

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 989 675**

51 Int. Cl.:

C07D 333/38 (2006.01)

A01N 43/10 (2006.01)

A01P 1/00 (2006.01)

A01N 53/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **30.06.2020** **PCT/EP2020/068324**

87 Fecha y número de publicación internacional: **07.01.2021** **WO21001331**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **30.06.2020** **E 20734421 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **10.07.2024** **EP 3994130**

54 Título: **Carboxamidas de tiofeno sustituidas y derivados de estas como microbicidas**

30 Prioridad:

03.07.2019 EP 19184093

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
27.11.2024

73 Titular/es:

BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (100.0%)
Kaiser-Wilhelm-Allee 1
51373 Leverkusen, DE

72 Inventor/es:

DUFOUR, JEREMY;
NICOLAS, LIONEL;
TSUCHIYA, TOMOKI;
BERNIER, DAVID;
KNOBLOCH, THOMAS y
BRUNET, STEPHANE

74 Agente/Representante:

GONZÁLEZ PECES, Gustavo Adolfo

ES 2 989 675 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín Europeo de Patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre Concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Carboxamidas de tiofeno sustituidas y derivados de estas como microbicidas

CAMPO DE LA TÉCNICA

La presente invención se refiere a derivados de carboxamida de tiofeno sustituida, su uso para controlar microorganismos fitopatógenos y las composiciones que comprenden a estos.

ANTECEDENTES

En WO2004/024692 se divulga que algunos derivados del ácido aminociclopropano carboxílico heterociclilo carbonilo se pueden emplear como microbicidas.

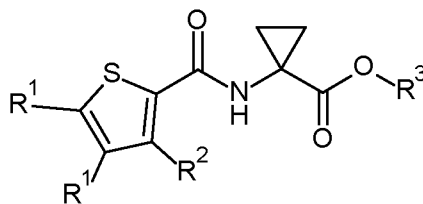
Los documentos WO2020/007905 y WO2020/007902 divulgan ciertos derivados de carboxamida de tiofeno sustituidos y mencionan que estos pueden ser eficientes para controlar bacterias y/o hongos.

Aunque se han creado varios agentes microbicidas hasta el momento, aún existe la necesidad de crear nuevos compuestos microbicidas con el fin de abordar los requisitos ambientales y económicos cada vez mayores impuestos en los agentes y las composiciones de protección del cultivo modernos. Esto incluye, por ejemplo, la mejora del espectro de acción, el perfil de seguridad, la selectividad, la tasa de aplicación, la formación de residuos y la capacidad de preparación favorable. También se podría esperar tener nuevos compuestos para evitar el surgimiento de resistencia.

La presente invención ofrece nuevos compuestos que tienen ventajas sobre compuestos y composiciones conocidas en al menos algunos de estos aspectos.

BREVE DESCRIPCIÓN

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



(I)

donde R¹, R² y R³ representan lo que se enumera en el presente documento, así como sus sales, N-óxidos y solvatos.

La presente invención se refiere a una composición que comprende al menos un compuesto de la fórmula (I) como se define en el presente documento y al menos un portador adecuado para la agricultura.

La presente invención se refiere a los procesos para preparar los compuestos de la fórmula (I) como se describen en el presente documento y los productos intermedios de estos.

La presente invención se refiere a un procedimiento para controlar microorganismos fitopatógenos que comprende el paso de aplicar al menos un compuesto de la fórmula (I) como se define en el presente documento o una composición como se define en el presente documento a las plantas, partes de plantas, semillas, frutas o al suelo en el que crecen las plantas.

DEFINICIONES

Se debe comprender que el término "alquilo" como se utiliza en el presente documento en el contexto de alquilo o alquilosulfonyl, alquilosulfinil, alquiloto, alquiloamino, por ejemplo, significa, preferentemente, alquilo ramificado y no ramificado, que significa, p. ej., metilo, etilo, *n*-propilo, *iso*-propilo, *n*-butilo, *iso*-butilo, *tert*-butilo, *sec*-butilo, pentilo, *iso*-pentilo, hexilo, heptilo, octilo, nonilo y decilo y los isómeros de estos.

Se debe comprender que el término "haloalquilo" como se utiliza en el presente documento significa, preferentemente, alquilo ramificado y no ramificado, como se define *supra*, en el que uno o más sustituyentes de hidrógeno se reemplazan de la misma manera o de forma diferente con halógeno. En particular, se prefiere que dicho haloalquilo sea, p. ej. clorometilo, fluoropropilo, fluorometilo, difluorometilo, triclorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, pentafluoroetilo, bromobutilo, trifluorometilo, iodoetilo e isómeros de estos.

El término "cicloalquilo" como se utiliza en el presente documento se refiere a un anillo que contiene carbono monocíclico no aromático, que tiene de 3 a 8 átomos de carbono. Los ejemplos de cicloalquilo saturado incluyen, a mero título enunciativo, el grupo ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclononilo y ciclodecilo.

5 El término "heterociclilo" como se utiliza en el presente documento se refiere a heterociclos saturados o parcialmente insaturados de cuatro, cinco o seis miembros que contienen de uno a cuatro heteroátomos seleccionados de manera independiente del grupo de oxígeno, nitrógeno y azufre. Si el anillo contiene más de un átomo de oxígeno, no se encuentran directamente adyacentes.

10 El término "halógeno" o "Hal" como se utiliza en el presente documento debe entenderse como flúor, cloro, bromo o yodo.

El término "halo" cuando se encuentra entre paréntesis (p. ej. "(Halo)alquilo C₁-C₆") designa la presencia opcional de uno o más sustituyentes de halógeno que pueden ser iguales o diferentes.

15 Se debe comprender que el término "alqueno" como se utiliza en el presente documento se refiere, preferentemente, al alqueno ramificado y no ramificado, p. ej. un grupo vinilo, propen-1-il, propen-2-il, but-1-en-1-il, but-1-en-2-il, but-2-en-1-il, but-2-en-2-il, but-1-en-3-il, 2-metil-prop-2-en-1-il o 2-metil-prop-1-en-1-il.

Se debe comprender que el término "alquino" como se utiliza en el presente documento se refiere, preferentemente, al alquino ramificado y no ramificado, p. ej. un grupo etinilo, prop-1-in-1-il, but-1-in-1-il, but-2-in-1-il o but-3-in-1-il.

20 El término "arilo" como se usa en el presente documento se refiere a un sistema de anillos de hidrocarburo aromático que comprende de 6 a 15 átomos de carbono, o de 6 a 12 átomos de carbono, preferentemente de 6 a 10 átomos de carbono. El sistema de anillos puede ser un sistema de anillo aromático monocíclico o policíclico fusionado (p. ej., bicíclico o tricíclico). Los ejemplos de arilo incluyen, a mero título enunciativo, fenilo, azulenilo, naftilo y fluorenilo. Se entiende además que cuando se dice que el grupo arilo se reemplaza con uno o más sustituyentes, dicho(s) sustituyente(s) pueden estar en cualquier posición en el/los anillo(s) de arilo mencionado(s). Particularmente, en caso de que el arilo sea un grupo fenilo, dicho(s) sustituyente(s) puede(n) ocupar una o ambas posiciones orto, una o ambas posiciones meta o la posición para o cualquier combinación de estas posiciones. Esta definición también aplica al arilo como parte de un sustituyente del compuesto (p. ej. ariloxi).

30 El término "aralquilo" como se usa en el presente documento se refiere a un alquilo C₁-C₆ sustituido por un arilo como se define en el presente documento. El ejemplo de aralquilo incluye el grupo bencilo (-CH₂-C₆H₅).

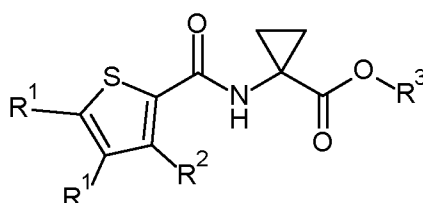
Como se utiliza en el presente documento, se debe comprender que el término "C₁-C₆", p. ej. en el contexto de la definición de "alquilo C₁-C₆" o "alcoxi C₁-C₆", significa un grupo que tiene una cantidad finita de átomos de carbono de 1 a 6, es decir, 1, 2, 3, 4, 5 o 6 átomos de carbono.

35 Se debe comprender que la expresión "grupo saliente" como se utiliza en el presente documento se refiere al grupo que es desplazado de un compuesto en una reacción de sustitución o eliminación, por ejemplo, un átomo de halógeno, un grupo trifluorometansulfonato (triflato), un alcoxi, un metansulfonato, un p-toluensulfonato, etc.

DESCRIPCIÓN DETALLADA

PRINCIPIOS ACTIVOS

La presente invención se relaciona con un compuesto de la fórmula (I):

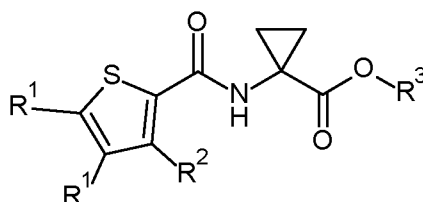


donde

R¹ son átomos de bromo o átomos de cloro;

R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro, átomo de yodo y átomo de flúor;

- 5 R^3 se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo- C_1-C_6 -heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C_1-C_6 -Si(alquilo C_1-C_6)₃ y alquilo C_1-C_6 -ciclopropilo, y si R^1 y R^2 son átomos de bromo, entonces R^3 se selecciona del grupo que consiste en haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo $-C_1-C_6$ -heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo- C_1-C_6 -Si(alquilo C_1-C_6)₃ y alquilo- C_1-C_6 -ciclopropilo, y si R^3 se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno y alquilo- C_1-C_6 , entonces R_2 se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo y átomo de yodo;
- 10 siempre que R^2 no sea un átomo de cloro cuando R^1 son átomos de cloro.
- En una realización preferida, R^1 son átomos de cloro.
- En otra realización preferida, R^1 son átomos de bromo.
- En otra realización preferida, R^2 se selecciona del grupo que consiste en átomo de flúor, átomo de cloro y átomo de bromo.
- 15 En otra realización preferida, R^1 son diferentes de R^2 .
- En otra realización preferida, R^1 son átomos de cloro y R^2 es un átomo de bromo.
- En otra realización, R^2 se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro y átomo de flúor.
- 20 En otra realización, R^3 se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , aralquilo y alquilo C_1-C_6 -ciclopropilo y, preferentemente, seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 y, más preferentemente, seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno y alquilo C_1-C_6 .
- 25 En otra realización preferida R^1 son átomos de cloro y R^2 es un átomo de bromo y R^3 se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , aralquilo y alquilo $-C_1-C_6$ -ciclopropilo- C_3-C_8 y, preferentemente, seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 y, más preferentemente, seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno y alquilo C_1-C_6 .
- 30 Otro aspecto de la presente invención es un compuesto de la fórmula (I):



donde

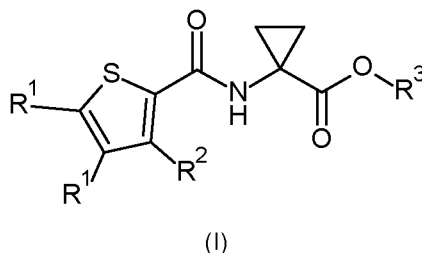
- R^1 son átomos de bromo o átomos de cloro;
- 35 R^2 se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro, átomo de yodo y átomo de flúor;
- R^3 se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo- C_1-C_6 -heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C_1-C_6 -Si(alquilo C_1-C_6)₃ y alquilo $-C_1-C_6$ -cicloalquilo C_3-C_8 y si R^1 y R^2 son átomos de bromo, entonces R^3 se selecciona del grupo que
- 40 consiste en haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo $-C_1-C_6$ -heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo $-C_1-C_6$ -Si(alquilo C_1-C_6)₃ y alquilo C_1-C_6 -ciclopropilo, y si R^3 se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno y alquilo C_1-C_6 , entonces R_2 se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo y átomo de yodo;

45

siempre que R^2 no sea un átomo de cloro cuando R^1 son átomos de cloro.

En una realización preferida de este aspecto, R^1 son átomos de cloro y R^2 es un átomo de bromo y R^3 se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , aralquilo y alquilo C_1-C_6 -cicloalquilo C_3-C_8 y, preferentemente, seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , y más preferentemente seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno y alquilo C_1-C_6 .

Otro aspecto de la presente invención se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) para controlar hongos y/o bacterias fitopatógenos en plantas o partes de plantas:



donde

R^1 son átomos de bromo o átomos de cloro;

R^2 se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro, átomo de yodo y átomo de flúor;

R^3 se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo C_1-C_6 -heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C_1-C_6 -Si(alquilo C_1-C_6)₃ y alquilo C_1-C_6 -ciclopropilo;

siempre que R^2 no sea un átomo de cloro cuando R^1 son átomos de cloro;

en la protección del cultivo.

En una realización preferida de este aspecto, R^1 son átomos de cloro.

En una realización preferida de este aspecto, R^1 son átomos de bromo.

En una realización preferida de este aspecto, R^2 se selecciona del grupo que consiste en átomo de flúor, átomo de cloro y átomo de bromo.

En una realización preferida de este aspecto, R^1 son diferentes de R^2 .

En una realización preferida de este aspecto, R^1 son átomos de cloro y R^2 se selecciona del grupo que consiste en átomo de flúor y átomo de cloro.

En una realización preferida de este aspecto, R^1 son átomos de cloro y R^2 es un átomo de bromo.

En una realización preferida de este aspecto, R^3 se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo C_1-C_6 -heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C_1-C_6 -Si(alquilo C_1-C_6)₃ y alquilo C_1-C_6 -ciclopropilo y, preferentemente, seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 y, más preferentemente, seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno y alquilo C_1-C_6 .

En otra realización preferida de este aspecto, R^1 son átomos de cloro y R^2 es un átomo de bromo y R^3 se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , aralquilo y alquilo C_1-C_6 -ciclopropilo- C_3-C_8 y, preferentemente, seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 y, más preferentemente, seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno y alquilo C_1-C_6 .

En otra realización preferida de este aspecto,

R^1 son átomos de bromo o átomos de cloro;

R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro y átomo de flúor;

R³ se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo C₁-C₆-heteroarilo, heterociclo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo C₁-C₆-ciclopropilo;

5 siempre que R² no sea un átomo de cloro cuando R¹ es un átomo de cloro.

En otra realización preferida de este aspecto,

R¹ son átomos de bromo o átomos de cloro;

R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro y átomo de flúor;

R³ se selecciona del grupo que consiste en un átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈ y aralquilo

10 siempre que R² no sea un átomo de cloro cuando R¹ es un átomo de cloro.

En otra realización preferida de este aspecto,

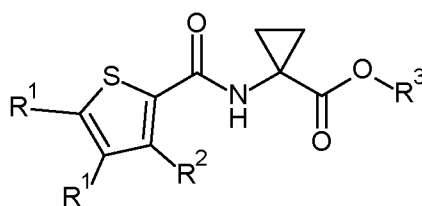
R¹ son átomos de bromo o átomos de cloro;

R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro y átomo de flúor;

R³ se selecciona del grupo que consiste en un átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈ y aralquilo

15 siempre que R² no sea un átomo de cloro cuando R¹ es un átomo de cloro y siempre que R² no sea un átomo de bromo cuando R¹ es un átomo de bromo.

Otro aspecto de la presente invención se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) para controlar hongos y/o bacterias fitopatógenos en plantas o partes de plantas:



(I)

donde

R¹ son átomos de bromo o átomos de cloro;

R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro, átomo de yodo y átomo de flúor;

25 R³ se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo, heteroarilo C₁-C₆, heterociclo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo C₁-C₆-cicloalquilo C₃-C₈;

siempre que R² no sea un átomo de cloro cuando R¹ son átomos de cloro;

30 en la protección del cultivo.

En una realización preferida de este aspecto, R¹ son átomos de cloro y R² es un átomo de bromo y R³ se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, aralquilo y alquilo C₁-C₆-cicloalquilo C₃-C₈ y, preferentemente, seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, y más preferentemente seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno y alquilo C₁-C₆.

Hay compuestos que no están comprendidos en el presente documento, que resultan de las combinaciones que están en contra de las leyes de la naturaleza y que el experto en la materia por tanto excluiría según su conocimiento experto. Por ejemplo, las estructuras de anillo con tres o más átomos de oxígeno adyacentes están excluidas.

Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, el compuesto de la fórmula (I) puede estar presente en forma de diferentes estereoisómeros. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. Por consiguiente, la invención abarca ambos estereoisómeros puros y cualquier mezcla de estos isómeros. Donde un compuesto puede estar presente en dos o más formas tautómeras en equilibrio, se debe considerar la referencia al compuesto por medio de una descripción tautomérica para incluir todas las formas tautómeras.

Cualquiera de los compuestos de la presente invención también puede existir en una o más formas isómeras geométricas dependiendo del número de enlaces dobles en el compuesto. Los isómeros geométricos por naturaleza de los sustituyentes de enlace doble o de anillo pueden estar presentes en su forma *cis* (= *Z*-) o *trans* (= *E*-). La invención, por lo tanto, se refiere igualmente a todos los isómeros geométricos y a todas las posibles mezclas, en todas las proporciones.

El compuesto de la fórmula (I) puede estar adecuadamente en su forma libre, en forma de sal, en forma de N-óxido o en forma de solvato (p. ej., un hidrato).

Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, el compuesto de la fórmula (I) puede estar presente en forma de compuesto libre y/o en forma de una sal de este, tal como una sal agroquímicamente activa.

Las sales agroquímicamente activas incluyen sales de adición de ácido de ácidos inorgánicos y orgánicos como también sales de bases habituales. Son ejemplos de ácidos inorgánicos los ácidos halohídricos, tales como el fluoruro de hidrógeno, cloruro de hidrógeno, bromuro de hidrógeno y yoduro de hidrógeno, ácido sulfúrico, ácido fosfórico y ácido nítrico y sales ácidas tales como bisulfato de sodio y bisulfato de potasio. Los ácidos orgánicos útiles incluyen, por ejemplo, ácido fórmico, ácido carbónico y ácidos alcanóicos como el ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido tricloroacético y ácido propiónico, también ácido glicólico, ácido tiocianico, ácido láctico, ácido succínico, ácido cítrico, ácido benzoico, ácido cinámico, ácido oxálico, ácidos grasos saturados o mono- o diinsaturados con 6 a 20 átomos de carbono, monoésteres alquilsulfúricos, ácidos alquilsulfónicos (ácidos sulfónicos con radicales alquilo de cadena lineal o ramificada con 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilsulfónicos o ácidos arildisulfónicos (radicales aromáticos tales como fenilo y naftilo, que contienen uno o dos grupos de ácido sulfónico), ácidos alquilsulfónicos (ácidos sulfónicos con cadenas de radicales alquilo lineales o ramificadas con 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilsulfónicos o ácidos arildisulfónicos (radicales aromáticos, tales como fenilo y naftilo, que contienen uno o más radicales de ácido sulfónico), donde los radicales alquilo y arilo pueden contener otros sustituyentes, por ejemplo, ácido p-toluensulfónico, ácido salicílico, ácido p-aminosalicílico, ácido 2-fenoxibenzoico, ácido 2-acetoxibenzoico.

Los solvatos de los compuestos de la fórmula (I) o sus sales son composiciones estequiométricas de los compuestos con solventes.

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

La presente invención se refiere a cualquier compuesto de la fórmula (I) divulgado en la tabla, así como al uso de este en la protección del cultivo (es decir, para controlar hongos y/o bacterias fitopatógenos en plantas o partes de plantas y/o controlar nematodos).

Otro aspecto de la presente invención se refiere a una composición que comprende al menos un compuesto de la fórmula (I) según la invención y al menos un auxiliar adecuado para la agricultura.

Otro aspecto de la presente invención se refiere a un procedimiento para controlar las enfermedades bacterianas y/o fúngicas y/o controlar los nematodos que comprende el paso de aplicar al menos un compuesto de la fórmula (I) según la invención o una composición según la invención a las plantas, partes de plantas, semillas, frutas o al suelo en el cual se cultivan las plantas.

Otro aspecto de la presente invención se refiere al uso de un compuesto o de una composición según la invención para controlar las enfermedades bacterianas y/o fúngicas y/o controlar los nematodos en plantas.

Preferentemente, se usan para controlar las enfermedades bacterianas o fúngicas.

Preferentemente, el compuesto o la composición según la invención se usa contra: enfermedades causadas por patógenos del oídio, tal como la especie *Podosphaera* (p. ej. *Podosphaera leucotricha*), especie *Sphaerotheca* (p. ej. *Sphaerotheca fuliginea*); enfermedades causadas por patógenos de la enfermedad de la roya, tal como la especie *Uromyces* (p. ej. *Uromyces appendiculatus*); enfermedades causadas por patógenos del grupo de *Oomycetes*, tal como la especie *Peronospora* (p. ej. *Peronospora parasitica*), especie *Phytophthora* (p. ej. *Phytophthora infestans*), especie *Plasmopara* (p. ej. *Plasmopara viticola*), especie *Pseudoperonospora* (p. ej. *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*), especie *Pythium* (p. ej. *Pythium ultimum*); enfermedades de la mancha foliar y enfermedades de marchitamiento foliar causadas, por ejemplo, por la especie *Alternaria* (p. ej. *Alternaria solani*), especie *Cercospora* (p. ej. *Cercospora beticola*), especie *Colletotrichum* (p. ej. *Colletotrichum lindemuthianum*), especie *Venturia* (p. ej. *Venturia inaequalis*);

enfermedades causadas por patógenos bacterianos, por ejemplo especie *Xanthomonas* (p. ej. *Xanthomonas campestris* pv. *campestris*), especie *Pseudomonas* (p. ej. *Pseudomonas syringae* pv. *tomato*), especie *Erwinia* (p. ej. *Erwinia amilovor*a), especie *Liberibacter* (p. ej. *Liberibacter Candidatus*), especie *Ralstonia* (p. ej. *Ralstonia solanacearum*).

- 5 Según un aspecto adicional de la presente invención, el compuesto o la composición según la invención se usa para el activador de defensa de la planta. Un inductor de defensa de la planta según la invención es un compuesto o una composición que estimula el sistema de defensa propio de las plantas.

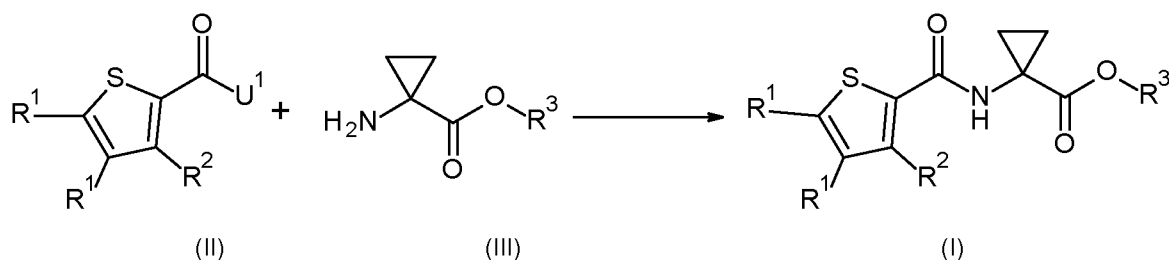
Procesos para la preparación de los compuestos de la fórmula (I)

- 10 La presente invención se refiere a los procesos de preparación de compuestos de la fórmula (I). Los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar mediante varias vías en analogía con los procesos conocidos (consulte las referencias del presente documento), y mediante una o más de las siguientes vías sintéticas descritas en el presente documento a continuación y en la parte experimental.

A menos que se indique lo contrario, a continuación, R^1 , R^2 y R^3 tienen el mismo significado que el de arriba para los compuestos de la fórmula (I).

15 Proceso 1

Los compuestos de la fórmula (I) como se definen en el presente documento se pueden preparar mediante un proceso 1 que comprende el paso de reaccionar un compuesto de la fórmula (II) o una de sus sales con un compuesto de la fórmula (III) o una de sus sales como se ilustra mediante el siguiente esquema de reacción:



Proceso 1

donde U^1 es un átomo de halógeno, un grupo hidróxilo o un grupo alcoxi C_1-C_6 .

- cuando U^1 representa un grupo hidróxilo, el proceso 1 se lleva a cabo de forma ventajosa en la presencia de un agente condensante. Los agentes condensantes adecuados se pueden seleccionar en la lista no limitada que consiste en un formador de haluro de ácido, tal como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxido de tricloruro de fósforo, cloruro de oxalilo o cloruro de tionilo; formador de anhídrido, tal como cloroformiato de etilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de isobutilo o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas, tal como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC), hidroccloruro de N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida (EDC) u otros agentes condensantes habituales, tal como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, cloruro bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosfínico, 1-[bis(dimetiloamino)metileno]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]piridinio 3-óxido hexafluorofosfato (HATU), 2-(1H-Benzotriazol-1-il)-1,1,3,3-tetrametiloaminio tetrafluoroborato (TBTU), (1-ciano-2-etoxi-2-oxoetilo)dimetiloamino-morfolino-carbenio hexafluorofosfato, N,N'-carbonyl-diimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonyl-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetracloro-metano, hidrato de cloruro de 4-(4,6-dimetoxi[1,3,5]-triazin-2-il)-4-metilmorfolinio, cloruro bis(2-oxo-3-oxazolidinil)fosfínico (BOP-Cl), bromotripirrolidinofosfoniohexafluorofosfato (PyBroP), cloruro de 2-cloro-1,3-dimetiloimidazolinio (DMC) y anhídrido propanofosfónico (T3P).

- Cuando U^1 representa un átomo de halógeno, el proceso 1 se lleva a cabo de forma ventajosa en la presencia de un ligante de ácido. Los ligantes de ácido adecuados para llevar a cabo el proceso 1 son, en cada caso, todas las bases inorgánicas y orgánicas que son habituales para dichas reacciones. Se otorga preferencia a los carbonatos de metal alcalino, tal como carbonato de cesio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio, acetatos de metal alcalinotérreo, tal como acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio y también aminas terciarias, tal como trimetilamina, trietilamina, diisopropilamino, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N-metilpiperidina, N,N-dimetilpiridina-4-amina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU) o bases aromáticas tal como la piridina.

Cuando U^1 representa un grupo alcoxi C_1-C_6 , el proceso 1 se puede llevar a cabo con un exceso del componente de amina, opcionalmente en la presencia de un ácido de Lewis tal como trimetilaluminio.

Si es adecuado, el proceso 1 se puede llevar a cabo en la presencia de una base y, si es adecuado, en la presencia de un solvente, preferentemente en condiciones de anhidro.

Los disolventes adecuados para llevar a cabo el proceso 1 no presentan limitaciones particulares. Pueden ser solventes orgánicos inertes tradicionales siempre que no disuelvan el compuesto que reaccionan o exhiben alguna interacción particular con este. Opcionalmente, se prefiere el uso de hidrocarburos halogenados, alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, pentano, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno, decalina, ISOPAR™ E o ISOPAR™ G, clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como éter dietílico, diisopropil éter, éter metil *tert*-butílico, éter metil *tert*-amílico, dioxano, tetrahydrofurano, 2-metiltetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, *n*- o *iso*-butironitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida hexametilfosfórica; ureas, tales como 1,3-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2(1*H*)-pirimidinona; ésteres, tales como acetato de metilo o acetato de etilo; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido o sulfonas, tales como sulfolano, y una mezcla de estos compuestos químicos.

El proceso 1 se puede realizar dentro de una atmósfera inerte; por ejemplo, una atmósfera de argón o nitrógeno. Cando se lleva a cabo el proceso 1, se puede utilizar 1 mol o un exceso del compuesto de la fórmula (III) y de 1 a 5 moles de base por mol del compuesto de la fórmula (II). También se pueden utilizar los componentes de disponible como en otras proporciones. La mezcla se lleva a cabo a través de procedimientos conocidos.

Los compuestos de la fórmula (III) se encuentran comercialmente disponibles o se pueden preparar mediante procesos conocidos.

Los compuestos de la fórmula (II) donde U¹ representa un grupo hidróxilo están comercialmente disponibles, se pueden preparar a partir de los compuestos de la fórmula (II) donde U¹ representa un grupo alcoxi C₁-C₆ mediante procesos conocidos tal como hidrólisis básica o se pueden preparar mediante varias vías en analogía con los procesos conocidos descritos en Beilstein Journal of Organic Chemistry (2007), 3, N.º 23; Justus Liebigs Annalen der Chemie (1937), 532, 236-49; WO2017212010; WO2003024961; Journal of Agricultural and Food Chemistry (2007), 55(18), 7517-7526 y otras referencias en los documentos citados o mediante una o más de las siguientes vías sintéticas descritas en el presente documento a continuación (tal como el proceso 3, el proceso 5 o el proceso 6) y en la parte experimental.

Los compuestos de la fórmula (II) donde U¹ representa un halógeno están comercialmente disponibles o se pueden preparar a partir de los compuestos de la fórmula (II) donde U¹ representa un grupo hidróxilo mediante procesos conocidos.

Los compuestos de la fórmula (II) donde U¹ representa un grupo alcoxi C₁-C₆ están comercialmente disponibles o se pueden preparar a partir de compuestos de la fórmula (II) donde U¹ representa un grupo hidróxilo mediante procesos conocidos o mediante el proceso 3, el proceso 5 o el proceso 6.

Proceso 2

Los compuestos de la fórmula (I) como se define en el presente documento se puede preparar mediante un proceso C1 a partir de un compuesto de la fórmula (IV) o una de sus sales al realizar una reacción de brominación o clorinación como se ilustra en el siguiente esquema de reacción:



Proceso 2

donde U² es un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un átomo de bromo y U³ es un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un átomo de bromo siempre que al menos uno de U² o U³ sea un átomo de hidrógeno.

El proceso 2 se puede llevar a cabo según los procesos conocidos (WO2008109786, WO2007098356).

El proceso 2 se realiza en la presencia de un agente de brominación o un agente de clorinación y, si es adecuado, en la presencia de un solvente.

Los agentes de brominación o clorinación adecuados para llevar a cabo el proceso 2 no están particularmente limitados siempre que se usen para la brominación o clorinación. Los ejemplos de los agentes de brominación incluyen bromo, N-bromosuccinimida y 1,3-dibromo-5,5-dimetil-2,4-imidazolidinediona. Los ejemplos de los agentes de clorinación incluyen N-clorosuccinimida, cloruro de sulfurilo y 1,3-dicloro-5,5-dimetil-2,4-imidazolidinediona.

Los solventes adecuados para llevar a cabo el proceso 2 no presentan limitaciones particulares. Pueden ser solventes orgánicos inertes tradicionales siempre que no disuelvan el compuesto que reaccionan o exhiben alguna interacción particular con este. Los solventes adecuados pueden ser, por ejemplo, los solventes divulgados en conexión con el proceso 1. Para llevar a cabo el proceso 2, también puede ser beneficioso emplear un ácido orgánico tal como ácido acético o ácido trifluoroacético como solvente o como cosolvente. Para llevar a cabo el proceso 2, también puede ser beneficioso usar un ácido de Lewis tal como cloruro de zinc (II) como catalizador.

Proceso 3

Los compuestos de la fórmula (I) como se define en el presente documento se pueden preparar mediante un proceso 3 a partir de un compuesto de la fórmula (V) o una de sus sales al realizar una reacción de halogenación como se ilustra en el siguiente esquema de reacción:



Proceso 3

El proceso 3 se puede llevar a cabo según los procesos conocidos (Angewandte Chemie, International Edition, 52(16), 4440-4444; 2013; ACS Catalysis, 6(11), 7839-7843; 2016; Journal of the American Chemical Society, 2017, 139, 888; Angewandte Chemie, International Edition, 2014, 53, 7928; Journal of the American Chemical Society, 2018, 140, 2789; WO2008156879; WO2012114285).

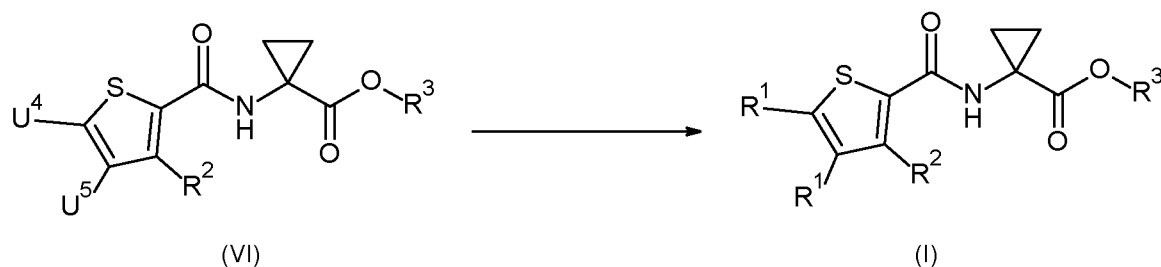
El proceso 3 se realiza en la presencia de un agente de halogenación y, si es adecuado, en la presencia de un solvente.

Los agentes de halogenación adecuados para llevar a cabo el proceso 3 no están particularmente limitados siempre que se usen para la halogenación. Los ejemplos de los agentes de brominación incluyen bromo, N-bromosuccinimida y 1,3-dibromo-5,5-dimetil-2,4-imidazolidinediona. Los ejemplos de los agentes de clorinación incluyen N-clorosuccinimida, cloruro de sulfurilo y 1,3-dicloro-5,5-dimetil-2,4-imidazolidinediona. Los ejemplos de agentes de brominación incluyen yodo, N-iodosuccinimida, cloruro de yodo y 1,3-diiodo-5,5-dimetil-2,4-imidazolidinediona. Los ejemplos de agentes de fluorinación incluyen N-fluorobenzenosulfonimida.

Los solventes adecuados para llevar a cabo el proceso 3 no presentan limitaciones particulares. Pueden ser solventes orgánicos inertes tradicionales siempre que no disuelvan el compuesto que reaccionan o exhiben alguna interacción particular con este. Los solventes adecuados pueden ser, por ejemplo, algunos de los solventes divulgados en conexión con el proceso 1. Para llevar a cabo el proceso 3, también puede ser beneficioso usar un ácido orgánico tal como ácido acético o ácido trifluoroacético como solvente o como cosolvente. Para llevar a cabo el proceso 3, también puede ser beneficioso usar un ácido de Lewis tal como cloruro de zinc (II) como catalizador. Para llevar a cabo el proceso 3, también puede ser beneficioso usar catalizadores de metal de transición tal como catalizadores de paladio. Para llevar a cabo el proceso 3, también puede ser beneficioso usar un reactivo organometálico adecuado tal como n-butil-litio.

Proceso 4

Los compuestos de la fórmula (I) como se definen en el presente documento se pueden preparar mediante un proceso 4 que comprende el paso de realizar una diazotación de un compuesto de la fórmula (VI) o una de sus sales, seguido de una sustitución aromática para proporcionar un compuesto de la fórmula (I) como se ilustra en el siguiente esquema de reacción:



Proceso 4

donde U^4 es un grupo amino, un átomo de cloro o un átomo de bromo y U^5 es un grupo amino, un átomo de cloro o un átomo de bromo siempre que al menos uno de U^4 o U^5 sea un grupo amino.

El proceso 4 se puede llevar a cabo según los procesos conocidos (The Chemistry of diazonium and diazo groups; Saul Patai; Wiley-Interscience; 1978; 288-280 y 645-657; Account of Chemical Research (2018), 51, 496 y las referencias citadas en el presente documento).

Los compuestos de la fórmula (VI) o una de sus sales como se define en el presente documento se pueden preparar mediante un proceso que comprende el paso de desproteger un compuesto de la fórmula (VII) o una de sus sales como se ilustra en el siguiente esquema de reacción:

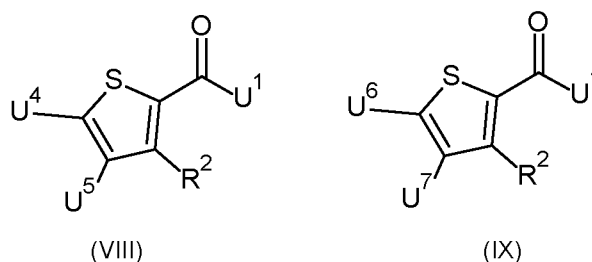


donde U^6 es un grupo amino protegido, un átomo de cloro o un átomo de bromo y U^7 es un grupo amino protegido, un átomo de cloro o un átomo de bromo siempre que al menos uno de U^6 o U^7 es un grupo amino protegido, U^4 es un grupo amino, un átomo de cloro o un átomo de bromo y U^5 es un grupo amino, un átomo de cloro o un átomo de bromo siempre que al menos uno de U^4 o U^5 es un grupo amino.

Los ejemplos de los grupos de protección del grupo amino incluyen un grupo bencilo, un grupo 4-metoxibencilo, un grupo alilo, un alquilsulfonil C_1-C_6 sustituido o no sustituido, un trifluorometilsulfonil, un fenilsulfonil sustituido o no sustituido, un alcóxicarbonilo C_1-C_6 sustituido o no sustituido, un bencilóxicarbonilo sustituido o no sustituido, un alilóxicarbonilo sustituido o no sustituido, un grupo acetilo o un grupo trifluoroacetilo.

El proceso de desprotección se puede llevar a cabo según los procesos conocidos para eliminar los grupos de protección (Greene's Protective Groups in Organic Synthesis; Peter G. M. Wuts; Wiley; Fifth Edition; 2014; 895-1194). Por ejemplo, los grupos de protección *tert*-butoxicarbonilo y bencilóxicarbonilo se pueden eliminar en un medio ácido (por ejemplo, con ácido clorhídrico o ácido trifluoroacético). Los grupos de protección bencilícos se pueden eliminar de forma hidrogenolítica con hidrógeno en la presencia de un catalizador (por ejemplo, paladio en un carbono activado). El grupo trifluoroacetilo se puede eliminar en un medio básico (por ejemplo, con carbonato de potasio o hidróxido de litio).

Los compuestos de la fórmula (VI) se pueden preparar a partir de compuestos de la fórmula (VIII) o una de sus sales y los compuestos de la fórmula (VII) se pueden preparar a partir de compuestos de la fórmula (IX) o una de sus sales mediante la reacción con un compuesto de la fórmula (II) en las condiciones como se describen en el proceso 1:



donde U⁴, U⁵, U⁶ y U⁷ son como se define en el presente documento, U¹ es un átomo de halógeno, un grupo hidróxilo o un grupo alcoxi C₁-C₆.

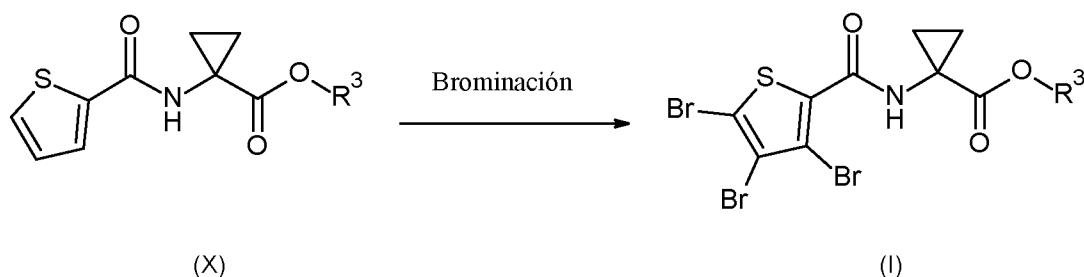
- 5 Los compuestos de la fórmula (VIII) y los compuestos de la fórmula (IX) se encuentran comercialmente disponibles o se pueden preparar mediante procesos conocidos con condiciones de reacciones similares a las divulgadas para preparar los compuestos de la fórmula (II).

Los compuestos de la fórmula (I) o una de sus sales donde R³ representa un átomo de hidrógeno se pueden preparar a partir de compuestos de la fórmula (I) donde R³ representa un alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, aralquilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo C₁-C₆-ciclopropilo mediante procesos bien conocidos tal como hidrólisis básica.

Los compuestos de la fórmula (I) donde R³ representa un alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, aralquilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo C₁-C₆-ciclopropilo se pueden preparar a partir de compuestos de la fórmula (I) o una de sus sales donde R³ representa un átomo de hidrógeno mediante procesos bien conocidos.

Proceso 5

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar mediante un proceso 5 a partir de un compuesto de la fórmula (X) o una de sus sales al llevar a cabo una reacción de brominación como se ilustra en el siguiente esquema de reacción:



Proceso 5

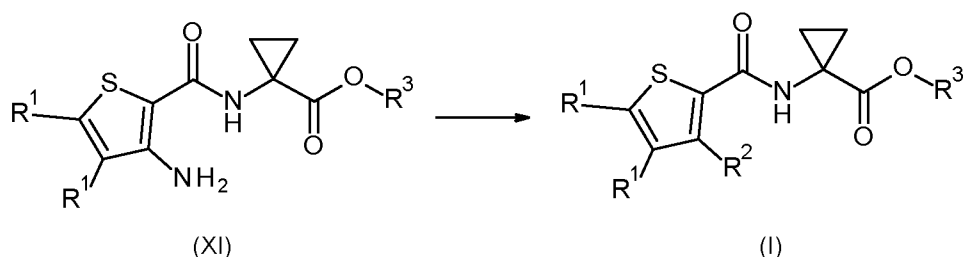
El proceso 5 se realiza en la presencia de un agente de brominación y, si es adecuado, en la presencia de un solvente.

Los agentes de brominación adecuados para llevar a cabo el proceso 5 no están particularmente limitados siempre que se usen para la brominación. Los ejemplos de los agentes de brominación incluyen N-bromosuccinimida, bromo y 1,3-dibromo-5,5-dimetil-2,4-imidazolidinediona.

Los solventes adecuados para llevar a cabo el proceso 5 no presentan limitaciones particulares. Pueden ser solventes orgánicos inertes tradicionales siempre que no disuelvan el compuesto que reaccionan o exhiben alguna interacción particular con este. Los solventes adecuados pueden ser, por ejemplo, los solventes divulgados en conexión con el proceso 2. Para llevar a cabo el proceso 5, también puede ser beneficioso usar un ácido orgánico tal como ácido acético o ácido trifluoroacético como solvente o como cosolvente. Para llevar a cabo el proceso 5, también puede ser beneficioso usar un ácido de Lewis tal como cloruro de zinc (II) como catalizador. Para llevar a cabo el proceso 5, también puede ser beneficioso usar un reactivo organometálico adecuado tal como n-butil-litio.

Proceso 6

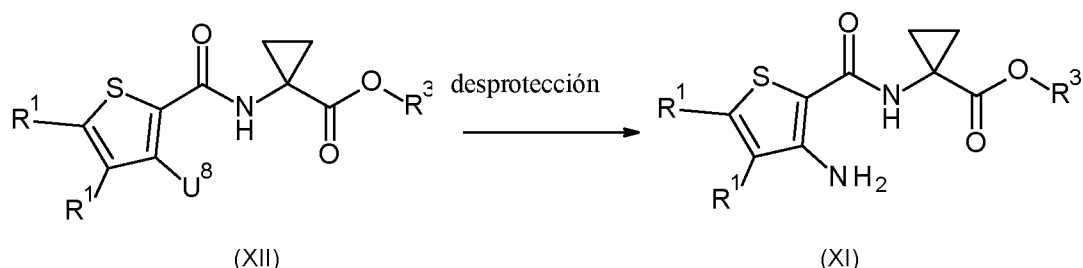
Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden preparar mediante un proceso 6 a partir de un compuesto de la fórmula (XI) como se ilustra en el siguiente esquema de reacción:



Proceso 6

5 El proceso 6 se puede llevar a cabo según los procesos conocidos (The Chemistry of diazonium and diazo groups; Saul Patai; Wiley-Interscience; 1978; 288-280 y 645-657; Account of Chemical Research (2018), 51, 496 y las referencias citadas en el presente documento).

Los compuestos de la fórmula (XI) como se define en el presente documento se pueden preparar mediante un proceso que comprende el paso de desproteger un compuesto de la fórmula (XII) mediante una reacción de desprotección como se ilustra en el siguiente esquema de reacción:

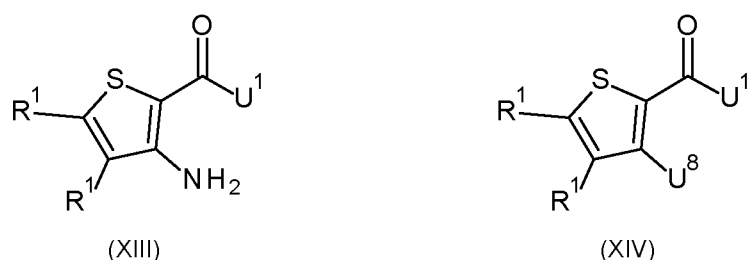


donde U^8 es un grupo amino protegido.

Los ejemplos de los grupos de protección del grupo amino incluyen un grupo bencilo, un grupo 4-metoxibencilo, un grupo alilo, un alquilosulfonil C₁-C₆ sustituido o no sustituido, un trifluorometilsulfonil, un fenilsulfonilo sustituido o no sustituido, un alcoxicarbonilo C₁-C₆ sustituido o no sustituido, un benciloxicarbonilo sustituido o no sustituido, un alililoxicarbonilo sustituido o no sustituido, un grupo acetilo o un grupo trifluoroacetilo.

El proceso de desprotección se puede llevar a cabo según los procesos conocidos para eliminar los grupos de protección (Greene's Protective Groups in Organic Synthesis; Peter G. M. Wuts; Wiley; Fifth Edition; 2014; 895-1194). Por ejemplo, los grupos de protección *tert*-butoxicarbonilo y benciloxicarbonilo se pueden eliminar en un medio ácido (por ejemplo, con ácido clorhídrico o ácido trifluoroacético). Los grupos de protección bencilícos se pueden eliminar de forma hidrogenolítica con hidrógeno en la presencia de un catalizador (por ejemplo, paladio en un carbono activado). El grupo trifluoroacetilo se puede eliminar en un medio básico (por ejemplo, con carbonato de potasio o hidróxido de litio).

Los compuestos de la fórmula (XI) también se pueden preparar a partir de los compuestos de la fórmula (XIII) y los compuestos de la fórmula (XII) se pueden preparar a partir de compuestos de la fórmula (XIV) mediante la reacción con un compuesto de la fórmula (III) en las condiciones como se describen en conexión con el proceso 1:



donde U⁸ se define en el presente documento y U¹ es un átomo de halógeno, un grupo hidróxilo o un grupo alcoxí C₁-C₆.

Los compuestos de la fórmula (XIII) y los compuestos de la fórmula (XIV) se encuentran comercialmente disponibles o se pueden preparar mediante procesos bien conocidos con condiciones de reacciones similares a las divulgadas para preparar los compuestos de la fórmula (II).

Proceso 7

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden preparar mediante un proceso 7 con una reacción de fluorinación como se ilustra en el siguiente esquema:

Proceso 7

La invención también se refiere a este proceso, donde R^1 , R^2 y R^3 son como se define en la reivindicación 1.

El proceso 7 se puede llevar a cabo según los procesos conocidos (Journal of the American Chemical Society 2011, 133, 11482 and Organic Process Research & Development 2014, 18, 1041).

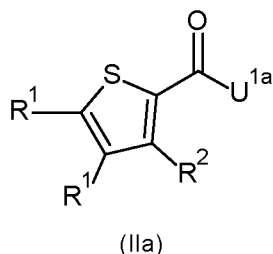
- 10 Los compuestos según la invención se pueden preparar según los procesos descritos arriba. No obstante, se entiende que, según el nivel de conocimiento general y las publicaciones disponibles, el experto en la técnica podrá adaptar estos procesos según las especificaciones de cada uno de los compuestos según la invención que se desean sintetizar.

Productos intermedios para la preparación de los compuestos de la fórmula (I)

- 15 La presente invención se refiere a los productos intermedios de preparación de compuestos de la fórmula (I).

A menos que se indique lo contrario, a continuación, R^1 , R^2 y R^3 tienen el mismo significado que el de arriba para los compuestos de la fórmula (I).

Se proporcionan los compuestos de la fórmula (IIa):



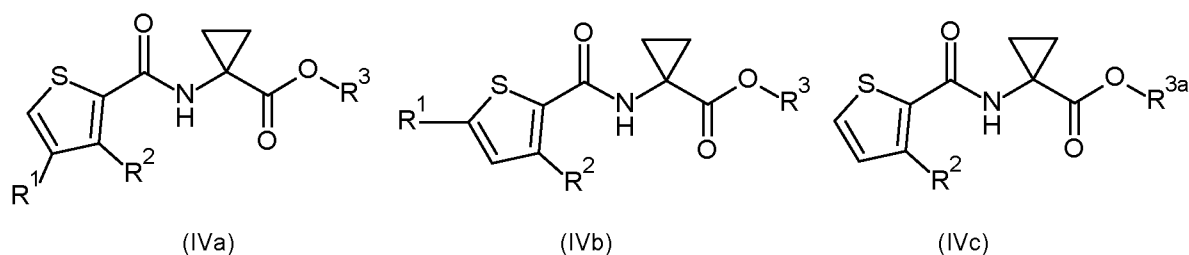
donde R^1 , R^2 y R^3 son como se define en el presente documento y U^{1a} es un grupo hidróxilo o un grupo alcoxi C_1-C_6 ,

siempre que el compuesto de la fórmula (IIa) no represente los siguientes productos:

- 4,5-dicloro-3-fluorotiofeno-2-carboxilato de metilo [2166596-88-7],
- 25 - ácido 4,5-dicloro-3-fluorotiofeno-2-carboxílico [2166596-87-6],
- 4,5-dibromo-3-fluorotiofeno-2-carboxilato de etilo [2260624-98-2],
- ácido 4,5-dibromo-3-fluorotiofeno-2-carboxílico [1628447-64-2],
- 4,5-dibromo-3-clorotiofeno-2-carboxilato de metilo [1501789-47-4],
- ácido 4,5-dibromo-3-iodotiofeno-2-carboxílico [854626-46-3],
- 30 - ácido 4,5-dibromo-3-clorotiofeno-2-carboxílico [503308-99-4],
- 4,5-dibromo-3-clorotiofeno-2-carboxilato de etilo [503308-98-3],
- 4,5-dibromo-3-fluorotiofeno-2-carboxilato de metilo [395664-58-1],

- 3,4,5-tribromotiofeno-2-carboxilato de *tert*-butilo [62224-27-5],
- 3,4,5-tribromotiofeno-2-carboxilato de etilo [54113-44-9],
- ácido 3,4,5-tribromotiofeno-2-carboxílico [53317-05-8] y
- 3,4,5-tribromotiofeno-2-carboxilato de metilo [24647-80-1].

5 Los compuestos de la fórmula (IVa), (IVb) y (IVc) son otro aspecto de la presente invención:



donde

R¹ es un átomo de bromo o átomo de cloro;

- 10 R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro, átomo de yodo y átomo de flúor;
- R³ se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo C₁-C₆-heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo C₁-C₆-ciclopropilo;

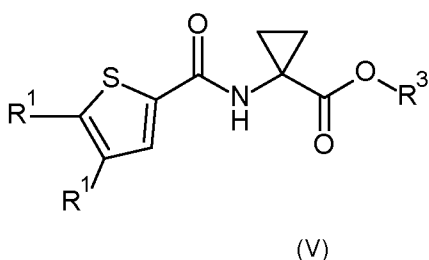
- 15 R^{3a} representa alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, aralquilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo C₁-C₆-ciclopropilo;

donde R³ es un heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros en (IVa) y (IVb) cuando R¹ y R² cada uno es un átomo de cloro;

siempre que el compuesto de la fórmula (IVa) y (IVc) no represente:

- 20 - ácido 1-[(3,4-dibromo-2-tienil)carbonil]amino}ciclopropanocarboxílico [2140459-54-5],
- 1-[(3-cloro-2-tienil)carbonil]amino}ciclopropanocarboxilato de metilo [2188523-33-1] y
- 1-[(3-bromo-2-tienil)carbonil]amino}ciclopropanocarboxilato de metilo [2175467-77-1].

Se proporcionan los compuestos de la fórmula (V):



25

donde

R¹ es un átomo de bromo o átomo de cloro;

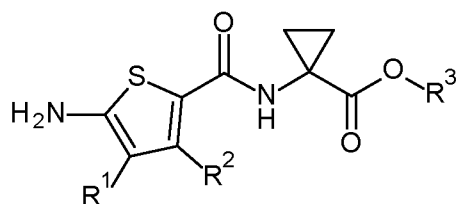
- 30 R³ se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo C₁-C₆-heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo C₁-C₆-ciclopropilo;

donde R³ un heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros cuando R¹ y R² son cada uno un átomo de cloro;

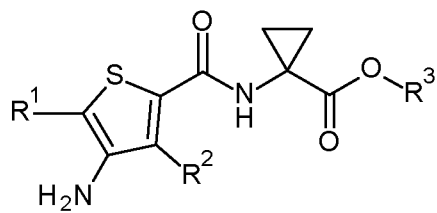
siempre que el compuesto de la fórmula (V) no represente los siguientes productos:

- ácido 1-[[[(4,5-dibromo-2-tienil)carbonil]amino]ciclopropanocarboxílico [726125-69-5],
- 1-[[[(4,5-dibromo-2-tienil)carbonil]amino]ciclopropanocarboxilato de but-2-in-1-ilo [666857-33-6],
- 1-[[[(4,5-dibromo-2-tienil)carbonil]amino]ciclopropanocarboxilato de ciclobutilo [666857-32-5],
- 1-[[[(4,5-dibromo-2-tienil)carbonil]amino]ciclopropanocarboxilato de propilo [666857-31-4] y
- 5 - 1-[[[(4,5-dibromo-2-tienil)carbonil]amino]ciclopropanocarboxilato de metilo [666857-30-3].

Los compuestos de la fórmula (VIa) y (VIb) son otro aspecto de la presente invención:



(VIa)



(VIb)

donde

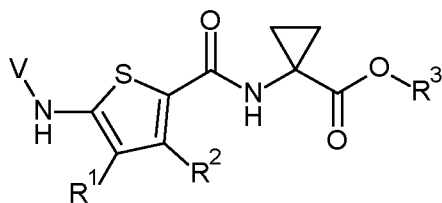
- 10 R¹ es un átomo de bromo o átomo de cloro;

R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro, átomo de yodo y átomo de flúor;

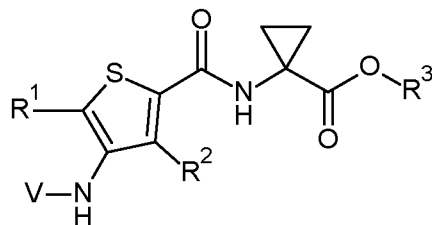
R³ se selecciona del grupo que consiste en haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo C₁-C₆-heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo C₁-C₆-ciclopropilo;

- 15 siempre que R² no sea un átomo de cloro cuando R¹ es un átomo de cloro.

Se proporcionan los compuestos de la fórmula (VIIa) y (VIIb):



(VIIa)



(VIIb)

donde

- 20 R¹ es un átomo de bromo o átomo de cloro;

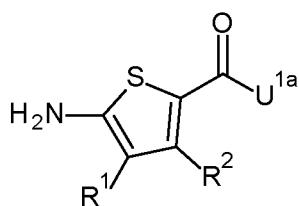
R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro, átomo de yodo y átomo de flúor;

R³ se selecciona del grupo que consiste en haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo C₁-C₆-heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo C₁-C₆-ciclopropilo;

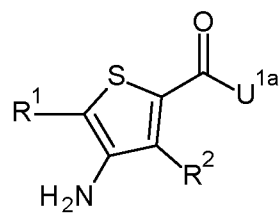
- 25 siempre que R² no sea un átomo de cloro cuando R¹ es un átomo de cloro;

V es un grupo bencilo, un grupo 4-metoxibencilo, un grupo alilo, un alcoxicarbonilo C₁-C₆ sustituido o no sustituido, un benciloxicarbonilo sustituido o no sustituido, un aliloxicarbonilo, un grupo acetilo o un grupo trifluoroacetilo.

Se proporcionan los compuestos de la fórmula (VIIIa) y (VIIIb):



(VIIIa)



(VIIIb)

donde

R¹ es un átomo de bromo o átomo de cloro;

- 5 R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro, átomo de yodo y átomo de flúor;

U^{1a} es un grupo hidróxilo o un grupo alcoxi C₁-C₆;

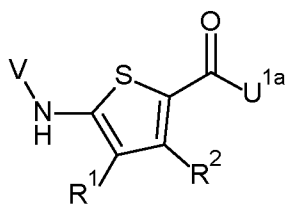
siempre que R² no sea un átomo de cloro ni átomo de flúor cuando R¹ es un átomo de cloro;

siempre que R² no sea un átomo de cloro ni átomo de flúor cuando R¹ es un átomo de bromo;

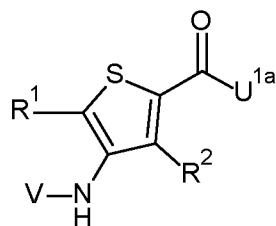
siempre que el compuesto de la fórmula (VIIIb) no represente:

- 10 - 4-amino-3,5-dibromotiofeno-2-carboxilato de etilo [1394375-09-7].

Se proporcionan los compuestos de la fórmula (IXa) y (IXb):



(IXa)



(IXb)

donde

- 15 R¹ es un átomo de bromo o átomo de cloro;

R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro, átomo de yodo y átomo de flúor;

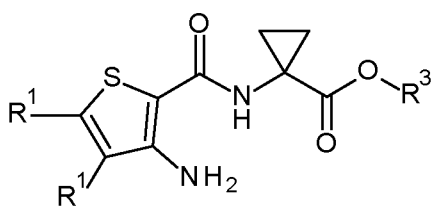
V es un grupo bencilo, un grupo 4-metoxibencilo, un grupo alilo, un alcoxycarbonilo C₁-C₆ sustituido o no sustituido, un benciloxycarbonilo sustituido o no sustituido, un aliloxycarbonilo, un grupo acetilo o un grupo trifluoroacetilo y U^{1a} es un grupo hidróxilo o un grupo alcoxi C₁-C₆.

- 20 U^{1a} es un grupo hidróxilo o un grupo alcoxi C₁-C₆;

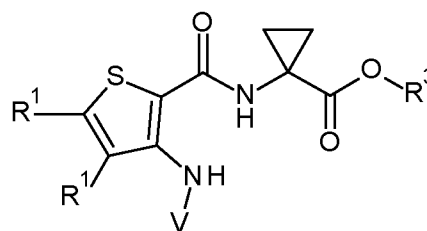
siempre que R² no sea un átomo de cloro ni átomo de flúor cuando R¹ es un átomo de cloro;

siempre que R² no sea un átomo de cloro ni átomo de flúor cuando R¹ es un átomo de bromo.

Se proporcionan los compuestos de la fórmula (XI) y (XIIa):



(XI)



(XIIa)

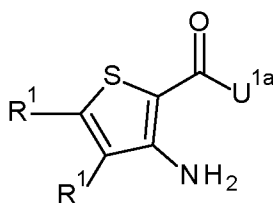
donde

5 V es un grupo bencilo, un grupo 4-metoxibencilo, un grupo alilo, un alcóxicarbonilo C₁-C₆ sustituido o no sustituido, un benciloxycarbonilo sustituido o no sustituido, un aliloxycarbonilo, un grupo acetilo o un grupo trifluoroacetilo;

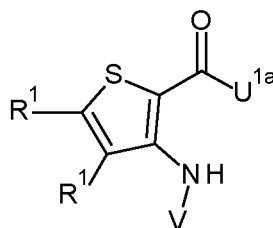
R¹ es un átomo de bromo o átomo de cloro;

10 R³ se selecciona del grupo que consiste en haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo C₁-C₆-heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo C₁-C₆-ciclopropilo.

Se proporcionan los compuestos de la fórmula (XIIIa) y (XIVa):



(XIIIa)



(XIVa)

donde

15 R¹ es un átomo de bromo o átomo de cloro;

V es un grupo bencilo, un grupo 4-metoxibencilo, un grupo alilo, un alcóxicarbonilo C₁-C₆ sustituido o no sustituido, un benciloxycarbonilo sustituido o no sustituido, un aliloxycarbonilo, un grupo acetilo o un grupo trifluoroacetilo; y

U¹ᵃ es un grupo hidróxilo o un grupo alcoxi C₁-C₆,

20 siempre que el compuesto de la fórmula (XIIIa) no represente:

- 3-amino-4,5-diclorotiofeno-2-carboxilato de metilo [1621488-35-4],

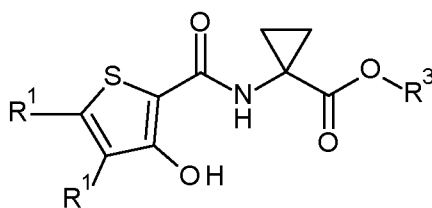
y siempre que el compuesto de la fórmula (XIVa) no represente:

- ácido 3-acetamido-4,5-diclorotiofeno-2-carboxílico [2090448-72-7],

- 3-acetamido-4,5-diclorotiofeno-2-carboxilato de metilo [632356-39-9], y

25 - 4,5-dicloro-3-[(metoxycarbonil)amino]tiofeno-2-carboxilato de metilo [35707-28-9].

Los compuestos de la fórmula (XV) son otro aspecto de la presente invención:



(XV)

donde

R¹ es un átomo de bromo o átomo de cloro;

- 5 R³ se selecciona del grupo que consiste en haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo C₁-C₆-heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo C₁-C₆-ciclopropilo.

Composiciones y formulaciones

- 10 La presente invención también se refiere a una composición; en particular, a una composición utilizada para controlar microorganismos no deseados, que comprenden uno o más de los compuestos de la fórmula (I). La composición es preferentemente una composición fungicida.

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

- 15 Un portador es una sustancia sólida o líquida; natural o sintética, u orgánica o inorgánica que es generalmente inerte. En general, el portador mejora la aplicación de los compuestos; por ejemplo, plantas, partes de plantas o semillas. Entre los ejemplos de *portadores sólidos* adecuados, se incluyen, a mero título enunciativo, las sales de amonio; los flúores de rocas naturales, tales como las caolinitas, arcilla, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita y tierra de diatomeas, y polvos de rocas sintéticas, tales como el sílice, alúmina y silicatos finamente molidos. Los ejemplos de portadores útiles típicos para preparar gránulos incluyen, a mero título enunciativo, las rocas naturales fraccionadas y trituradas, tales como calcita, mármol, pumita, sepiolita y dolomita, y gránulos sintéticos de polvos orgánicos e inorgánicos y gránulos de material orgánico, tales como aserrín, papel, cáscara de coco, mazorcas de maíz y espigas de tabaco. Los ejemplos de *portadores líquidos* adecuados incluyen, a mero título enunciativo, el agua, los solventes orgánicos y las combinaciones de estos. Los ejemplos de *solventes* adecuados incluyen los líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo, de las clases de hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como ciclohexano, parafinas, alquilbencenos, xileno, tolueno o alquilnaftalenos; los hidrocarburos alifáticos clorados o aromáticos clorados, tales como los clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno); alcoholes y polioles (los cuales, opcionalmente, también se pueden sustituir, eterificar y/o esterificar, tales como butanol o glicol); las cetonas (tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona); los ésteres (incluidas las grasas y los aceites) y los (poli)ésteres; las aminas sustituidas y no sustituidas; las amidas (tal como la metilformamida); las lactamas (tales como las N-alquilpirrolidonas), y las lactonas, las sulfonas y los sulfóxidos (tal como el dimetilsulfóxido). El portador también puede ser un diluyente gaseoso licuado; es decir, un líquido que es gaseoso en condiciones de temperatura y presión estándar; por ejemplo, los propelentes de aerosol, tales como los halohidrocarburos, el butano, el propano, el nitrógeno y el dióxido de carbono. En general, la cantidad de portador varía del 1% al 99,99%; preferentemente, del 5% al 99,9%; más preferentemente, del 10% al 99,5%, y más preferentemente aún, del 20% al 99% en peso de la composición.

La composición puede comprender, además, uno o más auxiliares aceptables que son habituales para las composiciones de formulación (p. ej. composiciones agroquímicas), tal como uno o más surfactantes.

- 40 El tensioactivo puede ser iónico (catiónico o aniónico) o no iónico, tales como los emulsionantes iónicos o no iónicos, los agentes espumantes, los dispersantes, los agentes de humectación y cualquiera de sus mezclas. Los ejemplos de tensioactivos adecuados incluyen, a mero título enunciativo, sales de ácido poliácrico; sales de ácido lignosulfónico o naftalensulfónico; policondensados de etileno y/u óxido de propileno con alcoholes grasos, ácidos grasos o aminas grasas (ésteres de ácidos grasos de polioxietileno, éteres de alcoholes grasos de polioxietileno; por ejemplo, éteres de alquilarilpoliglicol); fenoles sustituidos (preferentemente, alquilfenoles o arilfenoles); sales de ésteres de sulfosuccinato; derivados de taurina (preferentemente, tauratos de alquilo); ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polietoxilados; ésteres grasos de polioles y derivados de compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos, fosfatos (por ejemplo, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo) e hidrolizados proteicos; líquidos de desecho de lignosulfito, y metilcelulosa. Un tensioactivo se utiliza normalmente cuando el compuesto de la fórmula (I) y/o el portador no son hidrosolubles, y la aplicación se realiza con agua. Por lo tanto, la cantidad de tensioactivos normalmente varía del 5% al 40% en peso de la composición.

Otros ejemplos de coadyuvantes que son habituales para la formulación de las composiciones agroquímicas incluyen los repelentes de agua, agentes desecantes, aglutinantes (agentes adhesivos, de pegajosidad o de fijación, tales como carboximetilcelulosa, polímeros sintéticos y naturales con presentación en forma de polvos, gránulos o látex, tales como goma arábica, alcohol polivinílico y acetato de polivinilo; fosfolípidos naturales, tales como las cefalinas y lecitinas, y fosfolípidos sintéticos, tales como polivinilpirrolidona, acetato de polivinilo, alcohol de polivinilo y tilosa), espesantes, estabilizantes (p. ej., estabilizantes fríos, conservantes, antioxidantes, fotoestabilizantes u otros agentes que mejoran la estabilidad física y/o química), colorantes o pigmentos (tales como los pigmentos inorgánicos, p. ej., óxido férrico, óxido de titanio y azul de Prusia, y los colorantes orgánicos, p. ej., colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálica), antiespumantes (p. ej., antiespumantes de silicona y estereato de magnesio), conservantes (p. ej., diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal), espesantes secundarios (derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, arcilla modificada y sílice finamente molido), espesantes, giberelinas y coadyuvantes de procesamiento, aceites vegetales y minerales, perfumes, ceras, nutrientes (incluidos los nutrientes traza, tales como las sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc), coloides protectores, sustancias tixotrópicas, penetrantes, agentes secuestrantes y formadores de complejos.

La elección de los coadyuvantes se refiere al modo previsto de aplicación del compuesto de la fórmula (I) y/o con las propiedades físicas. Además, los coadyuvantes se pueden elegir para conferir propiedades particulares (propiedades técnicas, físicas y/o biológicas) a las composiciones o utilizar formas preparadas a partir de estas. La elección de los coadyuvantes permite adaptar las composiciones a necesidades específicas.

La composición puede estar en cualquier forma tradicional; por ejemplo, las soluciones (p. ej., soluciones acuosas), emulsiones, polvos humectables, suspensiones a base de agua y de aceite, polvos, polvillo, pastas, polvos solubles, gránulos solubles, gránulos para difusión, concentrados de suspoemulsión, productos sintéticos o naturales impregnados con el compuesto de la invención, fertilizantes y microencapsulaciones en sustancias poliméricas. El compuesto de la fórmula (I) puede encontrarse en forma disuelta, emulsionada o suspendida.

Se puede proporcionar la composición al usuario final como una formulación lista para usar; en otras palabras, las composiciones se pueden aplicar directamente a las plantas o a las semillas a través de un dispositivo adecuado, tal como un pulverizador o atomizador. De manera alternativa, se puede proporcionar la composición al usuario final en forma de concentrado que debe ser diluida antes de usarla; preferentemente con agua.

La composición se puede preparar con procedimientos convencionales; por ejemplo, mediante la combinación del compuesto de la fórmula (I) con un coadyuvante o más, según la descripción anterior que se encuentra en el presente documento.

En general, la composición contiene del 0,01% al 99% en peso; del 0,05% al 98% en peso; preferentemente, del 0,1% al 95% en peso; más preferentemente, del 0,5% al 90% en peso; más preferentemente aún, del 1% al 80% en peso del compuesto de la fórmula (I).

Los compuestos y las composiciones que comprenden a estos se pueden mezclar con otros ingredientes activos, tales como fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas, insecticidas, herbicidas, fertilizantes, reguladores de crecimiento, protectores o semioquímicos. Esto permite ampliar el espectro de actividad o prevenir el desarrollo de la resistencia. El *Pesticide Manual*, 17th Edition, describe ejemplos de insecticidas, acaricidas, nematocidas y bactericidas conocidos.

Los ingredientes activos especificados en el presente documento mediante su nombre común son conocidos y descritos, por ejemplo, en *The Pesticide Manual* (16th Ed. British Crop Protection Council) o se pueden buscar en Internet (p. ej. www.alanwood.net/pesticides).

En el presente documento, se entiende que, donde un compuesto (A) o un compuesto (B) puede estar presente en forma tautomérica, dicho compuesto también para incluir, cuando corresponda, las formas tautoméricas correspondientes, incluso si estas no se mencionan específicamente en cada caso.

Todos los socios de mezcla nombrados de las clases (1) a (15) pueden, si sus grupos funcionales lo permiten, formar opcionalmente sales con bases o ácidos adecuados.

1) Los inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1001) ciproconazol, (1002) difenoconazol, (1003) epoxiconazol, (1004) fenhexamida, (1005) fenpropidina, (1006) fenpropimorf, (1007) fenpirazamina, (1008) fluquinconazol, (1009) flutriafol, (1010) imazalil, (1011) sulfato de imazalil, (1012) ipconazol, (1013) metconazol, (1014) miclobutanil, (1015) paclobutrazol, (1016) procloraz, (1017) propiconazol, (1018) protioconazol, (1019) pirisoxazol, (1020) espiroxamina, (1021) tebuconazol, (1022) tetraconazol, (1023) triadimenol, (1024) tridemorf, (1025) triticonazol, (1026) (1R,2S,5S)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1027) (1S,2R,5R)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-ilmetil)ciclopentanol, (1028) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1029) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1030) (2R)-2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1031) (2S)-2-(1-

- clorociclopil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1032) (2S)-2-(1-clorociclopil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1033) (2S)-2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1034) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1035) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1036) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (1037) 1-[(2R,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il]metil-1H-1,2,4-triazol, (1038) 1-[(2S,4S)-2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-4-metil-1,3-dioxolan-2-il]metil-1H-1,2,4-triazol, (1039) 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1040) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1041) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-il tiocianato, (1042) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1043) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1050) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptano-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1051) 2-[2-cloro-4-(2,4-diclorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1052) 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1053) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1054) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, (1055) mefentrifluconazol, (1056) 2-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1057) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1058) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1059) 5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)metil)ciclopentanol, (1060) 5-(alilosulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1061) 5-(alilosulfanil)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1062) 5-(alilosulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1063) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1064) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1065) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(2,2,3,3-tetrafluoropropoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1066) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-(pentafluoroetoxi)fenil]sulfanil]fenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1067) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-[(1,1,2,2-tetrafluoroetil)sulfanil]fenoxi]fenil]-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1068) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenoxi]fenil]-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1069) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-[(2,2,3,3-tetrafluoropropil)sulfanil]fenoxi]fenil]-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1070) N'-(2,5-dimetil-4-[[3-[[pentafluoroetil)sulfanil]fenoxi]fenil]-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1071) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1072) N'-(4-[[3-(difluorometoxi)fenil]sulfanil]-2,5-dimetilofenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1073) N'-(4-[[3-[(difluorometil)sulfanil]fenoxi]-2,5-dimetilofenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1074) N'-(5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridina-3-il)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1075) N'-(4-[[4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il]oxi]-2,5-dimetilofenil)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1076) N'-(5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridina-3-il)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1077) N'-(5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridina-3-il)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1078) N'-(5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridina-3-il)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1079) N'-(5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridina-3-il)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1080) N'-(5-bromo-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridina-3-il)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1081) ipfentrifluconazol, (1082) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1083) 2-[6-(4-bromofenoxi)-2-(trifluorometil)-3-piridil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1084) 2-[6-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)-3-piridil]-1-(1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1085) 3-[2-(1-clorociclopil)-3-(3-cloro-2-fluoro-fenil)-2-hidroxi-propil]imidazol-4-carbonitrilo, (1086) 4-[[6-[rac-(2R)-2-(2,4-difluorofenil)-1,1-difluoro-2-hidroxi-3-(5-tioxo-4H-1,2,4-triazol-1-il)propilo]-3-piridil]oxi]benzonitrilo, (1087) N-isopropil-N'-(5-metoxi-2-metil-4-(2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-feniletil)fenil)-N-metiloimidoformamida, (1088) N'-(5-bromo-2-metilo-6-[(1-propoxipropil)-2-il]oxi]piridina-3-il)-N-etil-N-metiloimidoformamida, (1089) hexaconazol, (1090) penconazol, (1091) fenbuconazol.
- 2) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II; por ejemplo (2001) benzovindiflupir, (2002) bixafen, (2003) boscalid, (2004) carboxin, (2005) fluopiram, (2006) flutolanil, (2007) fluxaproxad, (2008) furametpir, (2009) isofetamid, (2010) isopirazam (enantiómero antiepipimérico 1R, 4S, 9S), (2011) isopirazam (enantiómero antiepipimérico 1S,4R,9R), (2012) isopirazam (racemato antiepipimérico 1RS,4SR,9SR), (2013) isopirazam (mezcla de racemato sinépimérico 1RS,4SR,9RS y acemato antiepipimérico 1RS,4SR,9SR), (2014) isopirazam (enantiómero sinépimérico 1R,4S,9R), (2015) isopirazam (enantiómero sinépimérico 1S,4R,9S), (2016) isopirazam (racemato sinépimérico 1RS,4SR,9RS), (2017) penflufeno, (2018) pentipirad, (2019) pidiflumetofeno, (2020) piraziflumida, (2021) sedaxano, (2022) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2023) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2024) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2025) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2''-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2026)

- 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (2027) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2028) inipirfluxam, (2029) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2030) fluindapir, (2031) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2032) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2033) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-[[4-(trifluorometil)piridin-2-il]oxi]fenil)etil]quinazolin-4-amina, (2034) N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2035) N-(2-*tert*-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2036) N-(2-*tert*-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2037) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2038) isoflucipram, (2039) N-[(1R,4S)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2040) N-[(1S,4R)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2041) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropil-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2042) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2043) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2044) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2045) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2046) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2047) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2048) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2049) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2050) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2051) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2052) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2053) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2054) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2055) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2056) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2057) pirapropoína, (2058) N-[rac-(1S,2S)-2-(2,4-diclorofenil)ciclobutil]-2-(trifluorometil)-nicotinamida, (2059) N-[(1S,2S)-2-(2,4-diclorofenil)ciclobutil]-2-(trifluorometil)nicotinamida.
- 3) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III; por ejemplo (3001) ametotradina, (3002) amisulbrom, (3003) azoxistrobina, (3004) coumetoxistrobina, (3005) coumoxistrobina, (3006) ciazofamida, (3007) dimoxistrobina, (3008) enoxastrobina, (3009) famoxadona, (3010) fenamidona, (3011) flufenoxistrobina, (3012) fluoxastrobina, (3013) kresoxim-metilo, (3014) metominostrobina, (3015) orisastrobina, (3016) picoxistrobina, (3017) piraclostrobina, (3018) pirametostrobina, (3019) piraoxistrobina, (3020) trifloxistrobina, (3021) (2E)-2-{2-[[[(1E)-1-(3-[[[(E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoximino)-N-metilacetamida, (3022) (2E,3Z)-5-[[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoximino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3023) (2R)-2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida, (3024) (2S)-2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida, (3025) fenpicoxamid, (3026) mandestrobina, (3027) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2-hidroxibenzamida, (3028) (2E,3Z)-5-[[1-(4-cloro-2-fluorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoximino)-N,3-dimetilpent-3-enamida, (3029) metil {5-[3-(2,4-dimetilfenil)-1H-pirazol-1-il]-2-metilbencil}carbamato, (3030) metiltetraprol, (3031) florilpicoxamida.
- 4) Inhibidores de la división celular y mitosis, por ejemplo (4001) carbendazim, (4002) dietofencarb, (4003) etaboxam, (4004) fluopicolida, (4005) pencicuron, (4006) tiabendazol, (4007) tiofanato de metilo, (4008) zoxamida, (4009) piridaclometilo, (4010) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (4011) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-piridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina, (4012) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4013) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4014) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4015) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4016) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4017) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4018) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4019) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4020) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4021) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4022) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (4023) N-(2-bromo-6-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4024) N-(2-bromofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4025) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (4026) fluopimomida.
- 5) Compuestos capaces de tener una acción multisitio, por ejemplo, (5001) mezcla de Burdeos, (5002) captafol, (5003) captan, (5004) clorotalonilo, (5005) hidróxido de cobre, (5006) naftenato de cobre, (5007) óxido de cobre, (5008) oxiclورو de cobre, (5009) sulfato de cobre (2+), (5010) ditianon, (5011) dodina, (5012) folpet, (5013) mancozeb, (5014) maneb, (5015) metiram, (5016) metiram-cinc, (5017) oxinato de cobre, (5018) propineb,

(5019) azufre y preparaciones de azufre (incluido el polisulfuro de calcio), (5020) tiram, (5021) zineb, (5022) ziram, (5023) 6-etil-5,7-dioxo-6,7-dihidro-5H-pirol[3',4':5,6][1,4]ditiino[2,3-c][1,2]tiazol-3-carbonitrilo.

6) Compuestos capaces de inducir la defensa contra el huésped; por ejemplo (6001) acibenzolar-S-metilo, (6002) isotianilo, (6003) probenazol, (6004) tiadinilo.

5 7) Inhibidores de aminoácidos y/o de la biosíntesis de las proteínas; por ejemplo, (7001) ciprodinil, (7002) kasugamicina, (7003) clorhidrato de kasugamicina hidratado, (7004) oxitetraciclina, (7005) pirimetanilo, (7006) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina.

8) Inhibidores de la producción de ATP; por ejemplo, (8001) siltiofam.

10 9) Inhibidores de la síntesis de la pared celular; por ejemplo, (9001) bentiavalicarb, (9002) dimetomorf, (9003) flumorf, (9004) iprovalicarb, (9005) mandipropamida, (9006) pirimorf, (9007) valifenalato, (9008) (2E)-3-(4-*tert*-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (9009) (2Z)-3-(4-*tert*-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona.

10) Inhibidores de la síntesis de membranas y lípidos; por ejemplo, (10.001) propamocarb, (10.002) clorhidrato de propamocarb, (10.003) tolclofos-metilo.

15 11) Inhibidores de la biosíntesis de la melanina; por ejemplo (11.001) triciclazol, (11.002) tolprocarb.

12) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos; por ejemplo, (12.001) benalaxil, (12.002) benalaxil-M (kiralaxil), (12.003) metalaxil, (12.004) metalaxil-M (mefenoxam).

13) Inhibidores de la transducción de señal; por ejemplo, (13.001) fludioxonilo, (13.002) iprodiona, (13.003) procimidona, (13.004) proquinazida, (13.005) quinoxifeno, (13.006) vinclozolina.

20 14) Compuestos que pueden actuar como desacopladores; por ejemplo, (14.001) fluazinam, (14.002) meptildinocap.

15) Otros fungicidas seleccionados del grupo que consiste en (15.001) ácido abscísico, (15.002) bentiazol, (15.003) betoxazina, (15.004) capsimicina, (15.005) carvona, (15.006) quinometionato, (15.007) cufraneb, (15.008) ciflufenamida, (15.009) cimoxanilo, (15.010) ciprosulfamida, (15.011) flutianilo, (15.012) fasetil-aluminio, (15.013) fasetil-calcio, (15.014) fasetil-sodio, (15.015) metil isotiocianato, (15.016) metrafenona, (15.017) mildiomicina, (15.018) natamicina, (15.019) dimetilditiocarbamato de níquel, (15.020) nitrotal-isopropilo, (15.021) oxamocarb, (15.022) oxatiapirolina, (15.023) oxifentiina, (15.024) pentaclorofenol y sales, (15.025) ácido fosfónico y sus sales, (15.026) propamocarb-fosetilato, (15.027) piriofenona (clazafenona), (15.028) tebufloquin, (15.029) teclotlam, (15.030) tolnifanida, (15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.033) 2-(6-bencilpiperidin-2-il)quinazolina, (15.034) dipimetritona, (15.035) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-in-1-ilo)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.036) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-ilo)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.037) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-ilo)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.038) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiperidin-2-il]quinazolina, (15.039) 2-[(5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metansulfonato, (15.040) 2-[(5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenil metansulfonato, (15.041) 2-[2-[(7,8-difluoro-2-metilquinolina-3-il)oxi]-6-fluorofenil]propan-2-ol, (15.042) 2-[2-fluoro-6-[(8-fluoro-2-metilquinolina-3-il)oxi]fenil]propan-2-ol, (15.043) fluoxapirolina, (15.044) 2-[3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]fenil metansulfonato, (15.045) 2-fenilfenol y sus sales, (15.046) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.047) fenilfenol, (15.048) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautomérica: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.049) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletil)amino]butanoico, (15.050) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.051) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofeno-2-sulfonohidrazida, (15.052) 5-fluoro-2-[(4-fluorobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.053) 5-fluoro-2-[(4-metilobencil)oxi]pirimidin-4-amina, (15.054) 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(quinolin-3-il)-2,3-dihidro-1,4-benzoxazepina, (15.055) but-3-in-1-il {6-[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino}oxi]metil]piridina-2-il}carbamato, (15.056) etil (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilato, (15.057) ácido fenazina-1-carboxílico, (15.058) propilo 3,4,5-trihidroxibenzoate, (15.059) quinolin-8-ol, (15.060) sulfato de quinolin-8-ol (2:1), (15.061) *tert*-butil-{6-[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metileno]amino}oxi]metil]piridin-2-il}carbamato, (15.062) 5-fluoro-4-imino-3-metil-1-[(4-metilofenil)sulfonil]-3,4-dihidropirimidin-2(1H)-ona, (15.063) aminopirifen, (15.064) (N'-[2-cloro-4-(2-fluorofenoxi)-5-metilofenil]-N-etil-N-metiloimidoformamida), (15.065) (N'-[2-cloro-5-metil-4-fenoxifenil]-N-etil-N-metiloimidoformamida), (15.066) 2-[2-[(7,8-difluoro-2-metiloquinolin-3-il)oxi]-6-fluorofenil]propan-2-ol, (15.067) (5-bromo-1-(5,6-dimetilpiridina-3-il)-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolina), (15.068) (3-(4,4-difluoro-5,5-dimetil-4,5-dihidrotieno[2,3-c]piridina-7-il)quinolina), (15.069) (1-(4,5-dimetil-1H-benzimidazol-1-il)-4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolina), (15.070) 8-fluoro-3-(5-fluoro-3,3-dimetil-3,4-

dihidroisoquinolin-1-il)quinolona, (15.071) 8-fluoro-3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolona, (15.072) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)-8-fluoroquinolina, (15.073) (N-metil-N-fenil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida), (15.074) metil {4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil}carbamato, (15.075) (N-{4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencil}-ciclopropano-carboxamida), (15.076) N-metil-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)-benzamida, (15.077) N-[(E)-metoxiiminometil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida, (15.078) N-[(Z)-metoxiiminometilo]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida, (15.079) N-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]-ciclopropano-carboxamida, (15.080) N-(2-fluorofenil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida, (15.081) 2,2-difluoro-N-metil-2-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]-acetamida, (15.082) N-alil-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]acetamida, (15.083) N-[(E)-N-metoxi-C-metil-carbonimidoil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-benzamida, (15.084) N-[(Z)-N-metoxi-C-metil-carbonimidoil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida, (15.085) N-alil-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]-propanamida, (15.086) 4,4-dimetil-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]-pirrolidin-2-ona, (15.087) N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-benzenecarboxamida, (15.088) 5-metil-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]pirrolidin-2-ona, (15.089) N-((2,3-difluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil)-3,3,3-trifluoro-propanamida, (15.090) 1-metoxi-1-metil-3-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea, (15.091) 1,1-dietil-3-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea, (15.092) N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]propanamida, (15.093) N-metoxi-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]ciclopropanocarboxamida, (15.094) 1-metoxi-3-metil-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea, (15.095) N-metoxi-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]-ciclopropano-carboxamida, (15.096) N,2-dimetoxi-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]-propanamida, (15.097) N-etil-2-metil-N-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]-propanamida, (15.098) 1-metoxi-3-metil-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]-urea, (15.099) 1,3-dimetoxi-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea, (15.100) 3-etil-1-metoxi-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]urea, (15.101) 1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]piperidin-2-ona, (15.102) 4,4-dimetil-2-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]isooxazolidin-3-ona, (15.103) 5,5-dimetil-2-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]isoxazolidin-3-ona, (15.104) 3,3-dimetil-1-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]-piperidin-2-ona, (15.105) 1-[[3-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]-azepan-2-ona, (15.106) 4,4-dimetil-2-[[4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]isoxazolidin-3-ona, (15.107) 5,5-dimetil-2-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metil]isoxazolidin-3-ona, (15.108) etil 1-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencil]-1H-pirazol-4-carboxilato, (15.109) N,N-dimetil-1-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencil]-1H-1,2,4-triazol-3-amina, (15.110) N-{2,3-difluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencil}butanamida, (15.111) N-(1-metilciclopropil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida, (15.112) N-(2,4-difluorofenil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida, (15.113) 1-(5,6-dimetilpiridina-3-il)-4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolina, (15.114) 1-(6-(difluorometil)-5-metil-piridina-3-il)-4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolina, (15.115) 1-(5-(fluorometil)-6-metil-piridina-3-il)-4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolina, (15.116) 1-(6-(difluorometil)-5-metoxi-piridina-3-il)-4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolina, (15.117) 4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil dimetilcarbarnato, (15.118) N-{4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil}propanamida, (15.119) 3-[2-(1-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-1,5-dihidro-2,4-benzodioxepin-6-il metanosulfonato, (15.120) 9-fluoro-3-[2-(1-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-1,5-dihidro-2,4-benzodioxepin-6-il metanosulfonato, (15.121) 3-[2-(1-[3,5-bis(difluorometilo)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-1,5-dihidro-2,4-benzodioxepin-6-il metanosulfonato, (15.122) 3-[2-(1-[3,5-bis(difluorometilo)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-9-fluoro-1,5-dihidro-2,4-benzodioxepin-6-il metanosulfonato, (15.123) 1-(6,7-dimetilpirazol[1,5-a]piridina-3-il)-4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolina, (15.124) 8-fluoro-N-(4,4,4-trifluoro-2-metil-1-fenilbutan-2-il)quinolina-3-carboxamida, (15.125) 8-fluoro-N-[(2S)-4,4,4-trifluoro-2-metil-1-fenilbutan-2-il]quinolina-3-carboxamida, (15.126) N-(2,4-dimetil-1-fenilpentan-2-il)-8-fluoroquinolina-3-carboxamida y (15.127) N-[(2S)-2,4-dimetil-1-fenilpentan-2-il]-8-fluoroquinolina-3-carboxamida.

Otro aspecto de la presente invención se refiere a una o más de las siguientes combinaciones de compuesto:

(I.01) + (1001), (I.01) + (1002), (I.01) + (1003), (I.01) + (1004), (I.01) + (1005), (I.01) + (1006), (I.01) + (1007), (I.01) + (1008), (I.01) + (1009), (I.01) + (1010), (I.01) + (1011), (I.01) + (1012), (I.01) + (1013), (I.01) + (1014), (I.01) + (1015), (I.01) + (1016), (I.01) + (1017), (I.01) + (1018), (I.01) + (1019), (I.01) + (1020), (I.01) + (1021), (I.01) + (1022), (I.01) + (1023), (I.01) + (1024), (I.01) + (1025), (I.01) + (1026), (I.01) + (1027), (I.01) + (1028), (I.01) + (1029), (I.01) + (1030), (I.01) + (1031), (I.01) + (1032), (I.01) + (1033), (I.01) + (1034), (I.01) + (1035), (I.01) + (1036), (I.01) + (1037), (I.01) + (1038), (I.01) + (1039), (I.01) + (1040), (I.01) + (1041), (I.01) + (1042), (I.01) + (1043), (I.01) + (1044), (I.01) + (1045), (I.01) + (1046), (I.01) + (1047), (I.01) + (1048), (I.01) + (1049), (I.01) + (1050), (I.01) + (1051), (I.01) + (1052), (I.01) + (1053), (I.01) + (1054), (I.01) + (1055), (I.01) + (1056), (I.01) + (1057), (I.01) + (1058), (I.01) + (1059), (I.01) + (1060), (I.01) + (1061), (I.01) + (1062), (I.01) + (1063), (I.01) + (1064), (I.01) + (1065), (I.01) + (1066), (I.01) + (1067), (I.01) + (1068), (I.01) + (1069), (I.01) + (1070), (I.01) + (1071), (I.01) + (1072), (I.01) + (1073), (I.01) + (1074), (I.01) + (1075), (I.01) + (1076), (I.01) + (1077), (I.01) + (1078), (I.01) + (1079), (I.01) + (1080), (I.01) + (1081), (I.01) + (1082), (I.01) + (1083), (I.01) + (1084), (I.01) + (1085), (I.01) + (1086), (I.01) + (1087), (I.01) + (1088), (I.01) + (1089), (I.01) + (1090), (I.01) + (1091),

ES 2 989 675 T3

	(I.01) + (2001), (I.01) + (2002), (I.01) + (2003), (I.01) + (2004), (I.01) + (2005), (I.01) + (2006), (I.01) + (2007),
	(I.01) + (2008), (I.01) + (2009), (I.01) + (2010), (I.01) + (2011), (I.01) + (2012), (I.01) + (2013), (I.01) + (2014),
	(I.01) + (2015), (I.01) + (2016), (I.01) + (2017), (I.01) + (2018), (I.01) + (2019), (I.01) + (2020), (I.01) + (2021),
5	(I.01) + (2022), (I.01) + (2023), (I.01) + (2024), (I.01) + (2025), (I.01) + (2026), (I.01) + (2027), (I.01) + (2028),
	(I.01) + (2029), (I.01) + (2030), (I.01) + (2031), (I.01) + (2032), (I.01) + (2033), (I.01) + (2034), (I.01) + (2035),
	(I.01) + (2036), (I.01) + (2037), (I.01) + (2038), (I.01) + (2039), (I.01) + (2040), (I.01) + (2041), (I.01) + (2042),
	(I.01) + (2043), (I.01) + (2044), (I.01) + (2045), (I.01) + (2046), (I.01) + (2047), (I.01) + (2048), (I.01) + (2049),
	(I.01) + (2050), (I.01) + (2051), (I.01) + (2052), (I.01) + (2053), (I.01) + (2054), (I.01) + (2055), (I.01) + (2056),
	(I.01) + (2057), (I.01) + (2058), (I.01) + (2059), (I.01) + (3001), (I.01) + (3002), (I.01) + (3003), (I.01) + (3004),
10	(I.01) + (3005), (I.01) + (3006), (I.01) + (3007), (I.01) + (3008), (I.01) + (3009), (I.01) + (3010), (I.01) + (3011),
	(I.01) + (3012), (I.01) + (3013), (I.01) + (3014), (I.01) + (3015), (I.01) + (3016), (I.01) + (3017), (I.01) + (3018),
	(I.01) + (3019), (I.01) + (3020), (I.01) + (3021), (I.01) + (3022), (I.01) + (3023), (I.01) + (3024), (I.01) + (3025),
	(I.01) + (3026), (I.01) + (3027), (I.01) + (3028), (I.01) + (3029), (I.01) + (3030), (I.01) + (3031), (I.01) + (4.001),
	(I.01) + (4002), (I.01) + (4003), (I.01) + (4004), (I.01) + (4005), (I.01) + (4006), (I.01) + (4007), (I.01) + (4008),
15	(I.01) + (4009), (I.01) + (4010), (I.01) + (4011), (I.01) + (4012), (I.01) + (4013), (I.01) + (4014), (I.01) + (4015),
	(I.01) + (4016), (I.01) + (4017), (I.01) + (4018), (I.01) + (4019), (I.01) + (4020), (I.01) + (4021), (I.01) + (4022),
	(I.01) + (4023), (I.01) + (4024), (I.01) + (4025), (I.01) + (4026), (I.01) + (5001), (I.01) + (5002), (I.01) + (5003),
	(I.01) + (5004), (I.01) + (5005), (I.01) + (5006), (I.01) + (5007), (I.01) + (5008), (I.01) + (5009), (I.01) + (5010),
	(I.01) + (5011), (I.01) + (5012), (I.01) + (5013), (I.01) + (5014), (I.01) + (5015), (I.01) + (5016), (I.01) + (5017),
20	(I.01) + (5018), (I.01) + (5019), (I.01) + (5020), (I.01) + (5021), (I.01) + (5022), (I.01) + (5023), (I.01) + (6001),
	(I.01) + (6002), (I.01) + (6003), (I.01) + (6004), (I.01) + (7001), (I.01) + (7002), (I.01) + (7003), (I.01) + (7004),
	(I.01) + (7005), (I.01) + (7006), (I.01) + (8001), (I.01) + (9001), (I.01) + (9002), (I.01) + (9003), (I.01) + (9004),
	(I.01) + (9005), (I.01) + (9006), (I.01) + (9007), (I.01) + (9008), (I.01) + (9009), (I.01) + (10.001),
	(I.01) + (10.002), (I.01) + (10003), (I.01) + (11.001), (I.01) + (11.002), (I.01) + (12.001), (I.01) + (12.002),
25	(I.01) + (12.003), (I.01) + (12.004), (I.01) + (13001), (I.01) + (13.002), (I.01) + (13.003), (I.01) + (13.004),
	(I.01) + (13.005), (I.01) + (13.006), (I.01) + (14001), (I.01) + (14.002), (I.01) + (15.001), (I.01) + (15.002),
	(I.01) + (15.003), (I.01) + (15.004), (I.01) + (15.005), (I.01) + (15.006), (I.01) + (15.007), (I.01) + (15.008),
	(I.01) + (15.009), (I.01) + (15.010), (I.01) + (15.011), (I.01) + (15.012), (I.01) + (15.013), (I.01) + (15.014),
	(I.01) + (15.015), (I.01) + (15.016), (I.01) + (15.017), (I.01) + (15.018), (I.01) + (15.019), (I.01) + (15.020),
30	(I.01) + (15.021), (I.01) + (15.022), (I.01) + (15.023), (I.01) + (15.024), (I.01) + (15.025), (I.01) + (15.026),
	(I.01) + (15.027), (I.01) + (15.028), (I.01) + (15.029), (I.01) + (15.030), (I.01) + (15.031), (I.01) + (15.032),
	(I.01) + (15.033), (I.01) + (15.034), (I.01) + (15.035), (I.01) + (15.036), (I.01) + (15.037), (I.01) + (15.038),
	(I.01) + (15.039), (I.01) + (15.040), (I.01) + (15.041), (I.01) + (15.042), (I.01) + (15.043), (I.01) + (15.044),
	(I.01) + (15.045), (I.01) + (15.046), (I.01) + (15.047), (I.01) + (15.048), (I.01) + (15.049), (I.01) + (15.050),
35	(I.01) + (15.051), (I.01) + (15.052), (I.01) + (15.053), (I.01) + (15.054), (I.01) + (15.055), (I.01) + (15.056),
	(I.01) + (15.057), (I.01) + (15.058), (I.01) + (15.059), (I.01) + (15.060), (I.01) + (15.061), (I.01) + (15.062),
	(I.01) + (15.063), (I.01) + (15.064), (I.01) + (15.065), (I.01) + (15.066), (I.01) + (15.067), (I.01) + (15.068),
	(I.01) + (15.069), (I.01) + (15.070), (I.01) + (15.071), (I.01) + (15.072), (I.01) + (15.073), (I.01) + (15.074),
	(I.01) + (15.075), (I.01) + (15.076), (I.01) + (15.077), (I.01) + (15.078), (I.01) + (15.079), (I.01) + (15.080),
40	(I.01) + (15.081), (I.01) + (15.082), (I.01) + (15.083), (I.01) + (15.084), (I.01) + (15.085), (I.01) + (15.086),
	(I.01) + (15.087), (I.01) + (15.088), (I.01) + (15.089), (I.01) + (15.090), (I.01) + (15.091), (I.01) + (15.092),
	(I.01) + (15.093), (I.01) + (15.094), (I.01) + (15.095), (I.01) + (15.096), (I.01) + (15.097), (I.01) + (15.098),
	(I.01) + (15.099), (I.01) + (15.100), (I.01) + (15.101), (I.01) + (15.102), (I.01) + (15.103), (I.01) + (15.104),
	(I.01) + (15.105), (I.01) + (15.106), (I.01) + (15.107), (I.01) + (15.108), (I.01) + (15.109), (I.01) + (15.110),
45	(I.01) + (15.111), (I.01) + (15.112), (I.01) + (15.113), (I.01) + (15.114), (I.01) + (15.115), (I.01) + (15.116),
	(I.01) + (15.117), (I.01) + (15.118), (I.01) + (15.119), (I.01) + (15.120), (I.01) + (15.121), (I.01) + (15.121),
	(I.01) + (15.122), (I.01) + (15.123), (I.01) + (15.125), (I.01) + (15.124), (I.01) + (15.125), (I.01) + (15.126),
	(I.01) + (15.127).

50 En estas combinaciones, el primer componente es un compuesto de la fórmula (I) como se define en la tabla I.1 (p. ej. I.01) y el segundo componente es un fungicida elegido en los grupos 1 a 15 como se define en el presente documento. Por ejemplo, la combinación (I.01) + (1001) se corresponde a una combinación que comprende el compuesto I.01 en la tabla I.1 y ciproconazol (1001).

55 En algunas otras realizaciones, las combinaciones del compuesto se corresponden a las combinaciones descritas arriba donde el compuesto (I.01) se reemplaza con una cualquiera de los compuestos enumerados en la Tabla I.1.

60 Los compuestos de la fórmula (I), y el fungicida seleccionado de los grupos (1) a (15), puede estar presente en una proporción del peso que varía de 100:1 a 1:100 (compuesto de la fórmula (I): fungicida seleccionado a partir de los grupos [1] a [15]), o que varía de 50:1 a 1:50, o que varía de 20:1 a 1:20. Algunos ejemplos adicionales de los rangos de proporción del peso incluyen 95:1 a 1:95, 90:1 a 1:90, 85:1 a 1:85, 80:1 a 1:80, 75:1 a 1:75, 70:1 a 1:70, 65:1 a 1:65, 60:1 a 1:60, 55:1 a 1:55, 45:1 a 1:45, 40:1 a 1:40, 35:1 a 1:35, 30:1 a 1:30, 25:1 a 1:25, 15:1 a 1:15, 10:1 a 1:10, 5:1 a 1:5, 4:1 a 1:4, 3:1 a 1:3, 2:1 a 1:2.

Un fungicida adicional elegido en los grupos 1 a 15 como se define en el presente documento se puede agregar a las combinaciones del compuesto.

Los compuestos de la fórmula (I) y las composiciones que comprenden a estos se pueden combinar con uno o más agentes biológicos de control.

A continuación, se muestran algunos ejemplos de agentes de control biológico que se pueden mezclar con los compuestos de la fórmula (I) y las composiciones que comprenden a estos:

5 (A) Agentes antibacterianos seleccionados del grupo de:

(A1) bacterias, tales como (A1.1) *Bacillus subtilis*, en particular, la cepa QST713/AQ713 (disponible como SERENADE OPTI o SERENADE ASO de Bayer CropScience LP, EE. UU., que posee el n.º de registro de adquisiciones de NRRL B21661 y se describe en la patente de los EE. UU. n.º 6,060,051); (A1.2) *Bacillus amyloliquefaciens*, en particular, la cepa D747 (disponible como Double Nickel™ de Certis, EE. UU., que posee el n.º de registro de adquisiciones de FERM BP-8234 y se divulga en la patente de los EE. UU. n.º 7,094,592); (A1.3) *Bacillus pumilus*, en particular, la cepa BU F-33 (que posee el n.º de registro de adquisiciones de NRRL 50185); (A1.4) la cepa FZB24 de *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* (disponible como Taegro® de Novozymes, EE. UU.); (A1.5) una cepa de *Paenibacillus* sp. que posee el n.º de registro de adquisiciones de NRRL B-50972 o el n.º de registro de adquisiciones de NRRL B-67129 y se describe en la Publicación de Patentes Internacionales n.º de registro de adquisiciones de WO 2016/154297; y

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

(B) Fungicidas seleccionados del grupo de:

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

40 En algunas realizaciones, el agente de control biológico es una cepa de *Bacillus subtilis* o *Bacillus amyloliquefaciens* que produce un compuesto de tipo fengicina o plipastatina, un compuesto tipo iturina y/o un compuesto tipo surfactina. Para ver los antecedentes, consulte el siguiente artículo de revisión: Ongena, M., et al., "Bacillus Lipopeptides: Versatile Weapons for Plant Disease Biocontrol," Trends in Microbiology, vol. 16, n.º 3, marzo de 2008, p. 115-125. Entre las cepas de *Bacillus* capaces de sintetizar lipopéptidos, se incluyen *Bacillus subtilis* QST713 (disponible como SERENADE OPTI o SERENADE ASO de Bayer CropScience LP, EE. UU., que posee el n.º de registro de adquisiciones de NRRL B21661 y se describe en la patente de los EE. UU. n.º 6,060,051), la cepa D747 de *Bacillus amyloliquefaciens* (disponible como Double Nickel™ de Certis, EE. UU., que posee el n.º de registro de adquisiciones de FERM BP-8234 y se divulga en la patente de los EE. UU. n.º 7,094,592); *Bacillus subtilis* MBI600 (disponible como SUBTILEX® de Becker Underwood, EE. UU., n.º de registro de EPA 71840-8); *Bacillus subtilis* Y1336 (disponible como BIOBAC® WP de Bion-Tech, Taiwán, registrado como un fungicida biológico en Taiwán con los números de registro 4764, 5454, 5096 y 5277); *Bacillus amyloliquefaciens*, en particular, la cepa FZB42 (disponible como RHIZOVITAL® de ABiTEP, DE), y *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* FZB24 (disponible en Novozymes Biologicals Inc., Salem, Virginia o Syngenta Crop Protection, LLC, Greensboro, Carolina del Norte como el fungicida TAEGR® o TAEGR® ECO (n.º de registro de EPA70127-5); y

(B2) hongos, por ejemplo: (B2.1) *Coniothyrium minitans*, en particular, la cepa CON/M/91-8 (n.º de registro de adquisiciones DSM-9660; p. ej., Contans® de Bayer); (B2.2) *Metschnikowia fructicola*, en particular, la cepa NRRL Y-30752 (p. ej., Shemer®); (B2.3) *Microsphaeropsis ochracea* (p. ej., Microx® de Prophyta); (B2.5) *Trichoderma* spp., incluida *Trichoderma atroviride*: incluye la cepa SC1 descrita en la Solicitud Internacional

- n. ° PCT/IT2008/000196); (B2.6) la cepa KRL-AG2 de *Trichoderma harzianum rifai* (también conocida como cepa T-22, /ATCC 208479, p. ej., PLANTSHIELD T-22G, Rootshield®, y TurfShield de BioWorks, EE. UU.); (B2.14) *Gliocladium roseum*, cepa 321U de W.F. Stoneman Company LLC; (B2.35) *Talaromyces flavus*, cepa V117b; (B2.36) *Trichoderma asperellum*, cepa ICC 012 de Isagro; (B2.37) *Trichoderma asperellum*, cepa SKT-1 (p. ej., ECO-HOPE® de Kumiai Chemical Industry); (B2.38) *Trichoderma atroviride*, cepa CNCM I-1237 (p. ej., Esquive® WP de Agrauxine, FR); (B2.39) *Trichoderma atroviride*, cepa n. ° V08/002387; (B2.40) *Trichoderma atroviride*, cepa NMI n. ° V08/002388; (B2.41) *Trichoderma atroviride*, cepa NMI n. ° V08/002389; (B2.42) *Trichoderma atroviride*, cepa NMI n. ° V08/002390; (B2.43) *Trichoderma atroviride*, cepa n. ° LC52 (p. ej., Tenet por Agrimm Technologies Limited); (B2.44) *Trichoderma atroviride*, cepa ATCC 20476 (IMI 206040); (B2.45) *Trichoderma atroviride*, cepa T11 (IMI352941/CECT20498); (B2.46) *Trichoderma harzianum*; (B2.47) *Trichoderma harzianum*; (B2.48) *Trichoderma harzianum rifai* T39 (p. ej., Trichodex® de Makhteshim, EE. UU.); (B2.49) *Trichoderma harzianum*, en particular, la cepa KD (p. ej., Trichoplus de Biological Control Products, SA (adquirido por Becker Underwood)); (B2.50) *Trichoderma harzianum*, cepa ITEM 908 (p. ej., Trianum-P from Koppert); (B2.51) *Trichoderma harzianum*, cepa TH35 (p. ej., Root-Pro por Mycontrol); (B2.52) *Trichoderma virens* (también se conoce como *Gliocladium virens*), en particular la cepa GL-21 (p. ej., SoilGard 12G por Certis, EE. UU.); (B2.53) *Trichoderma viride*, cepa TV1 (p. ej., Trianum-P por Koppert); (B2.54) *Ampelomyces quisqualis*, en particular, la cepa AQ 10 (p. ej., AQ 10® por IntrachemBio Italia); (B2.56) *Aureobasidium pullulans*, en particular, las blastosporas de la cepa DSM 14940; (B2.57) *Aureobasidium pullulans*, en particular, las blastosporas de la cepa DSM 14941; (B2.58) *Aureobasidium pullulans*, en particular, las mezclas de blastosporas de las cepas DSM 14940 y DSM 14941 (p. ej., Botector® por bio-ferm, CH); (B2.64) *Cladosporium cladosporioides*, cepa H39 (por Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek); (B2.69) *Gliocladium catenulatum* (sinónimo: *Clonostachys rosea f. catenulate*), cepa J1446 (p. ej., Prestop ® *Clonostachys rosea f. catenulate* por AgBio Inc. y Primastop® por Kemira Agro Oy); (B2.70) *Lecanicillium lecanii* (anteriormente conocida como *Verticillium lecanii*) conidia de la cepa KV01 (p. ej., Vertalec® por Koppert/Arysta); (B2.71) *Penicillium vermiculatum*; (B2.72) *Pichia anomala*, cepa WRL-076 (NRRL Y-30842); (B2.75) *Trichoderma atroviride*, cepa SKT-1 (FERM P-16510); (B2.76) *Trichoderma atroviride*, cepa SKT-2 (FERM P-16511); (B2.77) *Trichoderma atroviride*, cepa SKT-3 (FERM P-17021); (B2.78) *Trichoderma gamsii* (anteriormente conocida como *T. viride*), cepa ICC080 (IMI CC 392151 CABI, p. ej., BioDerma por AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V.); (B2.79) *Trichoderma harzianum*, cepa DB 103 (p. ej., T-Gro 7456 por Dagut Biolab); (B2.80) *Trichoderma polysporum*, cepa IMI 206039 (p. ej., Binab TF WP por BINAB Bio-Innovation AB, Suecia); (B2.81) *Trichoderma stromaticum* (p. ej., Tricovab por Ceplac, Brasil); (B2.83) *Ulocladium oudemansii*, en particular, la cepa HRU3 (p. ej., Botry-Zen® por Botry-Zen Ltd, NZ); (B2.84) *Verticillium albo-atrum* (anteriormente conocida como *V. dahliae*), cepa WCS850 (CBS 276.92; p. ej., Dutch Trig por Tree Care Innovations); (B2.86) *Verticillium chlamydosporium*; (B2.87) mezclas de la cepa ICC 012 de *Trichoderma asperellum* y la cepa ICC 080 de *Trichoderma gamsii* (producto conocido [por ejemplo] como BIO-TAM™ de Bayer CropScience LP, EE. UU.).

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

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

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

los virus seleccionados del grupo que consiste en *Adoxophyes orana* (tortrix de fruta de verano), virus de granulosis (GV) *Cydia pomonella* (polilla), virus de la poliedrosis nuclear (VPN) *Helicoverpa armigera* (gusano de algodón), mNPV *Spodoptera exigua* (gusano ejército de remolacha), mNPV *Spodoptera frugiperda* (gusano del ejército de otoño) y NPV *Spodoptera littoralis* (gusano de la hoja de algodón africano).

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

- extractos vegetales y productos formados por microorganismos incluidos proteínas y metabolitos secundarios que pueden usarse como agentes de control biológico, tales como *Allium sativum*, *Artemisia absinthium*, azadirachtin, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, quitina, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (*Chenopodium quinoa* extracto de saponina), *Pyrethrum/Pyrethrins*, *Quassia amara*, *Quercus*, *Quillaja*, Regalia, "Requiem™ Insecticide", rotenona, *ryanialtrianodina*, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*, timol, Triact 70, TriCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, Veratrin, *Viscum album*, extracto de *Brassicaceae*, en particular colza oleaginosa en polvo o mostaza en polvo.
- 5 Ejemplos de insecticidas, acaricidas y nematicidas, respectivamente, que podrían mezclarse con los compuestos de la fórmula (I) y las composiciones que comprenden a estos son:
- 10 (1) Inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE) tales como, por ejemplo, carbamatos, por ejemplo, alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbaril, carbofurán, carbosulfán, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomil, metolcarb, oxamil, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; u organofosfatos, por ejemplo,
- 15 acefato, azametifós, azinfós-etilo, azinfós-metilo, cadusafós, cloretoxifós, clorfenvinfós, clormefós, clorpirifós-metilo, coumafós, cianofós, demetón-S-metilo, diazinón, diclorvós/DDVP, dicrotofós, dimetoato, dimetilvinfós, disulfotón, EPN, etión, etoprofós, fanfur, fenamidós, fenitrotión, fentión, fostiazato, heptenofós, imiciafós, isofenofós, O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo, isoxatión, malatión, mecarbam, metamidofós, metidatión, mevinfós, monocrotofós, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratión-metilo, fentoato, forato,
- 20 fosalona, fosmet, fosfamidón, foxim, pirimifós-metilo, profenofós, propetanfós, protiofós, piraclofós, piridafentión, quinalfós, sulfotep, tebupirimfós, temefós, terbufós, tetraclovrinfós, tiometón, triazofós, triclorfón y vamidotión.
- (2) Bloqueadores del canal de cloruro regulados por GABA tales como, por ejemplo, ciclodieno-organoclorados, por ejemplo, clordano y endosulfán o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo, etiprol y fipronil.
- 25 (3) Moduladores del canal de sodio tales como, por ejemplo, piretroides, p. ej., acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, isómero de bioaletrina S-ciclopentenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, teta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [isómero (1R)-trans], deltametrina, empentrina [isómero (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato,
- 30 flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kadetrina, momfluorotrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, piretrinas (piretro), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [isómero (1R)], tralometrina y transflutrina o DDT o metoxicloro.
- (4) Moduladores competitivos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) tales como, p. ej., neonicotinoides, p. ej., acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflor o flupiradifurona.
- 35 (5) Moduladores alostéricos del receptor nicotínico de acetilcolina (nAChR) tales como, por ejemplo, espinosinas, p. ej., espinetoram y espinosad.
- (6) Moduladores alostéricos del canal de cloruro regulados por glutamato (GluCl) tales como, por ejemplo, abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.
- 40 (7) Imitadores de la hormona juvenil tales como, por ejemplo, análogos de la hormona juvenil, p. ej., hidropreno, kinopreno y metopreno o fenoxicarb o piriproxifeno.
- (8) Inhibidores misceláneos no específicos (multisitio), tales como, por ejemplo, haluros de alquilo, p. ej., bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o cloropicrina o fluoruro de sulfuro o bórax o tártaro emético o generadores de isocianato de metilo, p. ej., diazomet y metam.
- 45 (9) Moduladores de órganos cordotonaes tales como, por ejemplo, pimetrozina o flonicamida.
- (10) Inhibidores de crecimiento de ácaros, tales como, por ejemplo, clofentezina, hexitiazox y diflovidazina o etoxazol.
- 50 (11) Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insectos, tales como, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* subespecies *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecies *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespecies *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subespecies *tenebrionis*, y las proteínas vegetales de *B.t.*: Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/35Ab1.
- (12) Inhibidores de la ATP sintasa mitocondrial, tales como, disruptores de ATP tales como, por ejemplo, diafentiurón o compuestos de organoestaño, por ejemplo, azociclotina, cihexatina y óxido de fenbutatina, o propargita o tetradifón.

- (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa a través de la disrupción del gradiente protónico tales como, por ejemplo, clorfenapir, DNOC y sulfluramida.
- (14) Bloqueadores del canal de receptores nicotínicos de acetilcolina tales como, por ejemplo, cartap clorhidrato, tiociclam y tiosultap-sodio.
- 5 (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0 tales como, por ejemplo, clorfluazurón, diflubenzurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, teflubenzurón y triflumurón.
- (16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, por ejemplo, buprofezina.
- (17) Disruptores de la muda (en particular para Diptera, es decir, dípteros), tales como, por ejemplo, ciromazina.
- 10 (18) Agonistas del receptor de ecdisona tales como, por ejemplo, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.
- (19) Agonistas del receptor de octopamina, tales como, por ejemplo, amitraz.
- (20) Inhibidores del transporte de electrones mitocondrial por el complejo III, tales como, por ejemplo, hidrametilnona o acequinocil o fluacipirim.
- 15 (21) Inhibidores del transporte de electrones mitocondrial por el complejo I tales como, por ejemplo, del grupo de acaricidas METI, p. ej., fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona (Derris).
- (22) Bloqueadores del canal de sodio dependientes del voltaje tales como, por ejemplo, indoxacarb o metaflumizona.
- 20 (23) Inhibidores de acetil-CoA carboxilasa tales como, por ejemplo, derivados del ácido tetrónico y tetrámico, p. ej., espirodiclofeno, espiromesifeno y espirotetramato.
- (24) Inhibidores del transporte de electrones mitocondrial por el complejo IV tales como, por ejemplo, fosfinas, p. ej., fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de zinc o cianuros, p. ej., cianuro de calcio, cianuro de potasio y cianuro de sodio.
- 25 (25) Inhibidores del transporte de electrones mitocondrial por el complejo II tales como, por ejemplo, derivados de *beta*-cetonitrilo, p. ej., cienopirafeno y ciflometofeno y carboxanilidas, tales como, por ejemplo, piflubumida.
- (28) Moduladores del receptor de rianodina tales como, por ejemplo, diamidas, p. ej., clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida,
- Los compuestos activos adicionales tal como, por ejemplo, afidopiropeno, afoxolaner, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, broflanilida, bromopropilato, chinometionato, cloropraletina, crioliti, ciclaniliprol, cicloxaprida, cihalodiamida, dicloromezotiaz, dicofol, dimpropiridaz, epsilon-metoflutrina, epsilon momflutrina, flometoquinina, fluazaindolizina, fluensulfona, flufenerim, flufenoxistrobina, flufiprole, fluhexafon, fluopiram, fluralaner, fluxametamida, fufenozida, guadipir, heptaflutrina, imidacloz, iprodiona, kappa bifentrina, kappa teflutarina, lotilaner, meperflutrina, paichongding, piridalil, pirifluquinazon, piriminostrobina, spirobuciclofeno, tetrametilflutrina, tetraniliprol, tetraclorantraniliprole, tigolaner, tiofluoquinazone, triflumezopirim e iodometano; además preparaciones con base en *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), y también los siguientes compuestos:
- 30 1-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocido por WO2006/043635) (CAS 885026-50-6), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluorospiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il]}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocido por WO2003/106457) (CAS 637360-23-7),
- 40 2-cloro-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il}-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocido por WO2006/003494) (CAS 872999-66-1), 3-(4-cloro-2,6-dimetilofenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-2-ona (conocido por WO 2010052161) (CAS 1225292-17-0), 3-(4-cloro-2,6-dimetilofenil)-8-metoxi-2-oxo-1,carbonato de etilo 8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-4-il (conocido por EP2647626) (CAS 1440516-42-6), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilopiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocido por WO2004/099160) (CAS 792914-58-0), PF1364 (conocido por JP2010/018586) (CAS 1204776-60-2), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridina-3-il)metil]piridina-2(1H)-ilideno]-2,2,2-trifluoroacetamida (conocido por WO2012/029672) (CAS 1363400-41-2), (3E)-3-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridilideno]-1,1,1-trifluoro-propan-2-ona (conocido por WO2013/144213) (CAS 1461743-15-6), N-[3-(bencilcarbamoil)-4-clorofenil]-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocido por WO2010/051926) (CAS 1226889-14-0), 5-bromo-4-cloro-N-[4-cloro-2-metil-6-(metilcarbamoil)fenil]-2-(3-cloro-2-piridil)pirazol-3-carboxamida (conocido por CN103232431) (CAS 1449220-44-3), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(*cis*-1-óxido-3-tietanil)-benzamida, 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(*trans*-1-óxido-3-tietanil)-benzamida y 4-[(5S)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-2-metil-N-(*cis*-1-óxido-3-tietanil)benzamida (conocido por

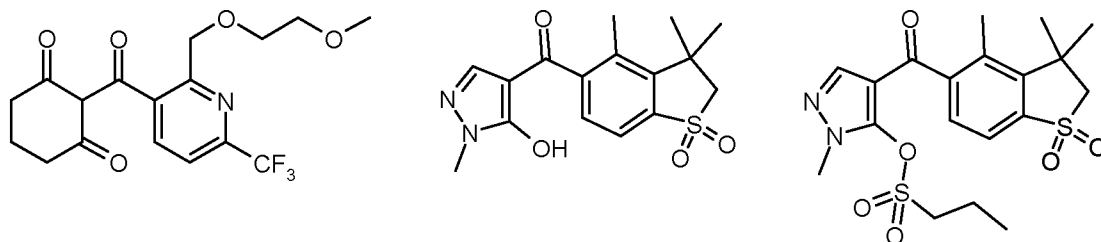
WO 2013/050317 A1) (CAS 1332628-83-7), *N*-[3-cloro-1-(3-piridinail)-1*H*-pirazol-4-il]-*N*-etilo-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]-propanamida, (+)-*N*-[3-cloro-1-(3-piridinail)-1*H*-pirazol-4-il]-*N*-etilo-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]-propanamida y (-)-*N*-[3-cloro-1-(3-piridinail)-1*H*-pirazol-4-il]-*N*-etilo-3-[(3,3,3-trifluoropropil)sulfinil]-propanamida (conocido por WO 2013/162715 A2, WO 2013/162716 A2, US 2014/0213448 A1) (CAS 1477923-37-7), 5-[[*(2E)*-3-cloro-2-propen-1-il]amino]-1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-4-[(trifluorometil)sulfinil]-1*H*-pirazol-3-carbonitrilo (conocido por CN 101337937 A) (CAS 1105672-77-2), 3-bromo-*N*-[4-cloro-2-metil-6-[(metiloamino)tioxometil]fenil]-1-(3-cloro-2-piridinail)-1*H*-pirazol-5-carboxamida, (Liudaibenjiaxuanan, conocido por CN 103109816 A) (CAS 1232543-85-9); *N*-[4-cloro-2-[[*(1,1*-dimetiloetil)amino]carbonil]-6-metilofenil]-1-(3-cloro-2-piridinail)-3-(fluorometoxi)-1*H*-pirazol-5-carboxamida (conocido por WO 2012/034403 A1) (CAS 1268277-22-0), *N*-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilofenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinail)-1*H*-pirazol-5-carboxamida (conocido por WO 2011/085575 A1) (CAS 1233882-22-8), 4-[3-[2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloro-2-propen-1-il)oxi]fenoxi]propoxi]-2-metoxi-6-(trifluorometilo)-pirimidina (conocido por CN 101337940 A) (CAS 1108184-52-6); (*2E*)- y 2(*Z*)-2-[2-(4-cianofenil)-1-[3-(trifluorometilo)fenil]etilideno]-*N*-[4-(difluorometoxi)fenil]-hidrazinocarboxamida (conocido por CN 101715774 A) (CAS 1232543-85-9); 3-(2,2-dicloroetil)-2,2-dimetil-4-(1*H*-benzimidazol-2-il)éster de ácido fenil-ciclopropanocarboxílico (conocido por CN 103524422 A) (CAS 1542271-46-4); (4*aS*)-7-cloro-2,5-dihidro-2-[[*(metoxicarbonil)*4-[(trifluorometil)tio]fenil]amino]carbonil]-indeno[1,2-*e*][1,3,4]oxadiazina-4*a*(3*H*)-éster de metilo de ácido carboxílico (conocido por CN 102391261 A) (CAS 1370358-69-2); 6-deoxi-3-*O*-etilo-2,4-di-*O*-metil-, 1-[*N*-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-pentafluoroetoxi)fenil]-1*H*-1,2,4-triazol-3-il]fenil]carbamato]- α -L-manopiranososa (conocido por US 2014/0275503 A1) (CAS 1181213-14-8); 8-(2-ciclopropilometoxi-4-trifluorometilo-fenoxi)-3-(6-trifluorometilo-piridazin-3-il)-3-aza-biciclo[3,2,1]octano (CAS 1253850-56-4), (8-*anti*)-8-(2-ciclopropilometoxi-4-trifluorometilo-fenoxi)-3-(6-trifluorometilo-piridazin-3-il)-3-aza-biciclo[3,2,1]octano (CAS 933798-27-7), (8-*sin*)-8-(2-ciclopropilometoxi-4-trifluorometilo-fenoxi)-3-(6-trifluorometilo-piridazin-3-il)-3-aza-biciclo[3,2,1]octano (conocido por WO 2007040280 A1, WO 2007040282 A1) (CAS 934001-66-8), *N*-[3-cloro-1-(3-piridinail)-1*H*-pirazol-4-il]-*N*-etilo-3-[(3,3,3-trifluoropropil)tio]-propanamida (conocido por WO 2015/058021 A1, WO 2015/058028 A1) (CAS 1477919-27-9) y *N*-[4-(aminotioxometil)-2-metil-6-[(metiloamino)carbonil]fenil]-3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinail)-1*H*-pirazol-5-carboxamida (conocido por CN 103265527 A) (CAS 1452877-50-7), 5-(1,3-dioxan-2-il)-4-[[4-(trifluorometil)fenil]metoxi]-pirimidina (conocido por WO 2013/115391 A1) (CAS 1449021-97-9), 3-(4-cloro-2,6-dimetilofenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1-metil-1,8-diazaspiro[4,5]dec-3-en-2-ona (conocido por WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-34-0), 3-(4-cloro-2,6-dimetilofenil)-8-metoxi-1-metil-1,8-diazaspiro[4,5]decane-2,4-diona (conocido por WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8), 3-(4-cloro-2,6-dimetilofenil)-8-metoxi-1-metil-2-oxo-1,8-diazaspiro[4,5]éster de etilo de ácido dec-3-en-4-il-carbónico (conocido por WO 2010/066780 A1, WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-00-0), *N*-[1-[(6-cloro-3-piridinail)metil]-2(1*H*)-piridinailideno]-2,2,2-trifluoro-acetamida (conocido por DE 3639877 A1, WO 2012029672 A1) (CAS 1363400-41-2), [*N(E)*]-*N*-[1-[(6-cloro-3-piridinail)metil]-2(1*H*)-piridinailideno]-2,2,2-trifluoro-acetamida, (conocido por WO 2016005276 A1) (CAS 1689566-03-7), [*N(Z)*]-*N*-[1-[(6-cloro-3-piridinail)metil]-2(1*H*)-piridinailideno]-2,2,2-trifluoro-acetamida, (CAS 1702305-40-5), 3-*endo*-3-[2-propoxi-4-(trifluorometil)fenoxi]-9-[[5-(trifluorometil)-2-piridinail]oxi]-9-azabicyclo[3,3,1]nonano (conocido por WO 2011/105506 A1, WO 2016/133011 A1) (CAS 1332838-17-1).

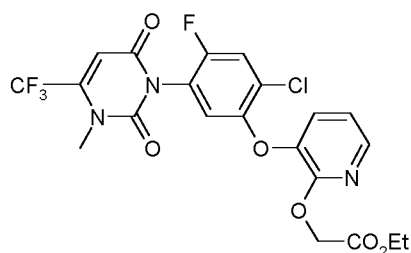
Ejemplos de protectores que podrían mezclarse con los compuestos de la fórmula (I) y las composiciones que comprenden a estos son, por ejemplo, benoxacor, cloquintocet (-mexilo), ciometrinilo, ciprosulfamida, diclormid, fenclorazol (-etilo), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifeno (-etilo),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

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

Acetoclor, acifluorfenó, acifluorfenó-sodio, aclonifeno, alaclor, alidoclor, aloxidim, aloxidim-sodio, ametrina, amicarbazona, amidocloro, amidosulfuron, ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metilofenil)-5-fluoropiridina-2-carboxílico, aminociclopiracloro, aminociclopiraclor-potasio, aminociclopiraclor-metilo, aminopirralida, amitrol, sulfamato de amonio, anilofos, asulam, atrazina, azafenidina, azimsulfurona, beflubutamida, benazolina, benazolinaetil, benfluralina, benfuresato, bensulfuron, bensulfuron-metilo, bensulide, bentazona, benzobiciclona, benzofenap, biciclopirona, bifenox, bilanafos, bilanafos-sodio, bispiribac, bispiribac-sodio, bromacil, bromobutida, bromofenoxim, bromoxinil, bromoxinil-butilato, -potasio, -heptanoato y -octanoato, busoxinona, butacloro, butafenacilo, butamifos, butenaclo, butralina, butoxidim, butilato, cafenstrol, carbetamida, carfentrazona, carfentrazona-etilo, clorambeno, clorbromurona, clorfenac, clorfenac-sodio, clorfenprop, clorflurenol, clorflurenol-metilo, cloridazona, clorimurón, clorimurón-etilo, clorofitalim, clorotolurón, clortal-dimetilo, clorsulfurón, cinidon, cinidon-etilo, cinmetiloina, cinosulfurón, clacifos, cletodim, clodinafop, clodinafop-propargilo, clomazona, clomeprop, clopiralid, cloransulam, cloransulam-metilo, cumilurón, cianamida, cianazina, cicloato, ciclopirimorato, ciclosulfamurón, cicloxidim, cihalofop, cihalofop-butilo, ciprozina, 2,4-D, 2,4-D-butotil, -butilo, -dimetiloammonium, -diolamin, -etilo, -2-etilohexil, -isobutilo, -isooctil, -isopropiloammonio, -potasio, -triisopropanolammonio, y -trolamina, 2,4-DB, 2,4-DB-butilo, -dimetiloammonio, -isooctil, -potasio, y -sodio, daimuron (dimron), dalapon, dazomet, n-decanol,

desmedifam, detosil-pirazolate (DTP), dicamba, dichlobenil, 2-(2,4-diclorobencil)-4,4-dimetil-1,2-oxazolidin-3-ona, 2-(2,5-diclorobencil)-4,4-dimetil-1,2-oxazolidin-3-ona, dichlorprop, dichlorprop-P, diclofop, diclofop-metilo, diclofop-P-metilo, diclosulam, difenzoquat, diflufenican, diflufenzopir, diflufenzopir-sodio, dimefurón, dimepiperato, dimetacloro, dimetametrin, dimetenamida, dimetenamida-P, dimetrasulfurón, dinitramina, dinoterb, difenamid, diquat, diquat-dibromid, ditiopir, diuron, DNOC, endotal, EPTC, esprocab, etalfuralin, etametsulfurón, etametsulfurón-metilo, etiozin, etofumesato, etoxifen, etoxifen-etilo, etoxisulfurón, etobenzanida, F-9600, F-5231, es decir, N-[2-cloro-4-fluoro-5-[4-(3-fluoropropil)-5-oxo-4,5-dihidro-1H-tetrazol-1-il]fenil]etanosulfonamida, F-7967, es decir, 3-[7-cloro-5-fluoro-2-(trifluorometil)-1H-benzimidazol-4-il]-1-metil-6-(trifluorometil)pirimidina-2,4(1H,3H)-diona, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fenoxaprop-etilo, fenoxaprop-P-etilo, fenoxasulfona, fenquintotrina, fentrazamida, flamprop, flamprop-M-isopropilo, flamprop-M-metilo, flazasulfurón, florasulam, fluazifop, fluazifop-P, fluazifop-butilo, fluazifop-P-butilo, flucarbazona, flucarbazona-sodio, flucetosulfurón, flucoralin, flufenacet, flufenpir, flufenpir-etilo, flumetsulam, flumiclorac, flumiclorac-pentil, flumioxazin, flumometuron, flurenol, flurenol-butilo, -dimetiloamonio y -metilo, fluoroglicofen, fluoroglicofen-etilo, flupropanat, flupirsulfurón, flupirsulfurón-metilo-sodio, fluridona, flurocloridona, fluroxipir, fluroxipir-meptil, flurtamona, flutiacet, flutiacet-metilo, fomesafeno, fomesafeno-sodio, foramsulfurón, fosamina, glufosinato, glufosinato-amonio, P-glufosinato-sodio, P-glufosinato-amonio, P-glufosinato-sodio, glifosato, glifosato-amonio, -isopropiloamonio, -diamonio, -dimetiloamonio, -potasio, -sodio, y -trimesio, H-9201, es decir, O-(2,4-dimetil-6-nitrofenil) O-etil isopropilofosforamidotoiato, halauxifeno, halauxifeno-metilo, halosafen, halosulfurón, halosulfurón-metilo, haloxifop, haloxifop-P, haloxifop-etoxietilo, haloxifop-P-etoxietilo, haloxifop-metilo, haloxifop-P-metilo, hexazinona, HW-02, es decir, 1-(dimetoxifosforil) etil-(2,4-diclorofenoxi)acetato, imazametabenz, imazametabenz-metilo, imazamox, imazamox-amonio, imazapic, imazapic-amonio, imazapir, imazapir-isopropiloamonio, imazaquina, imazaquina-amonio, imazetapir, imazetapir-imonio, imazosulfurón, indanofan, indaziflam, yodosulfurón, yodosulfurón-metilo-sodio, ioxinilo, ioxinilo-octanoato, -potasio y -sodio, ipencarbazona, isoproturon, isouron, isoxaben, isoxaflutol, karbutilata, KUH-043, s decir, 3-([5-(difluorometilo)-1-metilo-3-(trifluorometilo)-1H-pirazol-4-il]metilo)sulfonil)-5,5-dimetilo-4,5-dihidro-1,2-oxazol, ketospiradox, lactofen, lenacil, linuron, MCPA, MCPA-butotil, -dimetiloamonio, -2-etilohexil, -isopropiloamonio, -potasio y -sodio, MCPB, MCPB-metilo, -etilo y -sodio, mecoprop, mecoprop-sodio y -butotilo, mecoprop-P, mecoprop-P-butotilo, -dimetiloamonio, -2-etil-hexilo, y -potasio, mefenacet, mefluidida, mesosulfurón, mesosulfurón-metilo, mesotriona, metabenzotiazurón, metam, metamifop, metamitron, metazacloro, metazosulfuron, metabenzotiazurón, metiopsulfuron, metiozolina, isotiocianato de metilo, metobromurón, metolacloro, S-metolacloro, metosulam, metoxurón, metribuzina, metsulfurón, metsulfurón-metilo, molinat, monolinurón, monosulfurón, monosulfurón-éster, MT-5950, es decir, N-(3-cloro-4-isopropilofenil)-2-metil-pentanamida, NGGC-011, napropamida, NC-310, es decir, [5-(benciloxi)-1-metilo-1H-pirazol-4-il](2,4-diclorofenil)metanona, neburón, nicosulfurón, ácido nonanoico (ácido pelargónico), norflurazona, ácido oleico (ácidos grasos), orbencarb, ortosulfamurón, orizalina, oxadiargilo, oxadiazona, oxasulfurón, oxaziclomefona, oxifluorfono, paraquat, paraquat dicloruro, pebulato, pendimetalina, penoxsulam, pentaclorofenol, pentoxazona, petoxamid, aceites de petróleo, fenmedifam, picloram picolinafeno, pinoxaden, piperfos, pretiacloro, primisulfurón, primisulfurón-metilo, prodiamina, profoxidim, prometon, prometrina, propacloro, propanilo, propaquizafop, propazina, profam, propisocloro, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sodio, propirisulfurón, propizamida, prosulfocarb, prosulfurón, piracilonil, pirafufen, pirafufen-etilo, pirasulfotela, pirazolinato (pirazolato), pirazosulfurón, pirazosulfurón-etilo, pirazoxifeno, piribambenz, piribambenz-isopropilo, piribambenz-propilo, piribenzoxima, piributicarb, piridafol, piridato, piriftalida, piriminobac, piriminobac-metilo, pirimisulfano, piritiobac, piritiobac-sodio, piroxasulfona, piroxsulam, quinclocorac, quinmerac, quinoclamina, quizalofof, quizalofof-etilo, quizalofof-P, quizalofof-P-etilo, quizalofof-P-tefuril, rimsulfurón, saflufenacilo, setoxidim, sidurón, simazina, simetrina, SL-261, sulcotriona, sulfentrazona, sulfometurón, sulfometurón-metilo, sulfosulfurón, SYN-523, SYP-249, es decir, 1-etoxi-3-metil-1-oxobut-3-en-2-il 5-[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]-2-nitrobenzoato, SYP-300, es decir, 1-[7-fluoro-3-oxo-4-(prop-2-in-1-il)-3,4-dihidro-2H-1,4-benzoxazin-6-il]-3-propil-2-tioximidazolidina-4,5-diona, 2,3,6-TBA, TCA (ácido tricloroacético), TCA-sodio, tebutiurón, tefuriltriona, tembotriona, tepraloxidim, terbacilo, terbucarb, terbumetona, terbutilazin, terbutrin, tenilchlor, tiazopir, tiencarbazona, tiencarbazona-metilo, tifensulfuron, tifensulfuron-metilo, tiobencarb, tiafenacilo, tolpiralato, topamezona, tralkoxidim, triafamona, trialato, triasulfurón, triaziflam, tribenurón, tribenurón-metilo, triclopír, trietazina, trifloxisulfurón, trifloxisulfurón-sodio, trifludimoxazina, trifluralina, triflusulfurón, triflusulfurón-metilo, tritosulfurón, sulfato de urea, vernolato, XDE-848, ZJ-0862, es decir, 3,4-dicloro-N-{2-[(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)oxi]bencil}anilina, y los siguientes compuestos:





Ejemplos de reguladores del crecimiento vegetal son:

acibenzolar, acibenzolar-S-metilo, ácido 5-aminolevulínico, ancimidol, 6-bencilaminopurina, brasinolida, catequina, cloruro de cloromequat, cloprop, ciclanilida, ácido 3-(cicloprop-1-enil)propiónico, daminozida, dazomet, n-decanol, diquegulac, diquegulac-sodio, endotal, endotal-dipotasio, -disodio, y -mono(N,N-dimetilalquilamonio), etefón, flumetralina, flurenol, flurenol-butilo, flurprimidol, forclorfenurón, ácido giberélico, inabenfida, ácido indol-3-acético (IAA), ácido 4-indol-3-ilbutírico, isoprotiolano, probenazol, ácido jasmónico, hidrazida maleica, cloruro de mepiquat, 1-metilciclopropeno, jasmonato de metilo, 2-(1-naftil)acetamida, ácido 1-naftilacético, ácido 2-naftiloxiacético, mezcla de nitrofenolato, paclobutrazol, N-(2-feniletíl)-beta-alanina, ácido N-fenilftalámico, prohexadiona, prohexadiona-calcio, prohidrojasmona, ácido salicílico, estrigolactona, tecnazeno, tidiazurón, triacantanol, trinexapac, trinexapac-etilo, tsitodef, uniconazol, uniconazol-P.

Métodos y usos

Los compuestos de la fórmula (I) y las composiciones que comprenden a estos tienen una actividad microbicida potente. Pueden usarse para controlar microorganismos indeseados, tales como hongos y bacterias no deseados. Pueden ser particularmente útiles en la protección de cultivos (controlan microorganismos que causan enfermedades en las plantas) o para proteger materiales (p. ej., materiales industriales, madera, mercancías en almacenamiento) como se describe en mayor detalle más adelante en el presente documento. Más específicamente, los compuestos de la fórmula (I) y las composiciones que comprenden a estos pueden usarse para proteger de microorganismos indeseados a semillas, semillas en germinación, plántulas que ya emergieron, plantas, partes de plantas, frutos, bienes de cosecha y/o el suelo en el cual se cultivan las plantas.

Control o controlar como se usa en el presente documento abarca el tratamiento protector, curativo y dirigido a la erradicación de microorganismos indeseados. Microorganismos indeseados pueden ser bacterias patógenas, virus patógenos, oomicetos patógenos u hongos patógenos, más específicamente bacterias fitopatógenas, virus fitopatógenos, oomicetos fitopatógenos u hongos fitopatógenos. Como se detalla más adelante en el presente documento, estos microorganismos fitopatógenos son los agentes causales de un amplio espectro de enfermedades de las plantas.

Más específicamente, los compuestos de la fórmula (I) y las composiciones que comprenden a estos pueden usarse como fungicidas. Para el propósito de la memoria descriptiva, el término "fungicida" se refiere a un compuesto o composición que puede usarse en la protección de cultivos para el control de hongos indeseados, tales como plasmodioforomicetos, quitridiomicetos, zigomicetos, ascomicetos, basidiomicetos y deuteromicetos y/o para el control de oomicetos; más preferentemente para el control de los basidiomicetos (que provocan la enfermedad de la roya).

La presente invención también se refiere a un procedimiento para controlar microorganismos indeseados en plantas, tales como hongos, oomicetos y bacterias fitopatógenas, que comprende la etapa de aplicar al menos un compuesto de la fórmula (I), o al menos una composición que contenga a este, a los microorganismos y/o su hábitat (a las plantas, partes de plantas, semillas, frutos o al suelo en el cual crecen las plantas).

Típicamente, cuando el compuesto y la composición de la invención se emplean en procedimientos curativos o protectores para controlar hongos fitopatógenos y/u oomicetos fitopatógenos, se aplica una cantidad de estos que es eficaz y compatible para la planta a las plantas, partes de plantas, frutos, semillas o al suelo o los sustratos en los cuales crecen las plantas. Los sustratos adecuados que pueden usarse para cultivar plantas incluyen sustratos inorgánicos, tales como lana mineral, en particular lana de roca, perlita, arena o grava; sustratos orgánicos, tales como turba, corteza o aserrín de pino; y sustratos a base de petróleo tales como espumas poliméricas o perlas plásticas. Cantidad eficaz y compatible para la planta significa una cantidad que es suficiente para controlar o destruir los hongos presentes o que podrían aparecer en las tierras de cultivo, y que no implica ningún síntoma apreciable de fitotoxicidad para dichos cultivos. Tal cantidad puede variar dentro de una amplia gama, dependiendo del hongo por controlar, el tipo de cultivo, la etapa de crecimiento del cultivo, las condiciones climáticas y el respectivo compuesto o composición de la invención usados. Esta cantidad puede determinarse mediante pruebas de campo sistemáticas que están dentro de las capacidades de una persona experta en la materia.

Plantas y partes de plantas

Los compuestos de fórmula (I) y las composiciones que comprenden a estos pueden aplicarse a cualquier planta o partes de planta.

- 5 Plantas significa todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas e indeseadas o plantas de cultivo (incluidas las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos convencionales de mejoramiento y optimización, o mediante procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, incluidas las plantas genéticamente modificadas (plantas OMG o transgénicas) y cultivares de plantas que pueden estar protegidas o no protegidas por derechos de los obtentores.
- 10 Se entiende que las partes de las plantas comprenden todas las partes y órganos de las plantas que se encuentran por encima y por debajo del suelo, cuyos ejemplos incluyen brotes, hojas, flores y raíces. Algunos ejemplos son hojas, agujas, tallos, vástagos, flores, cuerpos frutales, frutos y semillas, y también raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de plantas también incluyen material cosechado y material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, esquejes, tubérculos, rizomas, gajos y semillas.
- 15 Las plantas que pueden tratarse de acuerdo con los procedimientos de la invención incluyen las siguientes: algodón, lino, vid, frutas, hortalizas, tales como *Rosaceae* sp. (por ejemplo, pomos tales como manzanas y peras, pero también drupas tales como damascos, cerezas, almendras y duraznos y frutos blandos tales como frutillas), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (por ejemplo, bananos y plantaciones bananeras), *Rubiaceae* sp. (por ejemplo, café), *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (por ejemplo, limones, naranjas y pomelos); *Solanaceae* sp. (por ejemplo, tomates), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (por ejemplo, lechuga), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp. (por ejemplo, pepino), *Alliaceae* sp. (por ejemplo, puerro, cebolla), *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, arvejas); plantas de cultivo principales tales como *Gramineae* sp. (por ejemplo, maíz, turba, cereales tales como trigo, centeno, arroz, cebada, avena, mijo y triticale), *Asteraceae* sp. (por ejemplo, girasol), *Brassicaceae* sp. (por ejemplo, repollo blanco, repollo colorado, brócoli, coliflor, repollos de Bruselas, pak choi, colinabo, rábanos, y colza, mostaza, rábano picante y berro), *Fabaceae* sp. (por ejemplo, poroto, maní), *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, poroto de soja), *Solanaceae* sp. (por ejemplo, papas), *Chenopodiaceae* sp. (por ejemplo, remolacha azucarera, remolacha forrajera, acelga, remolacha); plantas útiles y plantas ornamentales para jardines y áreas arboladas; y variedades genéticamente modificadas de cada una de estas plantas.
- 30

En algunas realizaciones preferidas, se tratan especies de plantas silvestres y cultivares de plantas, o los obtenidos por procedimientos de mejoramiento biológico convencionales, tales como fusión de protoplastos o por cruce, y también partes de estos, de conformidad con los procedimientos de la invención.

- 35 En algunas otras realizaciones preferidas, se tratan plantas transgénicas y cultivares de plantas obtenidos a través de procedimientos de ingeniería genética, de ser apropiado, en combinación con procedimientos convencionales (organismos genéticamente modificados), y partes de estos, de conformidad con los procedimientos de la invención. Más preferentemente, se tratan las plantas de los cultivares de plantas que están comercialmente disponibles o están en uso de conformidad con la invención. Cultivares de plantas son plantas que tienen nuevas propiedades ("rasgos") y que se han obtenido mediante mejoramiento convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Pueden ser cultivares, variedades, biotipos o genotipos.
- 40

- Los procedimientos según la invención se pueden usar en el tratamiento de organismos modificados genéticamente (OMG), p. ej. plantas o semillas. Las plantas genéticamente modificadas (o plantas transgénicas) son plantas de las cuales un gen heterólogo se ha integrado de manera estable en el genoma.
- 45 La expresión "gen heterólogo" significa, esencialmente, un gen que se proporciona o ensambla fuera de la planta y, cuando se introduce en el genoma nuclear, cloroplástico o mitocondrial, confiere a la planta transformada propiedades agronómicas nuevas o mejoradas u otras propiedades al expresar una proteína o polipéptido de interés o al subregular o silenciar otros genes que están presentes en la planta (mediante, por ejemplo, tecnología antisentido, tecnología de cosupresión, tecnología de interferencia de ARN -iARN- o tecnología de microARN -miARN-). Un gen heterólogo que se encuentra en el genoma también se denomina "transgén". Un transgén que se define por su ubicación particular en el genoma vegetal se denomina "transformación" o "evento transgénico".
- 50

- Las plantas y los cultivares de plantas que se pueden tratar con los procedimientos divulgados arriba incluyen todas las plantas que tienen material genético que confiere rasgos particularmente útiles y beneficiosos a estas plantas (ya sea que se hayan obtenido por medios de reproducción y/o biotecnológicos).
- 55

Las plantas y cultivares de plantas que pueden tratarse mediante los procedimientos divulgados anteriormente incluyen plantas y cultivares de plantas que son resistentes contra uno o más tipos de estrés biótico, es decir,

dichas plantas muestran una mejor defensa contra plagas animales y microbianas, tales como contra nematodos, insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias, virus y/o viroides.

5 Las plantas y cultivares de plantas que pueden tratarse mediante los procedimientos divulgados anteriormente incluyen las plantas que son resistentes a uno o más tipos de estrés abiótico. Las condiciones de estrés abiótico pueden incluir, por ejemplo, sequía, exposición a baja temperatura, exposición al calor, estrés osmótico, inundación, alta salinidad del suelo, alta exposición a minerales, exposición al ozono, alta exposición a la luz, disponibilidad limitada de nutrientes nitrogenados, disponibilidad limitada de nutrientes fosforados, evitación de sombra.

10 Las plantas y cultivares de plantas que pueden tratarse mediante los procedimientos divulgados anteriormente incluyen las plantas caracterizadas por características de rendimiento mejorado. Un mayor rendimiento en dichas plantas puede ser el resultado de, por ejemplo, mejor fisiología, crecimiento y desarrollo vegetal, tal como la eficiencia en el uso del agua, eficiencia en la retención del agua, mejor uso del nitrógeno, mejor asimilación del carbono, mejor fotosíntesis, mejor eficiencia en la germinación y maduración acelerada. Además, el rendimiento puede verse afectado por una mejor arquitectura vegetal (en condiciones estresantes o no estresantes), incluidos, pero sin limitarse a, floración temprana, control de la floración para la producción de semillas híbridas, vigor de la plántula, tamaño de la planta, números y distancia de entrenudos, crecimiento de la raíz, tamaño de la semilla, tamaño del fruto, tamaño de la vaina, número de vainas o espigas, número de semillas por vaina o espiga, masa de las semillas, mejor llenado de las semillas, menor dispersión de las semillas, menor dehiscencia de la vaina y resistencia al encame. Otros rasgos del rendimiento incluyen composición de la semilla, tal como contenido y composición de carbohidratos, por ejemplo, algodón o almidón, contenido de proteínas, contenido y composición de aceites, valor nutritivo, reducción en compuestos antinutritivos, mejor capacidad de procesamiento y mejor estabilidad en el almacenamiento.

25 Las plantas y cultivares de plantas que pueden tratarse mediante los procedimientos divulgados anteriormente incluyen plantas y cultivares de plantas que son plantas híbridas que ya expresan la característica de heterosis o vigor híbrido que da lugar a un rendimiento, vigor, salud y resistencia generalmente mayores hacia los tipos de estrés biótico y abiótico.

30 Las plantas y cultivares de plantas (obtenidos mediante procedimientos de biotecnología vegetal tales como ingeniería genética) que pueden tratarse mediante los procedimientos divulgados anteriormente incluyen plantas y cultivares de plantas que son plantas tolerantes a herbicidas, es decir, plantas que se hicieron tolerantes a uno o más herbicidas dados. Tales plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o bien mediante la selección de plantas que contienen una mutación que comunica tal tolerancia a los herbicidas.

35 Las plantas y cultivares de plantas (obtenidos mediante procedimientos de biotecnología vegetal tales como ingeniería genética) que pueden tratarse mediante los procedimientos divulgados anteriormente incluyen plantas y cultivares de plantas que son plantas transgénicas resistentes a insectos, es decir, plantas que se hicieron resistentes al ataque de ciertos insectos de interés. Tales plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante la selección de plantas que contienen una mutación que comunica tal tolerancia a los insectos.

40 Las plantas y cultivares de plantas (obtenidos mediante procedimientos de biotecnología vegetal tales como ingeniería genética) que pueden tratarse mediante los procedimientos divulgados anteriormente incluyen plantas y cultivares de plantas que son tolerantes a los tipos de estrés abiótico. Tales plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante la selección de plantas que contienen una mutación que comunica tal resistencia al estrés.

45 Las plantas y cultivares de plantas (obtenidos mediante procedimientos de biotecnología vegetal tales como ingeniería genética) que pueden tratarse mediante los procedimientos divulgados anteriormente incluyen plantas y cultivares de plantas que muestran una alteración en la cantidad, calidad y/o estabilidad en el almacenamiento del producto cosechado y/o una alteración en las propiedades de ingredientes específicos del producto cosechado.

50 Las plantas y cultivares de plantas (obtenidos mediante procedimientos de biotecnología vegetal tales como ingeniería genética) que pueden tratarse mediante los procedimientos divulgados anteriormente incluyen plantas y cultivares de plantas, tales como plantas de algodón, con características alteradas de la fibra. Tales plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante la selección de plantas que contienen una mutación que comunica tales características alteradas de la fibra.

55 Las plantas y cultivares de plantas (obtenidos mediante procedimientos de biotecnología vegetal tales como ingeniería genética) que pueden tratarse mediante los procedimientos divulgados anteriormente incluyen plantas y cultivares de plantas, tales como colza o plantas Brassica relacionadas, con características alteradas del perfil de aceites. Tales plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante la

selección de plantas que contienen una mutación que comunica tales características alteradas del perfil de aceites.

- Las plantas y cultivares de plantas (obtenidos mediante procedimientos de biotecnología vegetal tales como ingeniería genética) que pueden tratarse mediante los procedimientos divulgados anteriormente incluyen plantas y cultivares de plantas, tales como colza o plantas *Brassica* relacionadas, con características alteradas del desgrane de las semillas. Tales plantas pueden obtenerse mediante transformación genética, o mediante la selección de plantas que contienen una mutación que comunica tales características alteradas del desgrane de las semillas e incluyen plantas tales como plantas de colza con desgrane retrasado o reducido de las semillas.
- 10 Las plantas y cultivares de plantas (obtenidos mediante procedimientos de biotecnología vegetal tales como ingeniería genética) que pueden tratarse mediante los procedimientos divulgados anteriormente incluyen plantas y cultivares de plantas, tales como plantas de tabaco, con patrones alterados de modificación postraduccional de proteínas.

Patógenos y enfermedades

- 15 Los procedimientos divulgados arriba se pueden usar para controlar microorganismos, en particular los microorganismos fitopatógenos, tal como hongos fitopatógenos, que provocan enfermedades tales como:
- enfermedades causadas por patógenos del oídio, tal como las especies *Blumeria* (p. ej., *Blumeria graminis*), especies *Podosphaera* (p. ej., *Podosphaera leucotricha*), especies *Sphaerotheca* (p. ej., *Sphaerotheca fuliginea*), especies *Uncinula* (p. ej., *Uncinula necator*);
- 20 enfermedades causadas por patógenos de la enfermedad de la roya, tales como las especies *Gymnosporangium* (p. ej., *Gymnosporangium sabinae*), especies *Hemileia* (p. ej., *Hemileia vastatrix*), especies *Phakopsora* (p. ej., *Phakopsora pachyrhizi* o *Phakopsora meibomiae*), especies *Puccinia* (p. ej., *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* o *Puccinia striiformis*), especies *Uromyces* (p. ej., *Uromyces appendiculatus*);
- 25 enfermedades causadas por patógenos del grupo de los oomicetos, tales como especies *Albugo* (p. ej., *Albugo candida*), especies *Bremia* (p. ej., *Bremia lactucae*), especies *Peronospora*, (p. ej., *Peronospora pisi* o *P. brassicae*), especies *Phytophthora* (p. ej., *Phytophthora infestans*), especies *Plasmopara* (p. ej., *Plasmopara viticola*), especies *Pseudoperonospora* (p. ej., *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*), especies *Pythium* (p. ej., *Pythium ultimum*);
- 30 enfermedades de la mancha foliar y enfermedades de marchitamiento foliar causadas, por ejemplo, por especies *Alternaria* (p. ej., *Alternaria solani*), especies *Cercospora* (p. ej., *Cercospora beticola*), especies *Cladosporium* (p. ej., *Cladosporium cucumerinum*), especies *Cochliobolus* (p. ej., *Cochliobolus sativus* [forma conidial: *Drechslera*, sin.: *Helminthosporium*] o *Cochliobolus miyabeanus*), especies *Colletotrichum* (p. ej., *Colletotrichum lindemuthianum*), especies *Cycloconium* (p. ej., *Cycloconium oleaginum*), especies *Diaporthe* (p. ej., *Diaporthe citri*), especies *Elsinoe* (p. ej., *Elsinoe fawcettii*), especies *Gloeosporium* (p. ej., *Gloeosporium laeticolor*), especies *Glomerella* (p. ej., *Glomerella cingulata*), especies *Guignardia* (p. ej., *Guignardia bidwellii*), especies *Leptosphaeria* (p. ej., *Leptosphaeria maculans*), especies *Magnaporthe* (p. ej., *Magnaporthe grisea*), especies *Microdochium* (p. ej., *Microdochium nivale*), especies *Mycosphaerella* (p. ej., *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola* o *Mycosphaerella fijiensis*), especies *Phaeosphaeria* (p. ej., *Phaeosphaeria nodorum*), especies *Pyrenophora* (p. ej., *Pyrenophora teres* o *Pyrenophora tritici repentis*), especies *Ramularia* (p. ej., *Ramularia collo-cygni* o *Ramularia areola*), especies *Rhynchosporium* (p. ej., *Rhynchosporium secalis*), especies *Septoria* (p. ej., *Septoria apii* o *Septoria lycopersici*), especies *Stagonospora* (p. ej., *Stagonospora nodorum*), especies *Typhula* (p. ej., *Typhula incarnata*), especies *Venturia* (p. ej., *Venturia inaequalis*),
- 35 enfermedades de la raíz y el tallo causadas, por ejemplo, por especies *Corticium* (p. ej., *Corticium graminearum*), especies *Fusarium* (p. ej., *Fusarium oxysporum*), especies *Gaeumannomyces* (p. ej., *Gaeumannomyces graminis*), especies *Plasmodiophora* (p. ej., *Plasmodiophora brassicae*), especies *Rhizoctonia* (p. ej., *Rhizoctonia solani*), especies *Sarocladium* (p. ej., *Sarocladium oryzae*), especies *Sclerotium* (p. ej., *Sclerotium oryzae*), especies *Tapesia* (p. ej., *Tapesia acuformis*), especies *Thielaviopsis* (p. ej., *Thielaviopsis basicola*);
- 40 enfermedades de la espiga y de la panícula (incluidas las mazorcas de maíz) causadas, por ejemplo, por especies *Alternaria* (p. ej., *Alternaria*), especies *Aspergillus* (p. ej., *Aspergillus flavus*), especies *Cladosporium* (p. ej., *Cladosporium cladosporioides*), especies *Claviceps* (p. ej., *Claviceps purpurea*), especies *Fusarium* (p. ej., *Fusarium culmorum*), especies *Gibberella* (p. ej., *Gibberella zeae*), especies *Monographella* (p. ej., *Monographella nivalis*), especies *Stagonospora* (p. ej., *Stagonospora nodorum*);
- 55 enfermedades causadas por hongos carbonos, por ejemplo, especies *Sphacelotheca* (p. ej., *Sphacelotheca reiliana*), especies *Tilletia* (p. ej., *Tilletia caries* o *Tilletia controversa*), especies *Urocystis* (p. ej., *Urocystis occulta*), especies *Ustilago* (p. ej., *Ustilago nuda*);

podredumbre del fruto causada, por ejemplo, por especies *Aspergillus* (p. ej., *Aspergillus flavus*), especies *Botrytis* (p. ej., *Botrytis cinerea*), especies *Penicillium* (p. ej., *Penicillium expansum* o *Penicillium purpurogenum*), especies *Rhizopus* (p. ej., *Rhizopus stolonifer*), especies *Sclerotinia* (p. ej., *Sclerotinia sclerotiorum*), especies *Verticillium* (p. ej., *Verticillium alboatrum*);

- 5 enfermedades de podredumbre y marchitamiento transmitidas por la semilla y el suelo, y también enfermedades de las plántulas, causadas, por ejemplo, por especies *Alternaria* (p. ej., *Alternaria brassicicola*), especies *Aphanomyces* (p. ej., *Aphanomyces euteiches*), especies *Ascochyta* (p. ej., *Ascochyta lentis*), especies *Aspergillus* (p. ej., *Aspergillus flavus*), especies *Cladosporium* (p. ej., *Cladosporium herbarum*), especies *Cochliobolus* (p. ej., *Cochliobolus sativus* [forma conidial: *Drechslera*, *Bipolaris* Sin.: *Helminthosporium*]), especies *Colletotrichum* (p. ej., *Colletotrichum coccodes*), especies *Fusarium* (p. ej., *Fusarium culmorum*), especies *Gibberella* (p. ej., *Gibberella zeae*), especies *Macrophomina* (p. ej., *Macrophomina phaseolina*), especies *Microdochium* (p. ej., *Microdochium nivale*), especies *Monographella* (p. ej., *Monographella nivalis*), especies *Penicillium* (p. ej., *Penicillium expansum*), especies *Phoma* (p. ej., *Phoma lingam*), especies *Phomopsis* (p. ej., *Phomopsis sojae*), especies *Phytophthora* (p. ej., *Phytophthora cactorum*), especies *Pyrenophora* (p. ej., *Pyrenophora graminea*), especies *Pyricularia* (p. ej., *Pyricularia oryzae*), especies *Pythium* (p. ej., *Pythium ultimum*), especies *Rhizoctonia* (p. ej., *Rhizoctonia solani*), especies *Rhizopus* (p. ej., *Rhizopus oryzae*), especies *Sclerotium* (p. ej., *Sclerotium rolfii*), especies *Septoria* (p. ej., *Septoria nodorum*), especies *Typhula* (p. ej., *Typhula incarnata*), especies *Verticillium* (p. ej., *Verticillium dahliae*);
- 20 cánceres, agallas y escobas de bruja causados, por ejemplo, por especies *Nectria* (p. ej., *Nectria galligena*); enfermedades de marchitamiento causadas, por ejemplo, por especies *Monilinia* (p. ej., *Monilinia laxa*); deformaciones de hojas, flores y frutos causadas, por ejemplo, por especies *Exobasidium* (p. ej., *Exobasidium vexans*), especies *Taphrina* (p. ej., *Taphrina deformans*); enfermedades degenerativas en plantas leñosas causadas, por ejemplo, por especies *Esca* (p. ej., *Phaeomoniella chlamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* o *Fomitiporia mediterranea*), especies *Ganoderma* (p. ej., *Ganoderma boninense*); enfermedades de flores y semillas causadas, por ejemplo, por especies *Botrytis* (p. ej., *Botrytis cinerea*); enfermedades del tubérculo de plantas causadas, por ejemplo, por especies *Rhizoctonia* (p. ej., *Rhizoctonia solani*), especies *Helminthosporium* (p. ej., *Helminthosporium solani*);
- 30 enfermedades causadas por patógenos bacterianos, por ejemplo especies *Xantomonas* (p. ej., *Xantomonas campestris* pv. *Oryzae*), especies *Pseudomonas* (p. ej., *Pseudomonas syringae* pv. *Lachrymans*), especies *Erwinia* (p. ej., *Erwinia amilovora*).

Tratamiento de semillas

- 35 El procedimiento para controlar microorganismos indeseados se puede usar para proteger las semillas de microorganismos fitopatógenos, tal como hongos.

El término “semilla(s)” como se usa en el presente documento incluye semillas inactivas, semillas sometidas a acondicionamiento osmótico, semillas pregerminadas y semillas con raíces y hojas emergidas.

- 40 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento para proteger semillas y/o cultivos de microorganismos indeseados, tales como bacterias u hongos que comprende el paso de tratamiento de las semillas con uno o más compuestos de la fórmula (I) o una composición que comprenden a estos. El tratamiento de las semillas con los compuestos de la fórmula (I) o una composición que comprende a estos no solo protege a las semillas de microorganismos fitopatógenos, sino también a las plantas en germinación, las plántulas que ya emergieron y las plantas después de que emergieron.

El tratamiento de las semillas puede hacerse antes de la siembra, al momento de sembrar o al poco tiempo.

- 45 Cuando el tratamiento de las semillas se hace antes de la siembra (p. ej., las llamadas aplicaciones en la semilla), el tratamiento de las semillas puede llevarse a cabo de la siguiente manera: las semillas se pueden colocar en un mezclador con una cantidad deseada de los compuestos de la fórmula (I) o una composición que comprende a estos (ya sea como está o después de la dilución), se mezclan las semillas y los compuestos de la fórmula (I) o una composición que los comprende hasta que se logra una distribución homogénea sobre las semillas. Si es necesario, luego se pueden secar las semillas.

La solicitud también describe a semillas tratadas con uno o más compuestos de la fórmula (I) o una composición que comprende a estos. Como se describió anteriormente, el uso de las semillas tratadas permite proteger a las semillas de microorganismos indeseados, tal como hongos fitopatógenos, antes y después de sembrarlas y también permite proteger las plantas de germinación y las plántulas jóvenes que emergen de dichas semillas

tratadas. Una gran parte del daño a las plantas del cultivo provocado por los organismos nocivos se desencadena por la infección de las semillas antes de sembrarlas o después de la germinación de la planta. Esta fase es particularmente crítica ya que las raíces y los brotes de la planta que está creciendo son particularmente sensibles, e incluso un pequeño daño puede dar como resultado la muerte de la planta.

- 5 Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento para proteger las semillas, plantas en germinación y plántulas que ya emergieron, más generalmente se refiere a un procedimiento para proteger el cultivo de microorganismos fitopatógenos, que comprende el paso de usar semillas tratadas con uno o más compuestos de la fórmula (I) o una composición que comprende a estos.

- 10 Se prefiere que las semillas se traten en un estado en el que es suficientemente estable para que no se produzca daño en el ciclo del tratamiento. En general, las semillas pueden tratarse en cualquier momento entre la cosecha y al poco tiempo después de la siembra. Se acostumbra usar semillas que se han separado de la planta y liberadas de mazorcas, conchas, tallos, abrigos, pelos o la carne de las frutas. Por ejemplo, es posible usar semillas cosechadas, limpias y secas hasta un contenido de humedad de menos del 15% por peso. Opcionalmente, también es posible usar las semillas que, después de secadas, por ejemplo, se hayan tratado con agua y luego se hayan secado otra vez, o semillas justo después de la pregerminación, o semillas que se hayan almacenado en condiciones de pregerminación o semillas pregerminadas, o semillas sembradas en bandejas, cintas o papel en viveros.

- 20 La cantidad de los compuestos de la fórmula (I) o la composición que comprende a estos que se aplica a las semillas es normalmente tal que la germinación de la semilla no se vea perjudicada o que la planta resultante no esté dañada. Esto debe garantizarse especialmente en caso de que los ingredientes activos exhiban efectos fitotóxicos en ciertas tasas de aplicación. También deben considerarse los fenotipos intrínsecos de plantas transgénicas cuando se determina la cantidad de los compuestos de la fórmula (I) o composición que comprende a estos a aplicar a la semilla para lograr una protección óptima de la semilla y la planta en germinación con una cantidad mínima de los compuestos de la fórmula (I) o la composición que comprende a estos que se está utilizando.

- 30 Como se indica arriba, los compuestos de la fórmula (I) se pueden aplicar, como tal, directamente a las semillas, es decir, sin utilizar ninguno de los otros componentes y sin que se haya diluido, o se puede aplicar una composición que comprende los compuestos de la fórmula (I). Preferentemente, las composiciones se aplican a la semilla en cualquier forma adecuada. Los ejemplos de formulaciones adecuadas incluyen soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, lechadas o combinadas con otras composiciones de recubrimiento para la semilla, tal como materiales de formación de películas, materiales de granulados, polvos de hierro fino u otro metal, gránulos, material de recubrimiento para semillas inactivadas y también formulaciones de ULV. Las formulaciones pueden ser formulaciones listas para usar o pueden ser concentrados que necesitan diluirse antes del uso.

- 35 Estas formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo, mezclando el ingrediente activo o la mezcla de estos con aditivos habituales, por ejemplo, extendedores y disolventes o diluyentes habituales, tintes, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también agua.

- 40 Estas formulaciones se preparan de manera conocida, mezclando los ingredientes activos o combinaciones de ingredientes activos con aditivos habituales, por ejemplo, extendedores y disolventes o diluyentes habituales, tintes, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también agua.

- 45 Los tintes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de revestimiento de semillas son habituales para tales propósitos. Es posible utilizar tanto pigmentos, que son escasamente solubles en agua, como tintes, que son solubles en agua. Entre los ejemplos se incluyen los tintes conocidos por los nombres de Rodamina B, C.I. Pigmento Rojo 112 y C.I. Solvente Rojo 1. Los agentes humectantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de los revestimientos de semillas son todas las sustancias que promueven la humectación y que se usan convencionalmente para la formulación de ingredientes agroquímicos activos. Se pueden utilizar preferentemente los alquilonaftalenosulfonatos, como el diisopropil o los diisobutilnaftalenosulfonatos. Los dispersantes y/o emulsionantes útiles que pueden estar presentes en las formulaciones de los revestimientos de semillas son todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos que se usan convencionalmente para la formulación de ingredientes agroquímicos activos. Se prefiere el uso de dispersantes no iónicos o aniónicos o de mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Entre los dispersantes no iónicos útiles se incluyen especialmente los polímeros en bloque de óxido de etileno/óxido de propileno, los éteres de poliglicol de alquilfenol y los éteres de poliglicol de trisilfenol, así como sus derivados fosfatados o sulfatados. Los dispersantes aniónicos adecuados son especialmente los lignosulfonatos, las sales de ácido poliacrílico y los condensados de arilsulfonato-formaldehído. Los antiespumantes que pueden estar presentes en las formulaciones de los revestimientos de semillas son todas las sustancias que inhiben la espuma que se usan convencionalmente para la formulación de ingredientes agroquímicos activos. Los antiespumantes de silicona y el estearato de magnesio se pueden utilizar con preferencia. Los conservantes que pueden estar presentes

en las formulaciones de los revestimientos de semillas son todas las sustancias utilizables para tales propósitos en las composiciones agroquímicas. Los ejemplos incluyen el diclorofeno y el alcohol bencílico hemiformal. Los espesantes secundarios que pueden estar presentes en las formulaciones de los revestimientos de semillas son todas las sustancias utilizables para tales propósitos en las composiciones agroquímicas. Los ejemplos preferidos incluyen derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y sílice finamente dividida. Los adhesivos que pueden estar presentes en las formulaciones de los revestimientos de semillas son todos ligantes habituales que se usan en los productos de revestimientos de semillas. Los ejemplos preferidos incluyen la polivinilpirrolidona, el acetato de polivinilo, el alcohol polivinílico y la tilosa.

Los compuestos de la fórmula (I) y las composiciones que comprenden a estos son adecuados para proteger las semillas de cualquier variedad vegetal que se use en agricultura, en invernaderos, en bosques o en horticultura. Más particularmente, se prefieren las semillas de cereales (tales como trigo, cebada, centeno, mijo, triticale y avena), colza, maíz, algodón, soja, arroz, papa, girasol, frijol, café, guisante, remolacha (p. ej., remolacha azucarera y forrajera), maní, vegetales (tales como tomate, pepino, cebolla y lechuga), césped y plantas ornamentales. De particular significancia es el tratamiento de la semilla de trigo, soja, colza, maíz y arroz.

También se pueden usar los compuestos de la fórmula (I) o las composiciones que comprenden a estos para tratar semillas transgénicas, en particular semillas de plantas capaces de expresar una proteína que actúa contra plagas, daño por herbicidas o estrés abiótico, lo que aumenta por consiguiente el efecto protector. Los efectos sinérgicos también pueden ocurrir en interacción con las sustancias formadas por expresión.

Nematodos

En el presente contexto, el término “nematodos” abarca a todas las especies del *phylum Nematoda* y aquí en particular la especies que funcionan como parásitos en las plantas u hongos (por ejemplo, las especies del orden *Aphelenchida*, *Meloidogyne*, *Tylenchida* y otras) o además en humanos y animales (por ejemplo, las especies de los órdenes *Trichinellida*, *Tylenchida*, *Rhabditina* y *Spirurida*) y que provocan daño en estos organismos vivos y también otros helmintos parásitos.

Un nematocida en la protección de cultivo, como se describe en el presente documento, es capaz de controlar los nematodos.

El término “controlar los nematodos” significa destruir los nematodos o prevenir o impedir su desarrollo o su crecimiento o prevenir o impedir que penetren o succionen el tejido de la planta.

Aquí, la eficacia de los compuestos se determina al comparar las mortalidades, la formación de agallas, la formación de quistes, la densidad de nematodo por volumen de tierra, densidad de nematodo por raíz, cantidad de huevos de nematodo por volumen de tierra, morbilidad de los nematodos entre una planta o parte de una planta tratada con el compuesto de la fórmula (I) o el suelo tratada y una planta o parte de una planta sin tratamiento o el suelo sin tratamiento (100%). Preferentemente, la reducción lograda es del 25% al 50% en comparación con una planta, parte de una planta sin tratamiento o el suelo sin tratamiento, particular y preferentemente del 51% al 79% y muy particular y preferentemente para completar la destrucción o completar la prevención del desarrollo y crecimiento de los nematodos por una reducción del 80% al 100%. El control de los nematodos como se describe en el presente documento también comprende el control de la proliferación de los nematodos (desarrollo de quistes y/o huevos). Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden utilizar para mantener saludables las plantas o a los animales y se pueden emplear de forma curativa, preventiva o sistemática para el control de los nematodos.

El experto en la materia conoce los procedimientos para determinar las mortalidades, la formación de agallas, la formación de quistes, la densidad de nematodos por volumen de tierra, la densidad de nematodos por raíz, la cantidad de huevos de nematodos por volumen de tierra, la movilidad de los nematodos.

El uso de un compuesto de la fórmula (I) puede mantener la planta saludable y también comprende una reducción del daño provocado por los nematodos y un aumento del rendimiento de la cosecha.

En el presente contexto, el término “nematodos” se refiere a los nematodos de plantas que comprenden todos los nematodos que dañan las plantas. Los nematodos de plantas comprenden nematodos fitoparásitos y nematodos originados en el suelo. Los nematodos fitoparásitos incluyen ectoparásitos tales como *Xiphinema spp.*, *Longidorus spp.* y *Trichodorus spp.*; semiparásitos tales como *Tylenchulus spp.*; endoparásitos migratorios tales como *Pratylenchus spp.*, *Radopholus spp.* y *Scutellonema spp.*; parásitos no migratorios tales como *Heterodera spp.*, *Globodera spp.* y *Meloidogyne spp.*, y también endoparásitos del tallo y las hojas tales como *Ditylenchus spp.*, *Aphelenchoides spp.* y *Hirschmaniella spp.* Los nematodos del suelo que parasitan la raíz particularmente perjudiciales son, por ejemplo, nematodos que forman quistes del género *Heterodera* o *Globodera* y/o nematodos de las agallas de la raíz del género *Meloidogyne*. Las especies perjudiciales de este género son, por ejemplo, *Meloidogyne incognita*, *Heterodera glycines* (nematodo del quiste de soja), *Globodera pallida* y *Globodera rostochiensis* (nematodo del quiste de la papa amarilla), estas especies se controlan de manera eficaz con los compuestos descritos en el presente texto. Sin embargo, el uso de los compuestos

descritos en el presente texto no está de ningún modo restringido estos géneros o especies, sino que se extiende de la misma manera a otros nematodos.

Los nematodos de la planta incluyen, a mero título enunciativo, *Aglenchus agricola*, *Anguina tritici*, *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragariae* y los endoparásitos del tallo y la hoja *Aphelenchoides* spp., *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*, *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*, *Bursaphelenchus xylophilus* und *Bursaphelenchus* spp., *Cacopaurus pestis*, *Criconemella curvata*, *Criconemella onoensis*, *Criconemella ornata*, *Criconemella rusium*, *Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*) y *Criconemella* spp., *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense*, *Criconemoides ornatum* y *Criconemoides* spp., *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci*, *Ditylenchus myceliophagus* y, también, los endoparásitos del tallo y la hoja *Ditylenchus* spp., *Dolichodorus heterocephalus*, *Globodera pallida* (= *Heterodera pallida*), *Globodera rostochiensis* (nematodo del quiste de la papa amarilla), *Globodera solanacearum*, *Globodera tabacum*, *Globodera virginia* y los parásitos no migratorios que forman quistes *Globodera* spp., *Helicotylenchus digonicus*, *Helicotylenchus dihystrer*, *Helicotylenchus erythriner*, *Helicotylenchus multicinctus*, *Helicotylenchus nannus*, *Helicotylenchus pseudorobustus* y *Helicotylenchus* spp., *Hemicriconemoides*, *Hemicycliophora arenaria*, *Hemicycliophora nudata*, *Hemicycliophora parvana*, *Heterodera avenae*, *Heterodera cruciferae*, *Heterodera glycines* (nematodo del quiste del poroto de soja), *Heterodera oryzae*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera zeae* y los parásitos formadores de quistes no migratorios *Heterodera* spp., *Hirschmaniella gracilis*, *Hirschmaniella oryzae*, *Hirschmaniella spinicaudata* y los endoparásitos de tallos y hojas *Hirschmaniella* spp., *Hoplolaimus aegyptii*, *Hoplolaimus californicus*, *Hoplolaimus columbus*, *Hoplolaimus galeatus*, *Hoplolaimus indicus*, *Hoplolaimus magnistylus*, *Hoplolaimus pararobustus*, *Longidorus africanus*, *Longidorus breviannulatus*, *Longidorus elongatus*, *Longidorus laevicapitatus*, *Longidorus vineacola* y los ectoparásitos *Longidorus* spp., *Meloidogyne acronea*, *Meloidogyne africana*, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne arenaria thamesi*, *Meloidogyne artiella*, *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne coffeicola*, *Meloidogyne ethiopica*, *Meloidogyne exigua*, *Meloidogyne fallax*, *Meloidogyne graminicola*, *Meloidogyne graminis*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne incognita acrita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne kikuyensis*, *Meloidogyne minor*, *Meloidogyne naasi*, *Meloidogyne paranaensis*, *Meloidogyne thamesi* y los parásitos no migratorios *Meloidogyne* spp., *Meloinema* spp., *Nacobbus aberrans*, *Neotylenchus vigissi*, *Paraphelenchus pseudoparietinus*, *Paratrachodorus allius*, *Paratrachodorus lobatus*, *Paratrachodorus minor*, *Paratrachodorus nanus*, *Paratrachodorus porosus*, *Paratrachodorus teres* y *Paratrachodorus* spp., *Pratylenchus hamatus*, *Pratylenchus minutus*, *Pratylenchus projectus* y *Pratylenchus* spp., *Pratylenchus agilis*, *Pratylenchus allenii*, *Pratylenchus andinus*, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus cerealis*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus crenatus*, *Pratylenchus delattrei*, *Pratylenchus giibbicaudatus*, *Pratylenchus goodeyi*, *Pratylenchus hamatus*, *Pratylenchus hexincisus*, *Pratylenchus loosi*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus teres*, *Pratylenchus thornei*, *Pratylenchus vulnus*, *Pratylenchus zeae* y los endoparásitos migratorios *Pratylenchus* spp., *Pseudohalenchus minutus*, *Psilenchus magnidens*, *Psilenchus tumidus*, *Punctodera chalconensis*, *Quinisulcius acutus*, *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, los endoparásitos migratorios *Radopholus* spp., *Rotylenchulus borealis*, *Rotylenchulus parvus*, *Rotylenchulus reniformis* y *Rotylenchulus* spp., *Rotylenchus laurentinus*, *Rotylenchus macrodoratus*, *Rotylenchus robustus*, *Rotylenchus uniformis* y *Rotylenchus* spp., *Scutellonema brachyurum*, *Scutellonema bradys*, *Scutellonema clathricaudatum* y los endoparásitos migratorios *Scutellonema* spp., *Subanguina radiciola*, *Tetylenchus nicotianae*, *Trichodorus cylindricus*, *Trichodorus minor*, *Trichodorus primitivus*, *Trichodorus proximus*, *Trichodorus similis*, *Trichodorus sparsus* y los ectoparásitos *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus agri*, *Tylenchorhynchus brassicae*, *Tylenchorhynchus clarus*, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus digitatus*, *Tylenchorhynchus ebriensis*, *Tylenchorhynchus maximus*, *Tylenchorhynchus nudus*, *Tylenchorhynchus vulgaris* y *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus semipenetrans* y los semiparásitos *Tylenchulus* spp., *Xiphinema americanum*, *Xiphinema brevicolle*, *Xiphinema dimorphicaudatum*, *Xiphinema index* y los ectoparásitos *Xiphinema* spp.

Los nematodos que se pueden controlar con el uso de un compuesto de la fórmula (I) incluyen los nematodos del género *Meloidogyne* tales como el nematodo de nudo de raíz del sur (*Meloidogyne incognita*), el nematodo de nudo de raíz javanés (*Meloidogyne javanica*), el nematodo de nudo de raíz del norte (*Meloidogyne hapla*) y el nematodo de nudo de raíz del maíz (*Meloidogyne arenaria*); los nematodos del género *Ditylenchus* tales como el nematodo de raíz de la papa (*Ditylenchus destructor*) y el gusano redondo del tallo y el bulbo (*Ditylenchus dipsaci*); nematodos del género *Pratylenchus* tales como el nematodo de lesión de raíz de mazorca (*Pratylenchus penetrans*), el nematodo de lesión de raíz del crisantemo (*Pratylenchus fallax*), el nematodo de la raíz del café (*Pratylenchus coffeae*), el nematodo de la raíz del té (*Pratylenchus loosi*) y el nematodo de lesión de raíz de nogal (*Pratylenchus vulnus*); los nematodos del género *Globodera* tales como el nematodo del quiste de la papa amarilla (*Globodera rostochiensis*) y el nematodo del quiste de la papa blanca (*Globodera pallida*); los nematodos del género *Heterodera* tales como el nematodo del quiste de la soja (*Heterodera glycines*) y el gusano redondo del quiste de la remolacha (*Heterodera schachtii*); los nematodos del género *Aphelenchoides* tales como el nematodo de punta blanca del arroz (*Aphelenchoides besseyi*), nematodo del crisantemo (*Aphelenchoides ritzemabosi*) y el nematodo de la fresa (*Aphelenchoides fragariae*); nematodos del género *Aphelenchus* tales como el nematodo fungívoro (*Aphelenchus avenae*); los nematodos del género *Radopholus*, tales como el nematodo del excavador (*Radopholus similis*); los nematodos del género

Tylenchulus tales como el nematodo de la raíz cítrica (*Tylenchulus semipenetrans*); nematodos del género *Rotylenchulus* tales como el nematodo reniforme (*Rotylenchulus reniformis*); los nematodos que habitan en árboles tales como el nematodo de la madera de pino (*Bursaphelenchus xylophilus*) y el nematodo del anillo rojo (*Bursaphelenchus cocophilus*) y similares.

- 5 Las plantas que se pueden proteger con un compuesto de la fórmula (I) incluyen plantas tal como los cereales (por ejemplo, arroz, cebada, trigo, centeno, avena, maíz y similares), los frijoles (soja, judía, poroto, habichuelas, guisantes, maní y similares), los árboles frutales y de frutas (manzanas, especies de peras, vides, duraznos, albaricoques japoneses, cerezas, nogales, almendras, bananas, fresas y similares), las especies vegetales (repollo, tomate, espinaca, brócoli, lechuga, cebollas, cebolla de primavera, pimiento y similares), los cultivos de raíz (zanahoria, papa, batata, rábano, raíz de loto, nabo y similares), las plantas para materias prima industriales (algodón, cáñamo, morera de papel, mitsumata, colza, remolacha, lúpulos, caña de azúcar, remolacha azucarera, oliva, caucho, palmeras, café, tabaco, té y similares), las cucurbitáceas (calabaza, pepino, sandía, melón y similares), las plantas de praderas (*dactylis*, sorgo, *phleum pratense*, trébol, alfalfa y similares), los pastos de jardín (césped de terciopelo coreano, *agrostis* y similares), las plantas de especies, etc. (lavanda, romero, tomillo, perejil, pimiento, jengibre y similares) y las flores (crisantemo, rosa, orquídea y similares).

Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de café, en particular, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus coffeae*, *Meloidogyne exigua*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne coffeicola*, *Helicotylenchus* spp. y también *Meloidogyne paranaensis*, *Rotylenchus* spp., *Xiphinema* spp., *Tylenchorhynchus* spp. y *Scutellonema* spp.

Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de papas, en particular, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus coffeae*, *Ditylenchus dipsaci* y de *Pratylenchus alleni*, *Pratylenchus andinus*, *Pratylenchus cerealis*, *Pratylenchus crenatus*, *Pratylenchus hexincisus*, *Pratylenchus loosi*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus teres*, *Pratylenchus thornei*, *Pratylenchus vulnus*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Trichodorus cylindricus*, *Trichodorus primitivus*, *Trichodorus proximus*, *Trichodorus similis*, *Trichodorus sparsus*, *Paratrichodorus minor*, *Paratrichodorus allius*, *Paratrichodorus nanus*, *Paratrichodorus teres*, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne fallax*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne thamesi*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne javanica*, *Nacobbus aberrans*, *Globodera rostochiensis*, *Globodera pallida*, *Ditylenchus destructor*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus reniformis*, *Neotylenchus vigissi*, *Paraphelenchus pseudoparietinus*, *Aphelenchoides fragariae* y *Meloinema* spp.

Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de tomates, en particular, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne incognita*, *Pratylenchus penetrans* y también *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus vulnus*, *Paratrichodorus minor*, *Meloidogyne exigua*, *Nacobbus aberrans*, *Globodera solanacearum*, *Dolichodorus heterocephalus* y *Rotylenchulus reniformis*.

Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de la planta de pepino, en particular, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne incognita*, *Rotylenchulus reniformis* y *Pratylenchus thornei*.

Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de algodón, en particular, *Belonolaimus longicaudatus*, *Meloidogyne incognita*, *Hoplolaimus columbus*, *Hoplolaimus galeatus* y *Rotylenchulus reniformis*.

Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de maíz, en particular, *Belonolaimus longicaudatus*, *Paratrichodorus minor* y también *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus delattrei*, *Pratylenchus hexincisus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus zeae*, (*Belonolaimus gracilis*), *Belonolaimus nortoni*, *Longidorus breviannulatus*, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne arenaria thamesi*, *Meloidogyne graminis*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne incognita acrita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne naasi*, *Heterodera avenae*, *Heterodera oryzae*, *Heterodera zeae*, *Punctodera chalconensis*, *Ditylenchus dipsaci*, *Hoplolaimus aegyptii*, *Hoplolaimus magnistylus*, *Hoplolaimus galeatus*, *Hoplolaimus indicus*, *Helicotylenchus digonicus*, *Helicotylenchus dihystrera*, *Helicotylenchus pseudorobustus*, *Xiphinema americanum*, *Dolichodorus heterocephalus*, *Criconemella ornata*, *Criconemella onoensis*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus borealis*, *Rotylenchulus parvus*, *Tylenchorhynchus agri*, *Tylenchorhynchus clarus*, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus maximus*, *Tylenchorhynchus nudus*, *Tylenchorhynchus vulgaris*, *Quinisulcius acutus*, *Paratylenchus minutus*, *Hemicyclophora parvana*, *Aglenchus agricola*, *Anguina tritici*, *Aphelenchoides arachidis*, *Scutellonema brachyurum* y *Subanguina radiciola*.

Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de soja, en particular, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus scribneri*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Heterodera glycines*, *Hoplolaimus columbus* y también *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus hexincisus*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus crenatus*, *Pratylenchus alleni*, *Pratylenchus*

agilis, *Pratylenchus zaeae*, *Pratylenchus vulnus*, (*Belonolaimus gracilis*), *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne hapla*, *Hoplolaimus columbus*, *Hoplolaimus galeatus* y *Rotylenchulus reniformis*.

5 Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de tabaco, en particular, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica* y también *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus hexincisus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus crenatus*, *Pratylenchus thornei*, *Pratylenchus vulnus*, *Pratylenchus zaeae*, *Longidorus elongatus*, *Paratrichodorus lobatus*, *Trichodorus spp.*, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne hapla*, *Globodera tabacum*, *Globodera solanacearum*, *Globodera virginiae*, *Ditylenchus dipsaci*, *Rotylenchus spp.*, *Helicotylenchus spp.*, *Xiphinema americanum*, *Cricone-mella spp.*, *Rotylenchulus reniformis*, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Paratylenchus spp.* y *Tetylenchus nicotianae*.

15 Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de cítrico, en particular, *Pratylenchus coffeae* y también *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus vulnus*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Paratrichodorus minor*, *Paratrichodorus porosus*, *Trichodorus*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne incognita acrita*, *Meloidogyne javanica*, *Rotylenchus macrodorus*, *Xiphinema americanum*, *Xiphinema brevicolle*, *Xiphinema index*, *Cricone-mella spp.*, *Hemicricone-moides*, *Radopholus similis* y *Radopholus citrophilus*, *Hemicycliophora arenaria*, *Hemicycliophora nudata* y *Tylenchulus semipenetrans*.

20 Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de banana, en particular, *Pratylenchus coffeae*, *Radopholus similis* y también *Pratylenchus giibbicaudatus*, *Pratylenchus loosi*, *Meloidogyne spp.*, *Helicotylenchus multicinctus*, *Helicotylenchus dihystra* y *Rotylenchulus spp.*

25 Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de piña, en particular, *Pratylenchus zaeae*, *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus goodeyi*, *Meloidogyne spp.*, *Rotylenchulus reniformis* y también *Longidorus elongatus*, *Longidorus laevicapitatus*, *Trichodorus primitivus*, *Trichodorus minor*, *Heterodera spp.*, *Ditylenchus myceliophagus*, *Hoplolaimus californicus*, *Hoplolaimus pararobustus*, *Hoplolaimus indicus*, *Helicotylenchus dihystra*, *Helicotylenchus nannus*, *Helicotylenchus multicinctus*, *Helicotylenchus erythrine*, *Xiphinema dimorphicaudatum*, *Radopholus similis*, *Tylenchorhynchus digitatus*, *Tylenchorhynchus ebriensis*, *Paratylenchus minutus*, *Scutellonema clathricaudatum*, *Scutellonema bradys*, *Psilenchus tumidus*, *Psilenchus magnidens*, *Pseudohalenchus minutus*, *Cricone-moides ferniae*, *Cricone-moides onoense* y *Cricone-moides ornatum*.

30 Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de vid, en particular, *Pratylenchus vulnus*, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Xiphinema americanum*, *Xiphinema index* y también *Pratylenchus pratensis*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus thornei* y *Tylenchulus semipenetrans*.

35 Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de tres cultivos: frutas de pepita, en particular, *Pratylenchus penetrans* y también *Pratylenchus vulnus*, *Longidorus elongatus*, *Meloidogyne incognita* y *Meloidogyne hapla*.

40 Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de tres cultivos: frutas de hueso, en particular, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus vulnus*, *Meloidogyne arenaria*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne incognita*, *Cricone-mella xenoplax* y de *Pratylenchus brachyurus*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus scribneri*, *Pratylenchus zaeae*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Helicotylenchus dihystra*, *Xiphinema americanum*, *Cricone-mella curvata*, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Paratylenchus hamatus*, *Paratylenchus projectus*, *Scutellonema brachyurum* y *Hoplolaimus galeatus*.

45 Los compuestos de la fórmula (I) son particularmente adecuados para controlar los nematodos de tres cultivos: caña de azúcar y arroz, en particular *Trichodorus spp.*, *Cricone-mella spp.* y también *Pratylenchus spp.*, *Paratrichodorus spp.*, *Meloidogyne spp.*, *Helicotylenchus spp.*, *Tylenchorhynchus spp.*, *Aphelenchoides spp.*, *Heterodera spp.*, *Xiphinema spp.* y *Cacopaurus pestis*.

Aplicación

50 El compuesto de la fórmula (I) puede aplicarse como tal o, por ejemplo, en forma de soluciones, emulsiones, suspensiones a base de agua o aceite, polvos, polvos humedecibles, pastas, polvos solubles, polvillos, gránulos solubles, gránulos para siembra a voleo, concentrados de suspoemulsiones, productos naturales impregnados con el compuesto de la fórmula (I), sustancias sintéticas impregnadas con el compuesto de la fórmula (I), fertilizantes o microencapsulaciones en sustancias poliméricas listos para su utilización.

55 La aplicación se realiza de manera habitual, por ejemplo, al regar, pulverizar, atomizar, sembrar al voleo, espolvorear, aplicar espuma, esparcir sobre y similares. También es posible emplear el compuesto de la fórmula (I) mediante el procedimiento de volumen ultrabajo, a través de un sistema de irrigación o aplicación en drench, para aplicarla en surco o para inyectarla en el suelo alrededor del tallo o tronco. También es posible aplicar el compuesto de la fórmula (I) por medio de un sello, pintura u otro vendaje cicatrizante.

La cantidad eficaz y compatible con la planta del compuesto de la fórmula (I) que se aplica a las plantas, partes de la planta, frutos, semillas o el suelo dependerá de varios factores, tales como el compuesto/composición utilizado, lo que se somete a tratamiento (planta, parte de la planta, fruto, semilla o suelo), el tipo de tratamiento (espolvoreo, pulverización, desinfección de semillas), el propósito del tratamiento (curativo o protector), el tipo de microorganismos, la etapa de desarrollo de los microorganismos, la sensibilidad de los microorganismos, la etapa de crecimiento del cultivo y las condiciones ambientales.

Cuando se utiliza el compuesto de la fórmula (I) como fungicida, las tasas de aplicación pueden variar dentro de un rango relativamente amplio, según el tipo de aplicación. Para el tratamiento de partes de la planta, tales como las hojas, la tasa de aplicación puede oscilar de 0,1 g/ha a 10.000 g/ha, preferentemente de 10 g/ha a 1000 g/ha, más preferentemente de 50 g/ha a 300 g/ha (en caso de aplicar mediante riego o goteo, se puede incluso reducir la tasa de aplicación, especialmente cuando se utilizan sustratos inertes tales como lana de roca o perlita). Para el tratamiento de las semillas, la tasa de aplicación puede oscilar de 0,1 g a 200 g cada 100 kg de semillas, preferentemente de 1 g a 150 g cada 100 kg de semillas, más preferentemente de 2,5 g a 25 g cada 100 kg de semillas e incluso más preferentemente de 2,5 g a 12,5 g cada 100 kg de semillas. Para el tratamiento del suelo, la tasa de aplicación puede oscilar de 0,1 g/ha a 10.000 g/ha, preferentemente de 1 g/ha a 5000 g/ha.

Estas tasas de aplicación son meros ejemplos y no está previsto que limite el alcance de la presente invención.

Protección de materiales

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

Además, el compuesto y la composición de la invención pueden usarse como composiciones contra las incrustaciones, solos o en combinaciones con otros ingredientes activos.

En el presente contexto, materiales industriales son materiales inanimados que se han preparado para usar en la industria. Por ejemplo, los materiales industriales que deben protegerse de la alteración o destrucción microbiana pueden ser adhesivos, pegamentos, papel, papel para empapelado y cartón/cartulina, telas, alfombras, cuero, madera, fibras y tejidos, pinturas y artículos plásticos, lubricantes para enfriamiento y otros materiales que pueden infectarse o ser destruidos por microorganismos. Partes de fábricas y establecimientos de producción, por ejemplo, circuitos de agua de enfriamiento, sistemas de enfriamiento y calefacción y unidades de ventilación y aire acondicionado, que pueden verse perjudicadas por la proliferación de microorganismos también pueden mencionarse dentro del alcance de los materiales por proteger. Algunos materiales industriales dentro del alcance de la presente invención incluyen, preferentemente, adhesivos, colas, papel y cartón, cuero, madera, pinturas, lubricantes para enfriamiento y fluidos de transferencia de calor, más preferentemente madera.

El compuesto y la composición de la invención pueden prevenir efectos adversos, tales como podredumbre, descomposición, alteración del color, pérdida del color o formación de moho.

En el caso del tratamiento de la madera, el compuesto y la composición de la invención también pueden usarse contra enfermedades fúngicas que podrían desarrollarse en o dentro de la madera.

Madera significa todos los tipos de especies de madera y todos los tipos de trabajo en esta madera destinados para la construcción, por ejemplo, madera maciza, madera de alta densidad, madera laminada y madera terciada. Además, el compuesto y la composición de la invención pueden usarse para proteger de incrustaciones a objetos en contacto con el agua salada o salobre, especialmente cascos de embarcaciones, mallas, redes, construcciones, amarraderos y sistemas de señalización.

El compuesto y la composición de la invención también pueden emplearse para proteger mercancías en almacenamiento. Mercancías en almacenamiento son sustancias naturales de origen vegetal o animal o productos procesados de estos que son de origen natural, y para los cuales se desea protección a largo plazo. Las mercancías en almacenamiento de origen vegetal, por ejemplo, plantas o partes de plantas, tales como tallos, hojas, tubérculos, semillas, frutos, flores, granos, pueden protegerse recién cosechadas o después de procesarse mediante (pre)secado, humedecimiento, desmenuzamiento, molienda, prensado o tostado. Las mercancías en almacenamiento también incluyen madera, ya sea madera no procesada, tal como madera de construcción, postes de electricidad y barreras, o en la forma de productos terminados, tales como muebles. Las mercancías en almacenamiento de origen animal son, por ejemplo, pieles, cuero, pelaje y pelos. El compuesto y la composición de la invención pueden prevenir efectos adversos, tales como podredumbre, descomposición, alteración del color, pérdida del color o formación de moho.

Los microorganismos capaces de degradar o alterar materiales industriales incluyen, por ejemplo, bacterias, hongos, levaduras, algas y organismos mucilaginosos. El compuesto y la composición de la invención actúan, preferentemente, contra hongos, especialmente mohos, hongos que alteran el color de la madera y que

destruyen la madera (*Ascomycetes*, *Basidiomycetes*, *Deuteromycetes* y *Zygomycetes*), y contra organismos mucilaginosos y algas. Los ejemplos incluyen microorganismos de los siguientes géneros: *Alternaria*, tal como *Alternaria tenuis*; *Aspergillus*, tal como *Aspergillus niger*; *Chaetomium*, tal como *Chaetomium globosum*; *Coniophora*, tal como *Coniophora puetana*; *Lentinus*, tal como *Lentinus tigrinus*; *Penicillium*, tal como *Penicillium glaucum*; *Polyporus*, tal como *Polyporus versicolor*; *Aureobasidium*, tal como *Aureobasidium pullulans*; *Sclerophoma*, tal como *Sclerophoma pityophila*; *Trichoderma*, tal como *Trichoderma viride*; *Ophiostoma* spp., *Ceratocystis* spp., *Hemicola* spp., *Petriella* spp., *Trichurus* spp., *Coriolus* spp., *Gloeophyllum* spp., *Pleurotus* spp., *Poria* spp., *Serpula* spp. y *Tyromyces* spp., *Cladosporium* spp., *Paecilomyces* spp., *Mucor* spp., *Escherichia*, tal como *Escherichia coli*; *Pseudomonas*, tal como *Pseudomonas aeruginosa*; *Staphylococcus*, tal como *Staphylococcus aureus*, *Candida* spp. y *Saccharomyces* spp., tal como *Saccharomyces cerevisiae*.

Se pueden comprender aún más los aspectos de la presente instrucción puede en vista de los siguientes ejemplos, que no deben interpretarse de ninguna manera como limitantes del alcance de la presente instrucción.

15 EJEMPLOS

Ejemplo de preparación 1: 1-[[[(3-bromo-4,5-dicloro-2-tienil)carbonil]amino]ciclopropanocarboxilato de etilo (compuesto I.03)

Paso 1: Preparación de 3-amino-4,5-diclorotiofeno-2-carboxilato de metilo

1,35 g (5,04 mmol) de 3-acetamido-4,5-diclorotiofeno-2-carboxilato de metilo se disolvió en una mezcla de 2,1 mL (25,18 mmol) de una solución clorhídrica acuosa del 37% (p/p) y 8,2 mL de metanol. Se calentó la mezcla a 75 °C durante 3 horas. Se trató la mezcla de reacción enfriada con una solución de hidróxido de sodio al 30% (p/p) a 0 °C. La solución resultante se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron con sulfato de magnesio, se filtraron y concentraron en presión reducida para obtener 812 mg (98% de pureza, 70% de rendimiento) de 3-amino-4,5-diclorotiofeno-2-carboxilato de metilo como un sólido marrón usado como tal en el siguiente paso. LogP = 3,11. (M-H) = 226.

Paso 2: Preparación de 3-bromo-4,5-diclorotiofeno-2-carboxilato de metilo (compuesto IIa.03)

A una solución de 763 mg (3,41 mmol) de bromuro de cobre (II) y 0,53 mL (90% de pureza, 3,99 mmol) de nitrito de *tert*-butilo en 10,5 mL de acetonitrilo de anhidro se agregó con respecto a las porciones 600 mg (88% de pureza, 2,33 mmol) de 3-amino-4,5-diclorotiofeno-2-carboxilato de metilo a 0 °C. Después de que se desprendiera el gas, se agitó la solución a temperatura ambiente durante 18 horas. Se diluyó la mezcla de reacción con acetato de etilo y se acidificó con una solución acuosa de ácido clorhídrico de 1 M. La capa acuosa se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron con sulfato de magnesio, se filtraron y concentraron a presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (gradiente *n*-heptano/acetato de etilo) para obtener 563 mg (98% de pureza, 82% de rendimiento) de 3-bromo-4,5-diclorotiofeno-2-carboxilato de metilo como un sólido amarillo. LogP = 3,99. (M+H) = 288.

Paso 3: Preparación de ácido 3-bromo-4,5-diclorotiofeno-2-carboxílico de (compuesto IIa.04)

A una solución de 250 mg (0,86 mmol) de 3-bromo-4,5-diclorotiofeno-2-carboxilato de metilo en 5 mL de tetrahidrofurano se agregó gota a gota 1 mL de una solución acuosa de hidróxido de potasio de 1,9 M (1,9 mmol). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante 18 horas. Se diluyó la mezcla de reacción con acetato de etilo, agua y una solución acuosa de bicarbonato de sodio saturada. Se lavó la capa orgánica dos veces con una solución acuosa de bicarbonato de sodio. Se acidificaron cuidadosamente las capas acuosas combinadas con una solución acuosa de ácido clorhídrico al 37% (p/p) a 0 °C y se extrajeron con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron con sulfato de magnesio, se filtran y concentraron a presión reducida para obtener 219 mg (96% de pureza, 88% de rendimiento) de ácido 3-bromo-4,5-diclorotiofeno-2-carboxílico como un sólido blanco. LogP = 2,51. (M-H) = 273.

Paso 4: Preparación de 1-[[[(3-bromo-4,5-dicloro-2-tienil)carbonil]amino]ciclopropanocarboxilato de etilo (compuesto I.03)

En un matraz de fondo redondo de 100 mL en una atmósfera inerte, una solución de 2,47 g (14,6 mmol) de 2-cloro-1,3-dimetiloimidazolidinium cloruro disuelta en 50 mL de diclorometano se agregó en una solución de 3,45 g (90% de pureza, 11,2 mmol) de ácido 3-bromo-4,5-diclorotiofeno-2-carboxílico y 8,43 mL (48,3 mmol) de *N,N*-diisopropiloetiloamina disuelta en 50 mL de diclorometano. Después de 5 minutos de agitación, se agregaron 2,47 mg (14,6 mmol) de hidrocloreto de etilo 1-aminociclopropanocarboxilato (1:1) y se agitó la mezcla de reacción a temperatura ambiente durante 16 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice (gradiente *n*-heptano/acetato de etilo) para obtener 3,75 mg (100% de pureza, 86% de rendimiento) de 1-[[[(3-bromo-4,5-

dicloro-2-tienil)carbonil]amino}ciclopropanocarboxilato de etilo como un sólido beige. LogP = 3,44. (M+H) = 386.

Ejemplo de preparación 2: ácido 1-[[[(3-bromo-4,5-dicloro-2-tienil)carbonil]amino}ciclopropanocarboxílico (compuesto I.15)

- 5 A una solución de 150 mg (0,38 mmol) de 1-[[[(3-bromo-4,5-dicloro-2-tienil)carbonil]amino}ciclopropanocarboxilato de etilo en 2,3 mL de tetrahidrofurano se agregó gota a gota una solución de 19,5 mg (0,81 mmol) de hidróxido de litio en agua (0,4 mL). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. Se diluyó la mezcla de reacción con acetato de etilo, agua y se acidificó cuidadosamente a pH 1 con una solución de ácido clorhídrico acuosa de 1 M y se extrajo dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se secaron con sulfato de magnesio, se filtran y concentraron a presión reducida para obtener 131 mg (100% de pureza, 94% de rendimiento) de ácido 3-bromo-4,5-diclorotiofeno-2-carboxílico como un sólido blanco. LogP = 2,39. (M-H) = 358.

Ejemplo de preparación 3: 1-[[[(3-bromo-4,5-dicloro-2-tienil)carbonil]amino}ciclopropanocarboxilato de etilo (compuesto I.03)

- 15 **Paso 1:** Preparación del ácido 3-amino-4,5-diclorotiofeno-2-carboxílico (compuesto XIIIa.02)

A una solución de 200 mg (0,74 mmol) de 3-acetamido-4,5-diclorotiofeno-2-carboxilato de metilo en 1,0 mL de metanol se agregó gota a gota una solución de 105 mg (1,86 mmol) de hidróxido de potasio en agua (1,0 mL). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 0,5 horas, luego se calentó a 85 °C durante 18 horas. La mezcla de reacción resultante se concentró a presión reducida para obtener una capa acuosa que se acidificó cuidadosamente en un pH 6 con una solución de ácido clorhídrico acuoso de 1 M. El precipitado resultante se filtró y secó para obtener 112 mg (96% de pureza, 68% de rendimiento) del compuesto del título como un sólido beige. LogP = 2,05. (M-H) = 212.

Paso 2: Preparación de 1-[[[(3-amino-4,5-dicloro-2-tienil)carbonil]amino}ciclopropanocarboxilato de etilo (compuesto XI.01)

- 25 A una solución de 150 mg (0,60 mmol) de hidrocloreto de ácido 3-amino-4,5-diclorotiofeno-2-carboxílico (1:1) y 255 mg (1,50 mmol) de hidrocloreto de etilo 1-aminociclopropanocarboxilato (1:1) disueltos en 4,0 mL de diclorometano se agregará 0,45 mL (2,59 mmol) de N,N-diisopropiloetiloamina seguido de una solución de 255 mg (1,50 mmol) de cloruro de 2-cloro-1,3-dimetilimidazolinio en 2,0 mL de diclorometano. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. Se desactivó la mezcla de reacción con agua y se extrajo con diclorometano. Las capas orgánicas combinadas se secaron con sulfato de magnesio, se filtraron y concentraron a presión reducida. El residuo se purificó mediante la cromatografía de líquidos de alto rendimiento preparativa (gradiente acetonitrilo/solución acuosa de ácido fórmico [1%]) para obtener 69 mg (100% de pureza, 35% de rendimiento) del compuesto del título como un sólido blanco. LogP = 2,77. (M-H) = 323.

- 35 **Paso 3:** Preparación de 1-[[[(3-bromo-4,5-dicloro-2-tienil)carbonil]amino}ciclopropanocarboxilato de etilo (compuesto I.03)

A una solución de 53 mg (0,46 mmol) de bromuro de cobre (II) y 61 µL (90% de pureza, 0,46 mmol) de *tert*-butilo nitrito en 2 mL de acetonitrilo de anhidro se agregó gota a gota una solución de 100 mg (0,30 mmol) de 1-[[[(3-amino-4,5-dicloro-2-tienil)carbonil]amino}ciclopropanocarboxilato de etilo en 2 mL de acetonitrilo de anhidro a 0 °C. Después de que evolucionó el gas, se agitó la solución a temperatura ambiente durante 72 horas. Se diluyó la mezcla de reacción con diclorometano y se acidificó con una solución de ácido clorhídrico acuosa de 1 M. La capa acuosa se extrajo dos veces con diclorometano. Las capas orgánicas combinadas se secaron con sulfato de magnesio, se filtraron y concentraron a presión reducida. Primero, el residuo se purificó mediante la cromatografía de líquidos de alto rendimiento preparativa (gradiente acetonitrilo/solución acuosa de ácido fórmico [1%]) luego mediante la cromatografía de fluidos supercrítica preparativa (gradiente CO₂/Etanol) para obtener 30 mg (100% de pureza, 25% de rendimiento) del compuesto del título como un sólido blanco. LogP = 3,48. (M+H) = 386.

Ejemplo de preparación 4: 1-[[[(4,5-dibromo-3-fluoro-2-tienil)carbonil]amino}ciclopropanocarboxilato de etilo (compuesto I.01)

- 50 **Paso 1:** Preparación de 1-[[[(4-bromo-3-fluoro-2-tienil)carbonil]amino}ciclopropanocarboxilato de etilo (compuesto IVa.01)

A una solución de 300 mg (1,33 mmol) de 4-bromo-3-fluorotiofeno-2-ácido carboxílico y 442 mg (2,66 mmol) de hidrocloreto de etilo 1-aminociclopropanocarboxilato (1:1) disueltos en 10 mL de diclorometano se agregará 1,0 mL (5,73 mmol) de N,N-diisopropiloetiloamina seguido de una solución de 293 mg (1,73 mmol) de cloruro de 2-cloro-1,3-dimetilimidazolinio en 1,7 mL de diclorometano. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 18 horas. Se desactivó la mezcla de reacción con agua y se extrajo con diclorometano. Las

capas orgánicas combinadas se filtraron a través de un cartucho Chem Elut™ y se concentraron a presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (gradiente *n*-heptano/acetato de etilo) para obtener 315 mg (100% de pureza, 70% de rendimiento) del compuesto del título como un sólido blanco. LogP = 2,39. (M-H) = 336.

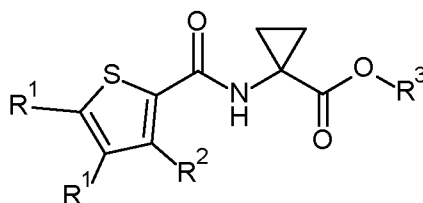
5 **Paso 2:** Preparación de 1-[[[(4,5-dibromo-3-fluoro-2-tienil)carbonil]amino]ciclopropanocarboxilato de etilo (compuesto I.01)

En un vial de microondas, a una suspensión agitada de 100 mg (0,29 mmol) de 1-[[[(4-bromo-3-fluoro-2-tienil)carbonil]amino]ciclopropanocarboxilato de etilo en 1 mL de ácido acético se agregaron 92 µL (1,78 mmol) de bromo. Se selló el vial y se agitó la mezcla de reacción a 70 °C durante 2,5 horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se agregó a una solución agitada de hielo y tiosulfato de sodio. La mezcla resultante se extrajo dos veces con diclorometano. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua, se secaron con sulfato sódico, se filtraron y concentraron a presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna en gel de sílice (gradiente *n*-heptano/acetato de etilo) para obtener 27 mg (100% de pureza, 22% de rendimiento) del compuesto del título como un sólido blanco. LogP = 3,13. (M+Na) = 436.

15 **Compuestos ejemplares**

Como se muestran en las tablas 1, 2, 3, 4, 5 y 6, los compuestos ejemplares según la invención se prepararon en analogía con los ejemplos proporcionados arriba y/o de conformidad con la descripción general de los procesos en el presente documento divulgado.

La siguiente tabla 1 ilustra de manera no limitante los ejemplos de los compuestos según la fórmula (I).



(I)

Tabla 1:

Ex N°	R ¹	R ²	R ³	LogP
I.01	Br	F	Et	3,13 ^[a]
I.02	Br	F	H	2,19 ^[a]
I.03	Cl	Br	Et	3,45 ^[a]
I.04	Cl	I	Et	3,39 ^[a]
I.05	Cl	I	H	2,34 ^[a]
I.06	Br	I	Et	3,41 ^[a]
I.07	Br	I	Me	3,06 ^[a]
I.08	Br	I	H	2,43 ^[a]
I.09	Br	Cl	Et	3,51 ^[a]
I.10	Br	Cl	Me	3,06 ^[a]
I.11	Br	Br	Me	3,11 ^[a]
I.12	Cl	Br	Me	3,06 ^[a]
I.13	Br	Cl	H	2,41 ^[a]
I.14	Br	Br	H	2,43 ^[a]
I.15	Cl	Br	H	2,37 ^[a]

ES 2 989 675 T3

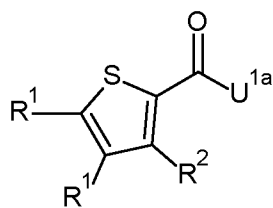
Ex N°	R ¹	R ²	R ³	LogP
I.16	Br	F	Me	2,77 ^[a]
I.17	Br	F	bencilo	3,94 ^[a]
I.18	Br	F	ciclopentilo	3,99 ^[a]
I.19	Br	F	<i>tert</i> -butilo	3,91 ^[a]
I.20	Br	F	2-metilpropilo	3,92 ^[a]
I.21	Br	F	butilo	3,96 ^[a]
I.22	Br	F	isopropilo	3,52 ^[a]
I.23	Br	F	prop-2-in-1-il	3,06 ^[a]
I.24	Br	F	alilo	3,33 ^[a]
I.25	Cl	Br	bencilo	4,28 ^[a]
I.26	Cl	Br	ciclopentilo	4,37 ^[a]
I.27	Cl	Br	<i>tert</i> -butilo	4,30 ^[a]
I.28	Cl	Br	2-metilpropilo	4,31 ^[a]
I.29	Cl	Br	butilo	4,34 ^[a]
I.30	Cl	Br	ciclobutilo	4,07 ^[a]
I.31	Cl	Br	propilo	3,89 ^[a]
I.32	Cl	Br	isopropilo	3,86 ^[a]
I.33	Cl	Br	prop-2-in-1-il	3,35 ^[a]
I.34	Cl	Br	alilo	3,66 ^[a]
I.35	Br	I	ciclobutilo	3,99 ^[a]
I.36	Br	F	ciclobutilo	3,71 ^[a]
I.37	Br	F	propilo	3,54 ^[a]
I.38	Br	Br	ciclobutilo	4,10 ^[a]
I.39	Br	Br	propilo	3,92 ^[a]
I.40	Br	Cl	propilo	3,91 ^[a]
I.41	Br	I	propilo	3,85 ^[a]
I.42	Br	Cl	ciclobutilo	4,17 ^[a]
I.43	Br	Br	Et	3,51 ^[a]
I.44	Cl	F	Et	3,05 ^[a]
I.45	Cl	F	Me	2,65 ^[a]
I.46	Cl	Br	ciclopropilmetilo	4,05 ^[a]
I.47	Br	Br	prop-2-in-1-il	3,44 ^[a]
I.48	Br	Br	alilo	3,77 ^[a]
I.49	Br	Br	<i>tert</i> -butilo	4,40 ^[a]

Ex N°	R ¹	R ²	R ³	LogP
I.50	Br	Br	bencilo	4,37 ^[a]
I.51	Br	I	prop-2-in-1-il	3,40 ^[a]
I.52	Br	I	alilo	3,71 ^[a]
I.53	Br	I	<i>tert</i> -butilo	4,30 ^[a]
I.54	Br	I	bencilo	4,30 ^[a]
I.55	Br	Br	ciclopentilo	4,47 ^[a]
I.56	Br	Br	2-metilpropilo	4,40 ^[a]
I.57	Br	Br	butilo	4,44 ^[a]
I.58	Br	Br	isopropilo	3,98 ^[a]
I.59	Br	I	ciclopentilo	4,37 ^[a]
I.60	Br	I	2-metilpropilo	4,33 ^[a]
I.61	Br	I	butilo	4,33 ^[a]
I.62	Br	I	isopropilo	3,87 ^[a]
I.63	Cl	Br	cianometilo	3,06 ^[a]
I.64	Cl	Br	2,2,2-trifluoroetilo	3,91 ^[a]
I.65	Cl	Br	trimetilsililmetilo	5,00 ^[a]
I.66	Cl	Br	fenilo	4,19 ^[a]
I.67	Br	Br	ciclopropilmetilo	4,02 ^[a]
I.68	Br	Br	oxan-4-il	3,26 ^[a]
I.69	Br	Br	trimetilsililmetilo	4,97 ^[a]
I.70	Cl	Br	oxan-4-il	3,23 ^[a]
I.71	Cl	Br	tietan-3-il	3,87 ^[a]
I.72	Br	Br	cianometilo	3,16 ^[a]
I.73	Br	Br	fenilo	4,23 ^[a]
I.74	Br	Br	2,2,2-trifluoroetilo	3,94 ^[a]
I.75	Br	Br	tietan-3-il	4,85 ^[a]

Nota: Me: metilo, Et: etilo

Como se muestran en las siguientes tablas, los productos intermedios ejemplares según la invención se prepararon en analogía con los ejemplos proporcionados arriba y/o de conformidad con la descripción general de los procesos en el presente documento divulgado.

- 5 La siguiente tabla 2 ilustra de manera no limitante los ejemplos de los productos intermedios según la fórmula (IIa).

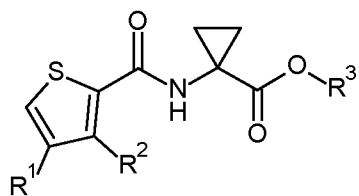


(IIa)

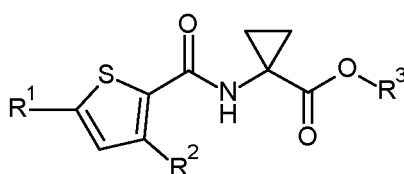
Tabla 2:

Ex N°	R ¹	R ²	U ^{1a}	LogP
II.a.01	Br	F	2-metilpropoxi	5,31 ^[a]
II.a.02	Cl	I	OEt	4,73 ^[b]
II.a.03	Cl	Br	OMe	4,11 ^[a]
II.a.04	Cl	Br	OH	2,52 ^[a]
II.a.05	Br	I	OMe	4,20 ^[a]
II.a.06	Cl	I	OMe	4,15 ^[a]
II.a.07	Cl	I	OH	2,64 ^[a]
II.a.08	Br	I	OEt	4,78 ^[a]
II.a.09	Cl	Br	OEt	4,58 ^[a]
Nota: Me: metilo, Et: etilo				

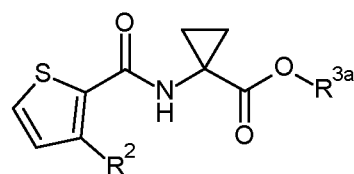
5 En la siguiente tabla 3 se ilustra de manera no limitante los ejemplos de los productos intermedios según la fórmula (IVa), (IVb) y (IVc).



(IVa)



(IVb)

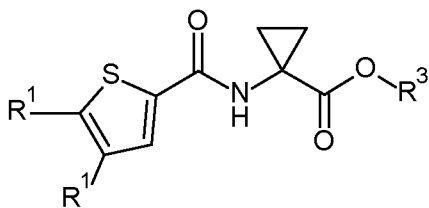


(IVc)

Tabla 3:

Ex N°	R ¹	R ²	R ³	R ^{3a}	LogP
IVa.01	Br	F	Et	-	2,37 ^[a]
IVb.01	Br	Cl	Et	-	2,84 ^[a]
IVb.02	Br	I	Et	-	2,98 ^[a]
IVb.03	Br	F	Et	-	2,46 ^[a]
IVb.04	Cl	Br	Et	-	2,86 ^[a]
IVb.05	Br	Br	Et	-	2,92 ^[a]
IVc.01	-	F	-	Et	1,65 ^[a]
Nota: Et: etilo					

En la siguiente tabla 4 se ilustra de manera no limitante los ejemplos de los productos intermedios según la fórmula (V).



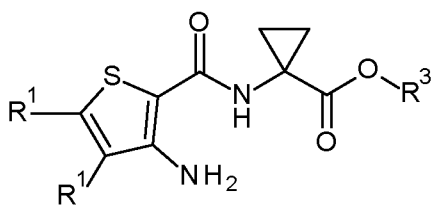
(V)

5

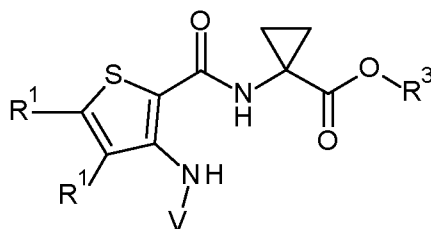
Tabla 4:

Ex N°	R¹	R³	LogP
V.01	Br	Et	2,90 ^[a]
V.02	Br	isopropilo	3,25 ^[a]
V.03	Cl	Et	2,77 ^[a]
V.04	Cl	Me	2,49 ^[a]
V.05	Cl	H	2,01 ^[a]
Nota: Me: metilo, Et: etilo			

En la siguiente tabla 5 se ilustra de manera no limitante los ejemplos de los productos intermedios según la fórmula (XI) y (XIa).



(XI)



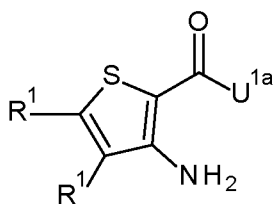
(XIa)

10

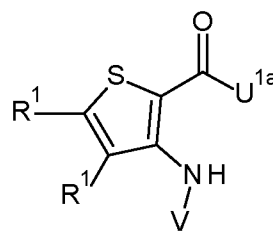
Tabla 5:

Ex N°	R¹	R³	V	LogP
XI.01	Cl	Et		2,77 ^[a]
XIa.01	Cl	Et	<i>tert</i> -butoxicarbonilo	3,34 ^[a]
Nota: Et: etilo				

En la siguiente tabla 6 se ilustra de manera no limitante los ejemplos de los productos intermedios según la fórmula (XIVa).



(XIIIa)



(XIVa)

Tabla 6:

Ex N°	R ¹	U ^{1a}	V	LogP
XIIIa.01	Br	OMe		3,15 ^[a]
XIIIa.02	Cl	OH		2,05 ^[a]
XIVa.01	Br	OMe	acetilo	2,01 ^[a]
XIVa.02	Br	OH	acetilo	1,39 ^[a]
Nota: Me: metilo, acetilo: -C(=O)-CH ₃				

En las tablas de arriba, las mediciones de los valores de LogP se realizaron según la directiva de la CEE 79/831 Anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento) en columnas de fase reversa con los siguientes procedimientos:

^[a] El valor de LogP se determina por la medición de LC-UV, en un rango ácido, con ácido fórmico al 0,1% en agua y acetonitrilo como eluyente (gradiente lineal de acetonitrilo al 10% a acetonitrilo al 95%).

^[b] El valor de LogP se determina por la medición de LC-UV, en un rango neutral, con solución de acetato de amonio 0,001 molar en agua y acetonitrilo como eluyente (gradiente lineal de acetonitrilo al 10% a acetonitrilo al 95%).

^[c] El valor de LogP se determina por la medición de LC-UV, en un rango ácido, con ácido fosfórico al 0,1% en agua y acetonitrilo como eluyente (gradiente lineal de acetonitrilo al 10% a acetonitrilo al 95%).

Si se dispone de más de un valor de LogP en el mismo procedimiento, se dan todos los valores y se separan con un "+".

La calibración se realizó con alcan-2-onas de cadena recta (con 3 a 16 átomos de carbono) con valores de LogP conocidos (mediciones de los valores de LogP usando tiempos de retención con interpolación lineal entre las alcanonas sucesivas). Los valores lambda máx. se determinaron usando espectros UV de 200 nm a 400 nm y los valores pico de las señales cromatográficas.

Listas de picos de la RMN

La tabla A proporciona los datos de RMN (¹H) de algunos compuestos que se divulgan en las tablas de arriba.

Los datos de RMN de ¹H- de ejemplos seleccionados se redactan en forma de listas de picos de RMN de ¹H. Para cada pico de la señal se enumera el valor δ en ppm y la intensidad de la señal entre paréntesis. Entre los pares de valor δ e intensidad de la señal hay un punto y coma como delimitador.

Por lo tanto, la lista de picos de un ejemplo tiene el siguiente patrón:

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

La intensidad de las señales agudas se correlaciona con altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en centímetros y muestra las relaciones reales de las intensidades de señal. A partir de las señales amplias se pueden mostrar varios picos o la mitad de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensa en el espectro.

Para calibrar la desviación química para los espectros de ¹H, se utiliza tetrametilsilano y/o la desviación química del solvente usado, especialmente en el caso de espectros que se miden en DMSO. Por lo tanto, en las listas de picos de RMN puede ocurrir el pico de tetrametilsilano, aunque no necesariamente.

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

Además, se pueden mostrar como señales impresas clásicas de RMN de ^1H de solventes, estereoisómeros de los compuestos blanco, que también son objeto de la invención, y/o picos de impurezas.

- 5 Para mostrar las señales del compuesto en el rango delta de los solventes y/o agua, se muestran en las listas de picos de RMN de ^1H los picos normales de los solventes, por ejemplo, picos de DMSO en DMSO- D_6 , y el pico de agua. Estos tienen comúnmente en promedio una intensidad alta.

- 10 Los picos de los estereoisómeros de los compuestos blanco y/o los picos de las impurezas tienen normalmente en promedio una intensidad menor que los picos de los compuestos blanco (por ejemplo, con una pureza de >90%).

Dichos estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del proceso específico de preparación. Por lo tanto, sus picos pueden ayudar a reconocer la reproducción de nuestro proceso de preparación mediante las impresiones de productos secundarios.

- 15 Un especialista que calcula los picos de los compuestos blanco por medio de procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores esperados evaluados de manera empírica) puede aislar los picos de los compuestos blanco opcionalmente según necesidad usando filtros de intensidad adicionales. Esta aislación sería similar a la elección de picos relevantes en la interpretación clásica de RMN de ^1H .

- 20 Se pueden encontrar más detalles de las listas de picos de RMN en la publicación de la "Citación de datos de listas de picos de RMN dentro de solicitudes de patente" de la Base de Datos de Divulgación de Investigación Número 564025.

Tabla A: Listas de picos de la RMN

I.01: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3):	
δ = 7,2986 (10,0); 6,7692 (0,9); 6,7458 (1,0); 4,2374 (2,3); 4,2136 (7,4); 4,1898 (7,5); 4,1661 (2,5); 2,0459 (0,3); 1,7222 (2,0); 1,7054 (5,5); 1,6946 (5,6); 1,6792 (2,5); 1,6057 (11,6); 1,3404 (2,6); 1,3250 (5,7); 1,3142 (5,8); 1,2927 (8,4); 1,2690 (16,0); 1,2452 (7,7); 0,0464 (0,4); 0,0356 (12,6); 0,0246 (0,4)	
I.02: RMN de ^1H (400,2 MHz, d_6 -DMSO):	
δ = 8,6811 (9,2); 8,2115 (1,4); 3,6200 (0,3); 3,5087 (0,6); 3,4532 (0,7); 3,4350 (0,7); 3,3804 (0,8); 3,3674 (0,8); 3,3592 (0,8); 3,2641 (0,7); 3,1691 (0,8); 2,5129 (16,4); 2,5086 (33,1); 2,5041 (44,1); 2,4996 (31,6); 2,4953 (15,0); 2,0770 (1,6); 1,3876 (5,8); 1,3757 (14,5); 1,3676 (16,0); 1,3571 (6,8); 1,3178 (0,6); 1,1827 (0,6); 1,1756 (0,4); 1,1432 (7,2); 1,1326 (15,7); 1,1245 (15,0); 1,1126 (5,6); 0,0000 (1,2)	
I.03: RMN de ^1H (400,2 MHz, d_6 -DMSO):	
δ = 9,0297 (2,9); 4,1005 (2,1); 4,0828 (6,7); 4,0651 (6,7); 4,0473 (2,1); 3,3285 (11,9); 2,5220 (0,4); 2,5133 (6,0); 2,5088 (12,5); 2,5042 (16,6); 2,4995 (12,0); 2,4950 (5,9); 1,4637 (1,8); 1,4515 (4,4); 1,4431 (4,8); 1,4322 (2,0); 1,1946 (2,2); 1,1820 (10,0); 1,1753 (4,9); 1,1641 (16,0); 1,1463 (7,1); -0,0002 (0,4)	
I.04: RMN de ^1H (499,9 MHz, d_6 -DMSO):	
δ = 9,1058 (3,8); 4,1569 (2,1); 4,1426 (6,5); 4,1284 (6,6); 4,1143 (2,1); 3,3757 (1,0); 2,5650 (0,4); 2,5615 (0,8); 2,5579 (1,0); 2,5543 (0,8); 2,5508 (0,4); 1,5126 (1,8); 1,5030 (4,7); 1,4964 (5,0); 1,4875 (2,0); 1,2481 (7,1); 1,2338 (16,0); 1,2238 (5,6); 1,2196 (9,1); 1,2076 (1,9)	
I.05: RMN de ^1H (300,2 MHz, d_6 -DMSO):	
δ = 12,5912 (0,3); 12,5704 (0,3); 8,9622 (5,6); 3,3582 (16,0); 2,5348 (7,3); 2,5289 (15,6); 2,5228 (21,8); 2,5167 (15,8); 2,5108 (7,3); 1,4582 (2,0); 1,4422 (5,0); 1,4314 (5,7); 1,4172 (2,5); 1,1587 (2,6); 1,1445 (5,5); 1,1336 (5,4); 1,1178 (2,0); 0,0317 (1,0); 0,0207 (30,4); 0,0098 (1,1)	
I.06: RMN de ^1H (400,2 MHz, d_6 -DMSO):	
δ = 9,0605 (4,1); 8,3150 (0,5); 4,1032 (2,2); 4,0855 (7,1); 4,0677 (7,1); 4,0500 (2,3); 3,3287 (15,8); 2,8923 (0,7); 2,7326 (0,6); 2,5263 (0,4); 2,5216 (0,6); 2,5128 (8,7); 2,5084 (18,0); 2,5038 (23,9); 2,4992 (17,7); 2,4948 (8,9); 1,4546 (1,8); 1,4425 (4,6); 1,4343 (5,1); 1,4233 (2,1); 1,1961 (7,7); 1,1783 (16,0); 1,1693 (2,6); 1,1604 (9,6); 1,1499 (5,1); 1,1378 (1,8); -0,0002 (0,5)	

ES 2 989 675 T3

I.07: RMN de ^1H (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9,0801 (2,6); 3,6446 (16,0); 3,3477 (11,1); 2,5279 (2,3); 2,5220 (3,1); 2,5161 (2,2); 1,4960 (1,0); 1,4795 (2,8); 1,4685 (3,1); 1,4541 (1,3); 1,2106 (1,4); 1,1961 (3,1); 1,1851 (2,9); 1,1685 (1,1); 0,0189 (2,7)
I.08: RMN de ^1H (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 12,6292 (0,5); 12,5891 (0,6); 12,5706 (0,6); 12,5368 (0,5); 8,9512 (15,1); 6,8906 (0,3); 3,3471 (16,0); 2,5343 (14,3); 2,5283 (29,9); 2,5222 (40,7); 2,5161 (28,9); 2,5102 (13,1); 2,2042 (0,5); 2,0093 (1,1); 1,9289 (0,4); 1,4951 (0,3); 1,4457 (5,1); 1,4297 (12,6); 1,4189 (14,1); 1,4050 (6,2); 1,3753 (4,2); 1,3509 (0,6); 1,2561 (0,6); 1,2184 (0,5); 1,2012 (1,5); 1,1949 (1,1); 1,1708 (0,7); 1,1518 (6,7); 1,1379 (14,3); 1,1271 (13,5); 1,1112 (5,0); 0,0308 (1,6); 0,0200 (45,4); 0,0090 (1,5)
I.09: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,9370 (2,9); 8,3118 (0,8); 4,0946 (2,2); 4,0769 (7,2); 4,0592 (7,3); 4,0414 (2,3); 3,3293 (20,0); 2,5272 (0,4); 2,5224 (0,6); 2,5138 (8,8); 2,5093 (18,0); 2,5047 (23,6); 2,5001 (16,8); 2,4956 (8,0); 1,4601 (1,8); 1,4478 (4,6); 1,4395 (5,0); 1,4285 (2,1); 1,1997 (2,3); 1,1887 (4,9); 1,1803 (4,9); 1,1726 (8,1); 1,1682 (2,2); 1,1549 (16,0); 1,1371 (7,5); -0,0002 (1,1)
I.10: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3): δ= 7,4278 (0,8); 7,2987 (6,4); 5,3380 (0,4); 3,7510 (16,0); 1,7477 (1,0); 1,7308 (2,9); 1,7200 (2,9); 1,7045 (1,3); 1,5918 (2,3); 1,3759 (1,3); 1,3604 (2,9); 1,3496 (2,9); 1,3327 (1,0); 0,0366 (8,1)
I.11: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3): δ= 7,5803 (1,0); 7,2984 (4,3); 3,7517 (16,0); 1,7458 (1,1); 1,7289 (3,1); 1,7181 (3,2); 1,7027 (1,4); 1,5994 (1,5); 1,3788 (1,4); 1,3634 (3,2); 1,3526 (3,2); 1,3356 (1,2); 0,0357 (5,6)
I.12: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3): δ= 7,5601 (1,2); 7,3006 (3,1); 7,2980 (3,7); 7,2901 (1,0); 3,7551 (13,6); 3,7527 (16,0); 3,7448 (4,5); 1,7476 (1,1); 1,7309 (3,3); 1,7206 (4,0); 1,7117 (1,2); 1,7047 (1,6); 1,6963 (0,5); 1,6041 (1,8); 1,6015 (2,1); 1,5936 (0,6); 1,3815 (1,4); 1,3669 (3,5); 1,3565 (3,9); 1,3472 (1,2); 1,3403 (1,3); 1,3385 (1,3); 1,3304 (0,4); 0,0376 (4,0); 0,0349 (4,9); 0,0270 (1,4)
I.13: RMN de ^1H (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 12,5766 (1,5); 8,8300 (3,7); 3,3459 (16,0); 2,5276 (8,8); 2,5217 (11,9); 2,5158 (8,8); 2,0084 (0,8); 1,4514 (1,4); 1,4350 (3,6); 1,4243 (4,0); 1,4102 (1,7); 1,1940 (0,5); 1,1760 (1,8); 1,1617 (3,8); 1,1509 (3,7); 1,1348 (1,4); 0,0297 (0,4); 0,0190 (8,8); 0,0081 (0,4)
I.14: RMN de ^1H (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 12,5829 (1,4); 8,9016 (2,9); 3,3458 (16,0); 2,5336 (4,3); 2,5278 (8,8); 2,5218 (11,9); 2,5157 (8,7); 2,5099 (4,2); 2,0088 (0,5); 1,4513 (1,1); 1,4350 (2,6); 1,4244 (3,0); 1,4103 (1,3); 1,1942 (0,4); 1,1624 (1,4); 1,1480 (3,0); 1,1374 (2,8); 1,1211 (1,1); 0,0304 (0,4); 0,0195 (11,3); 0,0085 (0,4)
I.15: RMN de ^1H (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 12,6626 (0,4); 12,6476 (0,4); 12,6242 (0,4); 12,5754 (0,4); 8,9164 (14,6); 4,0605 (0,6); 4,0368 (0,6); 3,3516 (4,4); 3,1902 (0,4); 2,5339 (12,4); 2,5280 (26,2); 2,5219 (35,8); 2,5158 (26,0); 2,5098 (12,2); 2,0090 (2,4); 1,9284 (2,2); 1,4449 (5,5); 1,4288 (14,0); 1,4179 (16,0); 1,4041 (7,1); 1,3511 (0,6); 1,3028 (0,5); 1,2812 (0,6); 1,2607 (0,6); 1,2382 (0,7); 1,2281 (0,8); 1,2181 (1,0); 1,2002 (0,9); 1,1944 (1,9); 1,1758 (7,4); 1,1618 (15,8); 1,1509 (14,7); 1,1348 (5,7); 1,0843 (0,4); 0,0304 (1,3); 0,0195 (37,9); 0,0085 (1,5)
I.16: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3): δ= 7,2989 (0,5); 6,8148 (0,6); 6,7916 (0,6); 4,1302 (0,3); 3,7323 (16,0); 2,0677 (1,4); 1,7485 (0,3); 1,7162 (1,1); 1,6993 (3,0); 1,6885 (3,0); 1,6730 (1,3); 1,3363 (1,4); 1,3208 (3,0); 1,3100 (3,1); 1,2931 (1,2); 1,2817 (0,8); 1,2578 (0,4); 0,0212 (0,7)

ES 2 989 675 T3

I.17: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,8909 (4,5); 7,9547 (0,3); 7,3701 (1,3); 7,3652 (1,2); 7,3499 (4,4); 7,3353 (10,1); 7,3237 (15,1); 7,3124 (3,8); 7,3057 (4,6); 7,2940 (0,9); 7,2890 (0,8); 5,1153 (16,0); 3,3640 (0,8); 3,3403 (45,6); 2,8925 (2,0); 2,7339 (1,9); 2,5090 (23,1); 2,5049 (29,3); 2,5010 (23,4); 1,4989 (2,3); 1,4865 (5,9); 1,4784 (6,6); 1,4674 (2,7); 1,2439 (3,0); 1,2328 (6,5); 1,2247 (6,2); 1,2122 (2,2); -0,0002 (0,6)
I.18: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,8138 (9,9); 7,9545 (0,5); 5,0663 (3,3); 5,0525 (6,2); 5,0383 (3,3); 4,0154 (0,4); 3,3355 (69,9); 2,8937 (3,7); 2,7341 (3,2); 2,6742 (0,4); 2,5138 (26,1); 2,5097 (48,7); 2,5053 (62,0); 2,5008 (46,2); 2,4966 (23,5); 2,3321 (0,4); 1,7582 (5,2); 1,7445 (5,4); 1,7324 (3,3); 1,7256 (3,8); 1,6064 (1,2); 1,5704 (14,0); 1,5574 (13,7); 1,5512 (14,4); 1,5397 (15,1); 1,5194 (6,4); 1,5100 (4,8); 1,4488 (0,3); 1,4276 (0,4); 1,4107 (5,7); 1,3984 (14,6); 1,3902 (16,0); 1,3793 (6,9); 1,3581 (0,6); 1,3395 (0,6); 1,2380 (1,1); 1,2079 (0,6); 1,1884 (0,4); 1,1683 (7,1); 1,1572 (15,4); 1,1490 (14,8); 1,1367 (5,5); 0,8673 (0,4); 0,8491 (0,7); -0,0002 (1,8)
I.19: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,7382 (0,9); 3,3348 (7,5); 2,8936 (0,8); 2,7341 (0,7); 2,5135 (2,5); 2,5094 (4,9); 2,5050 (6,3); 2,5006 (4,8); 1,3882 (0,6); 1,3761 (1,6); 1,3673 (2,4); 1,3580 (16,0); 1,1269 (0,6); 1,1160 (1,5); 1,1079 (1,4); 1,0957 (0,5)
I.20: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,8486 (2,2); 3,8201 (5,6); 3,8043 (5,6); 3,3352 (14,5); 2,8935 (0,5); 2,7337 (0,4); 2,5095 (10,7); 2,5051 (13,9); 2,5007 (10,9); 1,8507 (0,5); 1,8342 (1,0); 1,8177 (1,2); 1,8011 (1,0); 1,7847 (0,5); 1,4463 (1,2); 1,4339 (3,2); 1,4256 (3,5); 1,4148 (1,5); 1,2105 (1,5); 1,1994 (3,4); 1,1912 (3,3); 1,1788 (1,2); 0,8517 (16,0); 0,8348 (15,4); -0,0002 (0,4)
I.21: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,8241 (3,8); 4,0313 (4,5); 4,0153 (9,1); 3,9993 (4,5); 3,3361 (30,6); 2,8934 (0,8); 2,7344 (0,6); 2,5133 (10,7); 2,5094 (19,3); 2,5049 (24,0); 2,5004 (17,5); 2,4962 (8,6); 1,5346 (0,9); 1,5181 (2,9); 1,5111 (1,2); 1,5014 (3,8); 1,4811 (3,3); 1,4653 (1,3); 1,4402 (2,2); 1,4279 (5,6); 1,4197 (6,0); 1,4087 (2,6); 1,3338 (0,6); 1,3152 (2,4); 1,2962 (3,8); 1,2774 (3,7); 1,2592 (2,2); 1,2407 (1,1); 1,1991 (2,7); 1,1881 (5,9); 1,1799 (5,6); 1,1674 (2,0); 0,8672 (8,2); 0,8488 (16,0); 0,8303 (7,0); -0,0002 (0,5)
I.22: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,7943 (2,1); 4,8803 (0,4); 4,8648 (1,2); 4,8492 (1,6); 4,8336 (1,2); 4,8180 (0,5); 3,3346 (14,2); 2,8933 (0,5); 2,7335 (0,5); 2,5092 (9,6); 2,5049 (12,5); 2,5005 (9,7); 1,4276 (1,2); 1,4152 (3,1); 1,4071 (3,4); 1,3961 (1,4); 1,1765 (1,5); 1,1654 (3,5); 1,1568 (4,0); 1,1495 (16,0); 1,1338 (15,5); -0,0002 (0,4)
I.23: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,8683 (6,0); 7,9532 (1,0); 4,7109 (15,5); 4,7049 (16,0); 3,5563 (3,9); 3,5504 (7,9); 3,5444 (3,9); 3,3357 (40,7); 2,8931 (6,8); 2,7332 (6,0); 2,5092 (26,5); 2,5048 (34,7); 2,5004 (27,3); 1,4878 (3,0); 1,4750 (8,0); 1,4668 (9,0); 1,4558 (3,8); 1,4158 (0,3); 1,2946 (0,3); 1,2551 (3,9); 1,2437 (8,8); 1,2356 (8,8); 1,2229 (3,1); -0,0002 (1,2)
I.24: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,8619 (9,8); 5,9102 (1,5); 5,8977 (3,2); 5,8845 (2,8); 5,8711 (3,8); 5,8675 (2,3); 5,8585 (2,2); 5,8546 (4,0); 5,8414 (3,2); 5,8281 (4,0); 5,8156 (2,0); 5,3004 (2,6); 5,2965 (6,8); 5,2923 (7,1); 5,2572 (2,3); 5,2533 (5,9); 5,2492 (6,1); 5,1924 (7,1); 5,1888 (7,0); 5,1660 (6,5); 5,1623 (6,5); 4,5721 (9,5); 4,5685 (15,8); 4,5649 (10,8); 4,5599 (10,6); 4,5560 (15,7); 3,3373 (77,4); 2,8935 (0,8); 2,7340 (0,7); 2,6740 (0,4); 2,5273 (1,0); 2,5094 (44,6); 2,5050 (57,9); 2,5007 (44,5); 2,3320 (0,4); 1,4793 (5,4); 1,4669 (14,4); 1,4586 (16,0); 1,4476 (6,8); 1,4078 (0,6); 1,2739 (0,7); 1,2345 (7,6); 1,2233 (15,3); 1,2150 (14,9); 1,2026 (5,4); -0,0002 (1,6)
I.25: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9,1100 (5,0); 7,9531 (0,5); 7,3885 (0,8); 7,3853 (1,0); 7,3814 (0,6); 7,3642 (3,4); 7,3507 (16,0); 7,3475 (12,5); 7,3354 (4,2); 7,3318 (3,7); 7,3227 (1,4); 7,3142 (2,0); 7,3047 (0,7); 7,2988 (0,6); 5,1218 (15,4); 3,3338 (90,0); 2,8910 (3,3); 2,7317 (2,8); 2,6755 (0,4); 2,6717 (0,5); 2,5454 (0,3); 2,5249 (1,5); 2,5070 (59,0); 2,5026 (74,4); 2,4982 (55,2); 2,3296 (0,4); 2,3255 (0,3); 1,5112 (2,1); 1,4988 (5,4); 1,4907 (5,9); 1,4796 (2,4); 1,2748 (0,3); 1,2586 (0,4); 1,2350 (3,0); 1,2238 (5,9); 1,2156 (5,7); 1,2032 (2,1); -0,0002 (1,7)

ES 2 989 675 T3

I.26: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 9,0283$ (8,2); 8,3170 (16,0); 5,0874 (2,6); 5,0738 (5,1); 5,0651 (2,2); 5,0596 (2,6); 3,3357 (51,0); 3,3119 (7,0); 2,8929 (0,8); 2,7332 (0,7); 2,5267 (0,9); 2,5089 (39,2); 2,5045 (51,3); 2,5000 (39,3); 2,3312 (0,3); 1,7732 (4,4); 1,7597 (4,0); 1,7464 (2,9); 1,7402 (3,1); 1,7326 (2,3); 1,6570 (0,4); 1,6041 (12,3); 1,5947 (7,7); 1,5893 (7,0); 1,5738 (7,5); 1,5626 (5,5); 1,5272 (4,6); 1,5118 (2,4); 1,4854 (0,4); 1,4259 (4,6); 1,4137 (12,1); 1,4054 (13,4); 1,3946 (5,7); 1,3546 (0,5); 1,2385 (0,7); 1,2048 (0,4); 1,1650 (5,2); 1,1540 (12,1); 1,1458 (11,8); 1,1336 (4,3); -0,0002 (1,3)
I.27: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 8,9647$ (1,0); 8,3172 (0,8); 3,3335 (7,9); 3,3097 (0,4); 2,5084 (5,6); 2,5040 (7,2); 2,4996 (5,4); 1,3979 (0,7); 1,3799 (16,0); 1,3678 (1,2); 1,1212 (0,6); 1,1103 (1,4); 1,1022 (1,3); 1,0901 (0,5)
I.28: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 9,0520$ (2,7); 8,3171 (1,4); 3,8353 (5,5); 3,8194 (5,5); 3,3332 (14,2); 3,3094 (0,7); 2,5084 (11,7); 2,5042 (14,8); 2,5000 (11,6); 1,8772 (0,5); 1,8607 (1,0); 1,8441 (1,3); 1,8276 (1,0); 1,8111 (0,5); 1,4642 (1,3); 1,4519 (3,4); 1,4438 (3,7); 1,4329 (1,5); 1,2073 (1,6); 1,1963 (3,6); 1,1881 (3,5); 1,1759 (1,2); 0,8744 (16,0); 0,8575 (15,3); -0,0002 (0,4)
I.29: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 9,0428$ (4,7); 4,0456 (4,5); 4,0297 (9,1); 4,0137 (4,5); 3,3335 (31,7); 2,5083 (23,9); 2,5039 (30,4); 2,4994 (22,7); 1,5587 (0,9); 1,5421 (2,8); 1,5350 (1,2); 1,5255 (3,7); 1,5207 (2,8); 1,5052 (3,2); 1,4894 (1,3); 1,4557 (2,2); 1,4434 (5,8); 1,4352 (6,3); 1,4243 (2,6); 1,3593 (0,7); 1,3407 (2,3); 1,3217 (3,7); 1,3029 (3,7); 1,2847 (2,2); 1,2665 (0,6); 1,2353 (0,5); 1,1949 (2,7); 1,1839 (6,2); 1,1757 (6,0); 1,1634 (2,2); 0,8804 (8,2); 0,8620 (16,0); 0,8436 (7,0); -0,0002 (0,9)
I.30: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 9,0439$ (12,4); 8,3171 (0,9); 4,9371 (1,2); 4,9190 (4,6); 4,9005 (6,8); 4,8820 (4,6); 4,8639 (1,2); 3,3339 (75,1); 3,3103 (0,6); 2,8924 (1,8); 2,7329 (1,5); 2,6731 (0,4); 2,5258 (1,2); 2,5125 (25,8); 2,5083 (48,8); 2,5039 (62,3); 2,4994 (46,0); 2,4951 (22,9); 2,3307 (0,4); 2,2868 (1,8); 2,2802 (2,7); 2,2725 (2,4); 2,2670 (3,8); 2,2607 (5,2); 2,2564 (5,4); 2,2496 (5,0); 2,2426 (5,5); 2,2368 (5,9); 2,2320 (4,6); 2,2264 (3,0); 2,2188 (3,3); 2,2125 (2,5); 2,0102 (1,4); 2,0034 (1,1); 1,9897 (2,9); 1,9852 (5,5); 1,9785 (3,7); 1,9658 (5,6); 1,9602 (6,5); 1,9547 (5,0); 1,9419 (4,3); 1,9354 (5,2); 1,9177 (1,5); 1,9110 (1,6); 1,7708 (0,8); 1,7652 (1,4); 1,7594 (0,9); 1,7393 (3,7); 1,7332 (2,1); 1,7198 (2,1); 1,7140 (3,6); 1,6946 (0,8); 1,6888 (1,3); 1,6832 (0,7); 1,6326 (1,1); 1,6124 (2,3); 1,6071 (2,3); 1,5870 (4,7); 1,5820 (2,6); 1,5658 (2,5); 1,5610 (3,9); 1,5411 (1,8); 1,5355 (1,4); 1,5152 (0,6); 1,4531 (5,7); 1,4408 (14,8); 1,4326 (16,0); 1,4216 (6,6); 1,3817 (0,6); 1,2380 (1,0); 1,2269 (0,7); 1,1866 (6,9); 1,1755 (15,5); 1,1673 (14,9); 1,1550 (5,4); -0,0002 (1,8)
I.31: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 9,0451$ (4,3); 8,3168 (0,9); 4,0055 (4,8); 3,9895 (10,0); 3,9734 (4,9); 3,3349 (36,5); 3,3110 (0,6); 2,5122 (13,2); 2,5081 (24,6); 2,5036 (31,4); 2,4991 (23,3); 2,4949 (11,8); 1,6014 (0,6); 1,5832 (2,2); 1,5666 (4,4); 1,5485 (4,6); 1,5318 (2,4); 1,5139 (0,6); 1,4617 (2,2); 1,4495 (5,8); 1,4412 (6,3); 1,4303 (2,6); 1,2386 (0,6); 1,1989 (2,7); 1,1879 (6,2); 1,1796 (5,9); 1,1674 (2,2); 0,8847 (8,1); 0,8663 (16,0); 0,8477 (7,3); -0,0002 (0,8)
I.32: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 9,0342$ (2,3); 4,8971 (0,4); 4,8816 (1,1); 4,8660 (1,5); 4,8504 (1,1); 4,8348 (0,4); 3,3320 (24,4); 2,8920 (0,8); 2,7325 (0,7); 2,5075 (18,3); 2,5032 (23,4); 2,4990 (17,9); 1,4371 (1,1); 1,4250 (2,9); 1,4168 (3,2); 1,4059 (1,3); 1,1708 (15,4); 1,1553 (16,0); 1,1379 (1,2); -0,0002 (0,6)
I.33: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): $\delta = 9,0877$ (7,0); 8,3153 (3,0); 4,7238 (15,8); 4,7178 (16,0); 3,5684 (3,8); 3,5626 (7,5); 3,5566 (3,8); 3,3345 (27,7); 3,3106 (1,4); 2,8928 (0,8); 2,7334 (0,7); 2,5085 (24,4); 2,5041 (31,4); 2,4998 (23,8); 1,5042 (3,3); 1,4917 (8,7); 1,4834 (9,5); 1,4723 (4,0); 1,4325 (0,3); 1,2914 (0,3); 1,2517 (4,2); 1,2405 (9,4); 1,2323 (9,2); 1,2197 (3,3); -0,0002 (0,8)

ES 2 989 675 T3

I.34: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 9,0748 (4,4); 8,3166 (16,0); 5,9275 (0,8); 5,9149 (1,8); 5,9015 (1,6); 5,8884 (2,1); 5,8846 (1,4); 5,8756 (1,3); 5,8718 (2,3); 5,8584 (1,9); 5,8453 (2,2); 5,8327 (1,1); 5,3238 (4,0); 5,3196 (4,1); 5,3155 (1,8); 5,2806 (3,4); 5,2764 (3,6); 5,2724 (1,6); 5,2071 (4,0); 5,2034 (4,0); 5,1807 (3,7); 5,1770 (3,7); 4,5845 (5,7); 4,5810 (9,2); 4,5772 (6,5); 4,5723 (6,4); 4,5684 (9,0); 4,5648 (5,7); 3,3339 (17,6); 3,3103 (5,7); 2,8925 (1,2); 2,7329 (1,0); 2,5083 (26,6); 2,5040 (33,8); 2,4996 (26,1); 1,4951 (3,3); 1,4827 (8,7); 1,4745 (9,4); 1,4635 (4,0); 1,4236 (0,3); 1,2703 (0,4); 1,2305 (4,1); 1,2194 (9,0); 1,2112 (8,8); 1,1988 (3,2); -0,0002 (1,0)
I.35: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5189 (0,4); 7,3862 (6,5); 7,2981 (0,3); 7,2601 (66,7); 6,9969 (0,4); 5,0451 (1,1); 5,0270 (4,0); 5,0084 (5,9); 4,9897 (4,0); 4,9708 (1,1); 2,3648 (1,8); 2,3582 (2,5); 2,3378 (5,4); 2,3342 (5,5); 2,3271 (5,1); 2,3203 (5,6); 2,3140 (6,1); 2,2958 (3,1); 2,0916 (1,4); 2,0852 (1,2); 2,0674 (4,9); 2,0609 (3,8); 2,0476 (5,3); 2,0424 (6,5); 2,0369 (5,2); 2,0231 (4,0); 2,0170 (4,8); 1,9986 (1,4); 1,9914 (1,5); 1,8122 (1,3); 1,7870 (3,5); 1,7614 (3,4); 1,7362 (1,3); 1,7150 (0,4); 1,6777 (5,2); 1,6652 (14,8); 1,6573 (16,0); 1,6456 (6,4); 1,6131 (4,1); 1,5861 (3,6); 1,5652 (2,1); 1,5599 (2,1); 1,5408 (71,7); 1,3777 (0,5); 1,3383 (6,3); 1,3267 (15,1); 1,3188 (15,1); 1,3062 (5,3); 1,2552 (1,0); 0,8823 (0,3); 0,1472 (0,4); 0,0344 (0,4); -0,0002 (78,1); -0,1493 (0,4)
I.36: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,8043 (10,9); 8,3154 (0,5); 4,9153 (1,2); 4,8967 (4,7); 4,8782 (7,1); 4,8597 (4,8); 4,8411 (1,3); 3,3397 (106,7); 2,8931 (1,3); 2,7335 (1,2); 2,6739 (0,4); 2,5050 (61,4); 2,3315 (0,4); 2,2724 (1,8); 2,2669 (2,7); 2,2473 (6,1); 2,2437 (6,2); 2,2367 (5,5); 2,2238 (7,0); 2,2054 (3,3); 2,1997 (2,7); 1,9762 (1,4); 1,9702 (1,2); 1,9516 (5,4); 1,9455 (4,1); 1,9264 (7,3); 1,9074 (4,4); 1,9017 (5,6); 1,8840 (1,5); 1,8769 (1,7); 1,7492 (1,6); 1,7231 (4,1); 1,6978 (4,0); 1,6728 (1,4); 1,6235 (1,0); 1,5983 (2,7); 1,5776 (4,6); 1,5522 (4,1); 1,5316 (1,8); 1,5059 (0,5); 1,4454 (5,1); 1,4328 (14,0); 1,4249 (16,0); 1,4140 (6,7); 1,3742 (0,6); 1,2328 (1,1); 1,1913 (6,3); 1,1801 (14,8); 1,1722 (15,0); 1,1599 (5,4); -0,0002 (2,7)
I.37: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,8292 (3,9); 3,9916 (5,0); 3,9756 (10,1); 3,9596 (5,0); 3,3366 (28,9); 2,8936 (0,5); 2,7340 (0,5); 2,5096 (17,4); 2,5052 (22,1); 2,5008 (16,6); 1,5774 (0,6); 1,5593 (2,4); 1,5425 (4,7); 1,5246 (4,9); 1,5076 (2,5); 1,4899 (0,7); 1,4474 (2,3); 1,4350 (5,9); 1,4268 (6,4); 1,4158 (2,7); 1,2389 (0,4); 1,2037 (2,8); 1,1926 (6,2); 1,1844 (5,9); 1,1720 (2,1); 0,8624 (8,2); 0,8440 (16,0); 0,8254 (7,4); -0,0002 (0,5)
I.38: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5059 (6,4); 7,2606 (24,7); 5,0390 (1,0); 5,0196 (3,5); 5,0013 (5,5); 4,9827 (4,1); 4,9646 (1,5); 2,9565 (0,5); 2,8836 (0,4); 2,3551 (2,3); 2,3355 (5,5); 2,3306 (5,9); 2,3241 (5,8); 2,3172 (6,4); 2,3109 (6,8); 2,2932 (4,1); 2,2874 (3,2); 2,0831 (1,2); 2,0756 (1,2); 2,0572 (4,7); 2,0506 (4,0); 2,0373 (5,6); 2,0317 (6,7); 2,0264 (5,9); 2,0130 (4,9); 2,0067 (5,4); 1,9886 (2,2); 1,9815 (2,0); 1,8102 (1,3); 1,7841 (3,4); 1,7582 (3,6); 1,7334 (1,6); 1,6758 (4,6); 1,6631 (13,7); 1,6554 (16,0); 1,6438 (8,6); 1,6112 (4,5); 1,5850 (3,9); 1,5477 (25,8); 1,3753 (0,6); 1,3667 (0,4); 1,3347 (5,6); 1,3231 (14,1); 1,3154 (15,3); 1,3030 (7,3); 1,2545 (2,5); 0,0698 (0,7); -0,0002 (30,6)
I.39: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5215 (3,5); 7,2607 (14,3); 7,2447 (1,6); 4,0901 (5,2); 4,0736 (10,9); 4,0572 (6,4); 2,9559 (0,4); 2,8839 (0,4); 1,6877 (2,8); 1,6751 (8,0); 1,6673 (8,9); 1,6553 (6,9); 1,6367 (6,4); 1,6188 (6,5); 1,6014 (3,8); 1,5839 (1,5); 1,5481 (11,9); 1,3394 (3,2); 1,3277 (8,0); 1,3199 (8,5); 1,3075 (4,0); 1,2547 (1,0); 0,9240 (8,1); 0,9055 (16,0); 0,8870 (8,8); 0,0695 (1,5); -0,0002 (17,6); -0,0158 (2,3)
I.40: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,3772 (3,6); 7,2610 (11,3); 7,2444 (1,2); 4,0885 (5,3); 4,0721 (10,8); 4,0556 (6,3); 2,9558 (0,6); 2,8834 (0,5); 1,6880 (2,9); 1,6754 (8,0); 1,6677 (9,1); 1,6545 (5,8); 1,6344 (6,3); 1,6168 (6,7); 1,5991 (3,9); 1,5815 (1,5); 1,5514 (7,0); 1,3767 (0,3); 1,3364 (3,4); 1,3247 (8,1); 1,3170 (8,5); 1,3045 (3,8); 1,2549 (1,3); 0,9216 (8,1); 0,9032 (16,0); 0,8847 (8,7); 0,0694 (1,0); -0,0002 (13,6); -0,0166 (1,7)
I.41: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,4157 (3,3); 7,2920 (0,4); 7,2600 (34,1); 4,0942 (5,3); 4,0778 (10,8); 4,0613 (5,6); 1,6905 (2,7); 1,6779 (8,2); 1,6700 (8,3); 1,6592 (5,6); 1,6431 (5,6); 1,6250 (5,8); 1,6075 (3,0); 1,5899 (1,0); 1,5396 (36,1); 1,3445 (3,2); 1,3328 (7,8); 1,3249 (7,9); 1,3125 (2,9); 1,2573 (0,4); 0,9299 (8,3); 0,9114 (16,0); 0,8928 (7,7); -0,0002 (40,3); -0,0415 (0,3)

ES 2 989 675 T3

I.42: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,3665 (6,4); 7,3015 (0,3); 7,2603 (37,2); 5,0356 (1,0); 5,0175 (3,9); 4,9990 (5,8); 4,9801 (4,0); 4,9612 (1,2); 2,3607 (1,8); 2,3539 (2,5); 2,3358 (5,4); 2,3296 (5,4); 2,3231 (5,0); 2,3162 (5,6); 2,3106 (5,9); 2,2919 (3,2); 2,2855 (2,4); 2,0793 (1,4); 2,0723 (1,2); 2,0541 (4,9); 2,0475 (3,7); 2,0343 (5,5); 2,0291 (6,3); 2,0233 (4,9); 2,0099 (4,3); 2,0035 (4,8); 1,9855 (1,5); 1,9790 (1,6); 1,8102 (1,3); 1,7833 (3,4); 1,7578 (3,4); 1,7328 (1,3); 1,7163 (0,5); 1,6770 (5,3); 1,6645 (14,8); 1,6566 (16,0); 1,6449 (6,6); 1,6361 (3,0); 1,6311 (2,8); 1,6106 (4,3); 1,5843 (3,5); 1,5635 (2,1); 1,5578 (2,3); 1,5438 (35,8); 1,3713 (0,6); 1,3314 (6,3); 1,3198 (15,2); 1,3119 (14,9); 1,2994 (5,5); 1,2597 (0,8); -0,0002 (46,1)
I.43: RMN de ^1H (500,1 MHz, d_6-DMSO): δ= 9,0051 (4,3); 4,0905 (2,1); 4,0764 (6,6); 4,0622 (6,7); 4,0480 (2,2); 3,3080 (14,8); 2,5040 (9,1); 2,5007 (12,5); 2,4974 (9,4); 1,4509 (1,9); 1,4412 (5,3); 1,4347 (5,7); 1,4258 (2,2); 1,1791 (2,8); 1,1751 (7,8); 1,1705 (6,3); 1,1611 (16,0); 1,1544 (2,5); 1,1468 (7,0); -0,0002 (7,6); -0,0064 (0,3)
I.44: RMN de ^1H (600,1 MHz, d_6-DMSO): δ= 8,8524 (2,3); 4,0815 (2,1); 4,0766 (0,5); 4,0697 (6,8); 4,0649 (0,5); 4,0579 (6,8); 4,0461 (2,1); 3,3284 (53,8); 2,5101 (5,0); 2,5071 (11,1); 2,5040 (15,7); 2,5010 (11,2); 2,4979 (5,0); 1,4515 (2,0); 1,4433 (4,7); 1,4378 (5,1); 1,4303 (2,0); 1,1993 (2,0); 1,1917 (4,8); 1,1862 (4,8); 1,1781 (1,7); 1,1650 (0,4); 1,1541 (7,9); 1,1423 (16,0); 1,1305 (7,4); -0,0001 (0,7)
I.45: RMN de ^1H (600,1 MHz, d_6-DMSO): δ= 8,8543 (1,3); 3,6179 (0,9); 3,6093 (16,0); 3,3227 (14,6); 2,8930 (0,9); 2,7338 (0,7); 2,5095 (2,9); 2,5065 (6,4); 2,5034 (9,0); 2,5004 (6,4); 2,4974 (2,8); 1,4613 (1,2); 1,4533 (2,8); 1,4477 (3,0); 1,4402 (1,2); 1,2153 (1,2); 1,2077 (2,8); 1,2022 (2,8); 1,1940 (1,0); -0,0001 (0,5)
I.46: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5141 (4,4); 7,2604 (37,0); 7,2304 (0,5); 5,2992 (3,3); 3,9606 (15,6); 3,9426 (16,0); 1,7060 (3,9); 1,6935 (11,1); 1,6855 (11,6); 1,6739 (4,9); 1,6338 (0,6); 1,5462 (57,4); 1,5165 (0,9); 1,4977 (0,4); 1,3960 (0,4); 1,3563 (4,7); 1,3447 (11,5); 1,3366 (11,6); 1,3241 (4,2); 1,2862 (0,5); 1,2564 (0,3); 1,1274 (0,6); 1,1204 (0,9); 1,1087 (1,8); 1,1013 (1,6); 1,0894 (2,7); 1,0774 (1,7); 1,0706 (1,9); 1,0584 (1,1); 1,0515 (0,8); 1,0391 (0,4); 0,5580 (2,0); 0,5455 (6,9); 0,5430 (7,0); 0,5256 (7,3); 0,5111 (2,6); 0,4948 (0,6); 0,4744 (0,4); 0,2727 (2,4); 0,2607 (8,9); 0,2463 (8,5); 0,2343 (2,3); -0,0002 (46,0); -0,0295 (0,7)
I.47: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5458 (3,7); 7,2614 (16,3); 5,2996 (3,9); 4,7166 (16,0); 4,7105 (15,2); 2,4664 (4,2); 2,4603 (7,4); 2,4543 (3,7); 1,7574 (3,3); 1,7446 (9,4); 1,7367 (9,3); 1,7246 (3,7); 1,6843 (0,3); 1,5599 (20,4); 1,3786 (3,9); 1,3668 (9,5); 1,3588 (9,2); 1,3459 (3,2); 1,3072 (0,4); 1,2589 (0,4); -0,0002 (18,1)
I.48: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5431 (6,3); 7,2616 (21,2); 5,9182 (1,2); 5,9043 (2,5); 5,8915 (2,3); 5,8779 (3,3); 5,8615 (3,3); 5,8486 (2,6); 5,8351 (3,1); 5,8213 (1,6); 5,3101 (6,4); 5,3067 (6,1); 5,2996 (4,1); 5,2671 (5,5); 5,2638 (5,0); 5,2298 (6,8); 5,2270 (6,0); 5,2037 (6,2); 5,2009 (5,6); 4,6224 (14,6); 4,6085 (13,9); 1,7201 (5,4); 1,7075 (15,7); 1,6997 (15,4); 1,6879 (6,1); 1,6480 (0,7); 1,5659 (17,2); 1,3958 (0,5); 1,3556 (6,6); 1,3439 (16,0); 1,3360 (15,2); 1,3233 (5,6); 1,3053 (0,6); 1,2980 (0,6); 1,2844 (0,6); 1,2559 (1,1); 1,2249 (0,4); 1,2093 (0,3); -0,0002 (23,4)
I.49: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5197 (0,4); 7,4793 (5,6); 7,2611 (25,1); 5,2993 (9,1); 1,6441 (0,6); 1,6362 (0,5); 1,6050 (5,0); 1,5926 (15,0); 1,5847 (15,8); 1,5733 (7,0); 1,5559 (21,6); 1,5334 (1,4); 1,4885 (0,4); 1,4730 (0,6); 1,4636 (1,0); 1,4337 (187,2); 1,3890 (1,6); 1,3308 (1,0); 1,3237 (0,7); 1,3177 (0,8); 1,3097 (0,8); 1,2910 (6,3); 1,2796 (15,3); 1,2717 (16,0); 1,2593 (6,0); 1,2365 (0,7); 1,2246 (1,9); 1,2089 (1,7); 1,2010 (0,6); 1,1856 (0,4); 0,9024 (0,6); 0,8853 (0,7); -0,0002 (32,3)
I.50: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5269 (2,9); 7,3898 (0,6); 7,3849 (0,9); 7,3642 (3,1); 7,3504 (6,5); 7,3391 (5,6); 7,3299 (10,1); 7,3244 (11,4); 7,3172 (6,7); 7,3082 (11,4); 7,2932 (3,3); 7,2591 (11,8); 5,2968 (1,2); 5,1523 (16,0); 5,1176 (12,2); 1,8406 (1,4); 1,7640 (0,5); 1,7476 (0,4); 1,7242 (2,3); 1,7115 (6,5); 1,7036 (6,7); 1,6918 (3,0); 1,6526 (0,4); 1,3617 (2,6); 1,3500 (6,5); 1,3418 (7,0); 1,3284 (7,5); 1,3201 (6,5); 1,3105 (2,8); 1,2704 (0,5); 1,2567 (0,6); 1,0327 (2,2); 1,0230 (5,8); 1,0150 (5,4); 1,0046 (2,1); -0,0002 (16,1)

ES 2 989 675 T3

I.51: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,4404 (1,3); 7,2605 (9,7); 4,7212 (5,9); 4,7152 (5,5); 2,4674 (1,6); 2,4613 (2,7); 2,4552 (1,3); 1,7580 (1,2); 1,7452 (3,5); 1,7373 (3,3); 1,7253 (1,3); 1,5559 (2,8); 1,3867 (1,5); 1,3747 (3,5); 1,3668 (3,3); 1,3540 (1,2); 1,3038 (3,3); 1,2653 (14,4); 0,8985 (6,6); 0,8820 (16,0); 0,8644 (7,0); -0,0002 (12,0)
I.52: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5190 (0,4); 7,4370 (6,1); 7,2605 (61,6); 5,9240 (1,2); 5,9102 (2,6); 5,8970 (2,4); 5,8839 (3,4); 5,8673 (3,6); 5,8538 (2,7); 5,8410 (3,3); 5,8270 (1,8); 5,3163 (6,2); 5,3129 (6,3); 5,2733 (5,4); 5,2699 (5,4); 5,2323 (6,8); 5,2294 (6,6); 5,2062 (6,2); 5,2032 (6,0); 4,6266 (15,0); 4,6127 (14,6); 1,7219 (5,4); 1,7093 (15,6); 1,7013 (16,0); 1,6896 (6,4); 1,6490 (0,5); 1,5865 (0,3); 1,5486 (109,8); 1,5036 (0,4); 1,4029 (0,6); 1,3625 (6,5); 1,3507 (15,9); 1,3427 (16,0); 1,3301 (5,5); 1,2918 (0,4); 1,2592 (0,6); 0,8820 (0,4); -0,0002 (76,2); -0,1497 (0,4)
I.53: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,3512 (5,7); 7,2616 (25,2); 1,6479 (0,6); 1,6401 (0,4); 1,6096 (5,0); 1,5972 (15,5); 1,5893 (16,0); 1,5779 (7,0); 1,5624 (35,2); 1,5385 (1,2); 1,4846 (0,4); 1,4776 (0,5); 1,4647 (0,3); 1,4392 (191,8); 1,3969 (0,6); 1,3905 (0,4); 1,3261 (0,9); 1,3196 (0,7); 1,3115 (0,6); 1,2860 (6,4); 1,2746 (16,0); 1,2666 (15,9); 1,2543 (5,9); 1,2311 (1,8); 1,2154 (1,9); 1,2071 (0,5); 1,1913 (0,4); 0,9083 (0,6); 0,8914 (0,7); 0,8820 (0,4); 0,8758 (0,4); -0,0002 (31,0)
I.54: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,4142 (2,9); 7,3860 (0,5); 7,3608 (1,7); 7,3510 (3,5); 7,3399 (4,7); 7,3279 (11,2); 7,3155 (11,4); 7,2987 (3,0); 7,2599 (29,4); 5,1558 (16,0); 5,1200 (4,3); 1,7271 (2,4); 1,7145 (6,5); 1,7065 (6,8); 1,6948 (3,0); 1,6536 (1,3); 1,5975 (4,0); 1,4113 (0,4); 1,3708 (2,6); 1,3591 (6,5); 1,3511 (6,6); 1,3382 (2,8); 1,3346 (2,6); 1,3264 (2,3); 1,3163 (1,2); 1,3012 (0,5); 1,2756 (0,3); 1,2548 (0,6); 1,0540 (0,8); 1,0440 (1,9); 1,0361 (1,8); 1,0256 (0,7); -0,0002 (36,3)
I.55: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,4866 (5,0); 7,2611 (25,0); 5,2994 (16,0); 5,2067 (2,2); 5,1926 (4,0); 5,1865 (3,1); 5,1778 (2,4); 5,1718 (1,3); 1,8540 (1,0); 1,8392 (1,7); 1,8210 (3,2); 1,8063 (4,7); 1,7921 (3,4); 1,7669 (1,2); 1,6868 (4,6); 1,6581 (9,4); 1,6432 (8,6); 1,6306 (14,8); 1,6228 (15,0); 1,6111 (7,3); 1,5806 (4,1); 1,5713 (5,2); 1,5570 (55,3); 1,5170 (0,8); 1,3597 (0,4); 1,3194 (4,9); 1,3078 (12,0); 1,2999 (11,7); 1,2874 (4,2); 1,2596 (0,5); 1,2491 (0,4); -0,0002 (29,4)
I.56: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5276 (1,4); 7,2608 (10,1); 5,2994 (2,9); 3,9051 (5,4); 3,8888 (5,5); 1,9400 (0,5); 1,9234 (0,9); 1,9067 (1,2); 1,8900 (1,0); 1,8732 (0,5); 1,6919 (1,2); 1,6794 (3,4); 1,6714 (3,6); 1,6598 (1,4); 1,5527 (19,6); 1,3432 (1,5); 1,3315 (3,5); 1,3235 (3,6); 1,3110 (1,2); 0,9024 (16,0); 0,8856 (15,5); -0,0002 (12,1)
I.57: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5176 (3,0); 7,2606 (31,9); 5,2993 (5,6); 4,1303 (5,2); 4,1137 (10,4); 4,0972 (5,2); 1,6820 (2,6); 1,6694 (7,3); 1,6615 (7,4); 1,6498 (3,0); 1,6213 (1,1); 1,6045 (3,5); 1,5871 (4,7); 1,5672 (4,2); 1,5495 (72,0); 1,3851 (0,7); 1,3666 (2,6); 1,3478 (4,3); 1,3372 (4,1); 1,3263 (9,9); 1,3178 (7,9); 1,3105 (3,3); 1,3056 (3,0); 1,2921 (0,7); 0,9210 (8,4); 0,9026 (16,0); 0,8842 (7,0); -0,0002 (36,9)
I.58: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,4988 (1,3); 7,2608 (10,7); 5,2993 (2,3); 5,0501 (0,4); 5,0345 (1,1); 5,0189 (1,5); 5,0032 (1,1); 4,9876 (0,5); 1,6573 (1,2); 1,6447 (3,5); 1,6368 (3,6); 1,6252 (1,5); 1,5528 (22,6); 1,3289 (1,5); 1,3174 (3,6); 1,3094 (3,6); 1,2969 (1,3); 1,2246 (16,0); 1,2090 (16,0); -0,0002 (12,4)
I.59: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,3705 (5,2); 7,2610 (33,0); 5,2126 (2,4); 5,1983 (4,3); 5,1921 (3,3); 5,1836 (2,4); 5,1775 (1,3); 1,8594 (1,0); 1,8442 (1,9); 1,8246 (3,5); 1,8086 (4,9); 1,7945 (3,6); 1,7696 (1,3); 1,6960 (5,0); 1,6880 (3,7); 1,6682 (10,6); 1,6479 (7,7); 1,6353 (16,0); 1,6275 (14,8); 1,6156 (7,5); 1,6029 (2,2); 1,5831 (4,2); 1,5749 (5,5); 1,5547 (66,8); 1,3600 (0,5); 1,3195 (5,5); 1,3080 (13,1); 1,3001 (12,4); 1,2875 (4,4); 1,2650 (0,6); 1,2507 (0,4); 1,2248 (0,4); 1,2091 (0,3); 0,8821 (0,4); -0,0002 (39,5)

ES 2 989 675 T3

I.60: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,4310 (1,5); 7,2612 (6,7); 3,9090 (5,4); 3,8926 (5,4); 1,9470 (0,5); 1,9302 (1,0); 1,9136 (1,2); 1,8969 (1,0); 1,8803 (0,5); 1,6945 (1,3); 1,6819 (3,6); 1,6740 (3,6); 1,6624 (1,5); 1,5576 (10,4); 1,3479 (1,5); 1,3362 (3,7); 1,3283 (3,6); 1,3158 (1,2); 0,9083 (16,0); 0,8915 (15,5); -0,0002 (8,2)
I.61: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,4127 (0,4); 7,2608 (2,0); 4,1342 (0,7); 4,1177 (1,4); 4,1011 (0,8); 4,0951 (0,4); 4,0785 (0,5); 2,0435 (0,4); 1,6840 (0,6); 1,6715 (1,2); 1,6635 (1,3); 1,6519 (0,7); 1,6274 (0,3); 1,6173 (0,4); 1,6108 (0,6); 1,5937 (0,8); 1,5734 (0,6); 1,3739 (0,5); 1,3550 (0,8); 1,3412 (1,0); 1,3302 (1,7); 1,3223 (2,4); 1,3044 (2,9); 1,2866 (4,0); 1,2653 (13,7); 0,9968 (0,4); 0,9888 (0,4); 0,9520 (0,4); 0,9335 (0,9); 0,9237 (1,3); 0,9148 (0,7); 0,9050 (3,4); 0,8987 (6,3); 0,8821 (16,0); 0,8644 (7,4); 0,8377 (0,4); -0,0002 (2,4)
I.62: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,3719 (1,4); 7,2604 (19,0); 5,0552 (0,4); 5,0396 (1,1); 5,0240 (1,5); 5,0084 (1,1); 4,9929 (0,4); 1,6606 (1,2); 1,6482 (3,5); 1,6403 (3,6); 1,6286 (1,5); 1,5472 (38,5); 1,3307 (1,5); 1,3193 (3,7); 1,3113 (3,5); 1,2988 (1,2); 1,2311 (16,0); 1,2154 (15,8); -0,0002 (23,4)
I.63: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5419 (2,2); 7,5183 (0,4); 7,2599 (55,6); 7,2328 (0,4); 4,9283 (0,4); 4,7594 (16,0); 1,8045 (1,7); 1,7915 (5,2); 1,7834 (5,3); 1,7712 (2,2); 1,5810 (0,4); 1,5414 (77,9); 1,4929 (0,4); 1,4808 (0,4); 1,4386 (2,2); 1,4263 (5,7); 1,4184 (5,6); 1,4051 (2,1); 1,3657 (0,4); 1,3359 (1,4); 1,2840 (1,8); 1,2560 (10,3); 1,1844 (0,6); 1,1259 (0,4); 1,1051 (0,6); 1,0788 (0,4); 0,8812 (1,5); 0,8629 (1,0); 0,8452 (1,1); -0,0002 (68,6); -0,1496 (0,4)
I.64: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5341 (6,3); 7,2635 (6,2); 4,5225 (5,2); 4,5017 (15,8); 4,4809 (16,0); 4,4601 (5,4); 1,7878 (5,2); 1,7747 (15,0); 1,7668 (15,1); 1,7546 (6,2); 1,7144 (0,6); 1,5842 (8,3); 1,4709 (0,5); 1,4306 (6,3); 1,4184 (15,2); 1,4105 (15,0); 1,3973 (5,2); 1,3588 (0,3); 1,2636 (0,4); 0,8819 (0,4); -0,0002 (7,1)
I.65: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,4672 (2,3); 7,2222 (9,8); 3,7612 (16,0); 1,9663 (2,7); 1,6302 (1,9); 1,6178 (5,5); 1,6098 (5,6); 1,5982 (2,3); 1,5156 (14,1); 1,2890 (2,4); 1,2775 (5,7); 1,2695 (5,6); 1,2569 (2,1); 1,2179 (1,5); 0,8433 (0,4); 0,1477 (0,4); -0,0002 (75,6); -0,0388 (11,9); -0,1510 (0,4)
I.66: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,6344 (7,0); 7,5181 (0,6); 7,3779 (6,7); 7,3590 (14,4); 7,3385 (10,4); 7,2594 (77,3); 7,2354 (5,7); 7,2169 (8,1); 7,1982 (3,3); 7,0944 (13,3); 7,0918 (15,0); 7,0729 (13,1); 6,9956 (0,5); 5,2980 (0,9); 2,0040 (15,1); 1,9248 (0,3); 1,8870 (5,4); 1,8743 (15,6); 1,8663 (16,0); 1,8543 (6,6); 1,8142 (0,5); 1,5420 (148,4); 1,5147 (1,1); 1,4890 (6,6); 1,4771 (15,9); 1,4690 (16,0); 1,4562 (5,8); 1,4177 (0,4); 1,2570 (0,9); 0,8824 (0,5); 0,1457 (0,4); 0,0191 (0,4); -0,0002 (90,0); -0,1487 (0,5)
I.67: RMN de ^1H (600,2 MHz, d_6-DMSO): δ= 9,0466 (6,7); 3,8998 (12,7); 3,8880 (12,8); 3,3236 (16,0); 2,5136 (2,8); 2,5106 (6,0); 2,5076 (8,2); 2,5046 (5,9); 2,5017 (2,7); 1,4619 (3,1); 1,4539 (7,9); 1,4484 (8,7); 1,4410 (3,4); 1,1920 (3,8); 1,1845 (8,7); 1,1790 (9,0); 1,1710 (3,2); 1,0838 (0,5); 1,0798 (0,6); 1,0786 (0,6); 1,0759 (0,4); 1,0718 (1,2); 1,0706 (1,2); 1,0666 (1,2); 1,0642 (1,0); 1,0624 (0,9); 1,0586 (2,2); 1,0546 (0,9); 1,0530 (1,0); 1,0506 (1,3); 1,0466 (1,3); 1,0455 (1,3); 1,0414 (0,4); 1,0384 (0,7); 1,0375 (0,7); 1,0335 (0,5); 0,5044 (1,8); 0,4971 (5,7); 0,4942 (5,8); 0,4911 (2,6); 0,4872 (2,6); 0,4837 (5,8); 0,4808 (5,5); 0,4738 (2,0); 0,2679 (2,0); 0,2607 (6,5); 0,2582 (6,1); 0,2529 (5,8); 0,2503 (6,7); 0,2430 (1,7)
I.68: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5171 (5,9); 7,2626 (11,3); 5,0297 (1,0); 5,0198 (1,9); 5,0101 (2,9); 5,0003 (3,7); 4,9906 (3,0); 4,9808 (2,1); 4,9711 (1,1); 3,8385 (3,0); 3,8288 (3,8); 3,8227 (3,6); 3,8110 (5,4); 3,7995 (4,7); 3,7935 (4,8); 3,7839 (4,0); 3,5753 (4,0); 3,5669 (4,4); 3,5556 (4,7); 3,5468 (7,2); 3,5377 (4,0); 3,5265 (3,9); 3,5180 (3,6); 1,9362 (1,6); 1,9272 (3,1); 1,9199 (3,2); 1,9124 (3,2); 1,9037 (3,6); 1,8950 (4,2); 1,8871 (4,2); 1,8801 (4,2); 1,8710 (2,3); 1,6938 (5,8); 1,6816 (14,0); 1,6734 (16,0); 1,6620 (9,8); 1,6524 (4,3); 1,6402 (4,5); 1,6298 (3,8); 1,6202 (2,6); 1,6102 (2,1); 1,5783 (16,2); 1,3898 (0,4); 1,3495 (5,0); 1,3379 (12,2); 1,3299 (12,0); 1,3173 (4,5); 1,2787 (0,5); 1,2571 (0,4); -0,0002 (14,0)

ES 2 989 675 T3

I.69: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,4894 (2,4); 7,2252 (2,7); 3,7603 (16,0); 1,6272 (2,0); 1,6147 (5,4); 1,6068 (5,6); 1,5951 (2,4); 1,5539 (4,3); 1,2858 (2,4); 1,2742 (5,6); 1,2662 (5,6); 1,2536 (2,1); 0,1476 (0,4); 0,0444 (0,4); 0,0422 (0,4); 0,0330 (0,3); -0,0002 (75,6); -0,0392 (3,8); -0,0475 (0,5); -0,0560 (0,4); -0,1511 (0,4)
I.70: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5028 (6,5); 7,2637 (10,8); 5,3836 (0,4); 5,0304 (1,1); 5,0208 (2,2); 5,0110 (3,2); 5,0013 (4,1); 4,9915 (3,2); 4,9818 (2,1); 4,9722 (1,0); 4,1921 (0,3); 3,8382 (3,4); 3,8285 (4,3); 3,8225 (4,1); 3,8105 (5,9); 3,7991 (5,1); 3,7934 (5,2); 3,7837 (4,2); 3,5762 (4,7); 3,5679 (5,0); 3,5565 (5,4); 3,5477 (8,0); 3,5387 (4,3); 3,5273 (4,2); 3,5190 (3,8); 1,9370 (1,9); 1,9282 (3,5); 1,9210 (3,6); 1,9138 (3,6); 1,9039 (4,0); 1,8951 (4,6); 1,8882 (4,6); 1,8813 (4,5); 1,8722 (2,3); 1,6962 (5,7); 1,6837 (15,7); 1,6757 (16,0); 1,6638 (10,1); 1,6520 (4,2); 1,6399 (4,6); 1,6295 (3,8); 1,6198 (2,3); 1,6097 (2,1); 1,5921 (15,3); 1,3939 (0,5); 1,3537 (5,8); 1,3419 (13,8); 1,3340 (13,2); 1,3214 (4,7); 1,2985 (0,6); 1,2812 (1,0); 1,2632 (0,7); 1,1647 (0,5); -0,0002 (13,4)
I.71: RMN de ^1H (600,2 MHz, d_6-DMSO): δ= 9,0798 (6,5); 5,5610 (0,9); 5,5480 (3,4); 5,5350 (5,2); 5,5220 (3,5); 5,5089 (0,9); 3,3935 (4,2); 3,3906 (2,3); 3,3800 (7,2); 3,3770 (8,1); 3,3665 (3,2); 3,3636 (6,0); 3,3231 (16,0); 3,3002 (6,0); 3,2972 (3,3); 3,2874 (7,7); 3,2840 (6,4); 3,2740 (2,3); 3,2710 (4,2); 2,5137 (4,3); 2,5107 (9,2); 2,5077 (12,6); 2,5047 (9,1); 2,5017 (4,3); 1,4960 (3,2); 1,4878 (8,0); 1,4823 (8,7); 1,4748 (3,4); 1,2499 (0,4); 1,2409 (0,4); 1,2234 (3,6); 1,2158 (8,2); 1,2103 (8,4); 1,2021 (3,0)
I.72: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5661 (2,1); 7,2608 (12,0); 4,7583 (16,0); 2,0061 (1,4); 1,8020 (1,7); 1,7889 (4,9); 1,7809 (4,9); 1,7686 (2,1); 1,5524 (17,0); 1,4356 (2,1); 1,4233 (5,1); 1,4153 (5,0); 1,4022 (1,8); 1,2843 (0,4); 1,2564 (2,0); 0,8821 (0,6); 0,8638 (0,3); -0,0002 (14,2)
I.73: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,6574 (8,2); 7,3749 (6,8); 7,3551 (14,8); 7,3356 (10,5); 7,2587 (10,0); 7,2321 (5,4); 7,2136 (8,0); 7,1950 (3,2); 7,0905 (15,8); 7,0713 (13,3); 1,9208 (0,4); 1,8818 (5,4); 1,8690 (15,4); 1,8612 (16,0); 1,8492 (6,3); 1,8090 (0,5); 1,5668 (4,8); 1,5235 (0,6); 1,4834 (6,4); 1,4714 (15,7); 1,4636 (15,9); 1,4508 (5,5); 1,4118 (0,3); 1,2550 (0,8); -0,0002 (12,9)
I.74: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,5486 (6,2); 7,2611 (16,9); 4,5211 (5,3); 4,5003 (15,9); 4,4795 (16,0); 4,4587 (5,4); 1,7866 (5,2); 1,7736 (14,9); 1,7657 (14,6); 1,7534 (6,0); 1,7134 (0,6); 1,5548 (8,9); 1,4673 (0,5); 1,4270 (6,4); 1,4148 (15,0); 1,4069 (14,6); 1,3937 (5,2); 1,3551 (0,3); 1,2649 (0,7); 0,8821 (0,6); -0,0002 (22,9)
I.75: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): δ= 7,4958 (2,1); 7,2611 (11,6); 5,6817 (0,4); 5,6617 (1,4); 5,6421 (2,2); 5,6222 (1,5); 5,6026 (0,4); 3,4671 (1,6); 3,4429 (3,2); 3,4221 (2,1); 3,3034 (2,4); 3,2839 (3,4); 3,2796 (3,0); 3,2597 (1,8); 2,0064 (16,0); 1,6947 (1,6); 1,6819 (4,4); 1,6739 (4,6); 1,6621 (1,9); 1,5514 (6,0); 1,3506 (1,9); 1,3387 (4,6); 1,3308 (4,6); 1,3180 (1,7); 1,2549 (0,6); -0,0002 (15,2)
II.a.01: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3): δ= 7,2997 (5,8); 5,3391 (1,0); 4,1328 (5,2); 4,1187 (0,5); 4,1110 (5,2); 2,9515 (0,4); 2,1210 (0,4); 2,0987 (0,8); 2,0764 (1,1); 2,0542 (0,9); 2,0319 (0,5); 1,5936 (5,3); 1,4701 (0,6); 1,0596 (0,5); 1,0425 (16,0); 1,0201 (15,3); 1,0031 (0,8); 0,9866 (0,5); 0,9806 (0,8); 0,9727 (1,8); 0,9645 (0,5); 0,9504 (1,7); 0,1085 (0,7); 0,0376 (5,6)
II.a.02: RMN de ^1H (499,9 MHz, CDCl_3): δ= 7,2672 (1,2); 4,4055 (2,5); 4,3912 (7,7); 4,3769 (7,8); 4,3627 (2,6); 2,0088 (0,9); 1,4065 (8,0); 1,3922 (16,0); 1,3780 (8,0); 1,2628 (0,4); 1,2538 (1,0); -0,0002 (1,4)
II.a.03: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3): δ= 7,6041 (0,4); 7,2984 (2,1); 3,9506 (16,0); 3,9244 (1,2); 1,5852 (1,8); 0,0364 (2,4)

ES 2 989 675 T3

II.a.04: RMN de ^1H (499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 15,1027 (0,3); 14,9975 (0,4); 14,9759 (0,4); 14,9509 (0,4); 14,9312 (0,4); 14,8896 (0,4); 14,8671 (0,5); 14,8450 (0,5); 14,7865 (0,6); 14,7539 (0,7); 14,6142 (1,0); 14,5943 (1,2); 14,5485 (1,4); 14,5271 (1,5); 14,5236 (1,5); 14,2968 (4,7); 14,1541 (7,0); 14,0699 (5,8); 13,9449 (3,2); 13,8394 (2,0); 13,5699 (0,8); 13,5440 (0,8); 13,4921 (0,6); 13,4731 (0,6); 13,4502 (0,6); 13,4216 (0,6); 13,3628 (0,5); 13,3451 (0,5); 13,3306 (0,4); 13,2703 (0,5); 13,2252 (0,4); 13,2010 (0,4); 13,1591 (0,4); 13,1269 (0,3); 13,0464 (0,3); 7,7544 (8,9); 7,4284 (1,4); 4,5359 (0,3); 4,4060 (0,3); 4,3940 (0,3); 4,3632 (0,4); 4,3500 (0,4); 4,3401 (0,4); 4,2742 (0,4); 4,2369 (0,4); 4,2278 (0,5); 4,2094 (0,5); 4,1782 (0,5); 4,1293 (0,5); 4,1189 (0,6); 4,1132 (0,6); 4,1025 (0,6); 4,0515 (0,6); 4,0446 (0,7); 4,0191 (0,7); 3,9836 (0,8); 3,9763 (0,8); 3,9301 (0,9); 3,8612 (1,0); 3,4109 (6,4); 3,3496 (7,0); 3,1621 (3,7); 2,8672 (1,0); 2,8488 (1,0); 2,8394 (0,9); 2,8120 (0,8); 2,8052 (0,8); 2,7588 (0,9); 2,7233 (0,7); 2,7027 (0,7); 2,6458 (1,7); 2,6421 (2,1); 2,6172 (0,7); 2,5952 (0,7); 2,5818 (0,7); 2,5143 (96,0); 2,5108 (196,0); 2,5072 (264,8); 2,5037 (189,8); 2,5002 (88,3); 2,3720 (1,1); 2,3683 (1,6); 2,3644 (1,2); 2,1856 (0,5); 2,0896 (16,0); 2,0780 (0,4); 1,9135 (0,5); 1,3579 (3,0); 1,3421 (1,0); 1,3177 (0,4); 1,3006 (1,0); 1,2736 (0,5); 1,2600 (1,1); 1,2307 (1,5); 1,2053 (0,4); 1,1833 (2,4); 1,1716 (1,1); 1,0969 (0,4); 0,8541 (0,5)
II.a.05: RMN de ^1H (499,9 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 3,8598 (16,0); 3,3560 (0,5); 2,5322 (0,6); 2,5288 (1,2); 2,5253 (1,7); 2,5217 (1,2); 2,5184 (0,6)
II.a.06: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3): δ= 7,2983 (1,3); 3,9521 (16,0); 1,5875 (0,4); 0,0350 (1,7)
II.a.07: RMN de ^1H (300,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 19,6514 (1,2); 19,4242 (1,2); 14,4211 (1,5); 14,2144 (4,5); 14,0488 (9,5); 13,9419 (4,6); 13,7837 (1,7); 13,6736 (1,2); 13,6487 (1,2); 13,5662 (1,3); 9,3511 (1,3); 5,7749 (3,0); 4,0838 (1,6); 4,0599 (3,6); 4,0367 (3,6); 4,0129 (1,4); 3,7199 (1,5); 3,6986 (1,4); 3,6881 (1,6); 3,6447 (2,0); 3,5905 (2,2); 3,5604 (2,8); 3,3605 (11,6); 3,1076 (1,9); 3,0934 (1,9); 3,0852 (2,0); 3,0078 (1,6); 2,9717 (1,3); 2,9121 (1,4); 2,8858 (1,6); 2,7479 (1,7); 2,5339 (95,7); 2,5278 (198,8); 2,5217 (271,4); 2,5157 (195,8); 2,5096 (91,8); 2,4429 (1,8); 2,4204 (1,3); 2,2912 (2,1); 2,0080 (16,0); 1,2510 (7,5); 1,2177 (5,6); 1,1940 (10,0); 1,1702 (5,6); 0,8674 (1,7); 0,8481 (1,5); 0,8110 (1,2); 0,0286 (13,0); 0,0178 (337,9); 0,0069 (13,0); -0,0500 (1,4); -0,1807 (1,7)
II.a.08: RMN de ^1H (499,9 MHz, CDCl_3): δ= 7,2630 (2,8); 4,4029 (2,5); 4,3887 (7,6); 4,3744 (7,7); 4,3601 (2,6); 2,0073 (0,6); 1,5552 (2,0); 1,4026 (8,0); 1,3883 (16,0); 1,3740 (7,8); 1,2543 (0,5); -0,0002 (3,2)
II.a.09: RMN de ^1H (499,9 MHz, CDCl_3): δ= 7,2606 (15,4); 5,2995 (3,1); 4,3996 (2,5); 4,3853 (7,7); 4,3710 (7,8); 4,3568 (2,6); 1,5458 (28,2); 1,3998 (8,0); 1,3856 (16,0); 1,3713 (7,9); 1,2560 (0,6); -0,0002 (15,9)
IVa.01: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,7327 (3,0); 8,0481 (4,2); 8,0381 (4,2); 4,0875 (2,4); 4,0699 (7,4); 4,0521 (7,5); 4,0344 (2,5); 3,3389 (56,6); 2,5269 (0,4); 2,5132 (10,1); 2,5092 (19,6); 2,5048 (25,0); 2,5004 (18,0); 2,0758 (0,7); 1,4499 (2,0); 1,4377 (5,5); 1,4294 (5,9); 1,4184 (2,4); 1,2993 (0,5); 1,2594 (0,8); 1,2393 (2,1); 1,1964 (2,6); 1,1853 (5,8); 1,1770 (5,5); 1,1644 (2,4); 1,1592 (8,1); 1,1415 (16,0); 1,1237 (7,7); 0,8535 (0,5); -0,0002 (0,8)
IVb.01: RMN de ^1H (400,2 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,7731 (2,4); 8,3151 (5,0); 7,4172 (7,9); 4,0894 (2,1); 4,0717 (6,7); 4,0540 (6,7); 4,0362 (2,1); 3,3267 (10,3); 3,3026 (1,5); 2,5254 (0,4); 2,5206 (0,6); 2,5119 (7,7); 2,5075 (15,6); 2,5029 (20,3); 2,4983 (14,5); 2,4937 (6,9); 1,4457 (1,8); 1,4334 (4,4); 1,4251 (4,8); 1,4141 (2,0); 1,1822 (2,0); 1,1689 (9,3); 1,1629 (4,4); 1,1510 (16,0); 1,1333 (7,0); -0,0002 (2,4)
IVb.02: RMN de ^1H (600,1 MHz, $\text{d}_6\text{-DMSO}$): δ= 8,8939 (2,0); 8,3116 (3,7); 7,4235 (0,4); 7,4075 (5,4); 4,0887 (1,3); 4,0768 (4,0); 4,0722 (0,5); 4,0650 (4,0); 4,0604 (0,5); 4,0532 (1,3); 3,3325 (5,2); 3,3283 (15,0); 3,3245 (16,0); 3,3010 (1,0); 2,5086 (4,3); 2,5057 (9,0); 2,5027 (12,2); 2,4997 (8,6); 2,4969 (3,9); 1,4368 (1,2); 1,4289 (3,1); 1,4234 (3,3); 1,4160 (1,3); 1,1846 (4,4); 1,1727 (9,2); 1,1609 (4,6); 1,1528 (1,5); 1,1453 (3,2); 1,1398 (3,1); 1,1319 (1,1)

ES 2 989 675 T3

IVb.03: RMN de ^1H (400,1 MHz, CDCl_3): $\delta = 7,2597$ (13,8); 6,8664 (10,0); 6,7007 (2,6); 6,6837 (2,5); 4,1866 (2,9); 4,1703 (8,0); 4,1524 (7,9); 4,1350 (2,7); 2,9545 (0,4); 2,8817 (0,3); 1,6436 (10,4); 1,5880 (0,4); 1,5423 (10,2); 1,3280 (0,4); 1,2719 (10,7); 1,2483 (9,0); 1,2302 (16,0); 1,2127 (8,0); -0,0002 (17,6)
IVb.05: RMN de ^1H (400,2 MHz, d_6 -DMSO): $\delta = 8,8497$ (3,1); 7,4168 (8,3); 4,0937 (1,8); 4,0759 (5,5); 4,0582 (5,5); 4,0405 (1,8); 3,3552 (20,7); 3,3478 (40,9); 2,5097 (15,5); 2,5053 (19,3); 2,5009 (14,6); 1,4464 (1,6); 1,4343 (4,3); 1,4261 (4,7); 1,4152 (2,1); 1,2400 (1,0); 1,1799 (6,2); 1,1722 (3,0); 1,1621 (16,0); 1,1531 (5,7); 1,1444 (6,7); -0,0002 (0,5)
IVc.01: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3): $\delta = 7,4521$ (2,4); 7,4385 (2,6); 7,4336 (2,6); 7,4201 (2,4); 7,2982 (6,6); 6,8863 (4,0); 6,8853 (3,8); 6,8679 (4,1); 6,8326 (0,8); 4,2365 (2,4); 4,2127 (7,4); 4,1890 (7,6); 4,1653 (2,5); 1,7130 (2,0); 1,6964 (5,8); 1,6855 (5,9); 1,6704 (2,6); 1,6281 (6,3); 1,6174 (0,4); 1,3423 (2,7); 1,3272 (6,0); 1,3163 (6,1); 1,2996 (2,6); 1,2915 (8,3); 1,2677 (16,0); 1,2440 (7,7); 0,9161 (0,4); 0,0340 (6,6)
V.01: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3): $\delta = 7,3382$ (10,3); 7,3044 (7,9); 6,7676 (2,0); 4,2423 (2,4); 4,2185 (7,5); 4,1947 (7,6); 4,1710 (2,5); 2,8481 (4,7); 1,7064 (2,0); 1,6896 (5,6); 1,6789 (5,8); 1,6635 (2,5); 1,6420 (3,4); 1,3285 (2,7); 1,3132 (6,2); 1,2986 (9,4); 1,2856 (2,5); 1,2747 (16,0); 1,2509 (7,6); 0,0405 (8,1)
V.02: RMN de ^1H (499,9 MHz, CDCl_3): $\delta = 7,2919$ (4,7); 7,2623 (3,9); 6,7012 (1,2); 5,0384 (0,4); 5,0259 (1,1); 5,0134 (1,5); 5,0009 (1,2); 4,9885 (0,5); 1,6259 (1,1); 1,6160 (3,3); 1,6098 (3,4); 1,6003 (1,4); 1,5902 (7,5); 1,2665 (1,5); 1,2572 (3,9); 1,2510 (3,8); 1,2410 (1,3); 1,2203 (16,0); 1,2078 (16,0); -0,0002 (3,6)
V.03: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3): $\delta = 7,3126$ (10,3); 7,2989 (6,2); 6,7720 (1,8); 5,3370 (0,8); 4,2375 (2,4); 4,2137 (7,4); 4,1899 (7,5); 4,1662 (2,4); 1,7013 (1,9); 1,6845 (5,2); 1,6738 (5,4); 1,6584 (2,3); 1,6307 (5,4); 1,3234 (2,6); 1,3080 (5,9); 1,2938 (10,0); 1,2805 (2,6); 1,2700 (16,0); 1,2462 (7,6); 0,0350 (7,0)
V.04: RMN de ^1H (300,2 MHz, d_6 -DMSO): $\delta = 9,3043$ (2,1); 7,8355 (6,1); 3,6265 (16,0); 3,3513 (2,6); 2,5338 (0,5); 2,5280 (1,1); 2,5220 (1,4); 2,5160 (1,0); 2,5102 (0,5); 1,5032 (1,1); 1,4868 (2,8); 1,4758 (3,0); 1,4614 (1,3); 1,2090 (1,4); 1,1945 (3,0); 1,1835 (2,8); 1,1671 (1,0); 0,0164 (0,9)
V.05: RMN de ^1H (300,2 MHz, d_6 -DMSO): $\delta = 12,6058$ (0,4); 9,2124 (7,5); 7,8263 (16,0); 3,3584 (1,5); 2,5282 (4,5); 2,5223 (6,0); 2,5164 (4,5); 2,0945 (0,8); 1,4547 (2,9); 1,4388 (7,3); 1,4281 (8,1); 1,4141 (3,6); 1,3612 (0,3); 1,1423 (3,6); 1,1282 (7,8); 1,1174 (7,5); 1,1015 (2,8); 0,0173 (2,2)
XI.01: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3): $\delta = 7,2985$ (0,9); 6,2968 (2,9); 5,8790 (3,7); 4,2235 (2,2); 4,1997 (6,7); 4,1760 (6,8); 4,1523 (2,2); 2,0305 (0,4); 1,6536 (1,9); 1,6373 (5,4); 1,6265 (5,6); 1,6115 (2,3); 1,2774 (7,2); 1,2538 (16,0); 1,2401 (6,2); 1,2298 (12,0); 1,2129 (2,1); 0,0202 (0,8)
XIIa.01: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3): $\delta = 7,3430$ (0,4); 7,2989 (4,6); 6,7348 (0,4); 4,2303 (0,5); 4,2066 (1,5); 4,1828 (1,6); 4,1591 (0,5); 1,6856 (0,4); 1,6690 (1,2); 1,6582 (1,2); 1,6430 (0,6); 1,6095 (2,7); 1,5410 (16,0); 1,2930 (2,2); 1,2790 (1,3); 1,2691 (4,4); 1,2514 (0,6); 1,2454 (1,6); 0,0368 (5,5)
XIII.01: RMN de ^1H (499,9 MHz, CDCl_3): $\delta = 7,2626$ (1,0); 5,7182 (0,9); 3,8289 (16,0); 1,5821 (0,5); -0,0002 (1,1)

XIII.02: RMN de ^1H (300,2 MHz, d_6 -DMSO): δ = 13,4605 (1,6); 13,3786 (1,6); 13,2747 (2,0); 13,2607 (2,1); 13,2418 (2,4); 13,1976 (2,6); 13,1780 (2,4); 13,1651 (2,6); 13,0998 (2,9); 13,0936 (2,9); 13,0821 (3,0); 13,0381 (3,2); 12,9902 (3,5); 12,9696 (3,4); 12,9563 (3,4); 12,9261 (3,3); 12,9166 (3,1); 12,9040 (3,3); 12,8582 (3,1); 12,8359 (3,4); 12,8242 (3,0); 12,7876 (2,7); 12,6640 (2,0); 12,5368 (1,6); 12,5068 (1,6); 12,4811 (1,6); 7,1025 (1,6); 7,0457 (2,2); 7,0074 (2,0); 6,9258 (3,4); 6,8352 (5,3); 6,6472 (16,0); 6,5167 (6,9); 6,4124 (2,9); 6,3341 (1,8); 6,1823 (1,6); 3,9925 (1,7); 3,8936 (1,8); 3,7735 (1,8); 3,7667 (1,6); 3,6496 (2,9); 3,3680 (566,0); 3,2044 (4,4); 3,0765 (1,6); 3,0065 (1,9); 2,9799 (1,6); 2,7531 (2,5); 2,5392 (262,9); 2,5339 (326,0); 2,3041 (2,0); 1,2671 (1,7); 0,2259 (1,9); 0,0305 (246,1); -0,0116 (1,7); -1,0984 (1,8)
XIV.01: RMN de ^1H (300,2 MHz, CDCl_3): δ = 8,0902 (0,4); 7,2984 (6,7); 3,9068 (16,0); 2,2651 (12,6); 1,5989 (5,4); 0,1070 (0,6); 0,0362 (6,1)
XIV.02: RMN de ^1H (300,2 MHz, d_6 -DMSO): δ = 9,9025 (1,1); 8,0098 (0,7); 3,3874 (0,6); 3,3540 (0,6); 3,3136 (0,5); 2,5463 (8,0); 2,5404 (17,3); 2,5344 (24,4); 2,5284 (17,8); 2,5226 (8,5); 2,0407 (16,0); 1,9413 (0,4); 1,2066 (0,4); 0,0431 (0,8); 0,0322 (28,2); 0,0211 (1,1)

DATOS BIOLÓGICOS: compuestos según la fórmula (I)

El **ejemplo A** descrito a continuación muestra la inducción de la expresión genética de defensa en *Arabidopsis thaliana* mediante los compuestos según la fórmula (I), específicamente la estimulación de la vía ácida salicílica. Por lo tanto, estos compuestos pueden inducir defensas del huésped y, en consecuencia, proteger a las plantas contra una gran variedad de patógenos, incluidas las bacterias y los hongos.

Los **ejemplos B, C y D** descritos a continuación muestran la inactividad directa de la prueba celular *in vitro* de los compuestos según la fórmula (I) contra varios patógenos, incluidas las bacterias y los hongos y, por lo tanto, ilustran el modo de acción de los compuestos según la fórmula (I) como inductores de defensa del huésped de la planta.

Los **ejemplos E, F, G, H y I** descritos a continuación muestran la actividad *in vivo* de los compuestos *in planta* según la fórmula (I) al estimular la defensa de la planta contra varios patógenos que infecten las plantas, incluidas las bacterias y los hongos.

Los **ejemplos J, K, L, M y N** descritos a continuación muestran los ejemplos comparativos de la actividad *in vivo in planta* de los compuestos preparados de acuerdo con la enseñanza de WO2004/024692 en comparación con los compuestos de la fórmula (I) según la presente invención.

Ejemplo A: Inducción de la expresión del gen de defensa en *Arabidopsis thaliana*

Las plantas informantes de *Arabidopsis thaliana* que contienen la secuencia de codificación de una proteína fluorescente verde (GFP) enlazada a la secuencia promotora que responde al salicilato del gen PR1 (proteína I relacionada con la patogénesis) (AT2G14610) se cultivaron durante cinco días y luego se rociaron con los compuestos. El tercer día después del rociado, se evaluó la fluorescencia de la planta con un instrumento MacroFluo de Leica Microsystems (Wetzlar, Alemania). Se cuantificaron las fluorescencias con Meta-Morph Microscopy Automation & Image Analysis Software (Molecular Devices, Sunnyvale, California, Estados Unidos).

La fluorescencia de fondo en las hojas tratadas como modelo se estableció en 1,00. El tratamiento del ácido salicílico (300 ppm) dio como resultado un valor de fluorescencia relativo de 2,70, lo que proporciona la validez del sistema de la prueba.

En esta prueba, los siguientes compuestos según la invención mostraron un valor de fluorescencia relativa de al menos por encima de 2 en una concentración de 300 ppm del compuesto: I.01; I.02; I.03; I.04; I.05; I.06; I.07; I.08; I.09; I.10; I.11; I.12; I.13; I.14; I.15; I.16; I.17; I.18; I.20; I.21; I.22; I.23; I.24; I.25; I.26; I.27; I.28; I.29; I.30; I.31; I.32; I.33; I.34; I.36; I.37; I.38; I.39; I.40; I.41; I.42; I.44; I.45.

En esta prueba, los siguientes compuestos según la invención mostraron un valor de fluorescencia relativa de al menos por encima de 2 en una concentración de 75 ppm del compuesto: I.02; I.03; I.05; I.09; I.10; I.11; I.12; I.13; I.15; I.16; I.17; I.18; I.20; I.23; I.24; I.28; I.29; I.31; I.32; I.33; I.34; I.36; I.37; I.42; I.45. El salicilato es una de las principales hormonas de defensa frente a los patógenos de las plantas. Todos los compuestos descritos anteriormente estimulan la vía del ácido salicílico y, por lo tanto, pueden proteger a las plantas contra una gran variedad de patógenos.

Ejemplo B: Prueba celular *Pseudomonas syringae* pv. *tomate in vitro*

Solvente: DMSO

Medio de cultivo: Medio de caldo LB (Luria Broth Miller) Sigma

Inóculo: suspensión bacteriana

- 5 Los compuestos a analizar se solubilizaron en DMSO y se utilizó la solución para preparar el rango requerido de concentraciones. La concentración final de DMSO usada en el ensayo fue de $\leq 1\%$.

Se preparó el inóculo a partir de un cultivo previo de las bacterias cultivadas en un medio líquido y se diluyó a la densidad óptica (OD) deseada.

- 10 Se analizó la capacidad de los compuestos de inhibir el crecimiento de bacterias en un ensayo de cultivo líquido. Se agregaron los compuestos en las concentraciones deseadas al medio de cultivo que contiene la suspensión de la bacteria. Después de 24 horas de incubación, se determinó la eficacia de los compuestos mediante una medición de espectrometría del crecimiento de la bacteria. La inhibición se determinó mediante la comparación de los valores de absorbancia en los pocillos que contienen los compuestos con la absorbancia en los pocillos de control sin los compuestos.

- 15 En esta prueba, los siguientes compuestos según la invención no mostraron una actividad directa (eficacia menor que o igual al 30%) en una concentración de 20 ppm del ingrediente activo: I.01; I.02; I.03; I.04; I.05; I.06; I.07; I.08; I.09; I.10; I.11; I.12; I.13; I.14; I.15; I.16; I.44; I.45.

Ejemplo C: Prueba celular *Botrytis cinerea* in vitro

Solvente: DMSO

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

Inóculo: suspensión de esporas

Los fungicidas se solubilizaron en DMSO y se utilizó la solución para preparar el rango requerido de concentraciones. La concentración final de DMSO usada en el ensayo fue de $\leq 1\%$.

- 25 Se preparó una suspensión de *B. cinerea* y se diluyó a la densidad de esporas deseada.

- 30 Los fungicidas se examinaron por su capacidad para inhibir la germinación de esporas y el crecimiento de micelio en un ensayo de cultivo líquido. Se agregaron los compuestos en la concentración deseada al medio de cultivo con esporas. Después de 5 días de incubación, se determinó la toxicidad por hongos de los compuestos mediante la medición espectrométrica del crecimiento de micelio. La inhibición del crecimiento fúngico se determinó mediante la comparación de los valores de absorbancia en los pocillos que contienen los fungicidas con la absorbancia en los pocillos de control sin los fungicidas.

En esta prueba, los siguientes compuestos según la invención no mostraron una actividad directa (eficacia menor que o igual al 30%) en una concentración de 20 ppm del ingrediente activo: I.01; I.02; I.03; I.04; I.05; I.06; I.07; I.08; I.09; I.10; I.11; I.12; I.13; I.14; I.15; I.16; I.44; I.45.

- 35 **Ejemplo D: Prueba celular *Xanthomonas campestris* pv. *campestris* in vitro**

Solvente: DMSO

Medio de cultivo: Medio de caldo LB (Luria Broth Miller) Sigma

Inóculo: suspensión bacteriana

- 40 Los compuestos se solubilizaron en DMSO y se usó la solución para preparar el rango requerido de concentraciones. La concentración final de DMSO usada en el ensayo fue de $\leq 1\%$.

Se preparó el inóculo a partir de un cultivo previo de las bacterias cultivadas en un medio líquido y se diluyó a la densidad óptica (OD) deseada.

- 45 Se analizó la capacidad de los compuestos de inhibir el crecimiento de bacterias en un ensayo de cultivo líquido. Se agregaron los compuestos en las concentraciones deseadas al medio de cultivo que contiene la suspensión de la bacteria. Después de 24 horas de incubación, se determinó la eficacia de los compuestos mediante una medición de espectrometría del crecimiento de la bacteria. La inhibición se determinó mediante la comparación de los valores de absorbancia en los pocillos que contienen los compuestos con la absorbancia en los pocillos de control sin los ingredientes activos.

En esta prueba, los siguientes compuestos según la invención no mostraron una actividad directa (eficacia menor que o igual al 30%) en una concentración de 20 ppm del ingrediente activo: I.01; I.02; I.03; I.04; I.05; I.06; I.07; I.08; I.09; I.10; I.11; I.12; I.13; I.14; I.15; I.16; I.44; I.45.

Ejemplo E: prueba preventiva *in vivo* de *Pseudomonas syringae* pv. *tomate* (mancha bacteriana en el tomate)

Los ingredientes activos evaluados se prepararon mediante la homogeneización en una mezcla de acetona/sulfóxido de dimetilo/Tween®, y luego se diluyeron con agua para obtener la concentración del material activo deseado.

Las plantas jóvenes de tomate se trataron al rociar el ingrediente activo preparado como se describió anteriormente. Las plantas de control se trataron solamente con una solución acuosa de acetona/dimetilsulfóxido/Tween®.

Después de 72 horas, se contaminaron las plantas al rociar las hojas con una suspensión bacteriana acuosa de *Pseudomonas syringae* pv. *tomate*. Las plantas de tomate contaminadas se incubaron durante 4 días en una atmósfera saturada a 22 °C de día/20 °C de noche: 70% de HR y luego durante 1 o 2 días a 22 °C de día/20 °C de noche a 70% a 80% de humedad relativa.

La prueba se evaluó 5 o 6 días después de la inoculación. El valor 0% significa una eficacia que corresponde a la de las plantas de control mientras que una eficacia del 100% significa que no se observó una enfermedad.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 80% y 89% en una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I.01.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 90% y 100% en una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I.02; I.09.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 70% y 79% en una concentración de 31 ppm de ingrediente activo: I.07; I.09; I.11; I.12; I.15; I.26.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 80% y 89% en una concentración de 31 ppm de ingrediente activo: I.03; I.16; I.21; I.22; I.25; I.33; I.37; I.45.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 90% y 100% en una concentración de 31 ppm de ingrediente activo: I.10; I.17; I.23; I.24; I.40.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 70% y 79% en una concentración de 125 ppm de ingrediente activo: I.03; I.09; I.25; I.33; I.39; I.43.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 80% y 89% en una concentración de 125 ppm de ingrediente activo: I.01; I.12; I.14; I.20; I.34; I.36; I.45.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 90% y 100% en una concentración de 125 ppm de ingrediente activo: I.10; I.11; I.15; I.16; I.17; I.18; I.21; I.22.

Ejemplo F: prueba preventiva *in vivo* de *Peronospora parasítica* (mildió lanoso de crucífero)

Los ingredientes activos evaluados se prepararon mediante la homogeneización en una mezcla de acetona/sulfóxido de dimetilo/Tween®, y luego se diluyeron con agua para obtener la concentración del material activo deseado.

Las plantas jóvenes de repollo se trataron al rociar el ingrediente activo preparado como se describió anteriormente. Las plantas de control se trataron solamente con una solución acuosa de acetona/dimetilsulfóxido/Tween®.

Después de 72 horas, se contaminaron las plantas al rociar las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Peronospora parasítica*. Las plantas de repollo contaminadas se incubaron durante 5 días a 20 °C y en una humedad relativa del 100%.

La prueba se evaluó 5 días después de la inoculación. El valor 0% significa una eficacia que corresponde a la de las plantas de control mientras que una eficacia del 100% significa que no se observó una enfermedad.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 70% y 79% en una concentración de 31 ppm de ingrediente activo: I.01; I.04; I.26.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 80% y 89% en una concentración de 31 ppm de ingrediente activo: I.10; I.14; I.17; I.33.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 90% y 100% en una concentración de 31 ppm de ingrediente activo: I.02; I.09; I.13; I.15; I.23; I.28

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 70% y 79% en una concentración de 125 ppm de ingrediente activo: I.03

- 5 En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 80% y 89% en una concentración de 125 ppm de ingrediente activo: I.12; I.31; I.35; I.44

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 90% y 100% en una concentración de 125 ppm de ingrediente activo: I.02; I.09; I.10; I.13; I.14; I.15; I.16; I.17; I.23; I.26; I.28; I.29; I.30; I.33; I.38; I.40; I.42

10 **Ejemplo G: prueba preventiva *in vivo* de *Uromyces appendiculatus* (roya de frijol)**

Los ingredientes activos evaluados se prepararon mediante la homogeneización en una mezcla de acetona/sulfóxido de dimetilo/Tween®, y luego se diluyeron con agua para obtener la concentración del material activo deseado.

- 15 Las plantas jóvenes de frijol se trataron al rociar el ingrediente activo preparado como se describió anteriormente. Las plantas de control se trataron solamente con una solución acuosa de acetona/dimetilsulfóxido/Tween®.

Después de 72 horas, se contaminaron las plantas al rociar las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Uromyces appendiculatus*. Las plantas de frijol contaminadas se incubaron durante 24 horas a 20 °C y al 100% de humedad relativa y luego durante 9 días a 20 °C y del 70% al 80% de humedad relativa.

- 20 La prueba se evaluó 10 días después de la inoculación. El valor 0% significa una eficacia que corresponde a la de las plantas de control mientras que una eficacia del 100% significa que no se observó una enfermedad.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 70% y 79% en una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I.03; I.05.

- 25 En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 80% y 89% en una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I.09.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 90% y 100% en una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I.01; I.02.

Ejemplo H: Prueba preventiva *in vivo* de *Colletotrichum lindemuthianum* (antracnosis en frijoles)

- 30 Los ingredientes activos evaluados se prepararon mediante la homogeneización en una mezcla de acetona/sulfóxido de dimetilo/Tween®, y luego se diluyeron con agua para obtener la concentración del material activo deseado.

Las plantas jóvenes de frijol se trataron al rociar el ingrediente activo preparado como se describió anteriormente. Las plantas de control se trataron solamente con una solución acuosa de acetona/dimetilsulfóxido/Tween®.

- 35 Después de 72 horas, se contaminaron las plantas al rociar las hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Colletotrichum lindemuthianum*. Las plantas de frijol contaminadas se incubaron durante 24 horas a 20 °C y al 100% de humedad relativa y luego durante 5 días a 20 °C y al 90% de humedad relativa.

La prueba se evaluó 6 días después de la inoculación. El valor 0% significa una eficacia que corresponde a la de las plantas de control mientras que una eficacia del 100% significa que no se observó una enfermedad.

- 40 En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 70% y 79% en una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I.04.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 80% y 89% en una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I.09.

- 45 En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 90% y 100% en una concentración de 500 ppm de ingrediente activo: I.02; I.03.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 70% y 79% en una concentración de 31 ppm de ingrediente activo: I.04; I.10; I.31; I.42.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 80% y 89% en una concentración de 31 ppm de ingrediente activo: I.14; I.15; I.33.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 90% y 100% en una concentración de 31 ppm de ingrediente activo: I.02; I.13.

Ejemplo I: prueba preventiva *in vivo* de *Xanthomonas campestris* pv. *campestris* (podredumbre negra en repollo)

- 5 Los ingredientes activos evaluados se prepararon mediante la homogeneización en una mezcla de acetona/sulfóxido de dimetilo/Tween®, y luego se diluyeron con agua para obtener la concentración del material activo deseado.

Las plantas jóvenes de repollo se trataron al rociar el ingrediente activo preparado como se describió anteriormente. Las plantas de control se trataron solamente con una solución acuosa de acetona/dimetilsulfóxido/Tween®.

Después de 72 horas, se contaminaron las plantas al rociar las hojas con una suspensión bacteriana acuosa de *Xanthomonas campestris* pv. *campestris*. Las plantas de repollo contaminadas se incubaron durante 8 a 10 días a 27 °C en una humedad relativa del 95%.

- 15 La prueba se evaluó 8 o 10 días después de la inoculación. El valor 0% significa una eficacia que corresponde a la de las plantas de control mientras que una eficacia del 100% significa que no se observó una enfermedad.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 70% y 79% en una concentración de 125 ppm de ingrediente activo: I.02; I.03; I.15; I.31; I.38; I.44.

En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 80% y 89% en una concentración de 125 ppm de ingrediente activo: I.23; I.30; I.45.

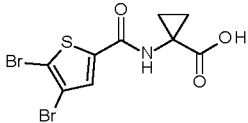
- 20 En esta prueba, los siguientes compuestos mostraron eficacia de acuerdo con la invención de entre el 90% y 100% en una concentración de 125 ppm de ingrediente activo: I.10; I.12; I.14; I.17; I.24; I.25; I.26; I.29; I.33; I.34; I.36; I.42.

Ejemplo J: ejemplos comparativos

- 25 El compuesto CMP1 se evaluó en una prueba preventiva *in vivo* en *Pseudomonas syringae* pv. *tomate* (mancha bacteriana en el tomate) en las mismas condiciones como se describen en el ejemplo E.

Se preparó el compuesto CMP1 de conformidad con las enseñanzas de WO2004/024692.

Los resultados se muestran en la tabla a continuación.

Ex.	Estructura	Eficacia (%) a 500 ppm	Eficacia (%) a 125 ppm
CMP1		0	0

- 30 Los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención mostraron una mejor eficacia que el compuesto CMP1 estructuralmente relacionado cuando se evaluaron en una concentración de 500 ppm.

Más específicamente, los compuestos I.02 mostraron una eficacia de al menos 90% en una concentración de 500 ppm mientras que CMP1 mostró una eficacia inferior al 10% en la misma concentración.

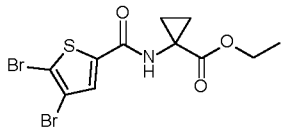
Los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención mostraron una mejor eficacia que el compuesto CMP1 estructuralmente relacionado cuando se evaluaron en una concentración de 125 ppm.

- 35 Más específicamente, el compuesto I.14 mostró una eficacia de al menos 80% en una concentración de 125 ppm mientras que CMP1 mostró una eficacia inferior al 10% en la misma concentración.

El compuesto CMP2 se evaluó en una prueba preventiva *in vivo* en *Pseudomonas syringae* pv. *tomate* (mancha bacteriana en el tomate) en las mismas condiciones como se describen en el ejemplo E.

Se preparó el compuesto CMP2 de conformidad con las enseñanzas de WO2004/024692.

- 40 Los resultados se muestran en la tabla a continuación.

Ex.	Estructura	Eficacia (%) a 125 ppm
CMP2		0

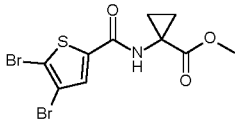
Los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención mostraron una mejor eficacia que el compuesto CMP2 estructuralmente relacionado cuando se evaluaron en una concentración de 125 ppm.

Más específicamente, los compuestos I.01, I.43 a I.09 mostraron una eficacia de al menos 70% en una concentración de 125 ppm mientras que CMP2 mostró una eficacia inferior al 10% en la misma concentración.

El compuesto CMP3 se evaluó en una prueba preventiva *in vivo* en *Pseudomonas syringae* pv. *tomate* (mancha bacteriana en el tomate) en las mismas condiciones como se describen en el ejemplo E.

Se preparó el compuesto CMP3 de conformidad con las enseñanzas de WO2004/024692.

Los resultados se muestran en la tabla a continuación.

Ex.	Estructura	Eficacia (%) a 31 ppm
CMP3		3

Los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención mostraron una mejor eficacia que el compuesto CMP3 estructuralmente relacionado cuando se evaluaron en una concentración de 31 ppm.

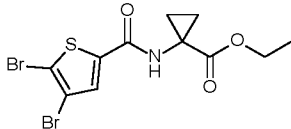
Más específicamente, los compuestos I.07, I.10, I.11 a I.16 mostraron una eficacia de al menos 70% en una concentración de 31 ppm mientras que CMP3 mostró una eficacia inferior al 10% en la misma concentración.

Ejemplo K: ejemplos comparativos

El compuesto CMP2 se evaluó en una prueba preventiva *in vivo* de *Peronospora parasitica* (mildió lanoso de crucífero) en las mismas condiciones como se describen en el ejemplo F.

Se preparó el compuesto CMP2 de conformidad con las enseñanzas de WO2004/024692.

Los resultados se muestran en la tabla a continuación.

Ex.	Estructura	Eficacia (%) a 31 ppm
CMP2		0

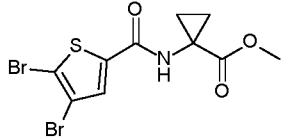
Los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención mostraron una mejor eficacia que los compuestos CMP2 estructuralmente relacionado cuando se evaluó en una concentración de 31 ppm.

Más específicamente, los compuestos I.01 a I.09 mostraron una eficacia de al menos 70% en una concentración de 31 ppm mientras que CMP2 mostró una eficacia inferior al 10% en la misma concentración.

El compuesto CMP3 se evaluó en una prueba preventiva *in vivo* de *Peronospora parasitica* (mildió lanoso de crucífero) en las mismas condiciones como se describen en el ejemplo F.

Se preparó el compuesto CMP3 de conformidad con las enseñanzas de WO2004/024692.

Los resultados se muestran en la tabla a continuación.

Ex.	Estructura	Eficacia (%) a 125 ppm
CMP3		38

- 5 Los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención mostraron una mejor eficacia que los compuestos CMP3 estructuralmente relacionado cuando se evaluó en una concentración de 125 ppm.

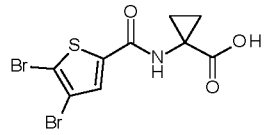
Más específicamente, los compuestos I. 10 a I. 16 mostraron una eficacia de al menos 90% en una concentración de 125 ppm mientras que CMP3 mostró una eficacia inferior al 40% en la misma concentración.

Ejemplo L: ejemplos comparativos

- 10 El compuesto CMP1 se evaluó en una prueba preventiva *in vivo* en *Colletotrichum lindemuthianum* (antracnosis en frijoles) en las mismas condiciones como se describen en el ejemplo E.

Se preparó el compuesto CMP1 de conformidad con las enseñanzas de WO2004/024692.

Los resultados se muestran en la tabla a continuación.

Ex.	Estructura	Eficacia (%) a 31 ppm
CMP1		27*

* media aritmética de las 2 pruebas

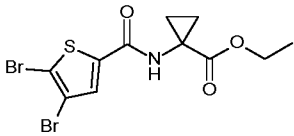
- 15 Los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención mostraron una mejor eficacia que el compuesto CMP1 estructuralmente relacionado cuando se evaluaron en una concentración de 31 ppm.

Más específicamente, los compuestos I.02, I.13 a I.14 mostraron una eficacia de al menos 80% en una concentración de 31 ppm mientras que CMP1 mostró una eficacia inferior al 30% en la misma concentración.

El compuesto CMP2 se evaluó en una prueba preventiva *in vivo* en *Colletotrichum lindemuthianum* (antracnosis en frijoles) en las mismas condiciones como se describen en el ejemplo I.

- 20 Se preparó el compuesto CMP2 de conformidad con las enseñanzas de WO2004/024692.

Los resultados se muestran en la tabla a continuación.

Ex.	Estructura	Eficacia (%) a 500 ppm
CMP2		0

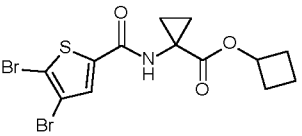
Los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención mostraron una mejor eficacia que el compuesto CMP2 estructuralmente relacionado cuando se evaluaron en una concentración de 500 ppm.

Más específicamente, el compuesto I.09 mostró una eficacia de al menos 80% en una concentración de 500 ppm mientras que CMP2 mostró una eficacia inferior al 10% en la misma concentración.

El compuesto CMP5 se evaluó en una prueba preventiva *in vivo* en *Colletotrichum lindemuthianum* (antracnosis en frijoles) en las mismas condiciones como se describen en el ejemplo I.

- 5 Se preparó el compuesto CMP5 de conformidad con las enseñanzas de WO2004/024692.

Los resultados se muestran en la tabla a continuación.

Ex.	Estructura	Eficacia (%) a 31 ppm
CMP5		25

Los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención mostraron una mejor eficacia que el compuesto CMP5 estructuralmente relacionado cuando se evaluaron en una concentración de 31 ppm.

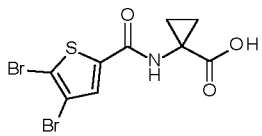
- 10 Más específicamente, el compuesto I.42 mostró una eficacia de al menos 70% en una concentración de 31 ppm mientras que CMP5 mostró una eficacia inferior al 30% en la misma concentración.

Ejemplo M: ejemplos comparativos

El compuesto CMP1 se evaluó en una prueba preventiva *in vivo* en *Xanthomonas campestris pv. campestris* (podredumbre negra en repollo) en las mismas condiciones como se describen en el ejemplo I.

- 15 Se preparó el compuesto CMP1 de conformidad con las enseñanzas de WO2004/024692.

Los resultados se muestran en la tabla a continuación.

Ex.	Estructura	Eficacia (%) a 31 ppm
CMP1		10*

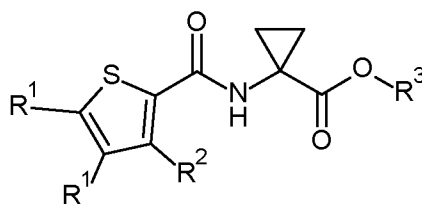
* media aritmética de las 2 pruebas

Los compuestos de la fórmula (I) de la presente invención mostraron una mejor eficacia que los compuestos CMP1 estructuralmente relacionado cuando se evaluó en una concentración de 31 ppm.

- 20 Más específicamente, el compuesto I.14 mostró una eficacia de al menos 80% en una concentración de 31 ppm mientras que CMP1 mostró una eficacia del 10% en la misma concentración.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula (I):



(I)

5 en el que

R¹ son átomos de bromo o átomos de cloro;

R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro, átomo de yodo y átomo de flúor;

10 R³ se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo-C₁-C₆-heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo C₁-C₆-ciclopropilo, y si R¹ y R² son átomos de bromo, entonces R³ se selecciona del grupo que consiste en haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo -C₁-C₆-heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo-C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo-C₁-C₆-ciclopropilo, y si R³ se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno y alquilo-C₁-C₆, entonces R₂ se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo y átomo de yodo;

siempre que R² no sea un átomo de cloro cuando R¹ son átomos de cloro.

2. Compuesto de la reivindicación 1, en el que R¹ son átomos de cloro.

3. Compuesto de la reivindicación 1, en el que R¹ son átomos de bromo.

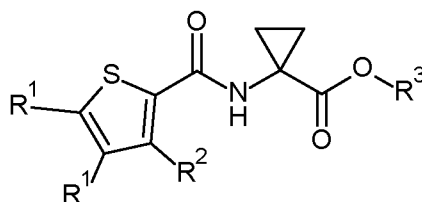
20 4. Compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a la 3, en el que R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de flúor, átomo de cloro y átomo de bromo.

5. Compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a la 4, en el que R¹ son diferentes de R².

6. Compuesto de la reivindicación 1, en el que R¹ son átomos de cloro y R² es un átomo de bromo.

25 7. Compuesto de una cualquiera de las reivindicaciones 1 a la reivindicación 6, en el que R³ se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, aralquilo y alquilo ciclopropilo C₁-C₆, y preferentemente seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈ y, más preferentemente, seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno y alquilo C₁-C₆.

30 8. Uso de un compuesto de la fórmula (I) para controlar hongos y/o bacterias fitopatógenos en plantas o partes de plantas:



(I)

en el que

35 R¹ son átomos de bromo o átomos de cloro;

R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de bromo, átomo de cloro, átomo de yodo y átomo de flúor;

R³ se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo C₁-C₆-heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo C₁-C₆-ciclopropilo;

siempre que R² no sea un átomo de cloro cuando R¹ son átomos de cloro;

en la protección del cultivo.

9. Uso de la reivindicación 8, en el que R¹ son átomos de cloro.

10. Uso de la reivindicación 8, en el que R¹ son átomos de bromo.

11. Uso de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 8 a 10, en el que R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de flúor, átomo de cloro y átomo de bromo.

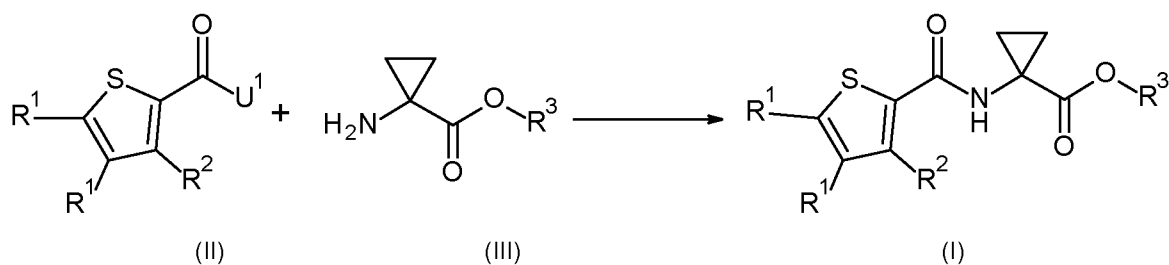
12. Uso de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 8 a 11, en el que R¹ son diferentes de R².

13. Uso de la reivindicación 8, en el que R¹ son átomos de cloro y R² se selecciona del grupo que consiste en átomo de flúor y átomo de cloro.

14. Uso de la reivindicación 8, en el que R¹ son átomos de cloro y R² es un átomo de bromo.

15. Uso de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 8 a 14, en el que R³ se selecciona del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, arilo, heteroarilo, aralquilo, alquilo -C₁-C₆-heteroarilo, heterociclilo de 4, 5 o 6 miembros, alquilo -C₁-C₆-Si(alquilo C₁-C₆)₃ y alquilo -C₁-C₆-ciclopropilo y preferentemente seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈ y, más preferentemente, seleccionado del grupo que consiste en átomo de hidrógeno y alquilo C₁-C₆.

16. Un proceso para preparar un compuesto de la fórmula (I) como se detalla en la reivindicación 1 que comprende el paso de reaccionar un compuesto de la fórmula (II), o una sal de este, con un compuesto de la fórmula (III), o una sal de este, para obtener el compuesto de la fórmula (I):



en el que

R¹, R² y R³ son como se define en la reivindicación 1; y

U¹ es un átomo de halógeno, un grupo hidróxilo o un grupo alcoxi C₁-C₆.

17. Un proceso para preparar un compuesto de la fórmula (I) como se detalla en la reivindicación 1 que comprende el paso de

llevar a cabo una brominación o clorinación de un compuesto de la fórmula (IV), o una sal de este, para proporcionar el compuesto de la fórmula (I):



en el que

R^1 , R^2 y R^3 son como se define en la reivindicación 1;

5 U^2 es un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un átomo de bromo; y

U^3 es un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o un átomo de bromo;

siempre que al menos uno de U^2 o U^3 sea un átomo de hidrógeno.

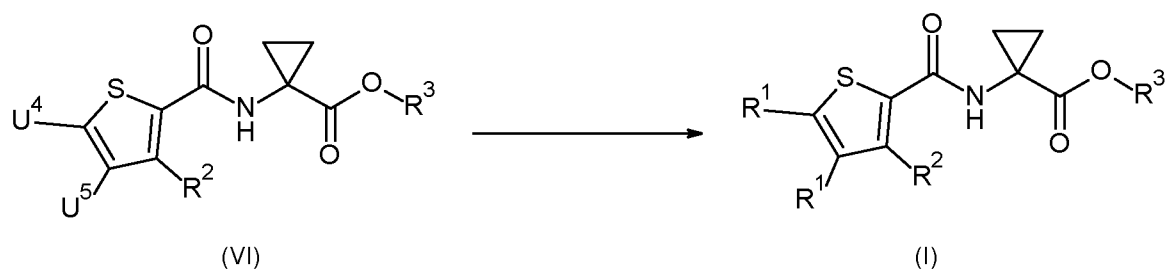
18. Un proceso para preparar un compuesto de la fórmula (I) como se detalla en la reivindicación 1 que comprende el paso de

10 llevar a cabo una halogenación de un compuesto de la fórmula (I) para obtener el compuesto de la fórmula (I):



en el que R^1 , R^2 y R^3 son como se define en la reivindicación 1.

15 19. Un proceso para preparar un compuesto de la fórmula (I) como se detalla en la reivindicación 1 que comprende el paso de llevar a cabo una diazotación de un compuesto de la fórmula (VI), o una sal de este, seguido de una sustitución aromática para obtener el compuesto de la fórmula (I):



en el que

20 R^1 , R^2 y R^3 son como se define en la reivindicación 1;

U^4 es un grupo amino, un átomo de cloro o un átomo de bromo; y

U^5 es un grupo amino, un átomo de cloro o un átomo de bromo;

siempre que al menos uno de U^4 o U^5 sea un grupo amino.

25 20. Una composición que comprende al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 y al menos un portador adecuado para la agricultura.