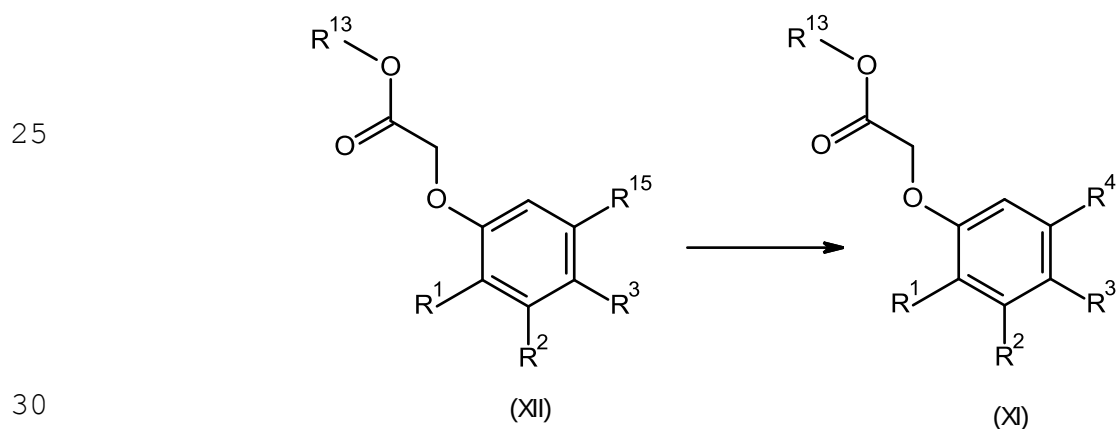


Esquema 6

10 Los compuestos de fórmula (XI), donde R^1 , R^2 y R^3 son tal como se definen para los compuestos de fórmula (I) y R^4 es un grupo ciclopropilo opcionalmente sustituido, pueden prepararse a partir de los compuestos de fórmula (XII), donde R^1 , R^2 y R^3 son tal como se definen para los

15 compuestos de fórmula (I) y R^{15} representa un grupo alqueno opcionalmente sustituido, mediante tratamiento con diyodometano con un reactivo organozinc tal como dietilzinc, opcionalmente en presencia de una fuente ácida, tal como ácido trifluoroacético, y en un disolvente

20 orgánico tal como diclorometano. Para ejemplos relacionados, véase: *Organic Reactions*, **2001**, 58, 1. Esto se muestra en el esquema 7.



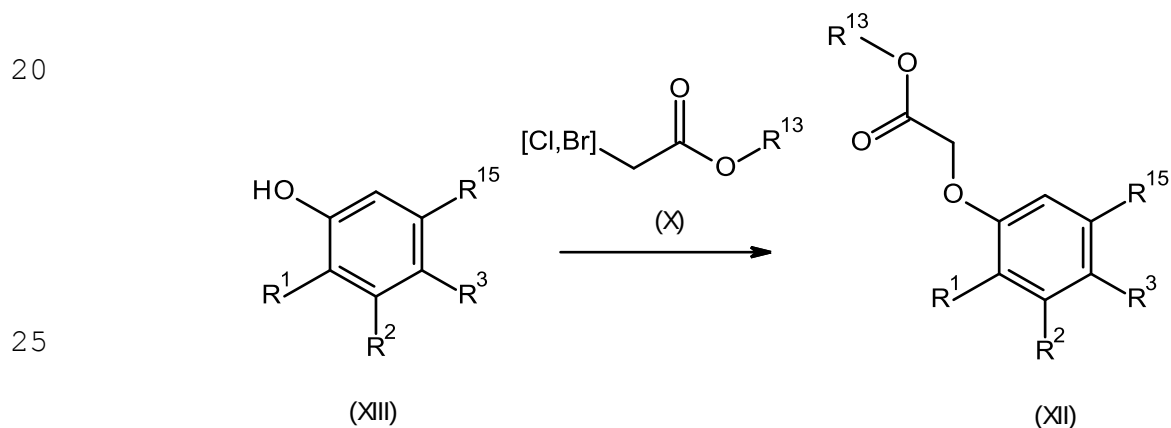
Esquema 7

Los compuestos de fórmula (XII), donde R^1 , R^2 y R^3 son tal como se definen para los compuestos de fórmula (I), R^{15}

es tal como se definió anteriormente y R^{13} es H o alquilo C_1-C_4 , pueden obtenerse a partir de los compuestos de fórmula (XIII) donde R^1 , R^2 y R^3 con tal como se definen para los compuestos de fórmula (I) y R^{15} es tal como se definió anteriormente, mediante tratamiento con una base tal como K_2CO_3 y un agente de alquilación de fórmula (X), donde R^{13} es H o alquilo C_1-C_4 , en un disolvente orgánico tal como dimetilformamida o N-metilpirrolidona. Esto se muestra en el esquema 8. Para ejemplos relacionados, véase:

10 *European Journal of Organic Chemistry*, **2015**, 2197-2204. Los compuestos de fórmula (X) están disponibles comercialmente o se preparan fácilmente a partir de los compuestos disponibles comercialmente mediante transformaciones de grupo funcional estándar tal como se describe en *March's*

15 *Advanced Organic Chemistry*, Smith and March, 6^a edición, Wiley, 2007. El experto apreciaría que los compuestos de fórmula (XI) o fórmula (VIII) pueden prepararse de manera análoga.

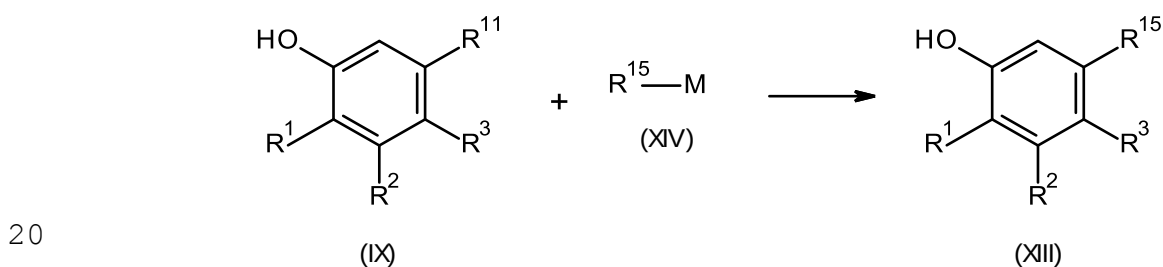


Esquema 8

Los compuestos de fórmula (XIII), donde R^1 , R^2 y R^3 son tal como se definen para los compuestos de fórmula (I) y R^{15} es tal como se definió anteriormente, pueden prepararse a través de la transformación de acoplamiento entre los compuestos de fórmula (IX), donde R^1 , R^2 y R^3 son tal como

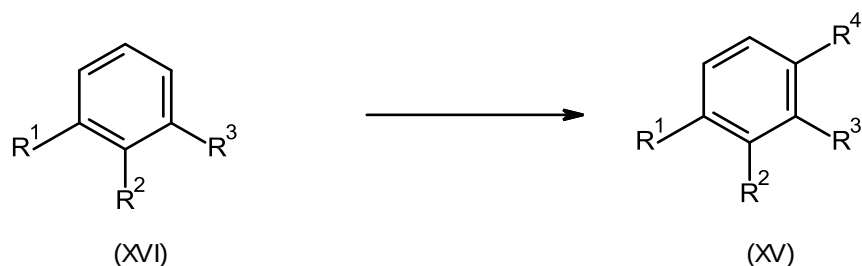
30

se definen para los compuestos de fórmula (I) y R^{11} es un haluro o pseudohaluro tal como cloro, bromo, yodo, $-\text{OSO}_2\text{CF}_3$ o $-\text{OSO}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, y los compuestos de fórmula (XIV), donde R^{15} es tal como se definió anteriormente y M representa una especie de metaloide o especie de pseudometalloide (por ejemplo M incluye pero no se limita a, $\text{B}(\text{OH})_2$, BPin , SnBu_3) o hidrógeno, usando un complejo de catalizador adecuado, tal como paladio(tetrakis(trifenilfosfina)), en un disolvente adecuado tal como dioxano, dimetilformamida o tetrahidrofurano a temperaturas entre 0°C - 150°C y opcionalmente una base, tal como fosfato de potasio o carbonato de potasio. Para ejemplos relacionados, véase: *Journal of Medicinal Chemistry*, **2015**, 58, 9258-9272 and *Journal of Medicinal Chemistry*, **2014**, 57, 1252-1275. Esto se muestra en el esquema 9.



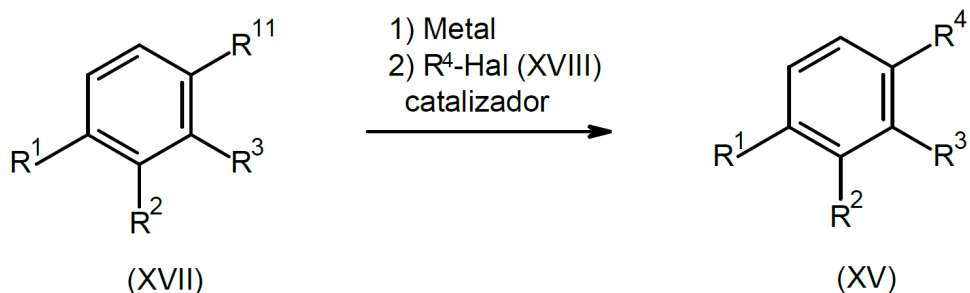
Esquema 9

Los compuestos de fórmula (XV), donde R^1 , R^2 y R^3 son tal como se definen para los compuestos de fórmula (I), pueden prepararse a través de la transformación de acoplamiento entre los compuestos de fórmula (XVI) y un cicloalqueno $\text{C}_3\text{-C}_7$ opcionalmente sustituido en presencia de un ácido adecuado, (por ejemplo, ácido p-toluenosulfónico) y en un disolvente adecuado, tal como tolueno. Para ejemplos relacionados, véase: *Journal of Organic Chemistry*, **1998**, 63, 2858. Esto se muestra en el esquema 10.



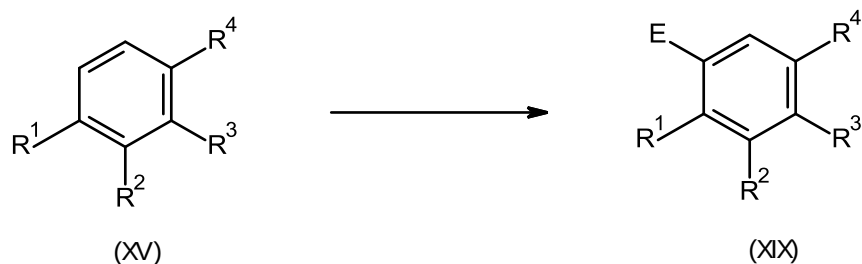
Esquema 10

Los compuestos de fórmula (XV), pueden obtenerse a partir de una reacción de acoplamiento cruzada entre los compuestos de fórmula (XVII), donde R^{11} es un haluro tal como cloro, bromo, y yodo, a través de la introducción de un metal, tal como litio o magnesio, y luego un compuesto $\text{R}^4\text{-Hal}$ de fórmula (XVIII) y un complejo de catalizador adecuado, tal como cloruro de hierro (III), en un disolvente adecuado tal como tolueno o tetrahidrofurano. Para ejemplos relacionados, véase: *J. Am. Chem. Soc.* **2004**, 126, 3686. Esto se muestra en el esquema 11.



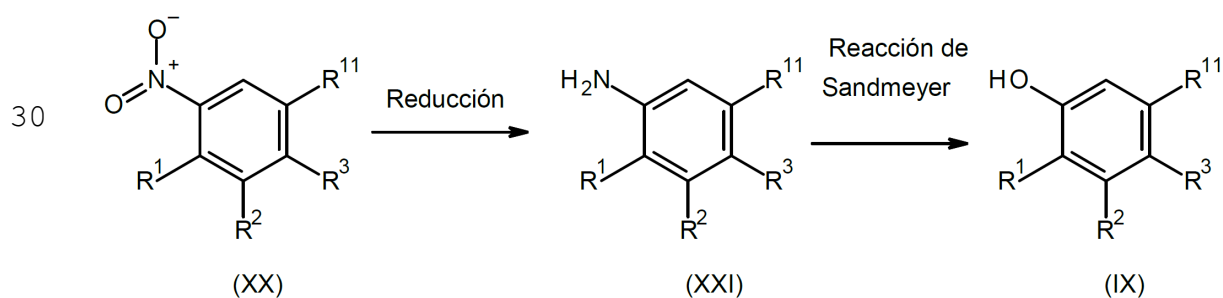
Esquema 11

Los compuestos de fórmula (XIX), donde E es nitro, cloro, bromo, formilo, o acilo, pueden obtenerse a partir de una reacción de sustitución electrofílica aromática entre los compuestos de fórmula (XV) y un electrófilo adecuado. Para ejemplos relacionados, véase: *J. Am. Chem. Soc.* **1964**, 86, 1067 y *Adv. Synth. Catal.* **2010**, 352, 3031. Esto se muestra en el esquema 12.



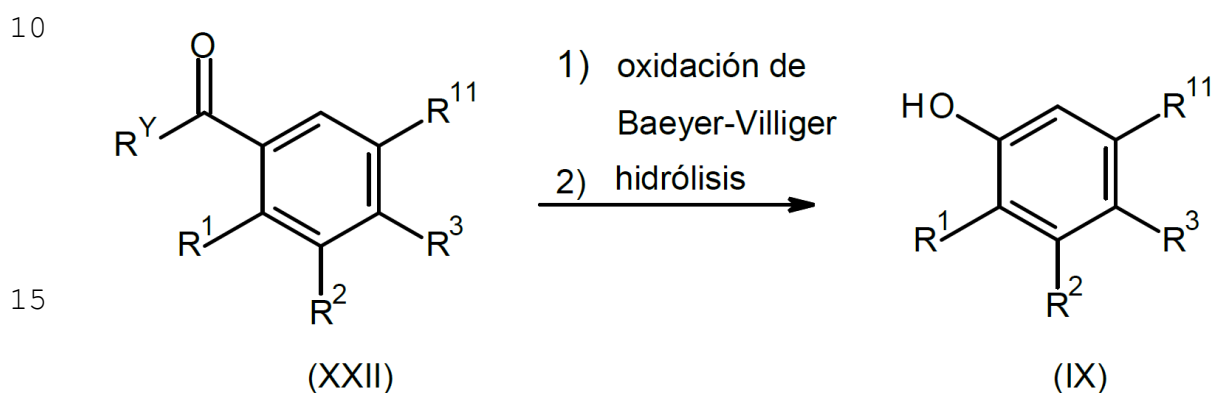
Esquema 12

Alternativamente, los compuestos de fórmula (IX), donde R^{11} es halógeno, R^4 o R^{12} es tal como se definió anteriormente, pueden prepararse a partir de los compuestos de fórmula (XX), a través de la reacción de reducción del grupo nitro usando un metal (por ejemplo Pd/C, hierro, o níquel Raney) en un disolvente adecuado (por ejemplo MeOH o etanol) en presencia de un agente de reducción (por ejemplo gas hidrógeno, cloruro de amonio, ácido fórmico, o hidrazina) a una temperatura entre 25°C y 65°C. En algunos casos, se obtiene un rendimiento de reacción mejorado cuando se aplica un aumento de presión. Para ejemplos relacionados, véase: Yoshii, Y. *et al Chem. Commun.* (2015), 51, 1070; Takeshiba, H. *et al Eur. Pat. Appl.*, (1997) 807631. Tras la reducción del grupo nitro, una reacción de sustitución aromática radical-nucleófila (Sandmeyer) de compuestos de fórmula (XXI) en presencia de una fuente de nitrito (por ejemplo, NaNO_2 o iso-amilnitrito), y una fuente de cobre (por ejemplo, CuCN) en un sistema de disolvente aceptable, tal como acetonitrilo acuoso, a temperaturas adecuadas (por ejemplo, 0 °C a 100 °C). Esta reacción se muestra en el Esquema 13.



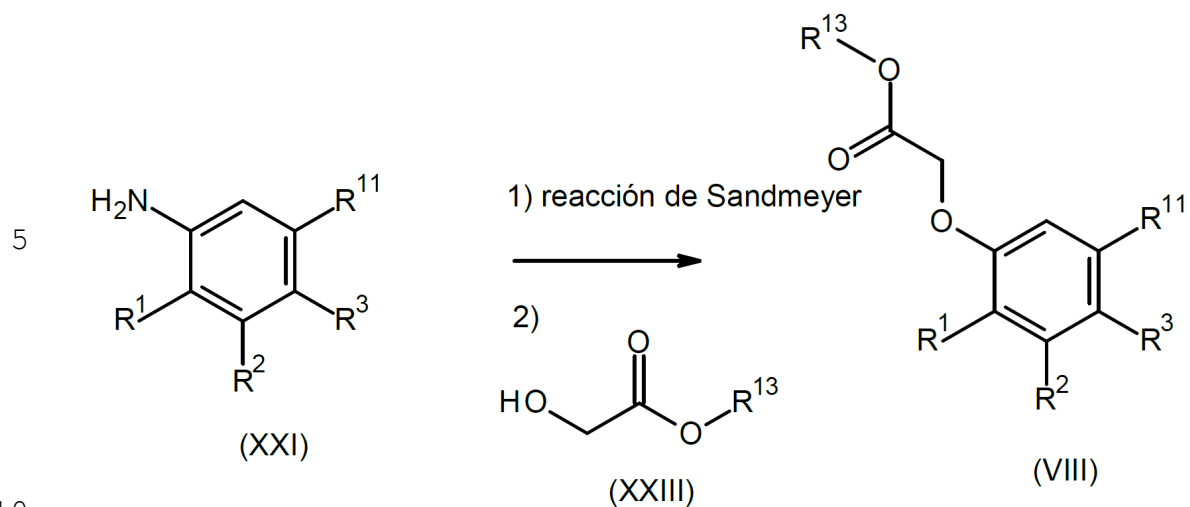
Esquema 13

Los compuestos de fórmula (IX) pueden obtenerse a partir de una reacción de oxidación de Baeyer-Villiger o Dakin entre los compuestos de fórmula (XXII), donde R^Y es H o Me, y un oxidante adecuado, tal como un ácido peroxifórmico o peróxido de hidrógeno. El éster resultante se hidroliza con el correspondiente fenol. Para ejemplos relacionados, véase el documento EP2289889. Esto se muestra en el esquema 14.



Esquema 14

Alternativamente, los compuestos de fórmula (VIII), donde R^{11} es halógeno y R^{13} es H o alquilo C_1-C_4 pueden prepararse a partir de los compuestos de fórmula (XX), a través de reacciones de sustitución aromáticas nucleófilas con compuestos de fórmula (XXIII) en presencia de una fuente de nitrito (por ejemplo, $NaNO_2$ o iso-amilnitrito) en condiciones ácidas (por ejemplo, H_2SO_4 o HBf_4) y una fuente de cobre (por ejemplo, $CuSO_4$ o $CuCN$) en un sistema de disolvente aceptable a temperaturas adecuadas (por ejemplo, 0 °C a 100 °C). Tales transformaciones se describen en el documento CN 101580477 o *Journal of Iowa Academy of Science* **2010**, 116, 27-35 y se muestran en el esquema 15. El experto apreciaría que los compuestos de fórmula (XI) o fórmula (XII) pueden prepararse de manera análoga.



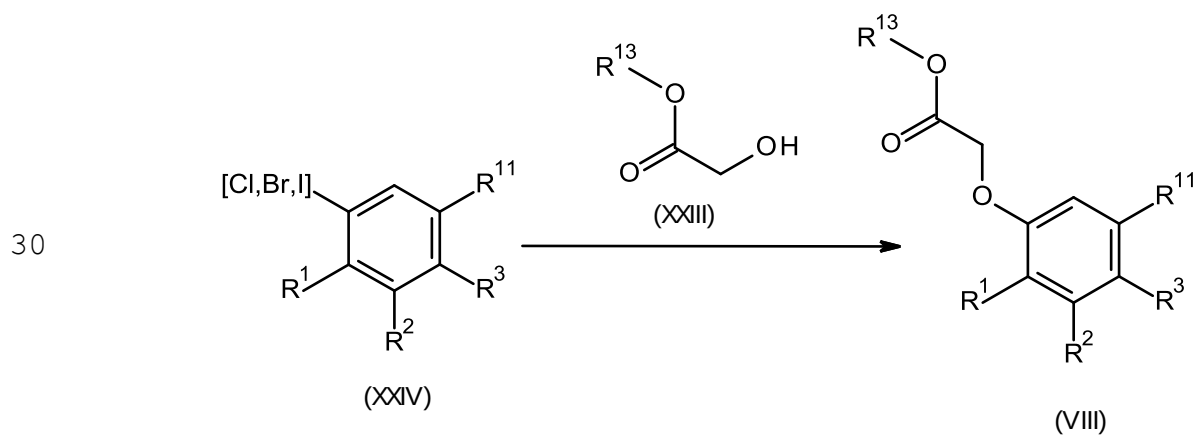
Esquema 15

Alternativamente, los compuestos de fórmula (VIII), donde R^{11} es halógeno y R^{13} es H o alquilo C_1 - C_4 pueden prepararse a partir de los compuestos de fórmula (XXIV), a través de reacciones de sustitución aromáticas nucleófilas con los compuestos de fórmula (XXIII) en presencia de una base (por ejemplo, Cs_2CO_3), un catalizador (fuente de cobre; por ejemplo, CuI o CuO), opcionalmente en presencia de un co-reactivo (por ejemplo, 1,10-fenantrolina) en un sistema de disolvente aceptable (por ejemplo, tolueno) a temperaturas adecuadas (por ejemplo de $0^\circ C$ a $110^\circ C$). Tales transformaciones se describen en los documentos WO 2007010082 o WO 200837626, y se muestran en el Esquema 16. El experto apreciaría que los compuestos de fórmula (XI) o

15

20

25



Esquema 16

Las interconversiones de grupos funcionales que se han descrito en los esquemas previos son conocidas por los expertos en la técnica. Se pueden consultar listas exhaustivas de condiciones de reacción en: *Comprehensive Organic Functional Group Transformations*, editado por A. R. Katritzky, O. Meth-Cohn y C. W. Rees. Pergamon Press (Elsevier Science Ltd.), Tarrytown, NY. 1995; o en: *Comprehensive Organic Transformations: A Guide to Functional Group Preparations*, Editado por Richard C. Larock, Wiley-VCH, Nueva York 1999.

Si la síntesis proporciona mezclas de isómeros, por lo general no se requiere necesariamente una separación, ya que en algunos casos los isómeros individuales se pueden interconvertir durante el tratamiento para su uso o durante su aplicación (p. ej., por la acción de la luz, ácidos o bases). Tales conversiones también pueden tener lugar después del uso, p. ej., en el tratamiento de plantas en la planta tratada o en el hongo perjudicial que se ha de controlar.

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

Los compuestos de fórmula (I) se pueden utilizar en el sector agrícola y campos de uso relacionados, p. ej., como principios activos para controlar plagas en plantas o en materiales inertes para controlar microorganismos responsables de su descomposición u organismos potencialmente dañinos para el ser humano. Los compuestos novedosos se distinguen por su excelente actividad en tasas de aplicación bajas, por ser bien tolerados por las plantas

y por ser ecológicos. Tienen unas propiedades curativas, preventivas y sistémicas muy útiles, y se pueden utilizar para proteger numerosas plantas de cultivo. Los compuestos de fórmula (I) se pueden utilizar para inhibir o destruir
5 las plagas que aparecen en plantas o partes de plantas (frutos, flores, hojas, tallos, tubérculos, raíces) de diferentes cultivos de plantas útiles, a la vez que también protegen las partes de las plantas que crecen más tarde, p. ej., frente a microorganismos fitopatógenos.

10 La presente invención se refiere, además, a un método para el control o la prevención de la infestación de plantas o material de propagación vegetal y/o cultivos alimentarios cosechados susceptibles de ser atacados por microbios mediante el tratamiento de las plantas o el material de
15 propagación vegetal y/o los cultivos alimentarios cosechados en donde se aplica una cantidad eficaz de un compuesto de Fórmula (I) a las plantas, a las partes de las mismas o al emplazamiento de las mismas.

También es posible utilizar compuestos de fórmula (I)
20 como fungicidas. El término "fungicida" como se usa en el presente documento, significa un compuesto que controla, modifica o previene el crecimiento de hongos. La expresión "cantidad eficaz como fungicida", cuando se utiliza, se refiere a la cantidad de un compuesto de este tipo o
25 combinación de compuestos de este tipo, que es capaz de producir un efecto sobre el crecimiento de los hongos. Los efectos de control o modificación incluyen toda desviación del desarrollo natural, tal como su exterminación, ralentización y similares, y la prevención incluye una
30 barrera u otra formación defensiva en una planta o sobre esta para prevenir la infección fúngica.

También puede ser posible usar los compuestos de fórmula (I) como agentes de revestimiento para tratar el

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

Además, los compuestos de fórmula (I) se pueden emplear para controlar hongos en áreas relacionadas, por
20 ejemplo, en la protección de materiales técnicos, que incluyen la madera y productos técnicos relacionados con la madera, en el almacenamiento de alimentos y en la gestión sanitaria.

Además, la invención se podría usar para proteger
25 materiales inertes contra ataques fúngicos, por ejemplo, madera, paneles para tabicar y pintura.

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

Absidia corymbifera, *Alternaria* spp, *Aphanomyces* spp,

Ascochyta spp, Aspergillus spp. que incluye A. flavus, A.
 fumigatus, A. nidulans, A. niger, A. terreus, Aureobasidium
 spp. que incluye A. pullulans, Blastomyces dermatitidis,
 Blumeria graminis, Bremia lactucae, Botryosphaeria spp. que
 5 incluye B. dothidea, B. obtusa, Botrytis spp. que
 incluye B. cinerea, Candida spp. que incluye C. albicans,
 C. glabrata, C. krusei, C. lusitaniae, C. parapsilosis, C.
 tropicalis, Cephaloascus fragrans, Ceratocystis spp,
 Cercospora spp. que incluye C. arachidicola, Cercosporidium
 10 personatum, Cladosporium spp, Claviceps purpurea,
 Coccidioides immitis, Cochliobolus spp, Colletotrichum spp.
 que incluye C. musae, Cryptococcus neoformans, Diaporthe
 spp, Didymella spp, Drechslera spp, Elsinoe spp,
 Epidermophyton spp, Erwinia amylovora, Erysiphe spp. que
 15 incluye E. cichoracearum, Eutypa lata, Fusarium spp. que
 incluye F. culmorum, F. graminearum, F. langsetiae, F.
 moniliiforme, F. oxysporum, F. proliferatum, F.
 subglutinans, F. solani, Gaeumannomyces graminis,
 Gibberella fujikuroi, Gloeodes pomigena, Gloeosporium
 20 musarum, Glomerella cingulata, Guignardia bidwellii,
 Gymnosporangium juniperi-virginianae, Helminthosporium spp,
 Hemileia spp, Histoplasma spp. que incluye H. capsulatum,
 Laetisaria fuciformis, Leptographium lindbergi, Leveillula
 taurica, Lophodermium seeditiosum, Microdochium nivale,
 25 Microsporum spp, Monilinia spp, Mucor spp, Mycosphaerella
 spp. que incluye M. graminicola, M. pomi, Oncobasidium
 theobromaeon, Ophiostoma piceae, Paracoccidioides spp,
 Penicillium spp. que incluye P. digitatum, P. italicum,
 Petriellidium spp, Peronosclerospora spp. que incluye P.
 30 maydis, P. philippinensis y P. sorghi, Peronospora spp,
 Phaeosphaeria nodorum, Phakopsora pachyrhizi, Phellinus
 igniarius, Phialophora spp, Phoma spp, Phomopsis viticola,
 Phytophthora spp. que incluye P. infestans, Plasmopara spp.

que incluye *P. halstedii*, *P. viticola*, *Pleospora* spp., *Podosphaera* spp. que incluye *P. leucotricha*, *Polymyxa graminis*, *Polymyxa betae*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Pseudomonas* spp, *Pseudoperonospora* spp.

5 que incluye *P. cubensis*, *P. humuli*, *Pseudopeziza tracheiphila*, *Puccinia* Spp. que incluye *P. hordei*, *P. recondita*, *P. striiformis*, *P. triticina*, *Pyrenopeziza* spp, *Pyrenophora* spp, *Pyricularia* spp. que incluye *P. oryzae*, *Pythium* spp. que incluye *P. ultimum*, *Ramularia* spp,

10 *Rhizoctonia* spp, *Rhizomucor pusillus*, *Rhizopus arrhizus*, *Rhynchosporium* spp, *Scedosporium* spp. que incluye *S. apiospermum* y *S. prolificans*, *Schizothyrium pomi*, *Sclerotinia* spp, *Sclerotium* spp, *Septoria* spp, que incluye *S. nodorum*, *S. tritici*, *Sphaerotheca macularis*,

15 *Sphaerotheca fusca* (*Sphaerotheca fuliginea*), *Sporothrix* spp, *Stagonospora nodorum*, *Stemphylium* spp,. *Stereum hirsutum*, *Thanatephorus cucumeris*, *Thielaviopsis basicola*, *Tilletia* spp, *Trichoderma* spp. que incluyen *T. harzianum*, *T. pseudokoningii*, *T. viride*, *Trichophyton* spp, *Typhula*

20 spp, *Uncinula necator*, *Urocystis* spp, *Ustilago* spp, *Venturia* spp. que incluyen *V. inaequalis*, *Verticillium* spp y *Xanthomonas* spp.

Los compuestos de fórmula (I) pueden usarse, por ejemplo, en el césped, en plantas ornamentales, tales como

25 flores, arbustos, árboles latifolios o perennifolios, por ejemplo, coníferas, así como también para la inyección de árboles, gestión de plagas y similares.

Dentro del alcance de la presente invención, los cultivos objetivo y/o plantas útiles a proteger típicamente

30 comprenden cultivos perennes y anuales tales como plantas de bayas, por ejemplo, moras, arándanos azules, arándanos rojos, frambuesas y frutillas; cereales, por ejemplo, cebada, maíz, mijo, avena, arroz, centeno, sorgo, triticales

y trigo; plantas que producen fibra, por ejemplo, algodón, lino, cáñamo, yute y sisal; cultivos de campo, por ejemplo, azúcar y remolacha forrajera, café, lúpulos, mostaza, colza oleaginosa (canola), amapola, caña de azúcar, girasol, té y
5 tabaco; árboles frutales, por ejemplo, los que producen manzana, damasco, palta, plátano, cereza, cítricos, nectarina, durazno, pera y ciruela; pastos, por ejemplo, grama común, pasto azul, agróstide, *Eremochloa ophiuroides*, festuca, *Lolium*, pasto de San Agustín y pasto *Zoysia*;
10 hierbas tales como albahaca, borraja, cebolleta, cilantro, lavanda, levístico, menta, orégano, perejil, romero, salvia y tomillo; legumbres, por ejemplo, porotos, lentejas, arvejas y soja; frutos secos, por ejemplo, almendra, castaña de cajú, cacahuete, avellana, maní, pacana,
15 pistacho y nuez; palmeras, por ejemplo, palmera oleaginosa; plantas ornamentales, por ejemplo, flores, arbustos y árboles; otros árboles, por ejemplo, de cacao, coco, oliva y caucho; hortalizas, por ejemplo, espárragos, berenjena, brócoli, repollo, zanahoria, pepino, ajo, lechuga,
20 calabacín, melón, quingombó, cebolla, pimiento, papa, zapallo, ruibarbo, espinaca y tomate; y vides, por ejemplo, uvas.

Se debe entender que la expresión "plantas útiles" también incluye las plantas útiles que han sido modificadas
25 para que sean tolerantes a herbicidas, tales como bromoxinilo, o a clases de herbicidas (tales como, por ejemplo, inhibidores de HPPD, inhibidores de ALS, por ejemplo, primisulfurón, prosulfurón y trifloxisulfurón, inhibidores de EPSPS (5-enolpirovil-shikimato-3-fosfato-
30 sintasa), inhibidores de GS (glutamina-sintetasa) o inhibidores de PPO (protoporfirinógeno-oxidasa)) como resultado de métodos convencionales de cultivo selectivo o de ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que ha

sido modificado para que sea tolerante a imidazolinonas, p. ej., imazamox, mediante métodos convencionales de cultivo selectivo (mutagénesis) es la colza de verano Clearfield® (canola). Los ejemplos de cultivos que se han modificado para que sean tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas mediante métodos de ingeniería genética incluyen las variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato disponibles en el mercado con los nombres comerciales RoundupReady®, Herculex I® y LibertyLink®.

Se debe entender que la expresión "plantas útiles" también incluye plantas útiles que han sido transformadas utilizando técnicas de ADN recombinante, las cuales son capaces de sintetizar una o más toxinas que actúan selectivamente tales como, por ejemplo, las conocidas que proceden de bacterias que producen toxinas, especialmente las del género *Bacillus*.

Son ejemplos de estas plantas: YieldGard® (variedad de maíz que expresa una toxina CryIA(b)); YieldGard Rootworm® (variedad de maíz que expresa una toxina CryIIIB(b1)); YieldGard Plus® (variedad de maíz que expresa una toxina CryIA(b) y una toxina CryIIIB(b1)); Starlink® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry9(c)); Herculex I® (variedad de maíz que expresa una toxina CryIF(a2) y la enzima fosfinotricina N-acetiltransferasa (PAT) para conseguir tolerancia al herbicida glufosinato de amonio); NuCOTN 33B® (variedad de algodón que expresa una toxina CryIA(c)); Bollgard I® (variedad de algodón que expresa una toxina CryIA(c)); Bollgard II® (variedad de algodón que expresa una toxina CryIA(c) y una toxina CryIIA(b)); VIPCOT® (variedad de algodón que expresa una toxina VIP); NewLeaf® (variedad de papa que expresa una toxina CryIIIA); NatureGard®

Agrisure® GT Advantage (rasgo de tolerancia a glifosato GA21), Agrisure® CB Advantage (rasgo del barrenador del maíz (CB) Bt11), Agrisure® RW (rasgo del gusano de la raíz del maíz) y Protecta®.

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

 Las toxinas que pueden ser expresadas por tales plantas transgénicas incluyen, por ejemplo, proteínas insecticidas de *Bacillus cereus* o *Bacillus popilliae*; o
15 proteínas insecticidas de *Bacillus thuringiensis* tales como δ-endotoxinas, p. ej., Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 o Cry9C, o proteínas insecticidas vegetativas (Vip), p. ej., Vip1, Vip2, Vip3 o Vip3A; o
20 proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nematodos, por ejemplo, *Photorhabdus* spp. o *Xenorhabdus* spp., tales como *Photorhabdus luminescens*, *Xenorhabdus nematophilus*; toxinas producidas por animales tales como toxinas de escorpiones, toxinas de arácnidos, toxinas de avispa y otras neurotoxinas específicas de insectos;
25 toxinas producidas por hongos tales como toxinas de estreptomicetos, lectinas vegetales tales como lectinas de arvejas, lectinas de cebada o lectinas de la campanilla de invierno; aglutininas; inhibidores de proteinasas tales como inhibidores de la tripsina, inhibidores de la serín
30 proteasa, inhibidores de la patatina, cistatina, papaína; proteínas que desactivan ribosomas (RIP, por sus siglas en inglés) tales como ricina, RIP del maíz, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas que participan en el

metabolismo de esteroides tales como 3-hidroxiesteroide oxidasa, ecdiesteroido-UDP-glucosil-transferasa, colesterol-oxidasas, inhibidores de la ecdisona, HMG-COA-reductasa, bloqueadores de los canales iónicos tales como los bloqueadores de los canales de sodio o calcio, esterasa de la hormona juvenil, receptores de hormonas diuréticas, estilbeno-sintasa, bibencilo-sintasa, quitinasas y glucanasas.

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

Se describen ejemplos de estas toxinas o plantas transgénicas capaces de sintetizar estas toxinas, por ejemplo, en los documentos EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878 y WO 03/052073.

Los procedimientos para preparar estas plantas transgénicas son generalmente conocidos por los expertos en la técnica y se describen, por ejemplo, en las

publicaciones mencionadas previamente. Ácidos desoxirribonucleicos de tipo CryI y su preparación se describen, por ejemplo, en los documentos WO 95/34656, EP-A-0 367 474, EP-A-0 401 979 y WO 90/13651.

5 La toxina contenida en las plantas transgénicas confiere a las plantas tolerancia a insectos dañinos. Tales insectos se pueden presentar en cualquier grupo taxonómico de insectos, pero se encuentran de manera especialmente común en los escarabajos (*Coleoptera*), insectos de dos alas
10 (*Diptera*) y mariposas (*Lepidoptera*).

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

Otros ejemplos de tales cultivos transgénicos son:

1. **Maíz Bt11** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. *Zea mays* modificado genéticamente que se ha
5 vuelto resistente al ataque del gusano barrenador del maíz europeo (*Ostrinia nubilalis* y *Sesamia nonagrioides*) mediante la expresión transgénica de una toxina Cry1Ab truncada. El maíz Bt11 también expresa transgénicamente la enzima PAT para lograr tolerancia al herbicida glufosinato
10 de amonio.

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

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

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

5. **Algodón IPC 531** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de

registro C/ES/96/02.

6. **Maíz 1507** de Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Bruselas, Bélgica, número de registro C/NL/00/10. Maíz modificado genéticamente para que exprese la proteína Cry1F, con el fin de obtener resistencia a determinados insectos lepidópteros, y para que exprese la proteína PAT, con el fin de lograr tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

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

Los compuestos de fórmula (I) (incluido cualquiera de los compuestos E.1 a E.23 o F.1 a F.10) o las composiciones fungicidas según la presente invención que comprenden un compuesto de fórmula (I) se pueden utilizar para controlar o prevenir enfermedades fitopatógenas, especialmente hongos fitopatógenos (tales como *Phakopsora pachyrhizi*) en plantas de soja.

En particular, las plantas de soja transgénicas que expresan toxinas, por ejemplo, proteínas insecticidas tales como delta-endotoxinas, por ejemplo, Cry1Ac (proteína Cry1Ac de Bt). Por consiguiente, esto puede incluir plantas de soja transgénicas que comprenden el evento MON87701 (véase la Patente de EE. UU. N.º 8,049,071 y las

solicitudes y patentes relacionadas, así como también el documento WO 2014/170327 A1 (por ejemplo, véase la referencia del párrafo [008] referente a la soja Intacta RR2 PROTM) evento MON87751 (Publicación de la Solicitud de Patente de EE. UU. N.º 2014/0373191) o evento DAS-81419 (Patente de EE. UU. N.º 8632978 y solicitudes y patentes relacionadas).

Otras plantas de soja transgénicas pueden comprender el evento SYHT0H2, tolerancia a HPPD (Publicación de Solicitud de Patente de EE. UU. N.º 2014/0201860 y solicitudes y patentes relacionadas), evento MON89788, tolerancia a glifosato (Patente de EE. UU. N.º 7,632,985 y solicitudes y patentes relacionadas), evento MON87708, tolerancia a dicamba (Publicación de Solicitud de Patente de EE. UU. N.º US 2011/0067134 y solicitudes y patentes relacionadas), evento DP-356043-5, tolerancia a glifosato y ALS (Publicación de Solicitud de Patente de EE. UU. N.º US 2010/0184079 y solicitudes y patentes relacionadas), evento A2704-12, tolerancia a glufosinato (Publicación de Solicitud de Patente de EE. UU. N.º US 2008/0320616 y solicitudes y patentes relacionadas), evento DP-305423-1, tolerancia a ALS (Publicación de Solicitud de Patente de EE. UU. N.º US 2008/0312082 y patentes y solicitudes relacionadas), evento A5547-127, tolerancia a glufosinato (Publicación de Solicitud de Patente de EE. UU. N.º US 2008/0196127 y solicitudes y patentes relacionadas), evento DAS-40278-9, tolerancia al ácido 2,4-diclorofenoxiacético y ariloxifenoxipropionato (véase los documentos WO 2011/022469, WO 2011/022470, WO 2011/022471, y solicitudes y patentes relacionadas), evento 127, tolerancia a ALS (documento WO 2010/080829 y solicitudes y patentes relacionadas), evento GTS 40-3-2, tolerancia a glifosato, evento DAS-68416-4, tolerancia al ácido 2,4-

diclorofenoxiacético y glufosinato, evento FG72, tolerancia a glifosato e isoxaflutol, evento BPS-CV127-9, tolerancia a ALS y GU262, tolerancia a glufosinato o evento SYHT04R, tolerancia a HPPD.

5 Los compuestos de fórmula (I) (incluido cualquiera de los compuestos E.1 a E.23 o F.1 a F.10) o las composiciones fungicidas según la presente invención que comprenden un compuesto de fórmula (I) se pueden utilizar para controlar o prevenir enfermedades fitopatógenas, especialmente hongos
10 fitopatógenos (tales como *Phakopsora pachyrhizi*) en plantas de soja. En particular, se conocen en la bibliografía científica ciertas variedades de plantas de soja élite donde se han introgresado apilamientos de gen R, que confieren un grado de inmunidad o resistencia frente a
15 *Phakopsora pachyrhizi* específicos, en el genoma de la planta, remítase, por ejemplo, a: "Fighting Asian Soybean Rust", Langenbach C, et al, Front Plant Science 7(797) 2016).

Una planta élite es cualquier planta procedente de una
20 línea élite, de tal forma que una planta élite es una planta representativa de una variedad élite. Los ejemplos no limitantes de variedades de soja élite que se encuentran disponibles comercialmente para granjeros o para reproductores de soja incluyen: AG00802, A0868, AG0902, AG1923, AG2403, A2824, A3704, A4324, A5404, AG5903, AG6202
25 AG0934; AG1435; AG2031; AG2035; AG2433; AG2733; AG2933; AG3334; AG3832; AG4135; AG4632; AG4934; AG5831; AG6534; y AG7231 (Asgrow Seeds, Des Moines, Iowa, EE. UU.); BPR0144RR, BPR 4077NRR y BPR 4390NRR (Bio Plant Research, Camp Point, Ill., EE. UU.); DKB17-51 y DKB37-51 (DeKalb Genetics, DeKalb, Ill., EE. UU.); DP 4546 RR, y DP 7870 RR (Delta & Pine Land Company, Lubbock, Tex., EE. UU.); JG 03R501, JG 32R606C ADD y JG 55R503C (JGL Inc., Greencastle,
30

Ind., EE. UU.); NKS 13-K2 (NK Division de Syngenta Seeds, Golden Valley, Minnesota, EE. UU.); 90M01, 91M30, 92M33, 93M11, 94M30, 95M30, 97B52, P008T22R2; P16T17R2; P22T69R; P25T51R; P34T07R2; P35T58R; P39T67R; P47T36R; P46T21R; y
 5 P56T03R2 (Pioneer Hi-Bred International, Johnston, Iowa, EE. UU.); SG4771NRR y SG5161NRR/STS (Soygenetics, LLC, Lafayette, Ind., EE. UU.); S00-K5, S11-L2, S28-Y2, S43-B1, S53-A1, S76-L9, S78-G6, S0009-M2; S007-Y4; S04-D3; S14-A6; S20-T6; S21-M7; S26-P3; S28-N6; S30-V6; S35-C3; S36-Y6;
 10 S39-C4; S47-K5; S48-D9; S52-Y2; S58-Z4; S67-R6; S73-S8; y S78-G6 (Syngenta Seeds, Henderson, Ky., EE. UU.); Richer (Northstar Seed Ltd. Alberta, CA); 14RD62 (Stine Seed Co. Ia., EE. UU.); o Armor 4744 (Armor Seed, LLC, Ar., EE. UU.).

15 Por lo tanto, en una realización preferida adicional, los compuestos de Fórmula (I) (incluyendo uno cualquiera de los compuestos E.1 a E.23 o F.1 a F.10), o las composiciones fungicidas de acuerdo con la presente invención que comprenden un compuesto de Fórmula (I), se
 20 usan para controlar *Phakopsora pachyrhizi*, (incluyendo cepas resistentes a fungicidas del mismo, como se indica en el presente documento) en variedades de plantas de soja de elite donde se han introgresado apilamientos de gen R, que confiere un grado de inmunidad o resistencia a *Phakopsora*
 25 *pachyrhizi* específicos, en el genoma de la planta. Puede esperarse que se produzcan numerosos beneficios de dicho uso, por ejemplo, una actividad biológica mejorada, un espectro de actividad ventajoso o más amplio (incluyendo cepas sensibles y resistentes de *Phakopsora pachyrhizi*), un
 30 perfil de seguridad aumentado, tolerancia del cultivo mejorada, interacciones sinérgicas o propiedades potenciadoras, aparición de la acción mejorada o una actividad residual de más duración, una reducción en el

número de aplicaciones y/o una reducción en la tasa de aplicación de los compuestos y composiciones necesaria para un control eficaz del fitopatógeno (*Phakopsora pachyrhizi*), permitiendo de este modo prácticas de gestión de la
 5 resistencia beneficiosas, un impacto ambiental reducido y una exposición reducida del operario.

Se han informado en la bibliografía científica cepas resistentes a fungicida de *Phakopsora pachyrhizi*, observándose cepas resistentes a uno o más fungicidas de al
 10 menos una de las siguientes clases de modo de acción fungicida: inhibidores de la desmetilación de esterol (DMI), inhibidores fuera de la quinona (QoI) e inhibidores de succinato deshidrogenasa (SDHI). Remítase, por ejemplo, a: "Sensitivity of *Phakopsora pachyrhizi* towards quinone-
 15 outside-inhibitors and demethylation-inhibitors, and corresponding resistance mechanisms". Schmitz HK et al, *Pest Manag Sci* (2014) 70: 378-388; "First detection of a SDH variant with reduced SDHI sensitivity in *Phakopsora pachyrhizi*" Simões K et al, *J Plant Dis Prot* (2018) 125:
 20 21-2; "Competitive fitness of *Phakopsora pachyrhizi* isolates with mutations in the CYP51 and CYTB genes". Klosowski AC et al, *Phytopathology* (2016) 106: 1278-1284; "Detection of the F129L mutation in the cytochrome b gene in *Phakopsora pachyrhizi*". Klosowski AC et al, *Pest Manag Sci* (2016) 72: 1211-1215.
 25

Por lo tanto, en una realización preferida, los compuestos de Fórmula (I) (incluido cualquiera de los compuestos E.1 a E.23 o F.1 a F.10), o las composiciones fungicidas según la presente invención que comprenden un
 30 compuesto de fórmula (I), se utilizan para controlar *Phakopsora pachyrhizi* que son resistentes a uno o más fungicidas de una cualquiera de las siguientes clases de MoA fungicida: inhibidores de la desmetilación de esterol

(DMI), inhibidores externos de la quinona (QoI) e inhibidores de succinato-deshidrogenasa (SDHI).

El término "emplazamiento", como se usa en el presente documento, significa campos en los que o sobre los que
5 crecen plantas, o donde se siembran semillas de plantas cultivadas, o donde se colocarán semillas en el suelo. Este término incluye la tierra, las semillas y las plántulas, así como la vegetación establecida.

El término "plantas" se refiere a todas las partes
10 físicas de una planta, que incluyen las semillas, las plántulas, los retoños, las raíces, los tubérculos, los tallos, los troncos, el follaje y los frutos.

Se entiende que la expresión "material de propagación vegetal" denota partes generativas de la planta, tales como
15 las semillas, que se pueden usar para la multiplicación de esta última, y a material vegetativo, tal como esquejes o tubérculos, por ejemplo, patatas. Cabe mencionar, por ejemplo, semillas (en el sentido estricto), raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas y partes de plantas. También se
20 pueden mencionar las plantas germinadas y plantas jóvenes que se van a trasplantar después de que germinen o después de que emerjan de la tierra. Estas plantas jóvenes se pueden proteger antes de trasplantarlas mediante un tratamiento total o parcial por inmersión. Preferentemente,
25 se entenderá que el "material de propagación vegetal" se refiere a las semillas.

Los compuestos de fórmula I se pueden emplear en una forma no modificada o, preferiblemente, junto con adyuvantes empleados tradicionalmente en el campo de la
30 formulación. Con este fin, se pueden formular convenientemente de una forma conocida para obtener concentrados emulsionables, pastas que se pueden aplicar como recubrimiento, soluciones o suspensiones diluibles o

que se pueden pulverizar directamente, emulsiones, polvos humectables, polvos solubles, polvos finos, materiales granulados y también encapsulaciones, por ejemplo, en sustancias poliméricas. Al igual que para el tipo de composiciones, los métodos de aplicación, tales como pulverización, atomización, espolvoreo, dispersión, recubrimiento o vertido, se seleccionan de acuerdo con los objetivos deseados y las circunstancias predominantes. Las composiciones también pueden contener adyuvantes adicionales, tales como estabilizantes, antiespumantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes o adherentes, así como fertilizantes, donadores de micronutrientes u otras formulaciones para la obtención de efectos especiales.

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

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

Los polvos humectables se presentan en forma de

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

Los concentrados emulsionables son composiciones líquidas homogéneas dispersables en agua u otro líquido, y pueden consistir únicamente en el compuesto activo con un agente emulsionante líquido o sólido, o también pueden contener un portador líquido, tal como xileno, naftas aromáticas pesadas, isoforona y otros disolventes orgánicos no volátiles. Cuando se utilizan, estos concentrados se dispersan en agua u otro líquido y se aplican normalmente como un aerosol a la zona que se desee tratar. La cantidad de principio activo puede estar comprendida entre un 0.5 % y un 95 % del concentrado.

Los gránulos dispersables en agua se dispersan en agua u otros vehículos líquidos. Los gránulos contienen el principio activo retenido en una matriz sólida. Las matrices sólidas típicas incluyen tierra de fuller, arcillas caoliníticas, sílices y otros sólidos orgánicos o inorgánicos fácilmente humectables. Los gránulos se forman mediante extrusión, aglomeración o secado por pulverización, y normalmente oscila entre 0.5 milímetros y 1 centímetro y preferiblemente de 1 a 2 milímetros en diámetro. Los gránulos dispersables en agua normalmente contienen desde el 5% hasta el 95% del principio activo, y también pueden contener una pequeña cantidad de agentes humectantes y/o dispersantes.

Las formulaciones granulares incluyen tanto extrudados como partículas relativamente gruesas y se aplican normalmente sin dilución a la zona en la que se requiere el tratamiento. Los portadores típicos para formulaciones granulares incluyen arena, tierra de fuller, arcilla 5 atapulgítica, arcillas bentoníticas, arcilla montmorillonítica, vermiculita, perlita, carbonato de calcio, ladrillo, piedra pómez, pirofilita, caolín, dolomita, escayola, harina de madera, mazorcas de maíz 10 molidas, cáscara de maní molida, azúcares, cloruro de sodio, sulfato de sodio, silicato de sodio, borato de sodio, magnesita, mica, óxido de hierro, óxido de cinc, óxido de titanio, óxido de antimonio, criolita, yeso, tierra de diatomeas, sulfato de calcio y otros materiales 15 orgánicos o inorgánicos que absorben el compuesto activo o que pueden recubrirse con este. Las formulaciones granulares contienen normalmente 5 % a 25 % de principios activos que pueden incluir agentes tensioactivos tales como naftas aromáticas pesadas, queroseno y otras fracciones del 20 petróleo, o aceites vegetales; y/o agentes aglutinantes tales como dextrinas, adhesivo o resinas sintéticas.

Los polvos finos son mezclas no aglomeradas del principio activo con sólidos finamente divididos tales como talco, arcillas, harinas y otros sólidos orgánicos e 25 inorgánicos que actúan como agentes dispersantes y portadores.

Las microcápsulas son normalmente microgotas o gránulos del principio activo envueltos en una carcasa porosa inerte que permite la salida del material envuelto 30 hacia su entorno en tasas controladas. Las microgotas encapsuladas tienen normalmente un diámetro de entre 1 y 50 micrómetros. El líquido envuelto normalmente constituye entre un 50 y un 95 % del peso de la cápsula y puede

incluir disolvente además del compuesto activo. Los gránulos encapsulados son generalmente gránulos porosos con membranas porosas que sellan las aberturas de los poros de los gránulos, de este modo se retienen las especies activas en forma líquida dentro de los poros de los gránulos. Los gránulos tienen normalmente un diámetro de entre 1 milímetro y 1 centímetro y, preferiblemente, de entre 1 y 2 milímetros. Los gránulos se forman por extrusión, aglomeración o perlado, o son de origen natural. Son ejemplos de dichos materiales la vermiculita, arcilla sinterizada, caolín, arcilla atapulgítica, serrín y carbón granular. Los materiales de la membrana o la carcasa incluyen cauchos naturales y sintéticos, materiales celulósicos, copolímeros de estireno-butadieno, poliacrilonitrilos, poliacrilatos, poliésteres, poliamidas, poliureas, poliuretanos y xantatos de almidón.

Otras formulaciones útiles para aplicaciones agroquímicas incluyen simples soluciones del principio activo en un disolvente en el que sea completamente soluble para la concentración deseada, tal como acetona, naftalenos alquilados, xileno y otros disolventes orgánicos. Se pueden utilizar también pulverizadores presurizados, en los que el principio activo se dispersa en forma finamente dividida como resultado de la vaporización de un portador del disolvente dispersante con bajo punto de ebullición.

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

Los portadores líquidos que se pueden utilizar incluyen, por ejemplo, agua, tolueno, xileno, nafta de petróleo, aceite de cultivos, acetona, cetona etil metílica, ciclohexanona, anhídrido acético, acetonitrilo,

acetofenona, acetato de amilo, 2-butanona, clorobenceno, ciclohexano, ciclohexanol, acetatos alquílicos, alcohol diacetónico, 1,2-dicloropropano, dietanolamina, *p*-dietilbenceno, dietilenglicol, abietato de dietilenglicol, 5 éter butílico del dietilenglicol, éter etílico del dietilenglicol, éter metílico del dietilenglicol, *N,N*-dimetilformamida, sulfóxido de dimetilo, 1,4-dioxano, dipropilenglicol, éter metílico del dipropilenglicol, dibenzoato de dipropilenglicol, diproxitol, 10 alquilpirrolidinona, acetato de etilo, 2-etilhexanol, carbonato de etileno, 1,1,1-tricloroetano, 2-heptanona, alfa-pineno, d-limoneno, etilenglicol, éter butílico del etilenglicol, éter metílico del etilenglicol, gamma-butirolactona, glicerol, diacetato de glicerol, monoacetato 15 de glicerol, triacetato de glicerol, hexadecano, hexilenglicol, acetato de isoamilo, acetato de isobornilo, isooctano, isoforona, isopropilbenceno, miristato de isopropilo, ácido láctico, laurilamina, óxido de mesitilo, metoxipropanol, cetona isoamil metílica, cetona isobutil 20 metílica, laurato de metilo, octanoato de metilo, oleato de metilo, cloruro de metileno, *m*-xileno, *n*-hexano, *n*-octilamina, ácido octadecanoico, acetato de octilamina, ácido oleico, oleilamina, *o*-xileno, fenol, polietilenglicol (PEG400), ácido propiónico, propilenglicol, éter 25 monometílico del propilenglicol, *p*-xileno, tolueno, fosfato de trietilo, trietilenglicol, ácido xilenosulfónico, parafina, aceite mineral, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etilo, acetato de amilo, acetato de butilo, metanol, etanol, isopropanol y alcoholes de peso molecular 30 superior tales como el alcohol amílico, alcohol tetrahidrofurfurílico, hexanol, octanol, etc., etilenglicol, propilenglicol, glicerina y *N*-metil-2-pirrolidinona. Por lo general, el portador elegido para la

dilución de los concentrados es el agua.

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

Se emplea convenientemente una amplia gama de agentes
10 tensioactivos tanto en dichas composiciones líquidas como sólidas, especialmente en las diseñadas para ser diluidas con un portador antes de su aplicación. Estos agentes, cuando se utilizan, normalmente comprenden entre un 0.1 % y un 15 % en peso de la formulación. Estos pueden ser de
15 naturaleza aniónica, catiónica, no iónica o polimérica y se pueden emplear como agentes emulsionantes, agentes humectantes, agentes de suspensión o con otros fines. Los agentes tensioactivos típicos incluyen sales de alquilsulfatos, tales como laurilsulfato de dietanolamonio;
20 sales de alquilarilsulfonato, tales como dodecilbencenosulfonato de calcio; productos de adición de óxido de alquilenol-alquilfenol, tales como nonilfenol-C.sub. 18 etoxilato; productos de adición de alcohol y óxido de alquilenol, tales como alcohol tridecílico C-.sub.
25 16 etoxilato; jabones, tales como estearato de sodio; sales de alquilnaftalenosulfonato, tales como dibutilnaftalenosulfonato de sodio; ésteres dialquílicos de sales de sulfosuccinato, tales como sulfosuccinato sódico de di(2-etilhexilo); ésteres de sorbitol, tales como oleato
30 de sorbitol; aminas cuaternarias, tales como cloruro de lauriltrimetilamonio; ésteres polietilenglicólicos de ácidos grasos, tales como estearato de polietilenglicol; copolímeros en bloque de óxido de etileno y óxido de

propileno; y sales de ésteres de fosfato mono- y dialquílicos.

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

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

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

Además, las composiciones de la invención también se pueden aplicar con uno o más inductores de resistencia adquirida sistémicamente (inductores "SAR"). Se conocen

inductores SAR y estos se describen, por ejemplo, en la Patente de Estados Unidos N.º US 6 919 298 e incluyen, por ejemplo, salicilatos y el inductor SAR comercializado acibenzolar-S-metilo.

5 Los compuestos de fórmula (I) se utilizan normalmente en forma de composiciones agroquímicas y se pueden aplicar a la zona de cultivo o a la planta que se va a tratar, simultánea o sucesivamente, con otros compuestos. Estos otros compuestos pueden ser, por ejemplo, fertilizantes o
10 donantes de micronutrientes u otros preparados que influyan sobre el crecimiento vegetal. Estos también pueden ser herbicidas selectivos o herbicidas no selectivos, así como insecticidas, fungicidas, bactericidas, nematocidas, molusquicidas o mezclas de varias de estas preparaciones,
15 si se desea junto con vehículos, tensioactivos o adyuvantes que faciliten la aplicación adicionales empleados habitualmente en la técnica de la formulación.

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

Por lo tanto, la invención proporciona una composición, preferiblemente una composición fungicida, que comprende al menos un compuesto de fórmula (I), un portador aceptable en agricultura y opcionalmente un adyuvante. Un
30 portador agrícola aceptable es, por ejemplo, un portador que sea adecuado para el uso agrícola. Los portadores agrícolas son muy conocidos en la técnica. Preferentemente, dicha composición puede comprender al menos uno o más

compuestos activos como pesticidas, por ejemplo, un principio activo fungicida adicional además del compuesto de fórmula (I).

El compuesto de fórmula (I) puede ser el único
5 principio activo de una composición o puede estar mezclado con uno o más principios activos adicionales tales como un pesticida, fungicida, compuesto sinérgico, herbicida o regulador del crecimiento vegetal, cuando proceda.

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

fungicidas de tipo sulfonanilida, fungicidas de tipo tiadiazol, fungicidas de tipo tiazol, fungicidas de tipo tiazolidina, fungicidas de tipo tiocarbamato, fungicidas de tipo tiofeno, fungicidas de tipo triazina, fungicidas de tipo triazol, fungicidas de tipo triazolopirimidina, fungicidas de tipo urea, fungicidas de tipo valinamida y fungicidas que contienen cinc.

Los ejemplos de principios activos adicionales adecuados también incluyen los siguientes: (9-diclorometilen-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico, metoxi-[1-metil-2-(2,4,6-triclorofenil)-etil]-amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico, (2-diclorometilen-3-etil-1-metil-indan-4-il)-amida del ácido 1-metil-3-difluorometil-1H-pirazol-4-carboxílico (1072957-71-1), (4'-metilsulfanil-bifenil-2-il)-amida del ácido 1-metil-3-difluorometil-1H-pirazol-4-carboxílico, [2-(2,4-dicloro-fenil)-2-metoxi-1-metil-etil]-amida del ácido 1-metil-3-difluorometil-4H-pirazol-4-carboxílico, (5-Cloro-2,4-dimetil-piridin-3-il)-(2,3,4-trimetoxi-6-metil-fenil)-metanona, (5-Bromo-4-cloro-2-metoxi-piridin-3-il)-(2,3,4-trimetoxi-6-metil-fenil)-metanona, 2-{2-[(E)-3-(2,6-Dicloro-fenil)-1-metil-prop-2-en-(E)-ilideneaminoximetil]-fenil}-2-[(Z)-metoxiimino]-N-metil-acetamida, 3-[5-(4-Cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina, (E)-N-metil-2-[2-(2,5-dimetilfenoximetil)fenil]-2-metoxi-iminoacetamida, 4-bromo-2-ciano-N, N-dimetil-6-trifluorometilbenzimidazol-1-sulfonamida, a-[N-(3-cloro-2,6-xilil)-2-metoxiacetamido]-y-buturolactona, 4-cloro-2-ciano-N,N-dimetil-5-p-tolilimidazol-1-sulfonamida, N-alil-4,5,-dimetil-2-trimetilsililtiofen-3-carboxamida, N-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenoxi)propionamida, N-(2-

metoxi-5-piridil)-ciclopropan-carboxamida, (.+-.)-cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 2-(1-terc-butil)-1-(2-clorofenil)-3-(1,2,4-triazol-1-il)-propan-2-ol, 2',6'-dibromo-2-metil-4-trifluorometoxi-4'-trifluorometil-1,3-tiazol-5-carboxanilida, 1-imidazolil-1-(4'-clorofenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ona, (E)-2-[2-[6-(2-cianofenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2-tioamidofenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2-fluorofenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2,6-difluorofenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(pirimidin-2-iloxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(5-metilpirimidin-2-iloxi)-fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(fenil-sulfoniloxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(4-nitrofenoxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-fenoxifenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3,5-dimetil-benzoil)pirrol-1-il]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3-metoxifenoxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2[2-(2-feniletén-1-il)-fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3,5-diclorofenoxi)piridin-3-il]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-(2-(3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenoxi)fenil)-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-(2-[3-(alfa-hidroxibencil)fenoxi]fenil)-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-(2-(4-fenoxipiridin-2-iloxi)fenil)-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3-n-propiloxi-fenoxi)fenil]3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3-isopropiloxifenoxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(2-fluorofenoxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3-etoxifenoxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(4-terc-butil-piridin-2-iloxi)fenil]-3-

metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(3-cianofenoxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[(3-metil-piridin-2-iloximetil)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2-metil-fenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(5-bromopiridin-2-iloximetil)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3-(3-yodopiridin-2-iloxi)fenoxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2-cloropiridin-3-iloxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E), (E)-2-[2-(5,6-dimetilpirazin-2-ilmetiloximinometil)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(6-metilpiridin-2-iloxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E), (E)-2-[2-(3-metoxifenil)metiloximinometil]-fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(6-(2-azidofenoxi)-pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E), (E)-2-[2-[6-fenilpirimidin-4-il)-metiloximinometil]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E), (E)-2-[2-[(4-clorofenil)-metiloximinometil]-fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2-n-propilfenoxi)-1,3,5-triazin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E), (E)-2-[2-[(3-nitrofenil)metiloximinometil]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, 3-cloro-7-(2-aza-2,7,7-trimetil-oct-3-en-5-ina), 2,6-dicloro-N-(4-trifluorometilbenzil)-benzamida, alcohol 3-yodo-2-propinílico, 4-clorofenil-3-yodopropargilformal, etilcarbamato de 3-bromo-2,3-diyodo-2-propenilo, alcohol 2,3,3-triyodoalílico, alcohol 3-bromo-2,3-diyodo-2-propenílico, n-butilcarbamato de 3-yodo-2-propinilo, n-hexilcarbamato de 3-yodo-2-propinilo, ciclohexil-carbamato de 3-yodo-2-propinilo, fenilcarbamato de 3-yodo-2-propinilo; derivados de fenol, tales como tribromofenol, tetraclorofenol, 3-metil-4-clorofenol, 3,5-dimetil-4-clorofenol, fenoxietanol, diclorofeno, o-fenilfenol, m-

fenilfenol, p-fenilfenol, 2-bencil-4-clorofenol, 5-hidroxi-
 2(5H)-furanona; 4,5-dicloroditiazolinona, 4,5-
 benzoditiazolinona, 4,5-trimetilenoditiazolinona, 4,5-
 dicloro-(3H)-1,2-ditiol-3-ona, 3,5-dimetil-tetrahidro-
 5 1,3,5-tiadiazin-2-tiona, cloruro de N-(2-p-
 clorobenzoiletil)-hexaminio, acibenzolar, acipetacos,
 alanicarb, albendazol, aldimorfo, alicina, alcohol alílico,
 ametoctradina, amisulbrom, amobam, ampropilfos, anilazinae,
 asomato, aureofungina, azaconazol, azafendina, azitiram,
 10 azoxistrobina, polisulfuro de bario, benalaxilo, benalaxil-
 M, benodanilo, benomilo, benquinox, bentalurona,
 bentiavalicarb, bentiazol, cloruro de benzalconio,
 benzamacrilo, benzamorf, ácido benzohidroxámico,
 benzovindiflupir, berberina, betoxazina, biloxazol,
 15 binapacrilo, bifenilo, bitertanol, bitionol, bixafeno,
 blasticidina-S, boscalida, bromotalonilo, bromuconazol,
 bupirimato, butiobato, polisulfuro de butilamin-calcio,
 captafol, captan, carbamorfo, carbendazim, clorhidrato de
 carbendazim, carboxina, carpropamida, carvona, CGA41396,
 20 CGA41397, quinometionato, quitosano, clobentiazona,
 cloraniformetano, cloranilo, clorfenazol, cloroneb,
 cloropicrina, clorotalonilo, clorozolinato, clozolinato,
 climbazol, clotrimazol, clozilacona, compuestos que
 contienen cobre tales como acetato de cobre, carbonato de
 25 cobre, hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oleato de
 cobre, oxiclорuro de cobre, oxiquinolato de cobre, silicato
 de cobre, sulfato de cobre, talato de cobre, cromato de
 cobre-zinc y mezcla Bordeaux, cresol, cufraneb, cuprobam,
 óxido cuproso, ciazofamida, ciclafuramida, cicloheximida,
 30 ciflufenamida, cimoxanilo, cипendazol, ciproconazol,
 ciprodinilo, dazomet, debacarb, decafentina, ácido
 dehidroacético, 1, 1'-dióxido de disulfuro de di-2-
 piridilo, diclofluanida, diclomezina, diclofenaco,

diclorano, diclorofeno, diclozolina, diclobutrazol,
 diclocimet, diehofencarb, difenoconazol, difenzoquat,
 diflumetorim, tiofosfato de O, O-di-iso-propil-S-bencilo,
 dimefluazol, dimetaclona, dimetconazol, dimetomorfo,
 5 dimetirimol, diniconazol, diniconazol-M, dinobutona,
 dinocap, dinoctona, dinopentona, dinosulfona, dinoterbona,
 difenilamina, dipiritiona, disulfiram, ditalimfos,
 ditianona, ditioéter, cloruro de dodecildimetilamonio,
 dodemorfo, dodicina, dodina, doguadinae, drazoxolona,
 10 edifenfos, enestroburina, epoxiconazol, etaconazol, etem,
 etaboxam, etirimol, etoxiquina, etilicina, (Z)-N-bencil-
 N([metil (metil-tioetilideneamino-oxicarbonil)amino]tio)- β -
 alaninato de etilo, etridiazol, famoxadona, fenamidona,
 fenaminosulf, fenapanilo, fenarimol, fenbuconazol,
 15 fenfuram, fenhexamida, fenitropan, fenoxanil, fempiclonil,
 fempicoxamida, fenpropidina, fenpropimorfo, fempirazamina,
 acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam,
 ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumetover, flumorfo,
 flupicolida, fluopiram, fluoroimida, fluotrimazol,
 20 fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida,
 flutaniilo, flutolaniilo, flutriafol, fluxapiroxad, folpet,
 formaldehído, fosetilo, fuberidazol, furalaxilo,
 furametpir, furcarbaniilo, furconazol, furfural,
 furmeciclox, furofanato, gliodina, griseofulvina,
 25 guazatina, halacrinato, hexa clorobenceno,
 hexaclorobutadieno, hexaclorofeno, hexaconazol,
 hexiltiofos, hidrargafeno, hidroxiiisoxazol, himexazol,
 imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol,
 iminoctadina, triacetato de iminoctadina, inezina,
 30 yodocarb, ipconazol, ipfentrifluconazol, iprobenfos,
 iprodiona, iprovalicarb, carbamato de isopropanilbutilo,
 isoprotiolano, isopirazam, isotianiilo, isovalediona,
 izopanfos, kasugamicina, kresoxim-metilo, LY186054,

LY211795, LY248908, mancozeb, mandipropamida, maneb,
 mebenilo, mecarbinzida, mefenoxam, mefentrifluconazol,
 mepanipirim, mepronilo, cloruro mercúrico, cloruro
 mercurioso, meptildinocap, metalaxilo, metalaxil-M, metam,
 5 metazoxolona, metconazol, metasulfocarb, metfuroxam,
 bromuro de metilo, yoduro de metilo, isotiocianato de
 metilo, metiram, metiram-zinc, metominostrobina,
 metrafenona, metsulfovax, milneb, moroxidina,
 miclobutanilo, miclozolina, nabam, natamicina, neoasozina,
 10 dimetilditiotiocarbamato de níquel, nitroestireno, nitrotal-
 iso-propil, nuarimol, octilinona, ofurace, compuestos de
 organomercurio, orisastrobina, ostol, oxadixilo,
 oxasulfurona, oxatiapiprolina, oxina-cobre, ácido
 oxolílico, oxpoconazol, oxicarboxina, paclobutrazol,
 15 parinol, pefurazoato, penconazol, pencicurona, penflufeno,
 pentaclorofenol, pentiopirad, fenamacrilo, óxido de
 fenazina, fosdifeno, fosetil-Al, ácidos fosforosos,
 ftalida, picoxistrobina, piperalina, policarbamato,
 polioxina D, polioxrim, poliram, probenazol, procloraz,
 20 procimidona, propamidina, propamocarb, propiconazol,
 propineb, ácido propiónico, proquinazid, protiocarb,
 protioconazol, pidiflumetofeno, piracarbolid,
 piraclostrobina, pirametrostrobina, piraoxistrobina,
 pirazofos, piribencarb, piridinitrilo, pirifenox,
 25 pirimetanilo, piriofenona, piroquilona, piroxiclor,
 piroxifur, pirrolnitrina, compuestos de amonio cuaternario,
 quinacetol, quinazamid, quinconazol, quinometionato,
 quinoxifeno, quintoceno, rabenzazol, santonina, sedaxano,
 siltiofam, simeconazol, sipconazol, pentaclorofenato de
 30 sodio, spiroxamina, estreptomicina, azufre, sultropeno,
 tebuconazol, tebfloquina, tecloftalam, tecnaceno, tecoram,
 tetraconazol, tiabendazol, tiadifluoro, ticiofeno,
 tifluzamida, 2-(tiocianometiltio) benzotiazol, tiofanato-

metilo, tioquinox, tiram, tiadinilo, timibenconazol, tioximid, tolcllofos-metilo, tolilfluanid, triadimefona, triadimenol, triamifos, triarimol, triazbutilo, triazóxido, triciclazol, tridemorfo, trifloxistrobina, triflumazol, 5 triforina, triflumizol, triticonazol, uniconazol, urbacida, validamicina, valifenalato, vapam, vinclozolina, zarilamid, zineb, ziram, y zoxamida.

Los compuestos de la invención también se pueden utilizar combinados con agentes antihelmínticos. Tales 10 agentes antihelmínticos incluyen compuestos seleccionados entre la clase de compuestos lactónicos macrocíclicos tales como derivados de ivermectina, avermectina, abamectina, emamectina, eprinomectina, doramectina, selamectina, moxidectina, nemadectina y milbemicina como los descritos 15 en los documentos EP-357460, EP-444964 y EP-594291. Otros agentes antihelmínticos incluyen derivados de avermectina/milbemicina semisintéticos y biosintéticos tales como los descritos en los documentos US-5015630, WO-9415944 y WO-9522552. Otros agentes antihelmínticos 20 incluyen bencimidazoles tales como albendazol, cambendazol, fenbendazol, flubendazol, mebendazol, oxfendazol, oxibendazol, parbendazol y otros miembros de la clase. Otros agentes antihelmínticos incluyen imidazotiazoles y tetrahidropirimidinas tales como tetramisol, levamisol, 25 pamoato de pirantel, oxantel o morantel. Otros agentes antihelmínticos incluyen fluquicidas, tales como triclabendazol y clorsulón, y cestocidas tales como praziquantel y epsiprantel.

Los compuestos de la invención se pueden utilizar 30 combinados con derivados y análogos de la clase paraherquamida/marcfortina de agentes antihelmínticos así como también oxazolinias antiparasitarias tales como las divulgadas en los documentos US-5478855, US-4639771 y DE-

19520936.

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

10 Los compuestos de la invención se pueden usar en combinación con otros ectoparasitocidas; por ejemplo, fipronilo; piretroides; organofosfatos; reguladores del crecimiento de insectos, tales como lufenurón; agonistas de la ecdisona, tales como tebufenocida y similares;
 15 neonicotinoides, tales como imidacloprid y similares.

Los compuestos de la invención se pueden utilizar combinados con alcaloides terpénicos, por ejemplo, los descritos en las publicaciones de solicitud de patente internacional con números WO 95/19363 o WO 04/72086,
 20 particularmente los compuestos descritos en dichos documentos.

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

Organofosfatos: acefato, azametifós, azinfós-etilo, azinfós-metilo, bromofós, bromofós-etilo, cadusafós, cloretoxifós, clorpirifós, clorfenvinfós, clormefós, demetón, demetón-S-metilo, demetón-S-metil sulfona,
 30 dialifós, diacinona, diclorvós, dicrotofós, dimetoato, disulfotón, etión, etoprofós, etrimfós, famfur, fenamifós, fenitrotión, fensulfotión, fentión, flupirazofós, fonofós, formotión, fostiazato, heptenofós, isazofós, isotioato,

isoxati3n, malati3n, metacrif3s, metamidof3s, metidati3n, metilo-parati3n, mevinf3s, monocrotof3s, naled, ometoato, oxidemet3n-metilo, paraoxona, parati3n, parati3n-metilo, fentoato, fosalona, fosfol3n, fosfocarb, fosmet, fosfamid3n, forato, foxima, pirimif3s, pirimif3s-metilo, profenof3s, propaf3s, proetamf3s, protiof3s, piraclof3s, piridapenti3n, quinalf3s, sulprof3s, temef3s, terbuf3s, tebupirimf3s, tetraclorvinf3s, timet3n, triazof3s, triclorf3n, vamidoti3n.

10 Carbamatos: alanicarb, aldicarb, metilcarbamato de 2-sec-butilfenilo, benfuracarb, carbarilo, carbofurano, carbosulf3n, cloetocarb, etiofencarb, fenoxicarb, fentiocarb, furatiocarb, HCN-801, isoprocarb, indoxacarb, metiocarb, metomilo, (metil)carbamato de 5-metil-m-cumenilbutirilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, 15 tiofanox, triazamato, UC-51717.

Piretroides: acrinatina, aletrina, alfameetrina, (E)-(1R)-*cis*-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenometil)ciclopropanocarboxilato de 5-bencil-3-furilmetilo, bifentrina, beta-ciflutrina, ciflutrina, a-cipermetrina, beta-cipermetrina, bioaletrina, bioaletrina (is3mero *S* ciclopent3lico), biorresmetrina, bifentrina, NCI-85193, cicloprotrina, cihalotrina, cititrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, 25 etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, fluvalinato (is3mero *D*), imiprotrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, permetrina, fenotrina, praletrina, piretrinas (productos naturales), resmetrina, tetrametrina, transflutrina, theta-cipermetrina, silafluofeno, t-fluvalinato, teflutrina, 30 tralometrina, Zeta-cipermetrina.

Reguladores del crecimiento de artr3podos: a) inhibidores de la s3ntesis de la quitina: benzoilureas:

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

Otros antiparasitarios: acequinocilo, amitraz, AKD-
 10 1022, ANS-118, azadiractina, *Bacillus thuringiensis*, bensultap, bifenazato, binapacrilo, bromopropilato, BTG-504, BTG-505, camfeclor, cartap, clorobencilato, clordimeform, clorfenapir, cromafenocida, clotianidina, ciromacina, diaclofeno, diafentiurón, DBI-3204, dinactina,
 15 dihidroximetildihidroxi pirrolidina, dinobutón, dinocap, endosulfán, etiprol, etofenprox, fenazaquina, flumita, MTI-800, fenpiroximato, fluacripirim, flubencimina, flubrocitrinato, flufencina, flufenprox, fluproxifeno, halofenprox, hidrametilnón, IKI-220, kanemita, NC-196,
 20 protector de nim, nidinorterfurano, nitenpiram, SD-35651, WL-108477, piridarilo, propargita, protrifenbuta, pimetrocina, piridabeno, pirimidifeno, NC-1111, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, silafluofeno, silomadina, espinosad, tebufenpirad,
 25 tetradifón, tetranactina, tiacloprid, tiociclam, tiametoxam, tolfenpirad, triazamato, trietoxiespinosina, trinactina, verbutina, vertalec, YI-5301.

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

Bactericidas: clortetraciclina, oxitetraciclina, estreptomycin.

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

Por lo tanto, los compuestos de fórmula (I) pueden utilizarse en combinación con uno o más de otros principios activos para proporcionar diversas mezclas fungicidas. Los ejemplos específicos de dichas mezclas incluyen (donde "I" representa un compuesto de fórmula (I)): un compuesto seleccionado del grupo de sustancias que consisten en aceites de petróleo + I, 1,1-bis(4-clorofenil)-2-etoxietanol + I, 2,4-diclorofenil bencenosulfonato + I, 2-fluoro-N-metil-N-1-naftilacetamida + I, 4-clorofenil fenil sulfona + I, acetoprol + I, aldoxicarb + I, amiditió + I, amidotioato + I, amitón + I, hidrogenooxalato de amitón + I, amitraz + I, aramita + I, óxido arsenioso + I, azobenceno + I, azotoato + I, benomilo + I, benoxafos + I, benzoato de bencilo + I, bixafeno + I, brofenvalerato + I, bromocicleno + I, bromofos + I, bromopropilato + I, buprofezina + I, butocarboxim + I, butoxicarboxim + I, butilpiridabeno + I, polisulfuro de calcio + I, camfeclor + I, carbanolato + I, carbofenotió + I, cimiazol + I, cinometionat + I, clorbensida + I, clordimeform + I, clorhidrato de clordimeform + I, clorfenetol + I, clorfensón + I, clorfensulfuro + I, clorobenzilato + I, cloromebuform + I, clorometiurón + I, cloropropilato + I, clortiofos + I, cinerina I + I, cinerina II + I, cinerinas + I, closantel + I, cumafos + I, crotamitón + I, crotoxifos + I, cufraneb + I, ciantoato + I, DCPM + I, DDT + I, demefiún + I, demefiún-O + I, demefiún-S + I, demetón-metilo + I, demetón-O + I, demetón-O-metilo + I, demetón-S

+ I, demetón-S-metilo + I, demetón-S-metilsulfón + I,
 diclofluanida + I, diclorvos + I, diclifos + I, dienoclor +
 I, dimefox + I, dinex + I, dinex-diclexina + I, dinocap-4 +
 I, dinocap-6 + I, dinoctón + I, dinopentón + I, dinosulfón
 5 + I, dinoterbón + I, dioxatión + I, difenilsulfona + I,
 disulfiram + I, DNOC + I, dofenapina + I, doramectina + I,
 endotión + I, eprinomectina + I, etoato-metilo + I,
 etrimfos + I, fenazaflor + I, óxido de fenbutatina + I,
 fenotiocarb + I, fenpirad + I, fenpiroximato + I,
 10 fenpirazamina + I, fensón + I, fentrifanilo + I,
 flubencimina + I, fluciclofurón + I, fluenetilo + I,
 fluorbensida + I, FMC 1137 + I, formetanato + I,
 clorhidrato de formetanato + I, formparanato + I, gamma-HCH
 + I, gliodina + I, halfenprox + I, ciclopropanocarboxilato
 15 de hexadecilo + I, isocarbofos + I, jasmolina I + I,
 jasmolina II + I, jodfenfos + I, lindano + I, malonobeno +
 I, mecarbam + I, mefosfolano + I, mesulfeno + I, metacrifos
 + I, bromuro de metilo + I, metolcarb + I, mexacarbato + I,
 milbemicina oxima + I, mipafox + I, monocrotofos + I,
 20 morfotión + I, moxidectina + I, naled + I, 4-cloro-2-(2-
 cloro-2-metil-propil)-5-[(6-yodo-3-
 piridil)metoxil]piridazin-3-ona + I, nifluridida + I,
 nikkomicinas + I, nitrilacarb + I, complejo de nitrilacarb
 y cloruro de cinc, 1:1 + I, ometoato + I, oxideprofos + I,
 25 oxidisulfotón + I, pp'-DDT + I, paratión + I, permetrina +
 I, fenkaptón + I, fosalona + I, fosfolán + I, fosfamidón +
 I, policloroterpenos + I, polinactinas + I, proclonol + I,
 promacilo + I, propoxur + I, protidatión + I, protoato + I,
 piretrina I + I, piretrina II + I, piretrinas + I,
 30 piridafentiión + I, pirimitato + I, quinalfos + I,
 quintiofos + I, R-1492 + I, fosglicina + I, rotenona + I,
 escradán + I, sebufos + I, selamectina + I, sofamida + I,
 SSI-121 + I, sulfiram + I, sulfluramid + I, sulfotep + I,

azufre + I, diflovidazina + I, tau-fluvalinato + I, TEPP +
 I, terbam + I, tetradifón + I, tetrasul + I, tiafenox + I,
 tiocarboxima + I, tiofanox + I, tiometón + I, tioquinox +
 I, turingiensina + I, triamifos + I, triarateno + I,
 5 triazofos + I, triazurón + I, trifenofos + I, trinactina +
 I, vamidotión + I, vaniliprol + I, betoxazina + I,
 dioctanoato de cobre + I, sulfato de cobre + I, cibutrina +
 I, diclona + I, diclorofeno + I, endotal + I, fentina + I,
 cal hidratada + I, nabam + I, quinoclamina + I, quinonamid
 10 + I, simazina + I, acetato de trifenilestaño + I, hidróxido
 de trifenilestaño + I, cruformato + I, piperazina + I,
 tiofanato + I, cloralosa + I, fentiión + I, piridin-4-amina
 + I, estriknina + I, 1-hidroxi-1H-piridin-2-tiona + I, 4-
 (quinoxalin-2-ilamino)bencenosulfonamida + I, sulfato de 8-
 15 hidroxiquinolína + I, bronopol + I, hidróxido de cobre + I,
 cresol + I, dipiritiona + I, dodicina + I, fenaminosulf +
 I, formaldehído + I, hidrargafeno + I, kasugamicina + I,
 clorhidrato de kasugamicina hidrato + I,
 bis(dimetilditiocarbamato) de níquel + I, nitrapirina + I,
 20 octilínona + I, ácido oxolínico + I, oxitettraciclina + I,
 hidroxiquinolína sulfato potásico + I, probenazol + I,
 estreptomícina + I, sesquisulfato de estreptomícina + I,
 tecloftalam + I, tiomersal + I, Adoxophyes orana GV + I,
 Agrobacterium radiobacter + I, Amblyseius spp. + I,
 25 Anagrapta falcífera NPV + I, Anagrus atomus + I, Aphelinus
 abdominalis + I, Aphidius colemani + I, Aphidoletes
 aphidimyza + I, Autographa californica NPV + I, Bacillus
 sphaericus Neide + I, Beauveria brongniartii + I,
 Chrysoperla carnea + I, Cryptolaemus montrouzieri + I,
 30 Cydia pomonella GV + I, Dacnusa sibirica + I, Diglyphus
 isaea + I, Encarsia formosa + I, Eretmocerus eremicus + I,
 Heterorhabditis bacteriophora y H. megidis + I, Hippodamia
 convergens + I, Leptomastix dactylopii + I, Macrolophus

caliginosus + I, Mamestra brassicae NPV + I, Metaphycus
 helvolus + I, Metarhizium anisopliae var. acridum + I,
 Metarhizium anisopliae var. anisopliae + I, Neodiprion
 sertifer NPV y N. lecontei NPV + I, Orius spp. + I,
 5 Paecilomyces fumosoroseus + I, Phytoseiulus persimilis + I,
 Steinernema bibionis + I, Steinernema carpocapsae + I,
 Steinernema feltiae + I, Steinernema glaseri + I,
 Steinernema riobrave + I, Steinernema riobravus + I,
 Steinernema scapterisci + I, Steinernema spp. + I,
 10 Trichogramma spp. + I, Typhlodromus occidentalis + I ,
 Verticillium lecanii + I, afolato + I, bisazir + I,
 busulfán + I, dimatíf + I, hemel + I, hempa + I, metepa +
 I, metiotepa + I, afolato de metilo + I, morzid + I,
 penflurón + I, tepa + I, tiohempa + I, tiotepa + I,
 15 tretamina + I, uredepa + I, acetato de (E)-dec-5-en-1-ilo
 con (E)-dec-5-en-1-ol + I, acetato de (E)-tridec-4-en-1-ilo
 + I, (E)-6-metilhept-2-en-4-ol + I, acetato de (E,Z)-
 tetradeca-4,10-dien-1-ilo + I, acetato de (Z)-dodec-7-en-1-
 ilo + I, (Z)-hexadec-11-enal + I, acetato de (Z)-hexadec-
 20 11-en-1-ilo + I, acetato de (Z)-hexadec-13-en-11-in-1-ilo +
 I, (Z)-icos-13-en-10-ona + I, (Z)-tetradec-7-en-1-al + I,
 (Z)-tetradec-9-en-1-ol + I, acetato de (Z)-tetradec-9-en-1-
 ilo + I, acetato de (7E,9Z)-dodeca-7,9-dien-1-ilo + I,
 acetato de (9Z,11E)-tetradeca-9,11-dien-1-ilo + I, acetato
 25 de (9Z,12E)-tetradeca-9,12-dien-1-ilo + I, 14-metiloctadec-
 1-eno + I, 4-metilnonan-5-ol con 4-metilnonan-5-ona + I,
 alfa-multistriatina + I, brevicomin + I, codlelure + I,
 codlemona + I, cuelure + I, disparlure + I, acetato de
 dodec-8-en-1-ilo + I, acetato de dodec-9-en-1-ilo + I,
 30 dodeca-8 + I, acetato de 10-dien-1-ilo + I, dominicalure +
 I, 4-metiloctanoato de etilo + I, eugenol + I, frontalín +
 I, grandlure + I, grandlure I + I, grandlure II + I,
 grandlure III + I, grandlure IV + I, hexalure + I,

ipsdienol + I, ipsenol + I, japonilure + I, lineatin + I,
 litlure + I, looplure + I, medlure + I, ácido megatomoico +
 I, metil eugenol + I, muscalure + I, acetato de octadeca-
 2,13-dien-1-ilo + I, acetato de octadeca-3,13-dien-1-ilo +
 5 I, orfralure + I, orictalure + I, ostramona + I, siglure +
 I, sordidin + I, sulcatol + I, acetato de tetradec-11-en-1-
 ilo + I, trimedlure + I, trimedlure A + I, trimedlure B₁ +
 I, trimedlure B₂ + I, trimedlure C + I, trunc-call + I, 2-
 (octiltio)etanol + I, butopironoxilo + I,
 10 butoxi(polipropilenglicol) + I, adipato de dibutilo + I,
 ftalato de dibutilo + I, succinato de dibutilo + I,
 dietiltoluamida + I, carbamato de dimetilo + I, ftalato de
 dimetilo + I, etil hexanediol + I, hexamida + I, metoquin-
 butilo + I, metilneodecanamida + I, oxamato + I, picaridin
 15 + I, 1-dicloro-1-nitroetano + I, 1,1-dicloro-2,2-bis(4-
 etilfenil)etano + I, 1,2-dicloropropano con 1,3-
 dicloropropeno + I, 1-bromo-2-cloroetano + I, acetato de
 2,2,2-tricloro-1-(3,4-diclorofenil)etilo + I, metil fosfato
 de 2,2-diclorovinilo 2-etilsulfiniletilo + I,
 20 dimetilcarbamato de 2-(1,3-ditiolan-2-il)fenilo + I,
 tiocianato de 2-(2-butoxietoxi)etilo + I, metilcarbamato de
 2-(4,5-dimetil-1,3-dioxolan-2-il)fenilo + I, 2-(4-cloro-
 3,5-xililoxi)etanol + I, dietil fosfato de 2-clorovinilo +
 I, 2-imidazolidona + I, 2-isovalerilindan-1,3-diona + I,
 25 (prop-2-inil)aminofenil metilcarbamato de 2-metilo + I,
 laurato de 2-tiocianatoetilo + I, 3-bromo-1-cloroprop-1-eno
 + I, dimetilcarbamato de 3-metil-1-fenilpirazol-5-ilo + I,
 metilcarbamato de 4-metil(prop-2-inil)amino-3,5-xililo + I,
 dimetilcarbamato de 5,5-dimetil-3-oxociclohex-1-enilo + I,
 30 acetión + I, acrilonitrilo + I, aldrin + I, alosamidin + I,
 alixicarb + I, alfa-ecdisona + I, fosfuro de aluminio + I,
 aminocarb + I, anabasina + I, atidación + I, azametifos +
 I, endotoxinas delta de *Bacillus thuringiensis* + I,

hexafluorosilicato de bario + I, polisulfuro de bario + I, bartrina + I, Bayer 22/190 + I, Bayer 22408 + I, beta-ciflutrina + I, beta-cipermetrina + I, bioetanometrina + I, biopermetrina + I, bis(2-cloroetil)éter + I, borax + I, 5 bromfenvinfos + I, bromo-DDT + I, bufencarb + I, butacarb + I, butatiofos + I, butonato + I, arseniato de calcio + I, cianuro de calcio + I, disulfuro de carbono + I, tetracloruro de carbono + I, clorhidrato de cartap + I, cevadina + I, clorbicicleno + I, clordano + I, clordecona + 10 I, cloroformo + I, cloropicrina + I, clorfoxima + I, clorprazofos + I, cis-resmetrina + I, cismetrina + I, clocitrina + I, acetoarsenito de cobre + I, arseniato de cobre + I, oleato de cobre + I, cumitoato + I, criolito + I, CS 708 + I, cianofenfos + I, cianofos + I, cicletrina + 15 I, citioato + I, d-tetrametrina + I, DAEP + I, dazomet + I, decarbofurano + I, diamidafofos + I, dicaptón + I, diclofentiión + I, dicresilo + I, diciclanilo + I, dieldrin + I, 5-metilpirazol-3-ilo fosfato de dietilo + I, dilor + I, dimeflutrina + I, dimetán + I, dimetrina + I, 20 dimetilvinfos + I, dimetilán + I, dinoprop + I, dinosam + I, dinoseb + I, diofenolán + I, dioxabenzofos + I, diticrofos + I, DSP + I, ecdisterona + I, EI 1642 + I, EMPC + I, EPBP + I, etafofos + I, etiofencarb + I, formiato de etilo + I, dibromuro de etileno + I, dicloruro de etileno + 25 I, óxido de etileno + I, EXD + I, fenclorfos + I, fenetacarb + I, fenitrotiión + I, fenoxacrim + I, fenpiritrina + I, fensulfotiión + I, fentiión-etilo + I, flucofurón + I, fosmetilan + I, fospirato + I, fostietán + I, furatiocarb + I, furetrina + I, guazatina + I, acetatos 30 de guazatina + I, tetratiocarbonato sódico + I, halfenprox + I, HCH + I, HEOD + I, heptaclor + I, heterofos + I, HHDN + I, cianuro de hidrógeno + I, hiquincarb + I, IPSP + I, isazofos + I, isobenzan + I, isodrin + I, isofenfos + I,

isolano + I, isoprotiolano + I, isoxati3n + I, hormona
 juvenil I + I, hormona juvenil II + I, hormona juvenil III
 + I, kelevan + I, kinopreno + I, arseniato de plomo + I,
 leptofos + I, lirimfos + I, litidati3n + I, metilcarbamato
 5 de m-cumenilo + I, fosfuro de magnesio + I, mazidox + I,
 mecarf3n + I, menaz3n + I, cloruro mercurioso + I,
 mesulfenfos + I, metam + I, metam-potasio + I, metam-sodio
 + I, fluoruro de metanosulfonilo + I, metocrotofos + I,
 metopreno + I, metotrina + I, metoxiclor + I, isotiocianato
 10 de metilo + I, metilcloroformo + I, cloruro de metileno +
 I, metoxadiazona + I, mirex + I, naftalofos + I, naftaleno
 + I, NC-170 + I, nicotina + I, sulfato de nicotina + I,
 nitiazina + I, nornicotina + I, O-etil etilfosfonotioato de
 O-5-dicloro-4-yodofenilo + I, O-4-metil-2-oxo-2H-cromen-7-
 15 ilo fosforotioato de O,O-dietilo + I, O-6-metil-2-
 propilpirimidin-4-ilo fosforotioato de O,O-dietilo + I,
 ditiopirofosfato de O,O,O',O'-tetrapropilo + I, 3cido
 oleico + I, para-diclorobenceno + I, parati3n-metilo + I,
 pentaclorofenol + I, laurato de pentaclorofenilo + I, PH
 20 60-38 + I, fenkapt3n + I, fosniclor + I, fosfina + I,
 foxim-metilo + I, pirimetafos + I, is3meros de
 policlorodicciclopentadieno + I, arsenito pot3sico + I,
 tiocianato pot3sico + I, precoceno I + I, precoceno II + I,
 precoceno III + I, primidofos + I, proflutrina + I,
 25 promecarb + I, protiofos + I, pirazofos + I, piresmetrina +
 I, cuasia + I, quinalfos-metilo + I, quinotiona + I,
 rafoxanida + I, resmetrina + I, rotenona + I, cadetrina +
 I, ryania + I, rianodina + I, cebadilla) + I, schradan + I,
 sebufos + I, SI-0009 + I, tiapronilo + I, arsenito de sodio
 30 + I, cianuro de sodio + I, fluoruro de sodio + I,
 hexafluorosilicato de sodio + I, pentaclorofen3xido de
 sodio + I, selenato de sodio + I, tiocianato de sodio + I,
 sulcofurona + I, sulcofurona-sodio + I, fluoruro de

sulfurilo + I, sulprofos + I, aceites de alquitrán + I,
 tazimcarb + I, TDE + I, tebupirimfos + I, temefos + I,
 teraletrina + I, tetracloroetano + I, ticrofos + I,
 tiociclam + I, tiociclam oxalato hidrógeno + I, tionazina +
 5 I, tiosultap + I, tiosultap-sodio + I, tralometrina + I,
 transpermetrina + I, triazamato + I, triclormetafos-3 + I,
 tricloronat + I, trimetacarb + I, tolprocarb + I,
 triclopiricarb + I, tripreno + I, veratridina + I,
 veratrina + I, XMC + I, zetametrina + I, fosfuro de zinc +
 10 I, zolaprofos + I, y meperflutrina + I, tetrametilflutrina
 + I, óxido de bis(tributiltina) + I, bromoacetamida + I,
 fosfato férrico + I, niclosamida-olamina + I, óxido de
 tributiltina + I, pirimorfo + I, trifenmorfo + I, 1,2-
 dibromo-3-cloropropano + I, 1,3-dicloropropeno + I, 3,4-
 15 diclorotetrahidrotiofeno 1,1-dióxido + I, 3-(4-clorofenil)-
 5-metilrodanina + ácido I, 5-metil-6-tioxo-1,3,5-
 tiadiazinan-3-ilacético + I, 6-isopentenilaminopurina + I,
 2-fluoro-N-(3-metoxifenil)-9H-purin-6-amina + I, benclotiaz
 + I, citocininas + I, DCIP + I, furfural + I, isamidofos +
 20 I, cinetina + I, composición de *Myrothecium verrucaria* + I,
 tetraclorotiofeno + I, xilenoles + I, zeatina + I,
 etilxantato de potasio + I, acibenzolar + I, acibenzolar-S-
 metilo + I, extracto de *Reynoutria sachalinensis* + I, alfa-
 clorohidrina + I, antu + I, carbonato de bario + I,
 25 bistiosemi + I, brodifacoum + I, bromadiolona + I,
 brometalina + I, clorofacinona + I, colecalciferol + I,
 cumacoloro + I, cumafurilo + I, cumatetralilo + I, crimidina
 + I, difenacoum + I, difetialona + I, difacinona + I,
 ergocalciferol + I, flocoumafen + I, fluoroacetamida + I,
 30 flupropadina + I, clorhidrato de flupropadina + I,
 norbormida + I, fosacetim + I, fósforo + I, pindona + I,
 pirinurona + I, Sciliosida + I, fluoroacetato de sodio +
 I, sulfato de talio + I, warfarina + piperonilato de I, 2-

(2-butoxietoxi)etilo + I, 5-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-hexilciclohex-2-enona + I, farnesol con nerolidol + I, verbutina + I, MGK 264 + I, butóxido de piperonilo + I, piprotal + I, isómero del propilo + I, S421 + I, sesamex +

5 I, sesasmolina + I, sulfóxido + I, antraquinona + I, naftenato de cobre + I, oxiclورو de cobre + I, diciclopentadieno + I, tiram + I, naftenato de zinc + I, ziram + I, imanin + I, ribavirina + I, óxido mercúrico + I, tiofanato-metilo + I, azaconazol + I, bitertanol + I,

10 bromuconazol + I, ciproconazol + I, difenoconazol + I, diniconazol + I, epoxiconazol + I, fenbuconazol + I, fluquinconazol + I, flusilazol + I, flutriafol + I, furametpir + I, hexaconazol + I, imazalilo + I, imibenconazol + I, ipconazol + I, metconazol + I,

15 miclobutanilo + I, paclobutrazol + I, pefurazoato + I, penconazol + I, protioconazol + I, pirifenox + I, procloraz + I, propiconazol + I, pirisoxazol + I, simeconazol + I, tebuconazol + I, tetraconazol + I, triadimefona + I, triadimenol + I, triflumizol + I, triticonazol + I,

20 ancimidol + I, fenarimol + I, nuarimol + I, bupirimato + I, dimetirimol + I, etirimol + I, dodemorfo + I, fenpropidina + I, fenpropimorfo + I, espiroxamina + I, tridemorfo + I, ciprodinilo + I, mepanipirim + I, pirimetanilo + I, fenciclonilo + I, fludioxonilo + I, benalaxilo + I,

25 furalaxilo + I, metalaxilo -+ I, Rmetalaxilo + I, ofurace + I, oxadixilo + I, carbendazim + I, debacarb + I, fuberidazol + I, tiabendazol + I, clozolinato + I, diclozolina + I, miclozolina + I, procimidona + I, vinclozolina + I, boscalid + I, carboxina + I, fenfuram +

30 I, flutolanilo + I, mepronilo + I, oxicarboxina + I, pentiopirad + I, tifluzamida + I, dodina + I, iminoctadina + I, azoxistrobina + I, dimoxistrobina + I, enestroburina + I, fenaminstrobina + I, flufenoxistrobina + I,

fluoxastrobina + I, kresoxim-metilo + I, metominostrobin + I, trifloxistrobin + I, orisastrobin + I, picoxistrobin + I, piraclostrobin + I, pirametostrobin + I, piraoxistrobin + I, ferbam + I, mancozeb + I, maneb + I,
 5 metiram + I, propineb + I, zineb + I, captafol + I, captan + I, fluoroimida + I, folpet + I, tolilfluanida + I, mezcla bordeaux + I, óxido de cobre + I, mancofite + I, oxina-cobre + I, nitrofenal-isopropilo + I, edifenfos + I, iprobenfos + I, fosdifen + I, tolclofos-metilo + I, anilazina + I,
 10 bentiavalicarb + I, blastidina-S + I, cloroneb + I, clorotalonilo + I, ciflufenamida + I, cimoxanilo + I, ciclobutrifluram + I, diclocimet + I, diclomezina + I, diclorano + I, dietofencarb + I, dimetomorfo + I, flumorfo + I, ditianona + I, etaboxam + I, etridiazol + I,
 15 famoxadona + I, fenamidona + I, fenoxanilo + I, ferimzona + I, fluazinam + I, fluopicolida + I, flusulfamida + I, fluxapirad + I, fenhexamida + I, fosetil-aluminio + I, himexazol + I, iprovalicarb + I, ciazofamid + I, metasulfocarb + I, metrafenona + I, pencicurona + I,
 20 ftalida + I, polioxinas + I, propamocarb + I, piribencarb + I, proquinazid + I, piroquilona + I, piriofenona + I, quinoxifeno + I, quintoceno + I, tiadinilo + I, triazoxida + I, triciclazol + I, triforina + I, validamicina + I, valifenalato + I, zoxamida + I, mandipropamida + I,
 25 flubeneteram + I, isopirazam + I, sedaxano + I, benzovindiflupir + I, pidiflumetofeno + ácido I, 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (3',4',5'-trifluoro-bifenil-2-il)-amida + I, isoflucipram + I, isotianilo + I, dipimetitrona + I, 6-etil-5,7-dioxo-
 30 pirrolo[4,5][1,4]ditiino[1,2-c]isotiazol-3-carbonitrilo + I, 2-(difluorometil)-N-[3-etil-1,1-dimetil-indan-4-il]piridin-3-carboxamida + I, 4-(2,6-difluorofenil)-6-metil-5-fenil-piridazin-3-carbonitrilo + I, (R)-3-

(difluorometil)-1-metil-N-[1,1,3-trimetilindan-4-il]pirazol-4-carboxamida + I, 4-(2-bromo-4-fluoro-fenil)-N-(2-cloro-6-fluoro-fenil)-2,5-dimetil-pirazol-3-amina + I, 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina + I, fluindapir + I, coumetoxistrobina (jiaxiangjunzhi) + I, lvbenmixianan + I, diclobentiazox + I, mandestrobina + I, 3-(4,4-difluoro-3,4-dihidro-3,3-dimetilisoquinolin-1-il)quinolona + I, 2-[2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metil-3-quinolil)oxi]fenil]propan-2-ol + I, oxatiapiprolina + N-[6-[[[(1-metiltetrazol-5-il)-fenil-metileno]amino]oximetil]-2-piridil]carbamato de I, terc-butilo + I, piraziflumida + I, inpirfluxam + I, trolprocarb + I, mefentrifluconazol + I, ipfentrifluconazol+ I, 2-(difluorometil)-N-[(3R)-3-etil-1,1-dimetil-indan-4-il]piridin-3-carboxamida + I, N'-(2,5-dimetil-4-fenoxi-fenil)-N-etil-N-metil-formamidina + I, N'-[4-(4,5-diclorotiazol-2-il)oxi-2,5-dimetil-fenil]-N-etil-N-metil-formamidina + I, [2-[3-[2-[1-[2-[3,5-bis(difluorometil)pirazol-1-il]acetil]-4-piperidil]tiazol-4-il]-4,5-dihidroisoxazol-5-il]-3-cloro-fenil]metanosulfonato + I, N-[6-[(Z)-[(1-metiltetrazol-5-il)-fenil-metilen]amino]oximetil]-2-piridil]carbamato de but-3-inilo + I, N-[[5-[4-(2,4-dimetilfenil)triazol-2-il]-2-metil-fenil]metil]carbamato de metilo + I, 3-cloro-6-metil-5-fenil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina + I, piridaclometilo + I, 3-(difluorometil)-1-metil-N-[1,1,3-trimetilindan-4-il]pirazol-4-carboxamida + I, 1-[2-[[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oximetil]-3-metil-fenil]-4-metil-tetrazol-5-ona + I, 1-metil-4-[3-metil-2-[[2-metil-4-(3,4,5-trimetilpirazol-1-il)fenoxi]metil]fenil]tetrazol-5-ona + I, aminopirifeno + I, ametoctradina + I, amisulbrom + I, penflufeno + I, (Z,2E)-5-[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oxi-2-metoxiimino-N,3-dimetil-pent-3-enamida + I,

florilpicoxamida + I, fempicoxamida + I, tebufloquina + I,
 ipflufenoguina + I, quinfumelina + I, isofetamida + I, N-
 [2-[2,4-dicloro-fenoxi]fenil]-3-(difluorometil)-1-metil-
 pirazol-4-carboxamida + I, N-[2-[2-cloro-4-
 5 (trifluorometil)fenoxi]fenil]-3-(difluorometil)-1-metil-
 pirazol-4-carboxamida + I, benzotrostobina + I,
 fenamacrilo + sal de I, 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol-zinc
 (2:1) + I, fluopiram + I, flutianilo + I, fluopimomida + I,
 pirapropoína + I, picarbutrazox + I, 2-(difluorometil)-N-
 10 (3-etil-1,1-dimetil-indan-4-il)piridin-3-carboxamida + I,
 2- (difluorometil) - N- ((3R) - 1, 1, 3- trimetilindan- 4-
 il) piridin- 3- carboxamida + I, 4-[[6-[2-(2,4-
 difluorofenil)-1,1-difluoro-2-hidroxi-3-(1,2,4-triazol-1-
 il)propil]-3-piridil]oxi]benzonitrilo + I, metiltetraprol +
 15 I, 2- (difluorometil) - N- ((3R) - 1, 1, 3- trimetilindan-
 4- il)piridin-3-carboxamida + I, α -(1, 1- dimetiletil) - α -
 [4'- (trifluorometoxi) [1, 1'- bifenil] - 4- il] -5-
 pirimidin-metanol + I, fluoxapiprolina + I, enoxastrobina +
 I, 4-[[6-[2-(2,4-difluorofenil)-1,1-difluoro-2-hidroxi-3-
 20 (1,2,4-triazol-1-il)propil]-3-piridil]oxi] benzonitrilo +
 I, 4-[[6-[2-(2,4-difluorofenil)-1,1-difluoro-2-hidroxi-3-
 (5-sulfanil-1,2,4-triazol-1-il)propil]-3-piridil]oxi]
 benzonitrilo + I, 4-[[6-[2-(2,4-difluorofenil)-1,1-
 difluoro-2-hidroxi-3-(5-tioxo-4H-1,2,4-triazol-1-
 25 il)propil]-3-piridil]oxi]benzonitrilo + I, trinexapac + I,
 coumoxistrobina + I, zhongshengmicina + I, tiodiazol cobre
 + I, zinc tiazol + I, amectottractina + I, iprodiona + I;
 N'-[5-bromo-2-metil-6-[(1S)-1-metil-2-propoxi-etoxi]-3-
 piridil]-N-etil-N-metil-formamidina + I, N'-[5-bromo-2-
 30 metil-6-[(1R)-1-metil-2-propoxi-etoxi]-3-piridil]-N-etil-N-
 metil-formamidina + I, N'-[5-bromo-2-metil-6-(1-metil-2-
 propoxi-etoxi)-3-piridil]-N-etil-N-metil-formamidina + I,
 N'-[5-cloro-2-metil-6-(1-metil-2-propoxi-etoxi)-3-piridil]-

N-etil-N-metil-formamidina + I, N'-[5-bromo-2-metil-6-(1-metil-2-propoxi-etoxi)-3-piridil]-N-isopropil-N-metil-formamidina + I (estos compuestos pueden prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO2015/155075); N'-[5-bromo-2-metil-6-(2-propoxipropoxi)-3-piridil]-N-etil-N-metil-formamidina + I (este compuesto puede prepararse a partir de los métodos descritos en el documento IPCOM000249876D); N-isopropil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-(2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-fenil-etil)fenil]-N-metil-formamidina+ I, N'-[4-(1-ciclopropil-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil)-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-isopropil-N-metil-formamidina + I (estos compuestos pueden prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO2018/228896); N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2-trifluorometil)oxetan-2-il]fenil]-N-metil-formamidina + I, N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2-trifluorometil)tetrahidrofuran-2-il]fenil]-N-metil-formamidina + I (estos compuestos pueden prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO2019/110427); N-[(1R)-1-bencil-3-cloro-1-metil-but-3-enil]-8-fluoro-quinolin-3-carboxamida + I, N-[(1S)-1-bencil-3-cloro-1-metil-but-3-enil]-8-fluoro-quinolin-3-carboxamida + I, N-[(1R)-1-bencil-3,3,3-trifluoro-1-metil-propil]-8-fluoro-quinolin-3-carboxamida + I, N-[(1S)-1-bencil-3,3,3-trifluoro-1-metil-propil]-8-fluoro-quinolin-3-carboxamida + I, N-[(1R)-1-bencil-1,3-dimetil-butil]-7,8-difluoro-quinolin-3-carboxamida + I, N-[(1S)-1-bencil-1,3-dimetil-butil]-7,8-difluoro-quinolin-3-carboxamida + I, 8-fluoro-N-[(1R)-1-[(3-fluorofenil)metil]-1,3-dimetil-butyl]quinolin-3-carboxamida + I, 8-fluoro-N-[(1S)-1-[(3-fluorofenil)metil]-1,3-dimetil-butyl]quinolin-3-carboxamida + I, N-[(1R)-1-bencil-1,3-dimetil-butyl]-8-fluoro-quinolin-3-carboxamida + I, N-[(1S)-1-bencil-1,3-dimetil-butyl]-8-

fluoro-quinolin-3-carboxamida + I, N-((1R)-1-bencil-3-cloro-1-metil-but-3-enil)-8-fluoro-quinolin-3-carboxamida + I, N-((1S)-1-bencil-3-cloro-1-metil-but-3-enil)-8-fluoro-quinolin-3-carboxamida + I (estos compuestos pueden prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO2017/153380);

1-(6,7-dimetilpirazolo[1,5-a]piridin-3-il)-4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-isoquinolina + I, 1-(6,7-dimetilpirazolo[1,5-a]piridin-3-il)-4,4,6-trifluoro-3,3-dimetil-isoquinolina + I, 4,4-difluoro-3,3-dimetil-1-(6-metilpirazolo[1,5-a]piridin-3-il)isoquinolina + I, 4,4-difluoro-3,3-dimetil-1-(7-metilpirazolo[1,5-a]piridin-3-il)isoquinolina + I, 1-(6-cloro-7-metil-pirazolo[1,5-a]piridin-3-il)-4,4-difluoro-3,3-dimetil-isoquinolina + I (estos compuestos pueden prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO2017/025510); 1-(4,5-dimetilbencimidazol-1-il)-4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-isoquinolina + I, 1-(4,5-dimetilbencimidazol-1-il)-4,4-difluoro-3,3-dimetil-isoquinolina + I, 6-cloro-4,4-difluoro-3,3-dimetil-1-(4-metilbencimidazol-1-il)isoquinolina + I, 4,4-difluoro-1-(5-fluoro-4-metilbencimidazol-1-il)-3,3-dimetil-isoquinolina + I, 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-1-isoquinolil)-7,8-dihidro-6H-ciclopenta[e]bencimidazol + I (estos compuestos pueden prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO2016/156085); N-metoxi-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]ciclopropanocarboxamida + I, N,2-dimetoxi-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]propanamida + I, N-etil-2-metil-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]propanamida + I, 1-metoxi-3-metil-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea + I,

1,3-dimetoxi-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea + I, 3-etil-1-metoxi-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea + I, N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]propanamida + I, 4,4-dimetil-2-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]isoxazolidin-3-ona + I, 5,5-dimetil-2-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]isoxazolidin-3-ona + I, 1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]pirazol-4-carboxilato de etilo + I, N,N-dimetil-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]-1,2,4-triazol-3-amina + I. Los compuestos en este párrafo pueden prepararse a partir de los métodos descritos en los documentos WO 2017/055473, WO 2017/055469, WO 2017/093348 y WO 2017/118689; 2-[6-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)-3-piridil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol + I (este compuesto puede prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO 2017/029179); 2-[6-(4-bromofenoxi)-2-(trifluorometil)-3-piridil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol + I (este compuesto puede prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO 2017/029179); 3-[2-(1-clorociclopropil)-3-(2-fluorofenil)-2-hidroxi-propil]imidazol-4-carbonitrilo + I (este compuesto puede prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO 2016/156290); 3-[2-(1-clorociclopropil)-3-(3-cloro-2-fluoro-fenil)-2-hidroxi-propil]imidazol-4-carbonitrilo + I (este compuesto puede prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO 2016/156290); 2-amino-6-metil-piridin-3-carboxilato de (4-fenoxifenil)metilo + I (este compuesto puede prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO 2014/006945); 2,6-Dimetil-1H,5H-

[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona + I (este compuesto puede prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO 2011/138281); N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencenocarbotioamida + I; N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida + I; (Z,2E)-5-[1-(2,4-diclorofenil)pirazol-3-il]oxi-2-metoxiimino-N,3-dimetil-pent-3-enamida + I (este compuesto puede prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO 2018/153707); N'-(2-cloro-5-metil-4-fenoxi-fenil)-N-etil-N-metil-formamidina + I; N'-[2-cloro-4-(2-fluorofenoxi)-5-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamidina + I (este compuesto puede prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO 2016/202742); 2-(difluorometil)-N-[(3S)-3-etil-1,1-dimetil-indan-4-il]piridin-3-carboxamida + I (este compuesto puede prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO 2014/095675); (5-metil-2-piridil)-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metanona + I, (3-metilisoxazol-5-il)-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metanona + I (estos compuestos pueden prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO 2017/220485); 2-oxo-N-propil-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida + I (este compuesto puede prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO 2018/065414); 1-[[5-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-2-tienil]metil]pirazol-4-carboxilato de etilo + I (este compuesto puede prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO 2018/158365); 2,2-difluoro-N-metil-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]acetamida + I, N-[(E)-metoxiiminometil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida + I, N-[(Z)-metoxiiminometil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-

oxadiazol-3-il]benzamida + I, N-[N-metoxi-C-metil-carbonimidoil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida + I (estos compuestos pueden prepararse a partir de los métodos descritos en el documento WO 2018/202428).

Los otros componentes de las mezclas descritos anteriormente son conocidos. Cuando los principios activos están incluidos en "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual - A World Compendium; Decimotercera Edición; Editor: C. D. S. Tomlin; Consejo Británico de Protección de los Cultivos], se describen en este con el número de entrada facilitado entre paréntesis anteriormente en el presente documento para el compuesto particular; por ejemplo, el compuesto "abamectina" se describe con el número de entrada (1). Cuando se añade "[CCN]" anteriormente en la presente a un compuesto particular, el compuesto en cuestión está incluido en "Compendium of Pesticide Common Names", que puede consultarse en Internet [A. Wood, Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995-2004], por ejemplo, el compuesto "acetoprol" se describe en la dirección de Internet <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>.

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

denominaciones ni ningún "nombre común", se emplea un "nombre alternativo". "N.º de Reg. CAS" se refiere al número de registro del Chemical Abstracts.

La mezcla de principio activo de los compuestos de fórmula (I) y un principio activo como se ha descrito anteriormente, preferiblemente en una relación de mezcla de 100:1 a 1:6000, especialmente de 50:1 a 1:50, más especialmente, en una relación de mezcla de 20:1 a 1:20, aún más especialmente, en una relación de mezcla de 10:1 a 1:10, muy especialmente, de 5:1 y 1:5, haciéndose especial referencia a una relación de 2:1 a 1:2 y prefiriéndose igualmente una relación de 4:1 a 2:1, por encima de todo, en una relación de 1:1 o 5:1 o 5:2 o 5:3 o 5:4 o 4:1 o 4:2 o 4:3 o 3:1 o 3:2 o 2:1 o 1:5 o 2:5 o 3:5 o 4:5 o 1:4 o 2:4 o 3:4 o 1:3 o 2:3 o 1:2 o 1:600 o 1:300 o 1:150 o 1:35 o 2:35 o 4:35 o 1:75 o 2:75 o 4:75 o 1:6000 o 1:3000 o 1:1500 o 1:350 o 2:350 o 4:350 o 1:750 o 2:750 o 4:750. Estas relaciones de mezcla son en peso.

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

Las mezclas que comprenden un compuesto de fórmula (I) y uno o más principios activos como se ha descrito anteriormente se pueden aplicar, por ejemplo, en una única forma "ya mezclada", en una mezcla de pulverización combinada compuesta por formulaciones separadas de los componentes que son principios activos individuales, tal como una "mezcla en tanque", y en un uso combinado de los principios activos individuales cuando se aplican de una

manera secuencial, es decir, uno después del otro con un periodo razonablemente corto, tal como unas pocas horas o días. El orden de aplicación de los compuestos de fórmula (I) y el principio o principios activos como se describen
5 anteriormente no es esencial para la puesta en práctica de la presente invención.

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

Las composiciones según la invención se preparan de forma conocida en sí misma, en ausencia de auxiliares, por ejemplo, moliendo, tamizando y/o comprimiendo un principio
20 activo sólido y en presencia de al menos un auxiliar, por ejemplo, mezclando íntimamente y/o moliendo el principio activo con el auxiliar (auxiliares). Estos procesos para preparar las composiciones y el uso de los compuestos de fórmula (I) para preparar estas composiciones son también
25 un objeto de la invención.

Otro aspecto de la invención se refiere al uso de un compuesto de fórmula (I) o de un compuesto individual preferido como se define en el presente documento, de una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula
30 (I) o al menos un compuesto individual preferido como se ha definido anteriormente, o de una mezcla fungicida o insecticida que comprende al menos un compuesto de fórmula (I) o al menos un compuesto individual preferido como se ha

definido anteriormente, mezclados con otros fungicidas o insecticidas, como se han descrito anteriormente, para controlar o prevenir la infestación de plantas, por ejemplo, plantas útiles tales como plantas de cultivo, material de propagación de las mismas, por ejemplo, semillas, cultivos recolectados, por ejemplo, cultivos alimentarios recolectados, o materiales inertes por parte de insectos o microorganismos fitopatógenos, preferiblemente organismos fúngicos.

Un aspecto adicional de la invención se refiere a un método para controlar o prevenir una infestación de plantas, por ejemplo, de plantas útiles tales como plantas de cultivo, material de propagación de las mismas, por ejemplo, semillas, cultivos recolectados, por ejemplo, cultivos alimentarios recolectados, o de materiales inertes por parte de insectos o microorganismos fitopatógenos o responsables de la descomposición, u organismos potencialmente dañinos para el ser humano, especialmente organismos fúngicos, que comprende la aplicación de un compuesto de fórmula (I) o un compuesto individual preferido como se ha definido anteriormente como principio activo a las plantas, a partes de las plantas o al emplazamiento de las mismas, al material de propagación de las mismas o a cualquier parte de los materiales inertes.

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

Un método preferido para controlar o prevenir una infestación de plantas de cultivo por parte de microorganismos fitopatógenos, especialmente organismos

fúngicos, o insectos que comprende aplicar un compuesto de fórmula (I) o una composición agroquímica que contenga al menos uno de dichos compuestos, es la aplicación foliar. La frecuencia de aplicación y la tasa de aplicación dependerán del riesgo de infestación por parte del patógeno o insecto correspondiente. Sin embargo, los compuestos de fórmula (I) también se pueden infiltrar en la planta a través de las raíces mediante la tierra (acción sistémica) empapando el emplazamiento de la planta con una formulación líquida o aplicando los compuestos en forma sólida a la tierra, por ejemplo, en forma granular (aplicación en la tierra). En cultivos de arrozales, estos granulados se pueden aplicar al campo de arroz inundado. Los compuestos de fórmula I también se pueden aplicar a las semillas (recubrimiento) impregnando las semillas o los tubérculos con una formulación líquida del fungicida o recubriéndolos con una formulación sólida.

Una formulación, p. ej., una composición que contiene el compuesto de fórmula (I) y, si se desea, un adyuvante sólido o líquido, o monómeros para encapsular el compuesto de fórmula (I), se puede preparar de una manera conocida, habitualmente mezclando y/o moliendo íntimamente el compuesto con diluyentes, por ejemplo, disolventes, portadores sólidos y, opcionalmente, compuestos de superficie activa (tensioactivos).

Las tasas de aplicación favorables son normalmente de 5 g a 2 kg de principio activo (p.a.) por hectárea (ha), preferiblemente de 10 g a 1 kg de p.a./ha y lo más preferiblemente de 20 g a 600 g de p.a./ha. Cuando se usa como agente de empapado de las semillas, las dosificaciones convenientes son de 10 mg a 1 g de sustancia activa por kg de semillas.

Cuando las combinaciones de la presente invención se

emplean para el tratamiento de semillas, en general, son suficientes tasas de 0.001 a 50 g de un compuesto de fórmula I por kg de semillas, preferiblemente de 0.01 a 10 g por kg de semillas.

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

10 Las composiciones de la invención se pueden emplear en cualquier forma convencional, por ejemplo, en forma de un paquete doble, un polvo para el tratamiento de semillas en seco (SS), una emulsión para el tratamiento de semillas (ES), un concentrado fluido para el tratamiento de semillas (CF), una solución para el tratamiento de semillas (LS), un
15 polvo dispersable en agua para el tratamiento de semillas (DS), una suspensión de cápsulas para el tratamiento de semillas (SCS), un gel para el tratamiento de semillas (GS), un concentrado emulsionable (CE), un concentrado en
20 suspensión (CS), una suspoemulsión (SE), una suspensión de cápsulas (SC), un gránulo dispersable en agua (GD), un gránulo emulsionable (GE), una emulsión de agua en aceite (EAc), una emulsión de aceite en agua (EAg), una microemulsión (ME), una dispersión oleosa (DO), un fluido
25 miscible en aceite (FAC), un líquido miscible en aceite (LAc), un concentrado soluble (SL), una suspensión de volumen ultrabajo (SU), un líquido de volumen ultrabajo (LU), un concentrado técnico (CT), un concentrado dispersable (CD), un polvo humectable (PH) o cualquier
30 formulación técnicamente factible combinada con adyuvantes aceptables en agricultura.

 Dichas composiciones se pueden producir empleando métodos convencionales, por ejemplo, mezclando los

principios activos con materiales inertes de formulación adecuados (diluyentes, disolventes, rellenos y opcionalmente otros ingredientes de formulación tales como tensioactivos, biocidas, anticongelantes, adherentes, espesantes y compuestos que proporcionen efectos adyuvantes). Cuando se desee obtener una eficacia de duración prolongada, también se pueden emplear formulaciones de liberación lenta convencionales. En particular, las formulaciones que se van a aplicar en formas de pulverización, tales como los concentrados dispersables en agua (por ejemplo, CE, CS, CD, DO, SE, EAg, EAc y similares), gránulos y polvos humectables, pueden contener tensioactivos tales como agentes humectantes y dispersantes y otros compuestos que proporcionen efectos adyuvantes, por ejemplo, el producto de condensación del formaldehído con naftalenosulfonato, un alquilarilsulfonato, un ligninosulfonato, un sulfato de alquilo graso, alquilfenol etoxilado y un alcohol graso etoxilado.

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

En general, las formulaciones incluyen entre un 0.01 y un 90 % en peso de agente activo, entre un 0 y un 20 % de

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

Aunque se prefiere formular los productos comerciales como concentrados, el usuario final normalmente empleará formulaciones diluidas.

EJEMPLOS

Los siguientes Ejemplos sirven para ilustrar la invención. Los compuestos de la invención se pueden diferenciar de los compuestos conocidos debido a su mayor eficacia con tasas de aplicación bajas, que puede ser verificada por un experto en la técnica utilizando los procedimientos experimentales que se exponen en los Ejemplos, empleando tasas de aplicación más bajas, cuando proceda, por ejemplo, 60 ppm, 20 ppm o 2 ppm.

Los compuestos de fórmula (I) pueden presentar varios beneficios que incluyen, *inter alia*, unos niveles ventajosos de actividad biológica para proteger a las plantas contra enfermedades provocadas por hongos o unas propiedades mejores para su uso como principios activos agroquímicos (por ejemplo, una mayor actividad biológica,

un espectro de actividad ventajoso, un perfil de seguridad más amplio (que incluye una mejor tolerancia del cultivo), unas propiedades fisicoquímicas mejores o una mayor biodegradabilidad).

5 En toda esta descripción, las temperaturas se proporcionan en grados Celsius y "p.f." quiere decir punto de fusión. CL/EM significa cromatografía líquida-espectroscopía de masas, y la descripción del aparato y los métodos es la siguiente:

10 Método G:

Los espectros se registraron en un espectrómetro de masas de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo único SQD, SQDII) dotado de una fuente de electronebulización (polaridad: iones positivos y negativos), capilaridad: 3.00
15 kV, Intervalo del cono: 30 V, Extractor: 2.00 V, temperatura de la fuente: 150°C, temperatura de desolvatación: 350°C, flujo de gas del cono: 50 l/h, flujo de gas de desolvatación: 650 L/h, intervalo de masas: de 100 a 900 Da) y un UPLC Acquity de Waters: Bomba binaria,
20 compartimento térmico de columna, detector de haz de diodos y detector ELSD. Columna: Waters UPLC HSS T3, 1.8 µm, 30 x 2.1 mm, temp: 60 °C, intervalo de longitudes de onda del DAD (nm): de 210 a 500, gradiente de disolventes: A = agua + MeOH al 5 % + HCOOH al 0.05 %, B = Acetonitrilo + HCOOH
25 al 0.05 %, gradiente: 10-100 % de B en 1.2 min; flujo (mL/min) 0.85.

Método H:

Los espectros se registraron en un espectrómetro de masas de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo único
30 SQD, SQDII) dotado de una fuente de electronebulización (polaridad: iones positivos y negativos, capilaridad: 3.00 kV, Intervalo del cono: 30V, Extractor: 2.00 V, temperatura de la fuente: 150°C, temperatura de desolvatación: 350°C,

flujo de gas del cono: 50 L/h, flujo de gas de desolvatación: 650 L/h, intervalo de masas: de 100 a 900 Da) y un UPLC Acquity de Waters: Bomba binaria, compartimento térmico de columna, detector de haz de diodos y detector ELSD. Columna: Waters UPLC HSS T3, 1.8 μ m, 30 x 2.1 mm, temp: 60 °C, intervalo de longitudes de onda del DAD (nm): de 210 a 500, gradiente de disolventes: A = agua + MeOH al 5 % + HCOOH al 0.05 %, B = Acetonitrilo + HCOOH al 0.05 %, gradiente: 10-100 % de B en 2.7 min; flujo (mL/min) 0.85.

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

Ejemplos de formulaciones

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

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

<u>Polvos para el tratamiento de</u>		a)	b)	c)
<u>semillas en seco</u>				
	principio activo [compuesto de fórmula (I)]	25 %	50 %	75 %
5	aceite mineral ligero	5 %	5 %	5 %
	ácido silícico muy dispersado	5 %	5 %	-
	Caolín	65 %	40 %	-
	Talco	-		20 %

El principio activo se mezcla a fondo con los adyuvantes y la mezcla se tritura a fondo en un molino adecuado, proporcionando polvos que se pueden usar directamente para el tratamiento de semillas.

<u>Concentrado emulsionable</u>			
	principio activo [compuesto de fórmula (I)]		10 %
15	octilfenol polietilenglicol éter (4-5 mol de óxido de etileno)		3 %
	dodecilbencenosulfonato de calcio		3 %
	éter de poliglicol y aceite de ricino (35 mol de óxido de etileno)		4 %
20	Ciclohexanona		30 %
	mezcla de xilenos		50 %

A partir de este concentrado mediante dilución con agua, pueden obtenerse emulsiones de cualquier dilución requerida, que pueden usarse en la protección de las plantas.

<u>Polvos</u>		a)	b)	c)
	principio activo [compuesto de fórmula (I)]	5 %	6 %	4 %
	Talco	95 %	-	-
30	Caolín	-	94 %	-
	carga mineral	-	-	96 %

Polvos finos listos para su uso se obtienen mezclando el principio activo con el portador y moliendo la mezcla en

un molino adecuado. Dichos polvos también se pueden utilizar para revestimientos en seco de semillas.

Gránulos extruidos

	principio activo [compuesto de fórmula (I)]	15 %
5	lignosulfonato de sodio	2 %
	Carboximetilcelulosa	1 %
	Caolín	82 %

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

Gránulos recubiertos

	principio activo [compuesto de fórmula (I)]	8 %
	polietilenglicol (peso molecular 200)	3 %
	Caolín	89 %

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

Concentrado en suspensión

20	principio activo [compuesto de fórmula (I)]	40 %
	propilenglicol	10 %
	nonilfenol polietilenglicol éter (15 moles de óxido de etileno)	6 %
	Lignosulfonato de sodio	10 %
25	Carboximetilcelulosa	1 %
	aceite de silicona (en forma de una emulsión al 75 % en agua)	1 %
	Agua	32 %

El principio activo finamente triturado se mezcla en conjunto con los adyuvante, proporcionando un concentrado en suspensión a partir del que se pueden obtener suspensiones de cualquier dilución deseada mediante dilución con agua. Utilizando tales diluciones, pueden

tratarse tanto plantas vivas como material de propagación de plantas y pueden protegerse contra la infestación por microorganismos mediante pulverización, vertido o inmersión.

5	<u>Concentrado fluido para el tratamiento de semillas</u>	
	principio activo [compuesto de fórmula (I)]	40 %
	propilenglicol	5 %
	copolímero de butanol PO/EO	2 %
	triestirenofenol con 10-20 moles de EO	2 %
10	1,2-bencisotiazolin-3-ona (en forma de una disolución al 20% en agua)	0.5 %
	sal de calcio de pigmento monoazo	5 %
	Aceite de silicona (en forma de una emulsión al 75 % en agua)	0.2 %
15	Agua	45.3 %

El principio activo finamente triturado se mezcla en conjunto con los adyuvante, proporcionando un concentrado en suspensión a partir del que se pueden obtener suspensiones de cualquier dilución deseada mediante dilución con agua. Utilizando tales diluciones, pueden tratarse tanto plantas vivas como material de propagación de plantas y pueden protegerse contra la infestación por microorganismos mediante pulverización, vertido o inmersión.

25 Suspensión de cápsulas de liberación lenta

Se mezclan 28 partes de una combinación del compuesto de fórmula (I) con 2 partes de un disolvente aromático y 7 partes de una mezcla de diisocianato de tolueno/polimetileno-polifenilisocianato (8:1). Esta mezcla se emulsiona en una mezcla de 1.2 partes de alcohol polivinílico, 0.05 partes de un antiespumante y 51.6 partes de agua hasta que se consigue el tamaño de partícula deseado. Se añade a esta emulsión una mezcla de 2.8 partes

de 1,6-diaminohexano en 5.3 partes de agua. Se agita la mezcla hasta que finaliza la reacción de polimerización.

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

La formulación resultante se aplica a las semillas en forma de una suspensión acuosa en un aparato adecuado para ese fin.

Lista de abreviaturas:

	Ac.	= acuoso
	s a	= singlete ancho
	°C	= grados Celsius
15	DCM	= diclorometano
	dd	= doblete de doblete
	DMF	= dimetilformamida
	DMSO	= dimetilsulfóxido
	DMSO- d_6	= dimetilsulfóxido deuterado
20	d	= doblete
	EtOAc	= acetato de etilo
	equiv.	= equivalente
	h	= hora(s)
	M	= molar
25	M	= mulitplete
	min	= minutos
	MHz	= megahercio
	p.f.	= punto de fusión
	$\text{Pd}_2(\text{dba})_3$	= tris(dibencilidenoacetona)dipaladio (0)
30	$\text{Pd}(\text{dppf})\text{Cl}_2 \cdot \text{DCM}$	= [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno] dicloropaladio(II), complejo de DCM
	$\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}_2$	= dicloruro de bis(trifenilfosfina) paladio (II)

ppm = partes por millón

TA = temperatura ambiente

t_R = tiempo de retención

s = singlete

5 t = triplete

THF = tetrahidrofurano

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

10

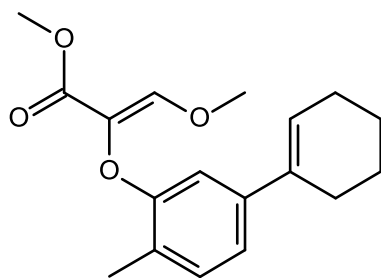
X-Phos Pd G2 = cloro(2-diciclohexilfosfino-2',4',6'-
triisopropil-1,1'-bifenil)[2-(2'-amino-1,1'-
bifenil)]paladio(II)

Ejemplos de preparación:

15

Ejemplo 1: Este ejemplo ilustra la preparación de (Z)-
2-[5-(ciclohexen-1-il)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-
enoato de metilo (Compuesto F.2 de la Tabla F a
continuación)

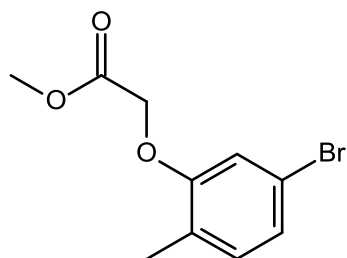
20



25

Etapa 1: Preparación de 2-(5-bromo-2-metil-
fenoxi)acetato de metilo

30

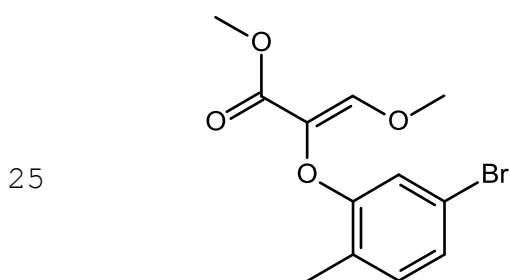


A una solución de 5-bromo-2-metilfenol (53.47 mmol,

10.00 g) y 2-bromoacetato de metilo (1.5 equiv., 80.20 mmol, 12.27 g, 7.44 ml) en tetrahidrofurano (0.5 mol/l, 106.9 ml) a temperatura ambiente se le añadió carbonato potásico (2 equiv., 106.9 mmol, 14.78 g), y la suspensión
 5 de color pardo claro se calentó a 65 °C durante 2 h y después se dejó enfriar a temperatura ambiente durante una noche. La mezcla de reacción se diluyó con EtOAc y se lavó con agua. La fase acuosa se extrajo con EtOAc, y la fase orgánica combinada total se lavó con agua, salmuera, se
 10 secó con Na₂SO₄, se filtró y se concentró al vacío para dar 2-(5-bromo-2-metil-fenoxi)acetato de metilo (47.22 mmol, 15.89 g, 88 % de rendimiento) en forma de un líquido de color pardo. El aceite en bruto estaba ligeramente contaminado con 2-bromoacetato de metilo residual, pero se
 15 llevó directamente a la siguiente etapa sin purificación adicional.

LCMS (Método H), TR = 1.59 min, MS: (M+1) = 259, 261;
¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 2.25 (s, 3 H) 3.84 (s, 3 H) 4.66 (s, 2 H) 6.84 (d, 1 H) 7.05 (m, 2 H)

20 Etapa 2: Preparación de (Z)-2-(5-bromo-2-metil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo



Parte 1: A una solución de 2-(5-bromo-2-metil-fenoxi)acetato (20.8 g, 80.3 mmol) y formiato de metilo
 30 (6.0 equiv., 482 mmol, 29.5 g, 30.5 ml) en tetrahidrofurano (0.5 mol/l, 161 ml) a temperatura ambiente en una atmósfera de argón se le añadió en porciones metóxido sódico (20 equiv., 161 mmol, 9.13 g). La reacción fue ligeramente

exotérmica y se mantuvo por debajo de 30 °C con la ayuda de un baño de agua a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora y se inactivó mediante la adición lenta de una solución acuosa saturada de NaHCO₃. Las dos fases se separaron, y la fase acuosa se extrajo con EtOAc. La fase orgánica combinada total se lavó con una solución acuosa saturada de NaHCO₃, salmuera, se secó con Na₂SO₄, se filtró y se concentró al vacío para dar 2-(5-bromo-2-metil-fenoxi)-3-hidroxi-prop-2-enoato de metilo, que se usó directamente en la siguiente etapa sin purificación adicional.

LCMS (Método G), TR = 0.80 y 0.90 min, MS: (M+1) = 287, 289

Parte 2: A una solución del 2-(5-bromo-2-metil-fenoxi)-3-hidroxi-prop-2-enoato de metilo en bruto y sulfato de dimetilo (1.2 equiv., 93.2 mmol, 11.8 g, 8.8 ml) en DMF (0.5 mol/l, 155 ml) a temperatura ambiente en una atmósfera de argón se le añadió carbonato potásico (1.5 equiv., 117 mmol, 16.3 g), y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 h. La mezcla de reacción se inactivó mediante la adición lenta de agua, y la mezcla se extrajo con EtOAc. La fase orgánica combinada total se lavó con una solución acuosa saturada de NaHCO₃, salmuera, se secó con Na₂SO₄, se filtró y se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida (ciclohexano:EtOAc) para dar (Z)-2-(5-bromo-2-metil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo (59.6 mmol, 18.0 g, 75 % de rendimiento) en forma de un sólido de color blanquecino.

LCMS (Método G), TR = 1.02 min, MS: (M+1) = 301, 303; ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 2.31 (s, 3 H) 3.74 (s, 3 H) 3.91 (s, 3 H) 6.86 (d, 1 H) 7.05 (m, 2 H) 7.35 (s, 1 H)

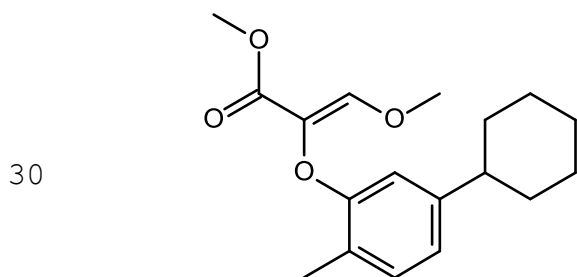
Etapa 3: Preparación de (Z)-2-[5-(ciclohexen-1-il)-2-

metil-fenoxil]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo

A una disolución de (Z)-2-(5-bromo-2-metil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo (203 mg, 0.67 mmol, 1.00 equiv.), en 1,4-dioxano (6 mL) y agua (1 mL) se le añadió
 5 ácido ciclohexen-1-ilborónico (93.4 mg, 0.74 mmol, 1.10 equiv.), fosfato de potasio (295 mg, 1.35 mmol, 2.00 equiv.) y X Phos Pd G2 (53.0 mg, 0.07 mmol, 0.10 equiv.). Se agitó la mezcla de reacción a 100°C durante 15 min y se retiró la fuente de calentamiento. Después de que el
 10 contenido alcanzó TA, se diluyó con EtOAc y una disolución de NaHCO₃ acuosa saturada y luego se extrajo con EtOAc. Se lavó la fracción orgánica combinada total con una disolución de NaHCO₃ acuosa saturada y salmuera, se secó con Na₂SO₄, se filtró, y se concentró a vacío. El residuo
 15 se purificó por cromatografía ultrarrápida (ciclohexano:EtOAc) para dar (Z)-2-[5-(ciclohexen-1-il)-2-metil-fenoxil]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo como un sólido amorfo.

LC-MS (Método G), TR = 1.17 min, MS: (M+H) = 303; ¹H
 20 RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7.36 (s, 1H), 7.11 (d, 1H), 6.96 (dd, 1H), 6.77 (d, 1H), 6.04 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 2.36 (m, 5H), 2.17 - 2.25 (m, 2H), 1.74 - 1.83 (m, 2H), 1.63 - 1.71 (m, 2H).

Ejemplo 2: Este ejemplo ilustra la preparación de (Z)-
 25 2-(5-ciclohexil-2-metil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo (compuesto E.15 de la Tabla E a continuación)



A una disolución de (Z)-2-[5-(ciclohexen-1-il)-2-

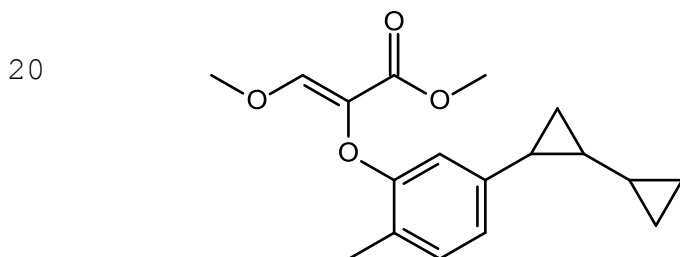
metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo (132 mg, 0.44 mmol, 1.00 equiv.), en hexano (0.87 mL) y EtOAc (2.18 mL) se le añadió paladio sobre carbono (23.2 mg, 0.01 mmol, 0.02 equiv.). Se agitó la mezcla de reacción bajo atmósfera

5 de hidrógeno durante 2 días. La mezcla de reacción se filtró sobre celite y se concentró al vacío. El residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida (ciclohexano:EtOAc) para dar (Z)-2-(5-ciclohexil-2-metil-fenoxi)-3-metoxi-prop-

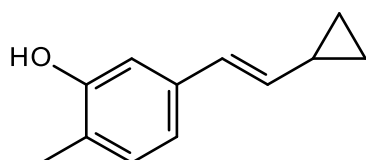
2-enoato de metilo como un sólido blanco (pf: 131 - 132°C).

10 LC-MS (Método G), TR = 1.21 min, MS: (M+H) = 305; ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm ppm 7.35 (s, 1H), 7.10 (d, 1H), 6.79 (dd, 1H), 6.58 (d, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 2.38 - 2.47 (m, 1H), 2.34 (s, 3H), 1.80-1.89 (m, 4H), 1.75 (a, 1H), 1.33 - 1.42 (m, 4H), 1.22 - 1.32 (m, 1H).

15 Ejemplo 3: Este ejemplo ilustra la preparación de (Z)-2-[5-(2-ciclopropilciclopropil)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo (compuesto E.7 de la Tabla E a continuación)



25 Etapla 1: Preparación de 5-[(E)-2-ciclopropilvinil]-2-metil-fenol

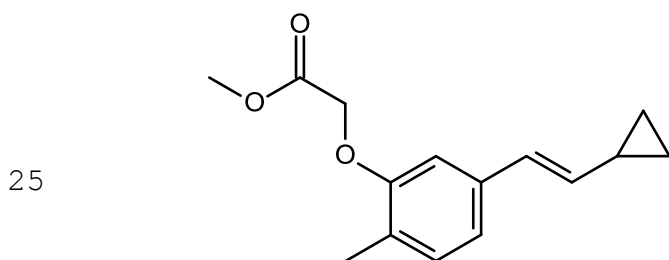


30 A una disolución de 5-bromo-2-metil-fenol (1.00 g, 5.35 mmol, 1.00 equiv.) en DME (26.7 mL), se le añadió una disolución de Na₂CO₃ 3 M acuosa (5.35 mL, 16.0 mmol, 3

equiv.), 2-(2-ciclopropilvinil)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (1.33 mL, 6.42 mmol, 1.20 equiv.). Se desgasificó la mezcla de reacción con argón, luego se introdujo $\text{Pd(dppf)Cl}_2 \cdot \text{CH}_2\text{Cl}_2$ (450 mg, 0.54 mmol, 0.10 equiv.). Se agitó la mezcla negra a 80°C durante 2 horas, se retiró la fuente de calentamiento, y se dejó que el contenido volviera a TA, se diluyó con EtOAc y se lavó con una disolución de NaHCO_3 acuosa saturada y salmuera. Se secó la fracción orgánica combinada total con Na_2SO_4 , se filtró y se concentró a vacío. Se purificó el residuo bruto resultante mediante cromatografía ultrarrápida (ciclohexano:EtOAc) para dar 5-[(E)-2-ciclopropilvinil]-2-metil-fenol como una disolución técnica rojiza (pureza del 50%).

LC-MS (Método G), TR = 1.00 min, MS: (M+H) = 175; ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: 7.04 (d, 1H), 6.82 (dd, 1H), 6.75 (d, 1H), 6.40 (d, 1H), 5.68 (dd, 1H), 4.71 (s, 1H), 2.24 (s, 3H), 1.51 - 1.63 (m, 1H), 0.79 - 0.87 (m, 2H), 0.48 - 0.54 (m, 2H).

Etapa 2: Preparación de 2-[5-[(E)-2-ciclopropilvinil]-2-metil-fenoxi]acetato de metilo

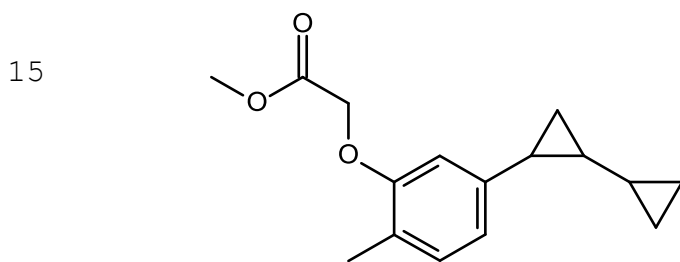


A una disolución técnica de 5-[(E)-2-ciclopropilvinil]-2-metil-fenol (pureza: el 50%, 2.70 g, 7.75 mmol, 1.00 equiv.), en DMF (15.5 mL) se le añadió K_2CO_3 (3.22 g, 23.2 mmol, 3.00 equiv.) y bromoacetato de metilo (2.44 g, 15.5 mmol, 2.00 equiv.). Se agitó la disolución naranja a TA durante 2 h, se diluyó con agua y

se extrajo con EtOAc. Se lavó la fracción orgánica combinada con agua y salmuera, se secó con Na₂SO₄, se filtró, y se concentró a vacío. Se purificó el residuo mediante cromatografía ultrarrápida (ciclohexano:EtOAc) para dar 2-[5-[(E)-2-ciclopropilvinil]-2-metil-fenoxi]acetato de metilo como un aceite marrón.

LC-MS (Método G), TR = 1.12 min, MS: (M+H) = 247; ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 7.08 (d, 1H), 6.88 (dd, 1H), 6.66 (d, 1H), 6.42 (d, 1H), 5.67 (dd, 1H), 4.67 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.59 (s, 1H), 0.80 - 0.86 (m, 2H), 0.49 - 0.54 (m, 2H).

Etapas 3: Preparación de 2-[5-(2-ciclopropilciclopropil)-2-metil-fenoxi]acetato de metilo



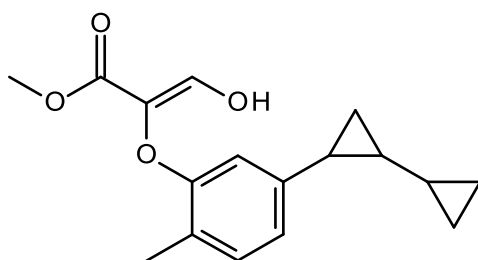
20 A una disolución de dietilzinc (1 M, 5.30 mL, 5.28 mmol, 4.00 equiv.) enfriada hasta 0°C se le añadió una disolución de ácido trifluoroacético (0.41 mL, 5.28 mmol, 4.00 equiv.) en DCM (6.60 mL). Se agitó la mezcla de reacción a 0°C durante 30 min luego se introdujo una disolución de diyodometano (0.43 mL, 5.28 mmol, 4.00 equiv.) en DCM (2.00 mL) y se agitó la reacción durante 30 min a 0°C. A continuación se introdujo una disolución de 2-[5-[(E)-2-ciclopropilvinil]-2-metil-fenoxi]acetato de metilo (500 mg, 1.32 mmol, 1.00 equiv.) en DCM (2.00 mL). Se agitó la disolución de reacción durante 1 h a 0°C luego 3 h a TA. Después, se diluyó el contenido con una disolución de NH₄Cl acuosa saturada y se extrajo con DCM. Se lavó la fracción orgánica combinada total con una

30

disolución de NaHCO_3 acuosa saturada y salmuera, se secó con Na_2SO_4 , se filtró, y se concentró a vacío. Se purificó el residuo bruto resultante mediante cromatografía ultrarrápida (ciclohexano:EtOAc) para dar 2-[5-(2-ciclopropilciclopropil)-2-metil-fenoxi]acetato de metilo como un aceite incoloro.

LC-MS (Método G), TR = 1.17 min, MS: (M+H) = 261; ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: 7.04 - 7.06 (m, 1H), 6.59 (dd, 1H), 6.44 (d, 1H), 4.65 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.60-1.67 (m, 1H), 1.06 - 1.16 (m, 1H), 0.91 - 0.99 (m, 1H), 0.74 (m, 2H), 0.38 - 0.48 (m, 2H), 0.11 - 0.20 (m, 2H).

Etapa 4: Preparación de (Z)-2-[5-(2-ciclopropilciclopropil)-2-metil-fenoxi]-3-hidroxi-prop-2-enoato de metilo

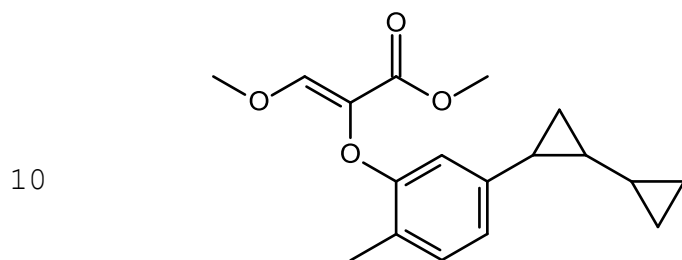


A una disolución de NaH (60% en aceite, 155 mg, 3.87 mmol, 4.00 equiv.) en DMF (2.00 mL) a TA se le añadió una disolución de 2-[5-(2-ciclopropilciclopropil)-2-metil-fenoxi]acetato de metilo (420 mg, 0.97 mmol, 1 equiv.) y formiato de metilo (1.21 mL, 19.4 mmol, 20.0 equiv.) en DMF (2.80 mL). Se agitó la mezcla de reacción marrón a 35°C durante 3 h luego se diluyó lentamente con MeOH y agua, se acidificó hasta pH 2 - 3, y se extrajo con EtOAc. Se lavó la fracción orgánica combinada con agua y salmuera, se secó con Na_2SO_4 , se filtró, y se concentró a vacío. Se purificó el producto bruto resultante mediante cromatografía ultrarrápida (ciclohexano:EtOAc) para dar (Z)-2-[5-(2-

ciclopropilciclopropil)-2-metil-fenoxi]-3-hidroxi-prop-2-enoato de metilo como un aceite marrón.

LC-MS (Método G), TR = 1.04 min, MS: (M+H) = 289.

Etapa 5: Preparación de (Z)-2-[5-(2-ciclopropilciclopropil)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo

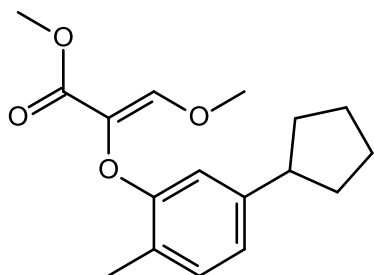


A una disolución de (Z)-2-[5-(2-ciclopropilciclopropil)-2-metil-fenoxi]-3-hidroxi-prop-2-enoato de metilo (400 mg, 0.69 mmol, 1.00 equiv.) en DMF (1.40 mL) a TA se le añadió K₂CO₃ (288 mg, 2.08 mmol, 3.00 equiv.) y sulfato de dimetilo (212 mg, 1.66 mmol, 2.40 equiv.). Se agitó la disolución marrón a TA durante 30 min, se diluyó con EtOAc, agua y una disolución de NaHCO₃ acuosa saturada, y luego se extrajo con EtOAc. Se lavó la fracción orgánica combinada con agua y salmuera, se secó con Na₂SO₄, se filtró, y se concentró a vacío. Se purificó el producto bruto resultante mediante cromatografía ultrarrápida (ciclohexano:EtOAc) y mediante cromatografía de fase inversa (acetonitrilo:agua) para dar (Z)-2-[5-(2-ciclopropilciclopropil)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo como un sólido blanco (pf: 54 - 56°C).

LC-MS (Método G), TR = 1.14 min, MS: (M+H) = 303; ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 7.33 (s, 1H), 7.03 (d, 1H), 6.57 (d, 1H), 6.44 (s, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 1.55-1.62 (m, 1H), 1.05 - 1.13 (m, 1H), 0.90 - 0.99 (m, 1H), 0.67 - 0.73 (m, 2H), 0.34 - 0.47 (m, 2H), 0.07 - 0.20 (m, 2H).

Ejemplo 4: Este ejemplo ilustra la preparación de (Z)-2-(5-ciclopentil-2-metil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo (compuesto E.13 de la Tabla E a continuación)

5



10 Bajo una atmósfera de argón, se añadió una disolución de THF 1 M - cloruro de zinc (2.54 mmol) a una disolución de THF 2 M - bromuro de ciclopentilmagnesio (2.54 mmol) y se agitó la suspensión de color amarillo claro a TA durante 10 minutos durante el cual se observó una pequeña

15 exotermia. Después, se añadieron una disolución de (Z)-2-(5-bromo-2-metil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo (0.153 g, 0.51 mmol) en tetrahidrofurano (2.5 mL) y PdCl₂(dppf) (0.19 g, 0.025 mmol) y se calentó la suspensión amarillo claro a 50°C durante 3 horas. Entonces se dejó que

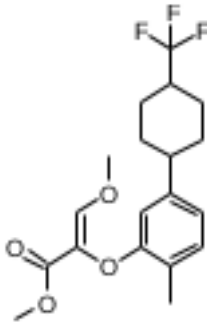
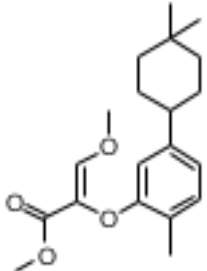
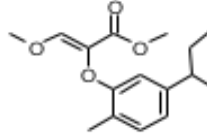
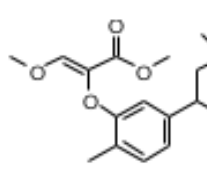
20 la mezcla de reacción alcanzara TA, se extinguió con una disolución de NH₄Cl acuosa saturada, y se extrajo con terc-butyl-metiléter. Entonces se lavó la fracción orgánica combinada total con agua y salmuera, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró a presión reducida. Se

25 purificó el producto bruto resultante mediante cromatografía ultrarrápida (gradiente de ciclohexano:EtOAc) para dar 0.106 mg del compuesto del título como un sólido blanco (pf 80 - 83°C).

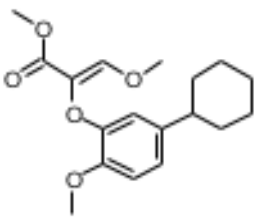
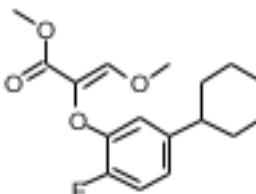
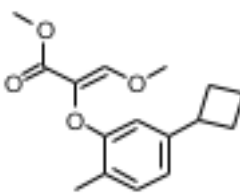
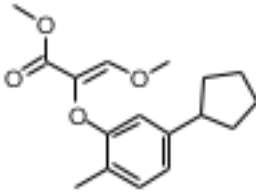
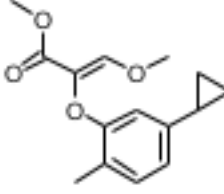
LC-MS (Método G), TR = 1.16 min, MS: (M+H) = 291; ¹H

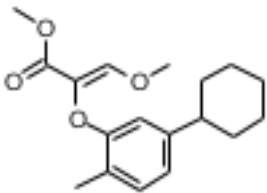
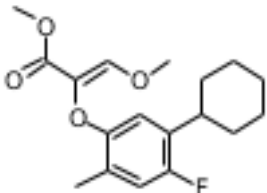
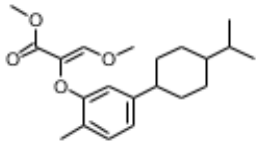
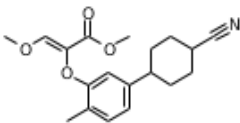
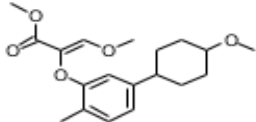
30 RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 7.35 (s, 1H), 7.09 (d, 1H), 6.82 (d, 1H), 6.60 (s, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 2.91 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.10 - 1.97 (m, 2H), 1.85 - 1.75 (m, 2H), 1.74 - 1.65 (m, 2H), 1.60 - 1.45 (m, 2H).

Tabla E: Datos de puntos de fusión (pf) y/o tiempos de retención (t_R) para compuestos de acuerdo con la fórmula (I):

	En- trada	Nombre del compuesto	Estructura	t_R (min)	Carga de masa	Mé- todo	PF (°C)
5							
10	E.1	(Z)-3-metoxi-2-[2-metil-5-[4-(trifluorometil)ciclohexil]fenoxi]prop-2-enoato de metilo					74 - 78
15	E.2	(Z)-2-[5-(4,4-dimetilciclohexil)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.31	333	G	
20							
25	E.3	(Z)-2-(5-cicloheptil-2-metil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.26	319	G	
30	E.4	(Z)-3-metoxi-2-[5-[(2E)-2-dimetilciclohexil]-2-metil-fenoxi]prop-2-		1.21	376	G	

En- trada	Nombre del compuesto	Estructura	t _R (min)	Carga de masa	Mé- todo	PF (°C)
5	enoato de metilo					
10	E.5 (Z)-2-[5-(5,5-dimetil-2-oxo-ciclohexil)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.10	347	G	
15	E.6 (Z)-2-[5-(4,4-difluorociclohexil)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo					117 - 119
20	E.7 (Z)-2-[5-(2-ciclopropilciclopropil)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo					54 - 56
25	E.8 (Z)-2-(2-bromo-5-ciclohexil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.20	369, 371	G	
30	E.9 (Z)-2-(2-cloro-5-ciclohexil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-		1.19	325, 327	G	

En- trada	Nombre del compuesto	Estructura	t _R (min)	Carga de masa	Mé- todo	PF (°C)
5	enoato de metilo					
10	E.10 (Z)-2-(5-ciclohexil-2-metoxi-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.12	321	G	
15	E.11 (Z)-2-(5-ciclohexil-2-fluoro-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.17	309	G	
20	E.12 (Z)-2-(5-ciclobutil-2-metil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.13	277	G	
25	E.13 (Z)-2-(5-ciclopentil-2-metil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo					80 - 83
30	E.14 (Z)-2-(5-ciclopropil-2-metil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.04	263	G	

En- trada	Nombre del compuesto	Estructura	t _R (min)	Carga de masa	Mé- todo	PF (°C)
5	E.15	(Z)-2-(5-ciclohexil-2-metil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo				131- 132
10	E.16	(Z)-2-(5-ciclohexil-4-fluoro-2-metil-fenoxi)-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.66	323	H
15	E.17	(Z)-2-[5-(4-isopropilciclohexil)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.35	347	G
20	E.18	(Z)-2-[5-(4-cianociclohexil)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.05	330	G
25	E.19	(Z)-3-metoxi-2-[5-(4-metoxiciclohexil)-2-metil-fenoxi]prop-2-enoato de metilo		1.12	335	G
30						

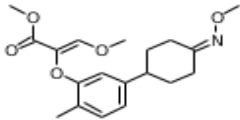
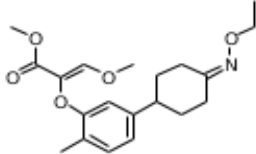
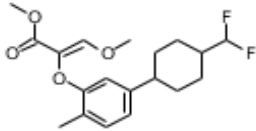
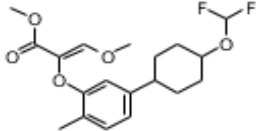
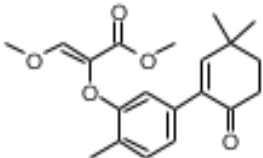
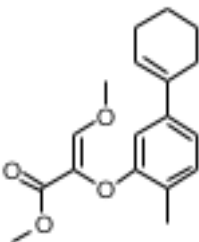
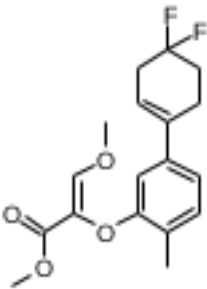
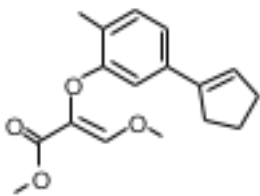
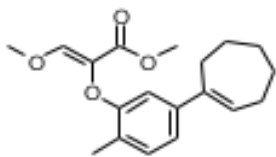
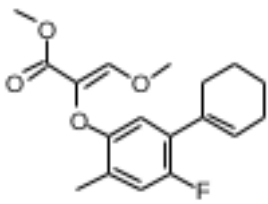
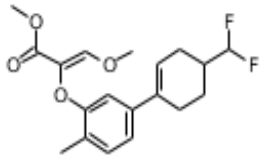
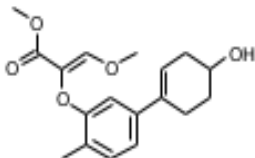
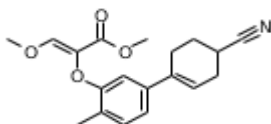
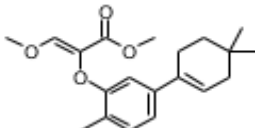
	En- trada	Nombre del compuesto	Estructura	t _R (min)	Carga de masa	Mé- todo	PF (°C)
5	E.20	(Z)-3-metoxi-2-[5-(4-metoxiimino ciclohexil)-2- metil- fenoxi]prop-2- enoato de metilo		1.08	343	G	
10	E.21	(Z)-2-[5-(4- etoxi iminociclohexil) -2-metil- fenoxi]-3- metoxi-prop-2- enoato de metilo		1.13	362	G	
15	E.22	(Z)-2-[5-[4- (difluorometil)ci clohexil]-2- metil-fenoxi]-3- metoxi-prop-2- enoato de metilo		1.15	355	G	
20	E.23	(Z)-2-[5-[4- (difluorometoxi)c i clohexil]-2- metil-fenoxi]-3- metoxi-prop-2- enoato de metilo		1.14	371	G	
25							
30							

Tabla F: Datos de puntos de fusión (pf) y/o tiempos de retención (t_R) para compuestos de acuerdo con la fórmula (I):

En- trada	Nombre del compuesto	Estructura	t_R (min)	Carga de masa	Mé- todo	PF (°C)
F.1	(Z)-2-[5-(3,3-dimetil-6-oxo-ciclohexen-1-il)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo					118 - 120
F.2	(Z)-2-[5-(ciclohexen-1-il)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo					103 - 105
F.3	(Z)-2-[5-(4,4-difluorociclohexen-1-il)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo					95 - 97

En- trada	Nombre del compuesto	Estructura	t _R (min)	Carga de masa	Mé- todo	PF (°C)
5						
F.4	(Z)-2-[5-(ciclopenten-1-il)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.82	289.2	H	
10						
F.5	(Z)-2-[5-(ciclohepten-1-il)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo					75 - 78
15						
F.6	(Z)-2-[5-(ciclohexen-1-il)-4-fluoro-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo					88 - 90
20						
F.7	(Z)-2-[5-[4-(difluorometil)ciclohexen-1-il]-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.15	353	H	
25						
30						

En- trada	Nombre del compuesto	Estructura	t _R (min)	Carga de masa	Mé- todo	PF (°C)
5 F.8 10	(Z)-2-[5-(4-hidroxiciclohexen-1-il)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		0.93	319	H	
15 F.9	(Z)-2-[5-(4-cianociclohexen-1-il)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.06	328	H	
20 F.10 25	(Z)-2-[5-(4,4-dimetilciclohexen-1-il)-2-metil-fenoxi]-3-metoxi-prop-2-enoato de metilo		1.28	331	H	

Ejemplo B: Ejemplos biológicos/métodos de prueba:

Alternaria solani (tizón temprano de tomates)

Se colocan discos foliares de tomate en agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y sobre estos se pulveriza el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Los discos foliares se inoculan con una suspensión de esporas del hongo 2 días después de la aplicación. Los discos foliares inoculados se incuban a 23 °C/21 °C

(día/noche) y un 80% de HR con un régimen de luz que consiste en 12 h de luz/12 h de oscuridad en una cámara climática, y la actividad de un compuesto se determina como el porcentaje de control de la enfermedad en comparación con los discos foliares no tratados cuando se observa un nivel adecuado de daños debidos a la enfermedad en discos foliares de control no tratados (5-7 días después de la aplicación).

Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 80 % de control de *Alternaria solani* con 200 ppm, en comparación con el control no tratado en las mismas condiciones, el cual presentó un desarrollo considerable de la enfermedad:

(Compuestos de la Tabla E): E.13, E.15, E.16, E.20, E.22, E.23

(Compuestos de la Tabla F): F.1, F.7

Glomerella lagenarium syn. *Colletotrichum lagenarium*
(antracnosis de cucurbitáceas):

Se mezclaron conidios de hongos procedentes de un depósito criogénico directamente en un caldo de nutrientes (caldo de dextrosa de papa, PDB). Se colocó una solución de los compuestos de prueba en DMSO en una placa de microvaloración (formato de 96 pocillos) y se añadió el caldo de nutrientes que contenía las esporas fúngicas. Las placas de prueba se incubaron a 24°C y la inhibición del crecimiento se determinó fotométricamente 72 hrs a 620 nm.

Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 80 % de control de *Glomerella lagenarium* a 20 ppm, en comparación con el control no tratado en las mismas condiciones, el cual presenta un desarrollo considerable de la enfermedad:

(Compuestos de la Tabla E): E.3, E.6, E.7, E.9, E.11, E.12, E.13, E.14, E.15, E.16, E.17, E.19, E.20, E.21, E.22,

E.23

(Compuestos de la Tabla F): F.1, F.2, F.3, F.4, F.5, F.6, F.7, F.10

Erysiphe graminis f.sp. tritici (oídio del trigo):

5 Se colocan segmentos foliares de trigo en agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizan las soluciones de ensayo sobre estos. Después de secarlos, se inoculan esporas del hongo a los discos de hoja. Después de una incubación adecuada, se evalúa la
10 actividad de un compuesto 7 ddi (días después de la inoculación) como actividad fungicida preventiva.

Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 80 % de control de *Erysiphe graminis f. sp. tritici* con 200 ppm, en comparación con el control no tratado en las mismas
15 condiciones, el cual presentó un desarrollo considerable de la enfermedad:

(Compuestos de la Tabla E): E.1, E.2, E.3, E.5, E.6, E.7, E.8, E.9, E.10, E.11, E.12, E.13, E.14, E.15, E.16, E.17, E.19, E.20, E.21, E.22, E.23

20 (Compuestos de la Tabla F): F.1, F.2, F.3, F.4, F.5, F.6, F.7, F.8, F.10

Monographella nivalis syn. *Microdochium nivale*, *Fusarium nivale*, (marchitamiento bajo la nieve, gomosis de los cereales):

25 Se mezclaron conidios de hongos procedentes de un depósito criogénico directamente en un caldo de nutrientes (caldo de dextrosa de papa, PDB). Se colocó una solución de los compuestos de prueba en DMSO en una placa de microvaloración (formato de 96 pocillos) y se añadió el
30 caldo de nutrientes que contenía las esporas fúngicas. Las placas de prueba se incubaron a 24°C y la inhibición del crecimiento se determinó fotométricamente 72 hrs a 620 nm.

Los siguientes compuestos proporcionaron al menos el

80 % de control de *Monographella nivalis* a 20 ppm, en comparación con el control no sometido a tratamiento en las mismas condiciones, que mostró un desarrollo considerable de la enfermedad:

5 (Compuestos de la Tabla E): E.1, E.2, E.3, E.6, E.7, E.8, E.9, E.10, E.11, E.12, E.13, E.14, E.15, E.16, E.17, E.19, E.20, E.21, E.22, E.23

 (Compuestos de la Tabla F): F.3, F.4, F.5, F.6, F.7, F.8, F.10

10 *Mycosphaerella arachidis* syn. *Cercospora arachidicola*, (Mancha foliar marrón de maní):

 Se mezclaron conidios de hongos procedentes de un depósito criogénico directamente en un caldo de nutrientes (caldo de dextrosa de papa, PDB). Se colocó una solución de
15 los compuestos de prueba en DMSO en una placa de microvaloración (formato de 96 pocillos) y se añadió el caldo de nutrientes que contenía las esporas fúngicas. Las placas de ensayo se incubaron a 24 °C y la inhibición del crecimiento se determinó fotométricamente después de
20 aproximadamente 5-6 días a 620 nm.

 Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 80 % de control de *Mycosphaerella arachidis* a 20 ppm, en comparación con el control no tratado en las mismas condiciones, el cual presenta un desarrollo considerable de
25 la enfermedad:

 (Compuestos de la Tabla E): E.1, E.2, E.3, E.6, E.7, E.8, E.9, E.10, E.11, E.12, E.13, E.14, E.15, E.16, E.17, E.19, E.20, E.21, E.22, E.23

 (Compuestos de la Tabla F): F.3, F.4, F.5, F.6, F.7,
30 F.8, F.10

Phakopsora pachyrhizi (Roya de soja):

 Se colocan discos foliares de soja en agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se

pulverizan las soluciones de prueba sobre estos. Después de secarlos, se inoculan los discos foliares con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación adecuada, se evalúa la actividad de un compuesto aprox. 12 ddi (días después de la inoculación) como actividad fungicida preventiva.

Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 70 % de control de *Phakopsora pachyrhizi* con 60 ppm, en comparación con el control no tratado en las mismas condiciones, el cual presentó un desarrollo considerable de la enfermedad:

(Compuestos de la Tabla E): E.12, E.13, E.14, E.15, E.20, E.21

(Compuestos de la Tabla F): F.2, F.3, F.4, F.6

15 *Phytophthora infestans* (tizón tardío de patata/tomate):

Se colocan discos foliares de tomate en agar en agua en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizan las soluciones de prueba sobre estos. Después de secarlos, se inoculan los discos foliares con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación adecuada, se evalúa la actividad de un compuesto 4 ddi (días después de la inoculación) como actividad fungicida preventiva.

25 Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 80 % de control de *Phytophthora infestans* con 200 ppm, en comparación con el control no tratado en las mismas condiciones, el cual presentó un desarrollo considerable de la enfermedad:

30 (Compuestos de la Tabla E): E.2, E.5, E.7, E.9, E.13, E.15, E.16, E.22

Plasmopara viticola (moho suave de la vid):

Se colocan discos foliares de vid en agar en placas de

múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizan las soluciones de prueba sobre estos. Después de secarlos, se inoculan los discos foliares con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación adecuada, se
 5 evalúa la actividad de un compuesto 7 ddi (días después de la inoculación) como actividad fungicida preventiva.

Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 80 % de control de *Plasmopara viticola* con 200 ppm, en comparación con el control no tratado en las mismas
 10 condiciones, el cual presentó un desarrollo considerable de la enfermedad:

(Compuestos de la Tabla E): E.2, E.3, E.5, E.6, E.7, E.8, E.9, E.10, E.11, E.12, E.13, E.14, E.15, E.16, E.19, E.20, E.21, E.22, E.23

15 (Compuestos de la Tabla F): F.1, F.2, F.3, F.4, F.5, F.6, F.7, F.10

Puccinia recondita (roya parda), curativa:

Se colocaron segmentos de hojas de trigo en agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos). Se
 20 inoculan los segmentos de hojas con una suspensión de esporas del hongo y se pulverizan con disoluciones de prueba 1 día después de la inoculación. Después de la incubación apropiada, se evalúa la actividad de un compuesto 8 dpi (días después de la inoculación) como
 25 actividad fungicida curativa.

Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 80 % de control de *Puccinia recondita f. sp. tritici* con 200 ppm, en comparación con el control no tratado en las mismas
 30 condiciones, el cual presentó un desarrollo considerable de la enfermedad:

(Compuestos de la Tabla E): E.7, E.12, E.13, E.15, E.16, E.19, E.20, E.21

(Compuestos de la Tabla F): F.2, F.6, F.7,

Puccinia recondita (roya parda), preventiva:

Se colocan segmentos foliares de trigo en agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizan las soluciones de ensayo sobre estos. Después de
 5 secarlos, se inoculan los segmentos foliares con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación adecuada, se evalúa la actividad de un compuesto 8 ddi (días después de la inoculación) como actividad fungicida preventiva.

10 Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 80 % de control de *Puccinia recondita f. sp. tritici* con 200 ppm, en comparación con el control no tratado en las mismas condiciones, el cual presentó un desarrollo considerable de la enfermedad:

15 (Compuestos de la Tabla E): E.1, E.2, E.3, E.5, E.6, E.7, E.8, E.9, E.10, E.12, E.13, E.14, E.15, E.16, E.19, E.20, E.21, E.22, E.23

(Compuestos de la Tabla F): F.1, F.2, F.3, F.4, F.6, F.7, F.8, F.10

20 *Pyricularia oryzae* (Añublo del arroz):

Se colocan segmentos foliares de arroz en agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizan las soluciones de ensayo sobre estos. Después de
 25 secarlos, se inoculan los discos foliares con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación adecuada, se evalúa la actividad de un compuesto 5 ddi (días después de la inoculación) como actividad fungicida preventiva.

30 Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 80 % de control de *Pyricularia oryzae* con 200 ppm, en comparación con el control no tratado en las mismas condiciones, el cual presentó un desarrollo considerable de la enfermedad:

(Compuestos de la Tabla E): E.3, E.6, E.7, E.12, E.13, E.15, E.16, E.20, E.21, E.23

(Compuestos de la Tabla F): F.1

Sclerotinia sclerotiorum (podredumbre algodonosa, moho blanco, etc.):

Se mezclan fragmentos miceliales del hongo preparados en un cultivo líquido fresco directamente en un caldo nutritivo (caldo de dextrosa de papa PDB). Se colocó una solución de los compuestos de prueba en DMSO en una placa de microvaloración (formato de 96 pocillos) y se añadió el caldo de nutrientes que contenía las esporas fúngicas. Las placas de prueba se incubaron a 24°C y la inhibición del crecimiento se determinó fotométricamente 72 hrs a 620 nm.

Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 80 % de control de *Sclerotinia sclerotiorum* con 60 ppm, en comparación con el control no tratado en las mismas condiciones, el cual presentó un desarrollo considerable de la enfermedad:

(Compuestos de la Tabla E): E.7, E.12, E.13, E.22, E.23

(Compuestos de la Tabla F): F.5, F.7

Datos comparativos

La actividad biológica de los compuestos E.13 y E.15 de la invención se compara con los compuestos de referencia X-1 y X-2. Los compuestos de referencia X-1 y X-2 se dan a conocer específicamente en la página 16 del documento WO 98/03464 y página 6 del documento EP 0 212 859 respectivamente.

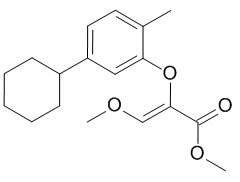
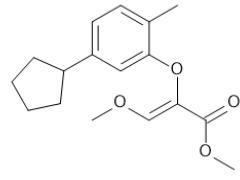
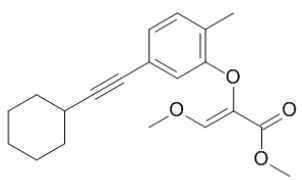
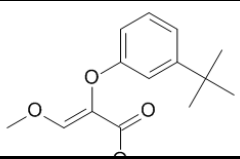
Ejemplo C Actividad Biológica Comparativa contra *Puccinia recondita* (Roya parda), curativa:

Método; Se colocaron segmentos de hojas de trigo en agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos). Se inoculan los segmentos de hojas con una

suspensión de esporas del hongo y se pulverizan con disoluciones de prueba 1 día después de la inoculación. Después de la incubación apropiada, se evalúa la actividad de un compuesto 8 dpi (días después de la inoculación) como actividad fungicida curativa.

Los datos se presentan como el porcentaje de control de la enfermedad de cada compuesto para las pruebas biológicas y las tasas de prueba que se describen a continuación en la tabla H.

Tabla H - Actividad Biológica contra *Puccinia recondita* (Roya parda), curativa:

Compuesto	Estructura del compuesto	Concentración (ppm)	control (%)
Compuesto E.15		200	100
		60	100
		20	90
Compuesto E.13		200	100
		60	0
		20	0
Compuesto de referencia X-1 Documento (WO 98/03464)		200	0
		60	0
		20	0
Compuesto de		200	0
		60	0

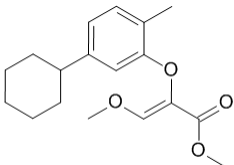
Compuesto	Estructura del compuesto	Concentración (ppm)	control (%)
referencia X-2 Documento (EP 0 212 859)		20	0

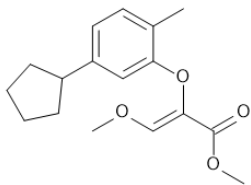
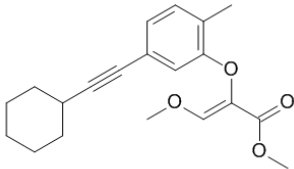
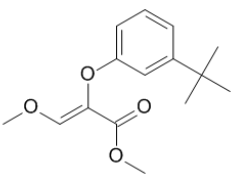
Ejemplo D: Actividad biológica comparativa contra *Phakopsora pachyrhizi* (roya de soja):

Método: Se pulverizan las plantas de soja en una cámara de pulverización con disoluciones compuestas de DMSO que se diluyen a la concentración apropiada con OCHIMA al 0.1% (adyuvante que comprende hexaoleato de sorbitol polietoxilado y tris (2-etilhexil) fosfato) justo antes de la pulverización. Se recortan discos foliares a partir de las plantas tratadas y se colocan sobre agar en placas de 24 pocillos un día después de la aplicación. Después, se inoculan los discos foliares con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación adecuada, se evalúa la actividad de un compuesto aprox. 12 ddi (días después de la inoculación) como actividad fungicida preventiva.

Los datos se presentan como el porcentaje de control de la enfermedad de cada compuesto para las pruebas biológicas y las tasas de prueba que se describen a continuación en la Tabla I.

Tabla I - Actividad biológica contra *Phakopsora pachyrhizi* (roya de soja):

Compuesto	Estructura del compuesto	Concentración (ppm)	control (%)
Compuesto E.15		200	99
		60	97
		20	51

Compuesto	Estructura del compuesto	Concentración (ppm)	control (%)
5		6	0
		200	98
		60	46
		20	4
		6	0
10		200	63
		60	0
		20	0
		6	0
		6	0
15		200	0
		60	0
		20	0
		6	0
		6	0

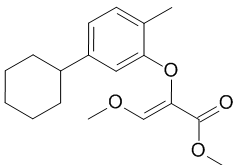
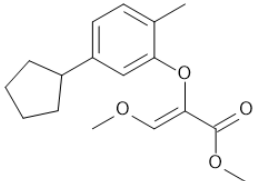
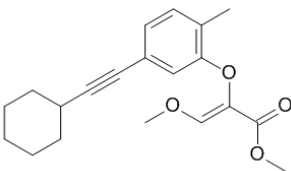
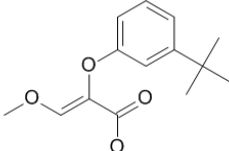
Ejemplo E: Actividad biológica comparativa contra *Phakopsora pachyrhizi* (roya de soja):

Método: Los compuestos que se van a probar se preparan como soluciones en DMSO que se diluyen hasta la concentración apropiada con Tween20 al 0.025% justo antes de la pulverización. Se colocan discos foliares de soja en agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizan las soluciones de prueba sobre estos. Después de secarlos, se inoculan los discos foliares con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación adecuada, se evalúa la actividad de un compuesto

aprox. 12 ddi (días después de la inoculación) como actividad fungicida preventiva.

Los datos se presentan como el porcentaje de control de la enfermedad de cada compuesto para las pruebas biológicas y las tasas de prueba que se describen a continuación en la Tabla J.

Tabla J - Actividad biológica contra *Phakopsora pachyrhizi* (roya de soja):

10	Compuesto	Estructura del compuesto	Concentración (ppm)	control (%)
15	Compuesto E.15		200	100
			60	100
			20	100
			6	95
			2	70
			0.6	10
20	Compuesto E.13		200	100
			60	100
			20	100
			6	60
			2	10
			0.6	10
25	Compuesto de referencia X-1 Documento (WO 98/03464)		200	100
			60	100
			20	80
			6	35
			2	0
			0.6	0
30	Compuesto de referencia		200	10
			60	10
			20	0

Compuesto	Estructura del compuesto	Concentración (ppm)	control (%)
X-2 Documento (EP 0 212 859)		6	0
		2	0
		0.6	0

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