

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 857 880**

51 Int. Cl.:

C07C 257/12 (2006.01)
C07C 317/40 (2006.01)
C07C 323/41 (2006.01)
A01N 37/52 (2006.01)
A01N 43/10 (2006.01)
C07D 335/02 (2006.01)
C07C 317/28 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **14.11.2017** **PCT/EP2017/079119**

87 Fecha y número de publicación internacional: **24.05.2018** **WO18091430**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **14.11.2017** **E 17794754 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **23.12.2020** **EP 3541779**

54 Título: **Derivados de fenilamidina microbicidas**

30 Prioridad:

15.11.2016 EP 16198815
14.06.2017 EP 17176108

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la
traducción de la patente:
29.09.2021

73 Titular/es:

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (100.0%)
Rosentalstrasse 67
4058 Basel, CH

72 Inventor/es:

WEISS, MATTHIAS y
SULZER-MOSSE, SARAH

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 857 880 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

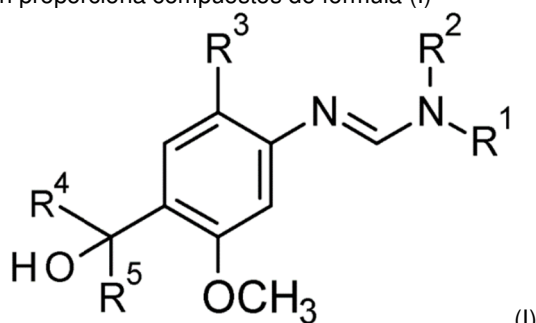
Derivados de fenilamidina microbicidas

La presente invención se refiere a derivados de fenilamidina novedosos, los cuales presentan actividad microbici-
da, p. ej., como principios activos, en particular actividad fungicida. La invención se refiere además a la preparación de
estos derivados de fenilamidina, a intermediarios útiles en la preparación de estos derivados de fenilamidina, a la
preparación de estos intermediarios, a composiciones agroquímicas que comprenden al menos uno de los derivados de
fenilamidina, a la preparación de estas composiciones y al uso de las composiciones o los derivados de fenilamidina
en agricultura u horticultura para controlar o prevenir la infestación de plantas, cultivos alimentarios recolectados,
semillas o materiales inertes por parte de microorganismos fitopatógenos, en particular hongos.

En el documento WO 00/46184 se describen ciertos compuestos de fenilamidina fungicidas.

Sorprendentemente, ahora se ha descubierto que determinados derivados de fenilamidina novedosos poseen
propiedades fungicidas favorables.

Por lo tanto, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I)



(I)

donde,

R¹ y R² se seleccionan cada uno independientemente de alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆; o
R¹ y R² junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un grupo cíclico saturado de tres a seis
miembros, que opcionalmente pueden contener un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;
R³ es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;
R⁴ es haloalquilo C₁-C₄;
R⁵ es cicloalquilo C₃-C₈ donde el cicloalquilo está sustituido con de 1 a 3 sustituyentes independientemente
seleccionados entre ciano, halógeno, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalcoxi C₃-C₆, alqueniiloxi C₃-C₆, alquiniiloxi
C₃-C₆, ariloxi, =N-OR⁹ o
R⁵ es cicloalquilo C₃-C₈ en donde el grupo cíclico contiene uno o dos átomos de oxígeno o azufre no contiguos o
donde uno de los miembros en el anillo representa SO o SO₂ o
R⁵ es alquiloalcoxi o
R⁵ es alquilo C₁-C₆ donde el alquilo está sustituido con 1 o 2 sustituyentes independientemente seleccionados
entre ciano, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ alquiloxi (C₁-C₆), haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ (donde el grupo
cicloalquilo opcionalmente contiene uno o dos átomos de oxígeno o azufre no contiguos o donde uno de los
miembros en el anillo opcionalmente representa SO o SO₂ y donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente
sustituido con de uno a cuatro grupos independientemente seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₆, alquiloxi
C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y/o un fenilo (donde el fenilo está él mismo opcionalmente sustituido con
halógeno)), cicloalquilo C₃-C₆ alquiloxi (C₁-C₆) (donde el grupo cicloalquilo opcionalmente contiene uno o dos
átomos de oxígeno o azufre no contiguos o donde uno de los miembros en el anillo opcionalmente representa SO
o SO₂ y donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con de uno a cuatro grupos independientemente
seleccionados entre halógeno, alquilo C₁-C₆, alquiloxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y/o un fenilo
(donde el fenilo está él mismo opcionalmente sustituido con halógeno)), benzociclopentaniloxi,
benzociclohexaniloxi, alqueniiloxi C₃-C₆, alquiniiloxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, cicloalquiltio C₃-C₆,
alquilsulfonilo C₁-C₄, arilsulfonilo (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶),
arilalquilsulfonilo (C₁-C₄) (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), ariltio (donde
el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), arilalquiltio (C₁-C₄) (donde el arilo está
opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), ariloxi (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de
uno a tres grupos R⁶), heteroariloxi (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con de uno a cuatro grupos
R⁶), Si(alquil C₁-C₄)₃alcoxi C₁-C₄, arilalquiloxi (C₁-C₄) (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a
tres grupos R⁶), heteroarilalquiloxi (C₁-C₄) (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres
grupos R⁶), =N-OR⁹, -O-N=C(R⁷)(R⁸), -O-(alquil C₁-C₆)-O-N=C(R⁷)(R⁸), -N(OR⁹)R¹⁰;
Cada R⁶ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-
C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄,

cicloalquiltio C₃-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₄, haloalquilsulfinilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, haloalqueniloxi C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquiniloxi C₂-C₆, arilo, ariloxi, heteroarilo heteroariloxi;

R⁷ y R⁸ se selecciona cada uno independientemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, arilo (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶) y cicloalquilo C₃-C₈ o

R⁷ y R⁸ junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un grupo cíclico saturado de cuatro a ocho miembros que opcionalmente puede contener un átomo de oxígeno o uno de azufre;

R⁹ es alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, arilalquilo (C₁-C₄) o cicloalquilo C₃-C₈ y

R¹⁰ es alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, arilalquilo (C₁-C₄), arilo o cicloalquilo C₃-C₈ o

R⁹ y R¹⁰ junto con el átomo de nitrógeno y oxígeno al cual están unidos forman un grupo cíclico saturado de cuatro a seis miembros y enantiómeros, sales o N-óxidos del mismo.

En un segundo aspecto, la presente invención proporciona una composición agroquímica que comprende un compuesto de fórmula (I).

Los compuestos de fórmula (I) se pueden usar para controlar microorganismos fitopatogénicos. Por lo tanto, con el fin de controlar un fitopatógeno, se puede aplicar un compuesto de fórmula (I), o una composición que comprende un compuesto de fórmula (I), de acuerdo con la invención directamente al fitopatógeno, o al emplazamiento del fitopatógeno, en particular a una planta susceptible de ser atacada por fitopatógenos.

Por lo tanto, un tercer aspecto de la presente invención proporciona el uso de un compuesto de fórmula (I), o una composición que comprende un compuesto de fórmula (I), tal como se describe en la presente para controlar un fitopatógeno.

En un aspecto adicional, la presente invención proporciona un método para controlar fitopatógenos, que comprende aplicar un compuesto de fórmula (I), o una composición que comprende un compuesto de fórmula (I), tal como se describe en la presente a dicho fitopatógeno, o al emplazamiento de dicho fitopatógeno, en particular a una planta susceptible de ser atacada por un fitopatógeno.

Los compuestos de fórmula (I) son especialmente eficaces para controlar hongos fitopatógenos.

Por lo tanto, en otro aspecto más, la presente invención proporciona el uso de un compuesto de fórmula (I), o una composición que comprende un compuesto de fórmula (I), tal como se describe en la presente para controlar hongos fitopatógenos.

En un aspecto adicional, la presente invención proporciona un método para controlar hongos fitopatógenos, que comprende aplicar un compuesto de fórmula (I), o una composición que comprende un compuesto de fórmula (I), tal como se describe en la presente a dichos hongos fitopatógenos, o al emplazamiento de dichos hongos fitopatógenos, en particular a una planta susceptible de ser atacada por hongos fitopatógenos.

Cuando se indique que los sustituyentes están opcionalmente sustituidos, esto quiere decir que pueden tener uno o más sustituyentes idénticos o diferentes, p. ej., de uno a tres sustituyentes, o que pueden no tenerlos. Normalmente, no habrá más de tres de estos sustituyentes opcionales presentes a la vez. Cuando se indique que un grupo está sustituido, p. ej., alquilo, esto incluirá aquellos grupos que formen parte de otros grupos, p. ej., el alquilo en alquiltio.

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

Los sustituyentes alquilo pueden ser de cadena lineal o ramificada. El alquilo, por sí mismo o como parte de otro sustituyente es, dependiendo del número de átomos de carbono mencionados, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-butilo, *n*-pentilo, *n*-hexilo y sus isómeros, por ejemplo, isopropilo, isobutilo, *sec*-butilo, *tert*-butilo o isoamilo.

Los sustituyentes alquenilo (ya sean solos o como parte de un grupo más grande, p. ej., alqueniloxi) pueden encontrarse en forma de cadenas lineales o ramificadas y los restos alquenilo, cuando proceda, pueden tener la configuración (*E*) o (*Z*). Algunos ejemplos son vinilo y alilo. Los grupos alquenilo son preferentemente grupos alquenilo C₂-C₆, más preferentemente C₂-C₄ y de la manera más preferida C₂-C₃.

Los sustituyentes alquinilo (ya sean solos o como parte de un grupo más grande, p. ej., alquiniloxi) pueden encontrarse en forma de cadenas lineales o ramificadas. Algunos ejemplos son etinilo y propargilo. Los grupos alquinilo son preferentemente grupos alquinilo C₂-C₆, más preferentemente C₂-C₄ y de la manera más preferida C₂-C₃.

Los grupos haloalquilo (solos o como parte de un grupo más grande, por ejemplo haloalquiloxi) pueden contener uno o más átomos de halógeno idénticos o diferentes y, por ejemplo, pueden representar CH₂Cl, CHCl₂, CCl₃, CH₂F, CHF₂, CF₃, CF₂Cl, CF₃CH₂, CH₃CF₂, CF₃CF₂ o CCl₃CCl₂.

Los grupos haloalquenilo (ya sean solos o como parte de un grupo más grande, p. ej., haloalqueniloxi) son grupos alquenilo, respectivamente, que están sustituidos con uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes y son, por

ejemplo, 2,2-difluorovinilo o 1,2-dicloro-2-fluorovinilo.

El término "alcoxi" se refiere a un radical $-OR$, donde R es alquilo, p. ej., como se ha definido anteriormente. Los grupos alcoxi incluyen, sin carácter limitante, metoxi, etoxi, 1-metiletoxi, propoxi, butoxi, 1-metilpropoxi y 2-metilpropoxi.

El término "ciano" se refiere a un grupo $-CN$.

Nitro se refiere a un grupo $-NO_2$.

El término "amino" se refiere a un grupo $-NH_2$.

El término "hidroxilo" o "hidroxi" se refiere a un grupo $-OH$.

Cicloalquilo puede estar saturado o parcialmente insaturado, preferentemente completamente saturado y es, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo o ciclohexenilo.

Los grupos arilo (ya sean solos o como parte de un grupo más grande tal como, p. ej., ariloxi, arilalquilo) son sistemas anulares aromáticos que pueden estar en forma mono-, bi- o tricíclica. Los ejemplos de estos anillos incluyen fenilo, naftilo, antraceno, indeno o fenantreno. Los grupos arilo preferidos son fenilo y naftilo, siendo el fenilo el más preferido. Cuando se indique que un resto arilo está sustituido, el resto arilo estará sustituido preferentemente con de uno a cuatro sustituyentes y de la manera más preferida con de uno a tres sustituyentes.

Los grupos heteroarilo (ya sean solos o como parte de un grupo más grande tal como, p. ej., heteroariloxi, heteroarilalquilo) son sistemas anulares aromáticos que contienen al menos un heteroátomo y que están constituidos por un único anillo, o por dos o más anillos condensados. Preferentemente, los anillos únicos contendrán hasta un máximo de tres heteroátomos y los sistemas bicíclicos hasta un máximo de cuatro heteroátomos, los cuales se seleccionarán preferentemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre. Los ejemplos de grupos monocíclicos incluyen piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo (p. ej., [1,2,4]triazolilo), furanilo, tiofenilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiazolilo, isotiazolilo y tiadiazolilo. Los ejemplos de grupos bicíclicos incluyen purinilo, quinolinilo, cinolinilo, quinoxalinilo, indolilo, indazolilo, bencimidazolilo, benzotiofenilo y benzotiazolilo. Se prefieren los grupos heteroarilo monocíclicos, siendo el piridilo el más preferido. Cuando se indique que un resto heteroarilo está sustituido, el resto heteroarilo estará sustituido preferentemente con de uno a cuatro sustituyentes y de la manera más preferida con de uno a tres sustituyentes.

Los grupos heterociclilo o anillos heterocíclicos (ya sean solos o como parte de un grupo más grande tal como heterociclilalquilo) son estructuras anulares no aromáticas que contienen hasta un máximo de 10 átomos, incluidos uno o más (preferentemente uno, dos o tres) heteroátomos seleccionados entre O, S y N. Los ejemplos de grupos monocíclicos incluyen oxetanilo, 4,5-dihidroisoxazolilo, tetrahydrofuranilo, [1,3]dioxolanilo, piperidinilo, piperazinilo, [1,4]dioxanilo, imidazolidinilo, [1,3,5]oxadiazinanilo, hexahidropirimidinilo, [1,3,5]triazinanilo y morfolinilo o sus versiones oxidadas, tales como 1-oxotietanilo y 1,1-dioxotietanilo. Los ejemplos de grupos bicíclicos incluyen 2,3-dihidrobenzofuranilo, benzo[1,4]dioxolanilo, benzo[1,3]dioxolanilo, cromenilo y 2,3-dihidrobenzo[1,4]dioxinilo. Cuando se indique que un resto heterociclilo está sustituido, el resto heterociclilo estará sustituido preferentemente con de uno a cuatro sustituyentes, de la manera más preferida con de uno a tres sustituyentes.

Los sustituyentes cicloalquilo pueden estar saturados o parcialmente insaturados, preferentemente totalmente saturados y son, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

La presencia de uno o más átomos de carbono asimétricos posibles en un compuesto de fórmula (I) quiere decir que los compuestos pueden existir en formas ópticamente isoméricas, es decir, formas enantioméricas o diastereoméricas. También pueden existir atropisómeros como resultado de la rotación restringida alrededor de un enlace sencillo. Se pretende que la fórmula (I) incluya todas estas formas isoméricas posibles y sus mezclas. La presente invención incluye todas aquellas formas isoméricas posibles y sus mezclas para un compuesto de fórmula (I). Igualmente, se pretende que la fórmula (I) incluya todos los tautómeros posibles. La presente invención incluye todas las posibles formas tautoméricas para un compuesto de fórmula (I).

En cada caso, los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención se encuentran en forma libre, en forma oxidada en forma de un N-óxido o en forma de sal, por ejemplo, una forma de sal útil desde el punto de vista agrícola.

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

Los valores preferidos de R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} son, en cualquier combinación de los mismos, como se expone a continuación:

Preferentemente, R¹ y R² se selecciona cada uno independientemente entre alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆.

Más preferentemente, R¹ y R² se seleccionan cada uno independientemente de metilo, etilo, propilo o isopropilo.

5 Incluso más preferentemente, R¹ es metilo o etilo.

Incluso más preferentemente R² es metilo, etilo, propilo o isopropilo.

Lo más preferentemente, R¹ es metilo o etilo y R² es etilo, propilo o isopropilo.

10 Preferentemente, R³ es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ O cicloalquilo C₃-C₆.

Más preferentemente, R³ es hidrógeno, fluoro, metilo, etilo o ciclopropilo.

15 Aún más preferentemente, R³ es hidrógeno, metilo o etilo.

De la manera más preferida, R³ es hidrógeno o metilo (especialmente el más preferido es metilo).

Preferentemente, R⁴ es haloalquilo C₁-C₃.

20 Más preferentemente, R⁴ es trifluorometilo, pentafluoroetilo o clorodifluorometilo.

De la manera más preferida, R⁴ es trifluorometilo o clorodifluorometilo (especialmente el más preferido es trifluorometilo).

25 Preferentemente, R⁵ es cicloalquilo C₃-C₈ donde el cicloalquilo está sustituido con de 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, halógeno, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquioxo C₃-C₆, alquenoiloxi C₃-C₆, alquinoiloxi C₃-C₆, feniloxi, =N-OR⁹ o

30 R⁵ es alquilo C₁-C₆ alquilo en donde le alquilo está sustituido con 1 o 2 sustituyentes independientemente seleccionados entre ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquiloiloxi C₃-C₆, alquenoiloxi C₃-C₆, alquinoiloxi C₃-C₆, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), piridiniloxi (donde el piridinilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), Si(alquil C₁-C₄)₃alcoxi C₁-C₄, fenilalquiloiloxi (C₁-C₄) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), =N-OR⁹, -O-N=C(R⁷)(R⁸), -N(OR⁹)R¹⁰.

35 Más preferentemente R⁵ es cicloalquilo C₄-C₆ donde el cicloalquilo está sustituido con 1 o 2 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, fluoro, cloro, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-C₆, alquenoiloxi C₃-C₄, alquinoiloxi C₃-C₄, feniloxi, =N-OR⁹ o

40 R⁵ es alquilo C₁-C₃ donde el alquilo está sustituido con de 1 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados de alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₂, cicloalquiloiloxi C₃-C₆, alquenoiloxi C₃-C₄, alquinoiloxi C₃-C₄, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), fenilalquiloiloxi (C₁-C₂) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), =N-OR⁹, -O-N=C(R⁷)(R⁸).

Aún más preferentemente R⁵ es cicloalquilo C₄-C₆ donde el cicloalquilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de fluoro, cloro, metoxi, etoxi, ciclopropoxi, aliloxi, propargiloxi, =N-OR⁹ o

45 R⁵ es alquilo C₁-C₃ donde el alquilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de alcoxi C₁-C₄, trifluorometoxi, difluorometoxi, cicloalquiloiloxi C₃-C₆, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), benciloxi (donde el fenilo del grupo bencilo está opcionalmente sustituido con un grupo R⁶) y =N-OR⁹.

Más preferentemente todavía, R⁵ es ciclobutilo o ciclohexilo donde el ciclobutilo o el ciclohexilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de metoxi, etoxi, ciclopropoxi, aliloxi, propargiloxi o =N-OR⁹ o R⁵ es metilo, etilo, propilo o isopropilo, donde el metilo, etilo, propilo o isopropilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de alcoxi C₁-C₄, cicloalquiloiloxi C₃-C₆, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶) y benciloxi (donde el fenilo del grupo bencilo está opcionalmente sustituido con un grupo R⁶).

50 De la forma más preferida, R⁵ es metilo, donde el grupo metilo está sustituido con metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi, *terc*-butoxi, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi o benciloxi (donde el fenilo del grupo bencilo está opcionalmente sustituido con R⁶) o R⁵ es etilo, donde el grupo etilo está sustituido con metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi, *terc*-butoxi o feniloxi (preferentemente feniloxi, donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con R⁶) y R⁶ es fluoro, cloro o metilo (preferentemente fluoro).

60 Preferentemente cada R⁶ se selecciona independientemente de fluoro, cloro, ciano, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₂, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalquiloiloxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₃, haloalquiltio C₁-C₃, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₃, haloalquilsulfonilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, haloalquilsulfonilo C₁-C₃, alquilcarbonilo C₁-C₃, alquenoil C₂-C₄, haloalquenoil C₂-C₄, alquenoiloxi C₂-C₄, haloalquenoiloxi C₂-C₄, alquinoil C₂-C₄, cicloalquil C₃-C₆, alquinoil C₂-C₄, alquinoiloxi C₂-C₄, fenilo, feniloxi.

65

Más preferentemente cada R⁶ se selecciona independientemente de fluoro, cloro, metilo, etilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, ciclopropilo, metiltio, trifluorometiltio, metilsulfonilo y etinilo.

Aún más preferentemente cada R⁶ se selecciona independientemente de fluoro, cloro, metilo, trifluorometoxi, difluorometoxi, ciclopropilo y metiltio.

De la forma más preferida cada R⁶ se selecciona independientemente de fluoro, cloro y metilo.

Preferentemente R⁷ y R⁸ se selecciona cada uno independientemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, fenilo (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶) y cicloalquilo C₃-C₈ o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un grupo cíclico saturado de cuatro a seis miembros el cual opcionalmente puede contener uno átomo de oxígeno o uno de azufre.

De la forma más preferida R⁷ se selecciona de alquilo C₁-C₄, fenilo (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶) y cicloalquilo C₃-C₈ y R⁸ es alquilo C₁-C₄ o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un grupo cíclico saturado de cuatro a seis miembros.

Preferentemente R⁹ es alquilo C₁-C₆, o fenilalquilo (C₁-C₄) o R⁹ y R¹⁰ junto con los átomos de nitrógeno y oxígeno a los que están unidos forman un grupo cíclico saturado de cinco a seis miembros.

Más preferentemente R⁹ es alquilo C₁-C₄ o fenilalquilo (C₁-C₂).

De la forma más preferida R⁹ es alquilo C₁-C₄ o bencilo.

De la forma más preferida R¹⁰ es alquilo C₁-C₆, fenilalquilo (C₁-C₄), fenilo o cicloalquilo C₃-C₆.

Un grupo de compuestos de acuerdo con la invención son aquellos de fórmula (IA) que son compuestos de fórmula (I) donde R¹, R², R³, R⁴, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se ha definido para los compuestos de fórmula (I) anteriores y R⁵ es cicloalquilo C₃-C₈ donde el cicloalquilo está sustituido con de 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, halógeno, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆, alqueniloxi C₃-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, ariloxi, =N-OR⁹ o un enantiómero, sal o N-óxido del mismo.

En los compuestos de fórmula (IA) R⁵ es preferentemente cicloalquilo C₃-C₈ donde el cicloalquilo está sustituido con de 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, halógeno, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆, alqueniloxi C₃-C₆, C₃-C₆ alquiniloxi, feniloxi, =N-OR⁹. Más preferentemente R⁵ es cicloalquilo C₄-C₆ donde el cicloalquilo está sustituido con 1 o 2 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, fluoro, cloro, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-C₆, alqueniloxi C₃-C₄, alquiniloxi C₃-C₄, feniloxi, =N-OR⁹. Aún más preferentemente R⁵ es cicloalquilo C₄-C₆ donde el cicloalquilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de fluoro, cloro, metoxi, etoxi, ciclopropoxi, aliloxi, propargiloxi, =N-OR⁹ y de la forma más preferida R⁵ es ciclobutilo o ciclohexilo donde el ciclobutilo o ciclohexilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de metoxi, etoxi, ciclopropoxi, aliloxi, propargiloxi o =N-OR⁹. Las definiciones preferidas de R¹, R², R³, R⁴, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se ha definido para los compuestos de fórmula (I).

Otro grupo de compuestos de acuerdo con la invención son aquellos de fórmula (IB) que son compuestos de fórmula (I) donde R¹, R², R³, R⁴, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se ha definido para los compuestos de fórmula (I) anteriores y R⁵ es alquilo C₁-C₆ donde el alquilo está sustituido con 1 o 2 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ alquiloxi (C₁-C₆), haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆ (donde el grupo cicloalquilo opcionalmente contiene uno o dos átomos de oxígeno o azufre no contiguos o donde uno de los miembros en el anillo opcionalmente representa SO o SO₂ y donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con de uno a cuatro grupos independientemente seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₆, alquiloxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y/o un fenilo (donde el fenilo está él mismo opcionalmente sustituido con halógeno)), cicloalquilo C₃-C₆ alquiloxi (C₁-C₆) (donde el grupo cicloalquilo opcionalmente contiene uno o dos átomos de oxígeno o azufre no contiguos o donde uno de los miembros en el anillo opcionalmente representa SO o SO₂ y donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con de uno a cuatro grupos independientemente seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₆, alquiloxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y/o un fenilo (donde el fenilo está él mismo opcionalmente sustituido con halógeno)), benzociclopentaniloxi, benzociclohexaniloxi, alqueniloxi C₃-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, alquiloxi C₁-C₄, haloalquiloxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₄, arilsulfonilo (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), arilalquilsulfonilo (C₁-C₄) (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), ariltio (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), arilalquiloxi (C₁-C₄) (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), ariloxi (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), heteroariloxi (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con de uno a cuatro R⁶), Si(alquil C₁-C₄)₃alcoxi C₁-C₄, arilalquiloxi (C₁-C₄) (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), heteroarilalquiloxi (C₁-C₄) (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), =N-OR⁹, -O-N=C(R⁷)(R⁸), -O-(alquil C₁-C₆)-O-N=C(R⁷)(R⁸), -N(OR⁹)R¹⁰.

En los compuestos de fórmula (IB) R⁵ es preferentemente R⁵ es alquilo C₁-C₆ donde el alquilo está sustituido con de

1 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆, alquenoiloxi C₃-C₆, alquinoiloxi C₃-C₆, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), piridiniloxi (donde el piridinilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), Si(alquil C₁-C₄)₃alcoxi C₁-C₄, fenilalquiloxi (C₁-C₄) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), =N-OR⁹, -O-N=C(R⁷)(R⁸), -N(OR⁹)R¹⁰. Más preferentemente R⁵ es alquilo C₁-C₃ donde el alquilo está sustituido con de 1 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados de alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₂, cicloalquiloxi C₃-C₆, alquenoiloxi C₃-C₄, alquinoiloxi C₃-C₄, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), fenilalquiloxi (C₁-C₂) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), =N-OR⁹, -O-N=C(R⁷)(R⁸). Aún más preferentemente R⁵ es alquilo C₁-C₃ donde el alquilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de alcoxi C₁-C₄, trifluorometoxi, difluorometoxi, cicloalquiloxi C₃-C₆, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), benciloxi (donde el fenilo del grupo bencilo está opcionalmente sustituido con un grupo R⁶) y =N-OR⁹. Aún más preferentemente R⁵ es metilo, etilo, propilo o isopropilo, donde el metilo, etilo, propilo o isopropilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de alcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶) y benciloxi (donde el fenilo del grupo bencilo está opcionalmente sustituido con un grupo R⁶) y de la forma más preferida R⁵ es metilo, donde el grupo metilo está sustituido con metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi, terc-butoxi, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi o benciloxi (donde el fenilo del grupo bencilo está opcionalmente sustituido con R⁶); o R⁵ es etilo, donde el grupo etilo está sustituido con metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi, terc-butoxi o feniloxi (preferentemente feniloxi, donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con R⁶); y R⁶ es fluoro, cloro o metilo (preferentemente fluoro). Las definiciones preferidas de R¹, R², R³, R⁴, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se ha definido para los compuestos de fórmula (I).

Otro grupo de compuestos de acuerdo con la invención son aquellos de fórmula (IC) que son compuestos de fórmula (I) donde R¹, R², R³, R⁴, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se ha definido para los compuestos de fórmula (I) anteriores y R⁵ es cicloalquilo C₃-C₈ donde el grupo cíclico contiene uno o dos átomos de oxígeno o azufre no contiguos o donde uno de los miembros en el anillo representa SO o SO₂. Las definiciones preferidas de R¹, R², R³, R⁴, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se ha definido para los compuestos de fórmula (I).

Otro grupo de compuestos de acuerdo con la invención son aquellos de fórmula (ID) que son compuestos de fórmula (I) donde R¹, R², R³, R⁴, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se ha definido para los compuestos de fórmula (I) anteriores y R⁵ es alquiloicarbonilo C₁-C₆. Las definiciones preferidas de R¹, R², R³, R⁴, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se ha definido para los compuestos de fórmula (I).

Un grupo preferido de compuestos de acuerdo con la invención son aquellos de fórmula (I-1) que son compuestos de fórmula (I) donde R¹ y R² se selecciona cada uno independientemente alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆; R³ es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆; R⁴ es haloalquilo C₁-C₄; R⁵ es cicloalquilo C₃-C₈ donde el cicloalquilo está sustituido con de 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, halógeno, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆, alquenoiloxi C₃-C₆, alquinoiloxi C₃-C₆, feniloxi, =N-OR⁹ o R⁵ es alquilo C₁-C₆ donde el alquilo está sustituido con de 1 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆, alquenoiloxi C₃-C₆, alquinoiloxi C₃-C₆, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), piridiniloxi (donde el piridinilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), Si(alquil C₁-C₄)₃alcoxi C₁-C₄, fenilalquiloxi (C₁-C₄) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), =N-OR⁹, -O-N=C(R⁷)(R⁸), -N(OR⁹)R¹⁰; cada R⁶ se selecciona independientemente de fluoro, cloro, ciano, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₂, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalquiloxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₃, haloalquiltio C₁-C₃, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₃, haloalquilsulfonilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, haloalquilsulfonilo C₁-C₃, alquilarbonilo C₁-C₃, alquenoiloxi C₂-C₄, haloalquenoiloxi C₂-C₄, alquenoiloxi C₂-C₄, haloalquenoiloxi C₂-C₄, alquinoiloxi C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆alquinoiloxi C₂-C₄, alquinoiloxi C₂-C₄, fenilo, feniloxi; R⁷ y R⁸ se selecciona cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₄, fenilo (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶) y cicloalquilo C₃-C₈ o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un grupo cíclico saturado de cuatro a seis miembros el cual opcionalmente puede contener uno átomo de oxígeno o uno de azufre; R⁹ es alquilo C₁-C₆ o fenilalquilo (C₁-C₄) y R¹⁰ es alquilo C₁-C₆, fenilalquilo (C₁-C₄), fenilo o cicloalquilo C₃-C₆ o R⁹ y R¹⁰ junto con el átomo de nitrógeno y de oxígeno al cual están unidos forman un grupo cíclico saturado de cinco a seis miembros o un enantiómero, sal o N-óxido del mismo.

Un grupo preferido más de compuestos de acuerdo con la invención son aquellos de fórmula (I-2) que son compuestos de fórmula (I) donde R¹ y R² se selecciona cada uno independientemente metilo, etilo, propilo o isopropilo; R³ es hidrógeno, fluoro, metilo, etilo o ciclopropilo; R⁴ es trifluorometilo, pentafluoroetilo o clorodifluorometilo; R⁵ es cicloalquilo C₄-C₆ donde el cicloalquilo está sustituido con 1 o 2 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, fluoro, cloro, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-C₆, alquenoiloxi C₃-C₄, alquinoiloxi C₃-C₄, feniloxi, =N-OR⁹ o R⁵ es alquilo C₁-C₃ donde el alquilo está sustituido con de 1 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados de alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₂, cicloalquiloxi C₃-C₆, alquenoiloxi C₃-C₄, alquinoiloxi C₃-C₄, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), fenilalquiloxi (C₁-C₂) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), =N-OR⁹, -O-N=C(R⁷)(R⁸); cada R⁶ se selecciona independientemente de fluoro, cloro, metilo, etilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, ciclopropilo, metiltio, trifluorometiltio, metilsulfonilo, y etinilo; R⁷ se selecciona de alquilo C₁-C₄, fenilo (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶) y

cicloalquilo C₃-C₈; R⁸ es alquilo C₁-C₄ o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un grupo cíclico saturado de cuatro a seis miembros; y R⁹ es alquilo C₁-C₄ o fenilalquilo (C₁-C₂) o un enantiómero, sal o N-óxido del mismo.

5 Un grupo preferido más de compuestos de acuerdo con la invención son aquellos de fórmula (I-3) que son compuestos de fórmula (I) donde R¹ es metilo o etilo; R² es metilo, etilo, propilo o isopropilo; R³ es hidrógeno, metilo o etilo; R⁴ es trifluorometilo o clorodifluorometilo; R⁵ es cicloalquilo C₄-C₆ donde el cicloalquilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de fluoro, cloro, metoxi, etoxi, ciclopropoxi, aliloxi, propargiloxi, =N-OR⁹ o R⁵ es alquilo C₁-C₃ donde el alquilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de alcoxi C₁-C₄, trifluorometoxi, difluorometoxi, cicloalquiloxi C₃-C₆, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), benciloxi (donde el fenilo del grupo bencilo está opcionalmente sustituido con un grupo R⁶) y =N-OR⁹; cada R⁶ se selecciona independientemente de fluoro, cloro, metilo, trifluorometoxi, difluorometoxi, ciclopropilo y metilitio y R⁹ es alquilo C₁-C₄ o bencilo o un enantiómero, sal o N-óxido del mismo.

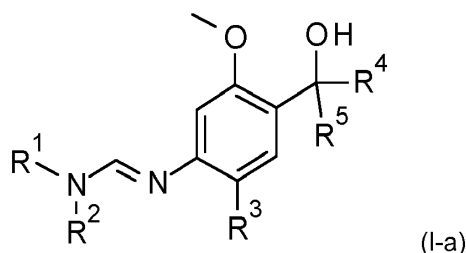
15 Un grupo preferido más de compuestos de acuerdo con la invención son aquellos de fórmula (1-4) que son compuestos de fórmula (I) donde R¹ es metilo o etilo; R² es etilo, propilo o isopropilo; R³ es hidrógeno o metilo; R⁴ es trifluorometilo o clorodifluorometilo; R⁵ es ciclobutilo o ciclohexilo donde el ciclobutilo o ciclohexilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de metoxi, etoxi, ciclopropoxi, aliloxi, propargiloxi, =N-OR⁹ o R⁵ es metilo, etilo, propilo o isopropilo, donde el metilo, etilo, propilo o isopropilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de alcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶) y benciloxi (donde el fenilo del grupo bencilo está opcionalmente sustituido con un grupo R⁶); cada R⁶ se selecciona independientemente de fluoro, cloro y metilo y R⁹ es alquilo C₁-C₄ o bencilo o un enantiómero, sal o N-óxido del mismo.

25 Un grupo preferido más de compuestos de acuerdo con la invención son aquellos de fórmula (I-5) que son compuestos de fórmula (I) donde R¹ es metilo o etilo; R² es etilo, propilo o isopropilo; R³ es hidrógeno o metilo (preferentemente metilo); R⁴ es trifluorometilo o clorodifluorometilo (preferentemente trifluorometilo); R⁵ es metilo, donde el grupo metilo está sustituido con metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi, *tert*-butoxi, ciclopropiloxi, ciclobutiloxi, ciclopentiloxi, ciclohexiloxi o benciloxi (donde el fenilo del grupo bencilo está opcionalmente sustituido con R⁶) o R⁵ es etilo, donde el grupo etilo está sustituido con metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, sec-butoxi, *tert*-butoxi o feniloxi (preferentemente feniloxi, donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con R⁶); y R⁶ es fluoro, cloro o metilo (preferentemente fluoro) o un enantiómero, sal o N-óxido del mismo.

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden presentar varios beneficios que incluyen, entre otros, unos niveles favorables de actividad biológica para proteger las plantas contra enfermedades que están provocadas por hongos o unas propiedades idóneas para su uso como principios activos agroquímicos (por ejemplo, una actividad biológica mayor, un espectro de actividad favorable, un perfil de seguridad más amplio, unas propiedades fisicoquímicas mejoradas o una mayor biodegradabilidad).

Ejemplos específicos de compuestos de fórmula (I) se ilustran en las Tablas 1 a 20 más adelante.

40 Cada una de las Tablas 1 a 20, que siguen a la Tabla P más adelante, hacen disponibles 48 compuestos de la fórmula(I-a)

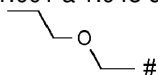


45 donde R¹, R², R³ y R⁴ son como se ha definido en la Tabla P y R⁵ es como se ha definido en las Tablas 1 a 20, respectivamente.

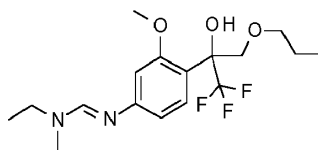
Por tanto, la Tabla 1 individualiza 48 compuestos de fórmula (I-a), donde para cada fila de la Tabla P, R⁵ es como se ha definido en la Tabla 1; de forma similar, la Tabla 2 individualiza 48 compuestos de fórmula (I-a), donde para cada fila de la Tabla P, R⁵ es como se ha definido en la Tabla 2; y así sucesivamente para las Tablas 3 a 20.

Tabla P

N.º de compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴
P.001	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	CF ₃
P.002	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	CF ₃
P.003	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	CF ₃
P.004	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	CF ₃
P.005	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	CF ₃
P.006	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂		H	CF ₃
P.007	CH ₃	CH ₂ CH ₃	F	CF ₃
P.008	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	F	CF ₃
P.009	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	F	CF ₃
P.010	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	F	CF ₃
P.011	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	F	CF ₃
P.012	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂		F	CF ₃
P.013	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃
P.014	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	CF ₃
P.015	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	Cl	CF ₃
P.016	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₃
P.017	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	CF ₃
P.018	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂		Cl	CF ₃
P.019	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃
P.020	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CF ₃
P.021	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃
P.022	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₃
P.023	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CF ₃
P.024	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂		CH ₃	CF ₃
P.025	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	CF ₂ Cl
P.026	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	CF ₂ Cl
P.027	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	H	CF ₂ Cl
P.028	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	CF ₂ Cl
P.029	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	H	CF ₂ Cl
P.030	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂		H	CF ₂ Cl
P.031	CH ₃	CH ₂ CH ₃	F	CF ₂ Cl
P.032	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	F	CF ₂ Cl
P.033	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	F	CF ₂ Cl
P.034	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	F	CF ₂ Cl
P.035	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	F	CF ₂ Cl
P.036	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂		F	CF ₂ Cl
P.037	CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ Cl
P.038	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	CF ₂ Cl
P.039	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ Cl
P.040	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Cl	CF ₂ Cl
P.041	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	Cl	CF ₂ Cl
P.042	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂		Cl	CF ₂ Cl
P.043	CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ Cl
P.044	CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CF ₂ Cl
P.045	CH ₃	(CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ Cl
P.046	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CF ₂ Cl
P.047	CH ₂ CH ₃	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	CF ₂ Cl
P.048	CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂		CH ₃	CF ₂ Cl

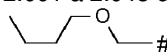
Tabla 1: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 1.001 a 1.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es

donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P. Por ejemplo, el compuesto 1.001 tiene la estructura siguiente:



5

Tabla 2: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 2.001 a 2.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



10

donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P. Por ejemplo, el compuesto 2.021 tiene la estructura siguiente:

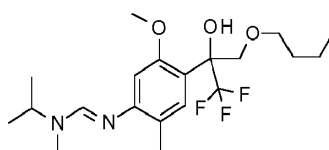
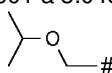


Tabla 3: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 3.001 a 3.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es

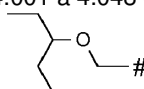


15

donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

20

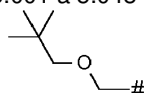
Tabla 4: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 4.001 a 4.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

25

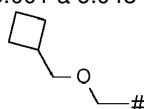
Tabla 5: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 5.001 a 5.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



30

donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables, R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

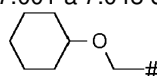
Tabla 6: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 6.001 a 6.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



35

donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

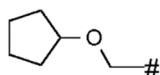
Tabla 7: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 7.001 a 7.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



40

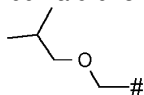
donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Tabla 8: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 8.001 a 8.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



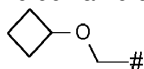
donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables, R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Tabla 9: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 9.001 a 9.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



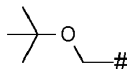
donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Tabla 10: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 10.001 a 10.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



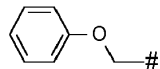
donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Tabla 11: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 11.001 a 11.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



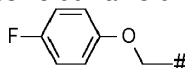
donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Tabla 12: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 12.001 a 11.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



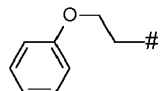
donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Tabla 13: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 13.001 a 13.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



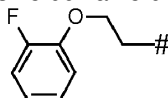
donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Tabla 14: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 14.001 a 14.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



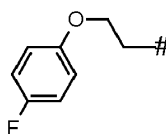
donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Tabla 15: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 15.001 a 15.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



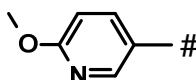
donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R⁵ al resto de la molécula y en el que las variables R¹, R², R³ y R⁴ tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Tabla 16: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 16.001 a 16.048 de la fórmula I-a, donde R⁵ es



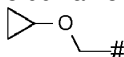
donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R^5 al resto de la molécula y en el que las variables R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Tabla 17: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 17.001 a 17.048 de la fórmula I-a, donde R^5 es



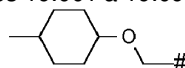
donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R^5 al resto de la molécula y en el que las variables R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Tabla 18: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 18.001 a 18.048 de la fórmula I-a, donde R^5 es



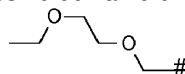
donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R^5 al resto de la molécula y en el que las variables R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Tabla 19: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 19.001 a 19.098 de la fórmula I-a, donde R^5 es



donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R^5 al resto de la molécula y en el que las variables R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Tabla 20: En esta tabla se divulgan 48 compuestos 20.001 a 20.048 de la fórmula I-a, donde R^5 es

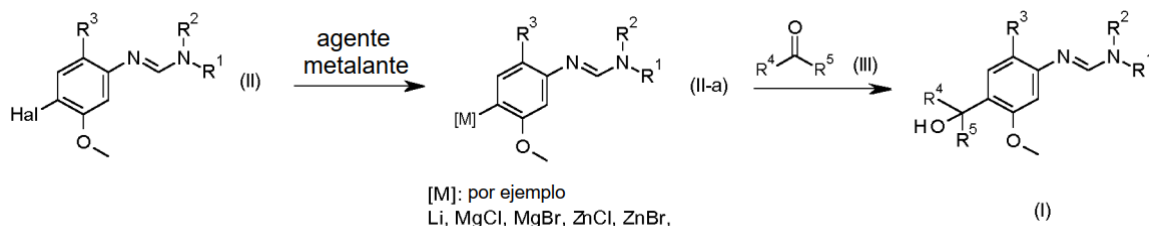


donde la marca almohadilla indica el punto de unión de R^5 al resto de la molécula y en el que las variables R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen el significado específico dado en la línea correspondiente de la Tabla P.

Los compuestos de la presente invención se pueden preparar como se muestra en los siguientes esquemas, en los que, a menos que se indique lo contrario, la definición de cada variable es tal como se definió anteriormente para un compuesto de fórmula (I).

Los compuestos de fórmula (I), donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 son como se ha definido para la fórmula (I), se pueden obtener mediante tratamiento de los compuestos de fórmula (II), donde R^1 , R^2 y R^3 son como se ha definido para la fórmula (I) y Hal es halógeno, preferentemente bromo o yodo, con un agente metalante tal como n-butil litio, magnesio, cinc o cloruro de i-propil magnesio-LiCl para generar un intermedio organometálico (II-a) el cual después se hace reaccionar con un compuesto de carbonilo de fórmula (III), donde R^4 y R^5 son como se ha definido para la fórmula (I). Esto se muestra en el Esquema 1 a continuación, los ejemplos y las condiciones representativas se describen en Chem. Commun. **2015**, 51, 6884, Angew. Chem. Int. ed. **2006**, 45, 6040 o March's Advanced Organic Chemistry, Smith, 7ª edición, Wiley, **2013**.

Esquema 1



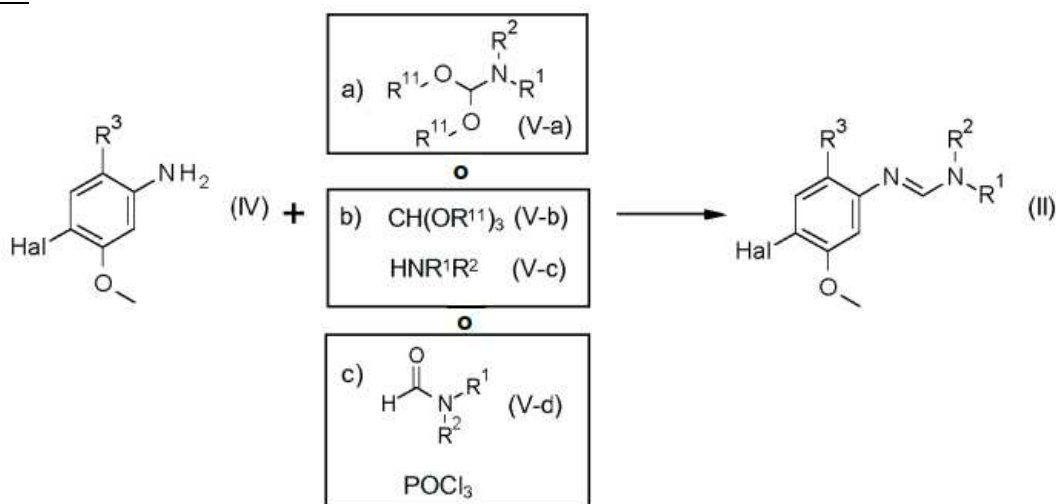
Los compuestos de fórmula (II), donde R^1 , R^2 y R^3 son como se ha definido para la fórmula (I) y Hal es halógeno, preferentemente bromo o yodo, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula (IV), donde R^3 es como se ha definido para la fórmula (I) y Hal es halógeno preferentemente bromo o yodo, mediante diversos

métodos conocidos entre los cuales los usos más extendidos son los siguientes:

- Tratamiento con un compuesto de fórmula (V-a), donde R^1 y R^2 son como se ha definido para la fórmula (I) y R^{11} es alquilo C_1-C_4 , en un disolvente inerte tal como tolueno a temperaturas de entre 0°C y 100°C .
- Tratamiento con un ortoéster de fórmula (V-b) donde R^{11} es alquilo C_1-C_4 , seguido de tratamiento con una amina de fórmula (V-c) en un disolvente orgánico tal como metanol a temperaturas de entre 20°C y 100°C .
- Tratamiento con una formamida de fórmula (V-d) donde R^1 y R^2 son como se ha definido para la fórmula (I) y un agente de activación tal como POCl_3 en un disolvente inerte tal como diclorometano a temperaturas de entre -20°C y 40°C .

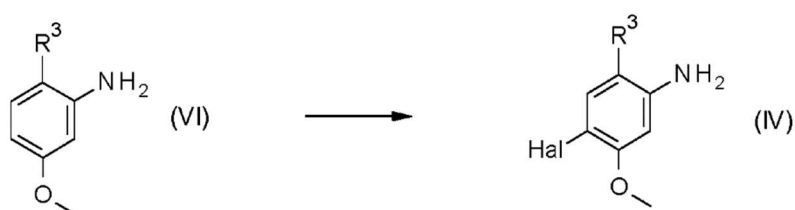
Esto se muestra en el Esquema 2 a continuación.

Esquema 2



Los compuestos de fórmula (IV), donde R^3 se ha definido para la fórmula (I) y Hal es halógeno, preferentemente bromo o yodo, se pueden obtener mediante halogenación de un compuesto de fórmula (VI), donde R^3 es como se ha definido para la fórmula (I) con un agente de reacción tal como bromo, N-bromosuccinimida o N-yodosuccinimida en un disolvente inerte tal como diclorometano a temperaturas de entre -40°C y 40°C . Esto se muestra en el Esquema 3 a continuación.

Esquema 3



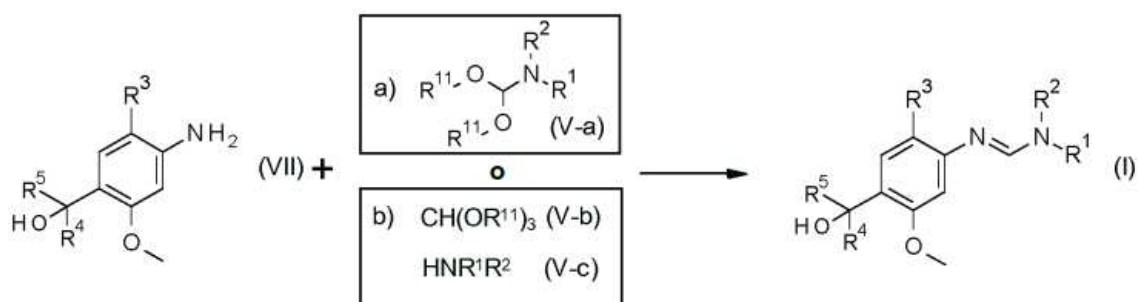
La síntesis de las anilinas de fórmula (VI) donde R^3 es como se ha definido para la Fórmula (I), mediante reducción de los compuestos nitro correspondientes es trivial para un experto en la técnica.

De manera alternativa los compuestos de Fórmula (I), donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 son como se ha definido para la fórmula (I), se pueden obtener mediante transformación de los compuestos de fórmula (VII), donde R^3 , R^4 y R^5 son como se ha definido para la fórmula (I), mediante diversos métodos conocidos, entre los cuales los usos más extendidos son los siguientes:

- Tratamiento con un compuesto de fórmula (V-a), donde R^1 y R^2 son como se ha definido para la fórmula (I), y R^{11} es alquilo C_1-C_4 , en un disolvente inerte tal como tolueno a temperaturas de entre 0°C y 100°C .
- Tratamiento con un ortoéster de fórmula (V-b) donde R^{11} es alquilo C_1-C_4 , seguido de tratamiento con una amina de fórmula (V-c) en un disolvente orgánico tal como metanol a temperaturas entre de 20°C y 100°C .

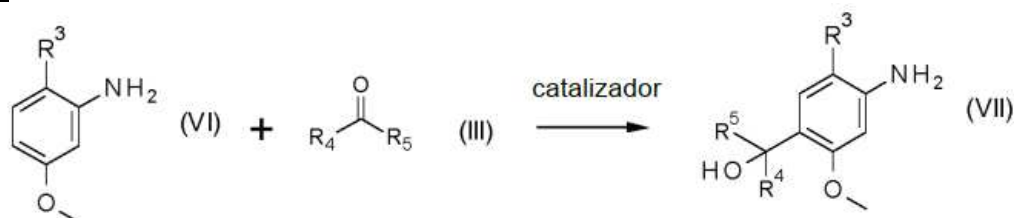
Esto se muestra en el Esquema 4 a continuación.

Esquema 4



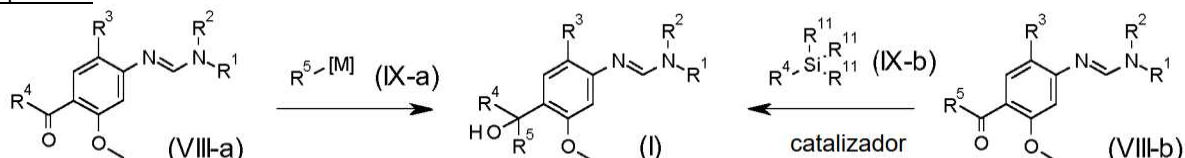
Los compuestos de fórmula (VII), donde R^3 , R^4 y R^5 son como se ha definido para la fórmula (I), se pueden obtener mediante tratamiento de un compuesto de fórmula (VI), donde R^3 es como se ha definido para la fórmula (I) con un compuesto de fórmula (III) donde R^4 y R^5 son como se ha definido para la fórmula (I), en condiciones ácidas en un disolvente inerte a temperaturas de entre 40 °C y 200 °C. Esto se muestra en el Esquema 5 a continuación.

Esquema 5



Como alternativa los compuestos de fórmula (I), donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 son como se ha definido para la fórmula (I), se pueden obtener mediante tratamiento de los compuestos de fórmula (VIII-a) o los compuestos de fórmula (VIII-b), con un reactivo organometálico de fórmula (IX-a), donde [M] puede ser una sal de magnesio, cinc o litio entre otras sales de metales adecuadas para la adición a compuestos de carbonilo o (IX-b), donde R^{11} es alquilo C_1 - C_4 , respectivamente. Ciertas especies de reactivos organometálicos con base de cinc de fórmula (IX-a) pueden requerir la adición de un ácido de Lewis tal como $Ti(OiPr)_4$ para añadirlos de forma eficaz a las especies de carbonilo. Los reactivos de fórmula (IX-b) pueden requerir la adición de un catalizador nucleófilo tal como fluoruro de cesio para añadirlos de forma eficaz a las especies de carbonilo. Esto se muestra en el Esquema 6.

Esquema 6

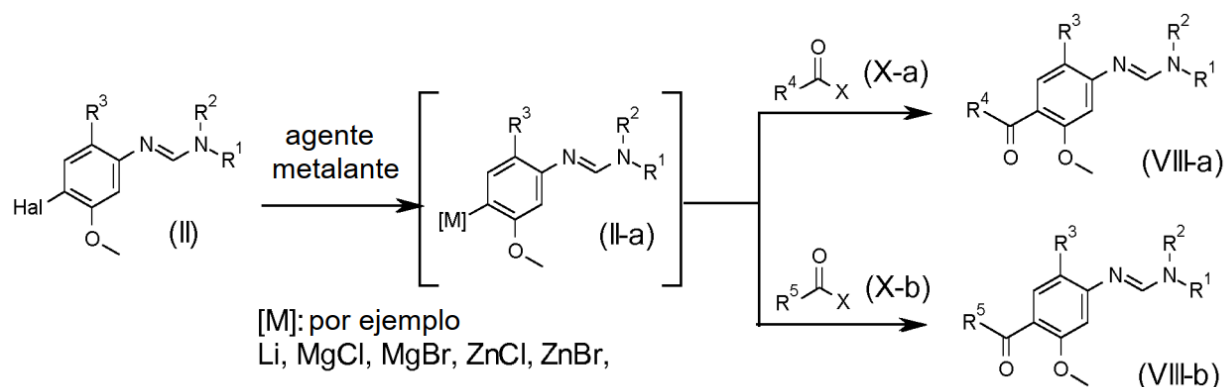


[M]: MgCl, MgBr, ZnCl, ZnBr, Li

Un experto en la técnica conoce los métodos para la generación de reactivos organometálicos de fórmula (IX-a) y (IX-b), los protocolos generales y referencias se pueden encontrar en March's Advanced Organic Chemistry, Smith, 7ª edición, Wiley, 2013.

Los compuestos de fórmula (VIII-a) y (VIII-b), donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 son como se ha definido para la fórmula (I), se pueden obtener mediante tratamiento de los compuestos de fórmula (II), donde R^1 , R^2 y R^3 son como se ha definido para la fórmula (I) y Hal es halógeno, preferentemente bromo o yodo, con un agente metalante tal como n-butil litio, magnesio, cinc o cloruro de i-propil magnesio-LiCl para generar un intermedio organometálico (II-a) el cual se hace reaccionar después con un compuesto de carbonilo de fórmula (X-a) o (X-b) respectivamente, donde R^4 y R^5 son como se ha definido para la fórmula (I) y X es un grupo saliente adecuado tal como fluoro, cloro, bromo, alcoxi C_1 - C_4 , alcóxicarbonilo C_1 - C_4 , alquilcarbonilo C_1 - C_6 , fenoxi o N(Me)OMe, como se muestra en el esquema 7.

Esquema 7



Ciertas combinaciones de intermedios organometálicos (II-a) y reactivos (X-b) o (X-a) pueden requerir la presencia de un catalizador de metal de transición tal como CuCl o Ni(acetilacetato)₂-2,2'-bipiridina como se describe en Angew. Chem. Int. Ed. 2006, 45, 6040 o J. Am. Chem. Soc. 2004, 126, 15964 y referencias en los mismos para proceder de manera eficaz.

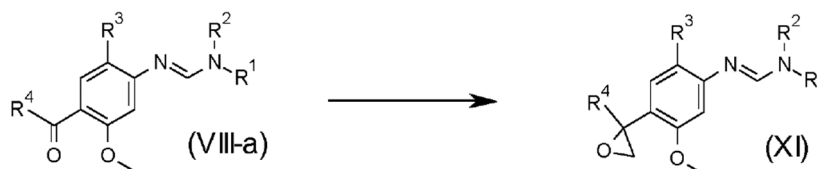
De manera alternativa, ciertos compuestos de fórmula (I-a), donde R¹, R², R³ y R⁴ son como se ha definido para la fórmula (I), X es oxígeno o azufre y R¹² es alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₃-C₆, alquino C₃-C₆, arilo (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), heteroarilo (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), arilalquilo (C₁-C₄) (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), se puede obtener mediante tratamiento de los compuestos de fórmula (XI), donde R¹, R², R³ y R⁴ son como se ha definido para la fórmula (I), con compuestos de fórmula (XII), donde X y R¹² son como se ha definido anteriormente, en un disolvente inerte tal como DMF en presencia de una base tal como hidruro de sodio a temperaturas de entre 0 °C y 80 °C. Esto se muestra en el esquema 8.

Esquema 8



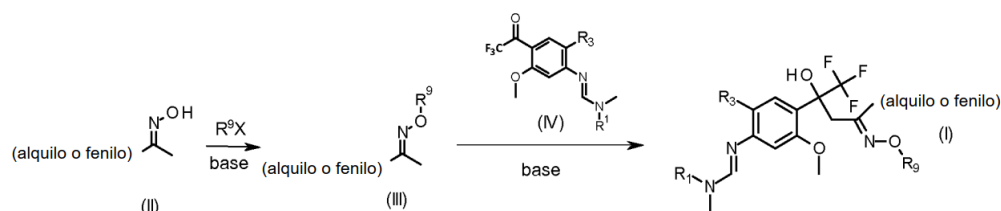
Los compuestos de fórmula (XI), donde R¹, R², R³ y R⁴ son como se ha definido para la fórmula (I), se pueden obtener mediante tratamiento de los compuestos de fórmula (VIII-a), donde R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ son como se ha definido para la fórmula (I), con un reactivo de azufre-iluro tal como yoduro de trimetilsulfoxonio en presencia de una base tal como *tert*-butóxido de potasio, en un disolvente inerte tal como DMSO a una temperatura de entre 0 °C y 80 °C. Esto se muestra en el esquema 9.

Esquema 9



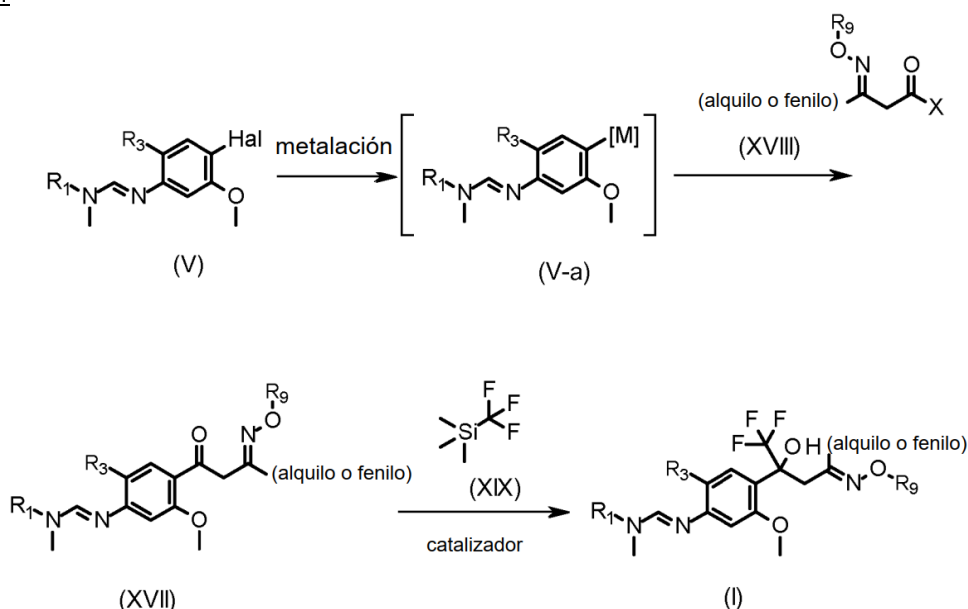
Los compuestos de fórmula (I), donde R⁵ es -CH₂C(=N-OR⁹)- alquilo C₁-C₂ o -CH₂C(=N-OR⁹)-fenilo y R¹, R³, R⁹ son como se ha definido para la fórmula (I), se pueden obtener mediante tratamiento de los compuestos de fórmula (II) y compuesto de halógeno, donde R⁹ es como se ha definido para la fórmula (I) y X es halógeno, preferentemente bromo o yodo, con una base tal como hidróxido de sodio para generar el compuesto (III), donde R⁹ es como se ha definido para la fórmula (I) el cual se hace reaccionar después con un compuesto de carbonilo de fórmula (IV), donde R¹ y R³ son como se ha definido para la fórmula (I) y una base tal como diisopropilamida de litio. Esto se muestra en el Esquema 10 a continuación.

Esquema 10



Como alternativa los compuestos de fórmula (I) donde R^5 es $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{N}-\text{OR}^9)-$ alquilo C_1-C_2 o $-\text{CH}_2\text{C}(=\text{N}-\text{OR}^9)-$ fenilo y R^1 y R^3 son como se ha definido para la fórmula (I), se pueden obtener mediante tratamiento de los compuestos de fórmula (V), donde R^1 es como se ha definido para la fórmula (I) y Hal es halógeno, preferentemente bromo o yodo, con un agente metalante tal como n-butil litio, magnesio, cinc o cloruro de i-propil magnesio-LiCl para generar un intermedio organometálico (V-a) el cual se hace reaccionar después con un compuesto de fórmula (XVIII), donde R^9 es como se ha definido para la fórmula (I) y X es cloro preferentemente para dar un compuesto de fórmula (XVII) el cual se hace reaccionar después con un reactivo de fórmula (XIX) que puede requerir la adición de un catalizador nucleófilo tal como fluoruro de cesio para añadirlo de manera eficaz a las especies de carbonilo. Esto se muestra en el Esquema 11 a continuación.

Esquema 11



Como alternativa, los compuestos de fórmula (I) donde R_1 , R_2 , R_3 , R_4 y R_5 son como se ha definido para la fórmula (I), se pueden obtener mediante transformación de otro compuesto de fórmula (I-b) estrechamente relacionado usando técnicas de síntesis habituales conocidas por el experto en la técnica. Los ejemplos no exhaustivos incluyen reacciones de oxidación, reacciones de reducción, reacciones de hidrólisis, reacciones de acoplamiento, reacciones de sustitución nucleófila o electrófila aromática, reacciones de sustitución nucleófila, reacciones de adición nucleófila y reacciones de halogenación.

Ciertos intermedios descritos en los esquemas anteriores son novedosos y, como tales, constituyen otro aspecto de la invención.

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

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

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

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

15 Además, los compuestos de acuerdo con la presente invención se pueden emplear para controlar hongos en áreas relacionadas, por ejemplo, en la protección de materiales técnicos, que incluyen la madera y productos técnicos relacionados con la madera, en el almacenamiento de alimentos o en la gestión sanitaria.

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

Los compuestos de fórmula (I) y las composiciones fungicidas que los contienen pueden utilizarse para controlar enfermedades de las plantas provocadas por una amplia gama de patógenos fúngicos de las plantas. Son eficaces a la hora de controlar una amplia gama de enfermedades de las plantas tales como patógenos foliares de cultivos de plantas ornamentales, pastos, hortalizas, cereales, frutos y campos de cultivo.

Estos hongos y vectores fúngicos de enfermedades, así como también las bacterias y virus fitopatógenos que se pueden controlar son, por ejemplo:

30 Absidia corymbifera, Alternaria spp, Aphanomyces spp, Ascochyta spp, Aspergillus spp. que incluye A. flavus, A. fumigatus, A. nidulans, A. niger, A. terreus, Aureobasidium spp. que incluye A. pullulans, Blastomyces dermatitidis, Blumeria graminis, Bremia lactucae, Botryosphaeria spp. que incluye B. dothidea, B. obtusa, Botrytis spp. que incluye B. cinerea, Candida spp. que incluye C. albicans, C. glabrata, C. krusei, C. lusitanae, C. parapsilosis, C. tropicalis, Cephalosporium fragrans, Ceratocystis spp, Cercospora spp. incluyendo C. arachidicola, Cercosporidium personatum, Cladosporium spp, Claviceps purpurea, Coccidioides immitis, Cochliobolus spp, Colletotrichum spp. que incluye C. musae, Cryptococcus neoformans, Diaporthe spp, Didymella spp, Drechslera spp, Elsinoe spp, Epidermophyton spp, Erwinia amylovora, Erysiphe spp. que incluye E. cichoracearum, Eutypa lata, Fusarium spp. que incluye F. culmorum, F. graminearum, F. langsethiae, F. moniliforme, F. oxysporum, F. proliferatum, F. subglutinans, F. solani, Gaeumannomyces graminis, Gibberella fujikuroi, Gloeodes pomigena, Gloeosporium musarum, Glomerella cingulate, Guignardia bidwellii, Gymnosporangium juniperi-virginianae, Helminthosporium spp, Hemileia spp, Histoplasma spp. que incluye H. capsulatum, Laetisaria fuciformis, Leptographium lindbergii, Leveillula taurica, Lophodermium segetis, Microdochium nivale, Microsporium spp, Monilinia spp, Mucor spp, Mycosphaerella spp. que incluye M. graminicola, M. pomi, Oncobasidium theobromaeon, Ophiostoma piceae, Paracoccidioides spp, Penicillium spp. que incluye P. digitatum, P. italicum, Petriellidium spp, Peronosclerospora spp. que incluye P. maydis, P. philippinensis y P. sorghi, Peronospora spp, Phaeosphaeria nodorum, Phakopsora pachyrhizi, Phellinus igniarius, Phialophora spp, Phoma spp, Phomopsis viticola, Phytophthora spp. que incluye P. infestans, Plasmopara spp. que incluye P. halstedii, P. viticola, Pleospora spp., Podosphaera spp. que incluye P. leucotricha, Polymyxa graminis, Polymyxa betae, Pseudocercospora herpotrichoides, Pseudomonas spp, Pseudoperonospora spp. que incluye P. cubensis, P. humuli, Pseudopeziza tracheiphila, Puccinia spp. que incluye P. hordei, P. recondita, P. striiformis, P. triticea, Pyrenopeziza spp, Pyrenophora spp, Pyricularia spp. que incluye P. oryzae, Pythium spp. que incluye P. ultimum, Ramularia spp, Rhizoctonia spp, Rhizomucor pusillus, Rhizopus arrhizus, Rhynchosporium spp, Scedosporium spp. que incluye S. apiospermum y S. prolificans, Schizothyrium pomi, Sclerotinia spp., Sclerotium spp., Septoria spp., que incluye S. nodorum, S. tritici, Sphaerotheca macularis, Sphaerotheca fusca (Sphaerotheca fuliginea), Sporothrix spp., Stagonospora nodorum, Stemphylium spp., Stereum hirsutum, Thanatephorus cucumeris, Thielaviopsis basicola, Tilletia spp., Trichoderma spp., que incluye T. harzianum, T. pseudokoningii, T. viride, Trichophyton spp., Typhula spp., Uncinula necator, Urocystis spp., Ustilago spp., Venturia spp., que incluye V. inaequalis, Verticillium spp. y Xanthomonas spp.

En particular, los compuestos de fórmula (I) y las composiciones fungicidas que los contienen se pueden utilizar para controlar enfermedades de las plantas provocadas por una amplia gama de patógenos fúngicos de las plantas pertenecientes a las clases de los Basidiomycetes, Ascomycetes, Oomycetes y/o Deuteromycetes, Blasocladiomycetes, Critidiomycetes, Glomeromycetes y/o Mucoromycetes.

Estos patógenos pueden incluir:

Oomicetos, que incluyen enfermedades de *Phytophthora* tales como las provocadas por *Phytophthora capsici*, *Phytophthora infestans*, *Phytophthora sojae*, *Phytophthora fragariae*, *Phytophthora nicotianae*, *Phytophthora cinnamomi*, *Phytophthora citricola*, *Phytophthora citrophthora* y *Phytophthora erythroseptica*; enfermedades de *Pythium* tales como las provocadas por *Pythium aphanidermatum*, *Pythium arrhenomanes*, *Pythium graminicola*, *Pythium irregulare* y *Pythium ultimum*; enfermedades provocadas por *Peronosporales* tales como *Peronospora destructor*, *Peronospora parasitica*, *Plasmopara viticola*, *Plasmopara halstedii*, *Pseudoperonospora cubensis*, *Albugo candida*, *Sclerophthora macrospora* y *Bremia lactucae*; y otros tales como *Aphanomyces cochlioides*, *Labyrinthula zosterae*, *Peronosclerospora sorghi* y *Sclerospora graminicola*.

Ascomicetos, incluyendo enfermedades o podredumbres por tizones, oídeos, chancros a añublo, por ejemplo los causados por los *Pleosporales* tales como *Stemphylium solani*, *Stagonospora tainanensis*, *Spilocaea oleaginea*, *Setosphaeria turcica*, *Pyrenochaeta lycopersici*, *Pleospora herbarum*, *Phoma destructiva*, *Phaeosphaeria herpotrichoides*, *Phaeocryptopus gaeumannii*, *Ophiosphaerella graminicola*, *Ophiobolus graminis*, *Leptosphaeria maculans*, *Hendersonia creberrima*, *Helminthosporium tritici-repentis*, *Setosphaeria turcica*, *Drechslera glycines*, *Didymella bryoniae*, *Cycloconium oleagineum*, *Corynespora cassiicola*, *Cochliobolus sativus*, *Bipolaris cactivora*, *Venturia inaequalis*, *Pyrenophora teres*, *Pyrenophora tritici-repentis*, *Alternaria alternata*, *Alternaria brassicicola*, *Alternaria solani* y *Alternaria tomatophila*. *Capnodiales* tales como *Septoria tritici*, *Septoria nodorum*, *Septoria glycines*, *Cercospora arachidicola*, *Cercospora sojae*, *Cercospora zeae-maydis*, *Cercospora capsellae* y *Cercospora herpotrichoides*, *Cladosporium carpophilum*, *Cladosporium effusum*, *Passalora fulva*, *Cladosporium oxysporum*, *Dothistroma septosporum*, *Isariopsis clavispora*, *Mycosphaerella fijiensis*, *Mycosphaerella graminicola*, *Mycovellosiella koepkei*, *Phaeoisariopsis bataticola*, *Pseudocercospora vitis*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Ramularia beticola*, *Ramularia collo-cygni*. *Magnaporthales* tales como *Gaeumannomyces graminis*, *Magnaporthe grisea*, *Pyricularia oryzae*. *Diaporthales* tales como *Anisogramma anomala*, *Apiognomonina errabunda*, *Cytospora platani*, *Diaporthe phaseolorum*, *Discula destructiva*, *Gnomonia fructicola*, *Greeneria uvicola*, *Melanconium juglandinum*, *Phomopsis viticola*, *Sirococcus clavigignenti-juglandacearum*, *Tubakia dryina*, *Dicarpella* spp., *Valsa ceratosperma*, y otras tales como *Actinothyrium graminis*, *Ascochyta pisi*, *Aspergillus flavus*, *Aspergillus fumigatus*, *Aspergillus nidulans*, *Asperisporium caricae*, *Blumeriella jaapii*, *Candida* spp., *Capnodium ramosum*, *Cephalosporium* spp., *Cephalosporium gramineum*, *Ceratocystis paradoxa*, *Chaetomium* spp., *Hymenoscyphus pseudoalbidus*, *Coccidioides* spp., *Cylindrosporium padi*, *Diplocarpon malae*, *Drepanopeziza campestris*, *Elsinoe ampelina*, *Epicoccum nigrum*, *Epidermophyton* spp., *Eutypa lata*, *Geotrichum candidum*, *Gibellina cerealis*, *Gloeocercospora sorghi*, *Gloeodes pomigena*, *Gloeosporium perennans*; *Gloeotinia temulenta*, *Griphosphaeria corticola*, *Kabatella lini*, *Leptographium microsporum*, *Leptosphaerulina crassiasca*, *Lophodermium seeditiosum*, *Marssonina graminicola*, *Microdochium nivale*, *Monilinia fructicola*, *Monographella albescens*, *Monosporascus cannonballus*, *Naemacyclus* spp., *Ophiostoma novo-ulmi*, *Paracoccidioides brasiliensis*, *Penicillium expansum*, *Pestalotia rhododendri*, *Petriellidium* spp., *Pezicula* spp., *Phialophora gregata*, *Phyllachora pomigena*, *Phymatotrichum omnivora*, *Physalospora abdita*, *Plectosporium tabacinum*, *Polyscytalum pustulans*, *Pseudopeziza medicaginis*, *Pyrenopeziza brassicae*, *Ramulispora sorghi*, *Rhabdocline pseudotsugae*, *Rhynchosporium secalis*, *Sacrocladium oryzae*, *Scedosporium* spp., *Schizothyrium pomi*, *Sclerotinia sclerotiorum*, *Sclerotinia minoritario*, *Sclerotium* spp., *Typhula ishikariensis*, *Seimatosporium mariae*, *Lepteutypa cupressi*, *Septocysta ruborum*, *Sphaceloma perseae*, *Sporonema phacidiioides*, *Stigmata palmivora*, *Tapesia yallundae*, *Taphrina bullata*, *Thielaviopsis basicola*, *Trichoseptoria fructigena*, *Zygophiala jamaicensis*; enfermedades del mildiu pulverulento, por ejemplo las causadas por *Erysiphales* tales como *Blumeria graminis*, *Erysiphe polygoni*, *Uncinula necator*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Podosphaera leucotricha*, *Podosphaera macularis*. *Golovinomyces cichoracearum*, *Leveillula taurica*, *Microsphaera diffusa*, *Oidiopsis gossypii*, *Phyllactinia guttata* y *Oidium arachidis*; mohos, por ejemplo los causados por *Botryosphaeriales* tales como *Dothiorella aromatica*, *Diplodia seriata*, *Guignardia bidwellii*, *Botrytis cinerea*, *Botryotinia allii*, *Botryotinia fabae*, *Fusicoccum amygdali*, *Lasiodiplodia theobromae*, *Macrophoma theicola*, *Macrophomina phaseolina*, *Phyllosticta cucurbitacearum*; antracnosis, por ejemplo las causadas por *Glomeriales* tales como *Colletotrichum gloeosporioides*, *Colletotrichum lagenarium*, *Colletotrichum gossypii*, *Glomerella cingulata*, y *Colletotrichum graminicola*; y marchitez o royas por ejemplo los causados por *Hypocreales* tales como *Acremonium strictum*, *Claviceps purpurea*, *Fusarium culmorum*, *Fusarium graminearum*, *Fusarium virguliforme*, *Fusarium oxysporum*, *Fusarium subglutinans*, *Fusarium oxysporum* f.sp. *cubense*, *Gerlachia nivale*, *Gibberella fujikuroi*, *Gibberella zeae*, *Gliocladium* spp., *Myrothecium verrucaria*, *Nectria ramulariae*, *Trichoderma viride*, *Trichothecium roseum* y *Verticillium theobromae*.

Basidiomicetos, que incluyen tizones, por ejemplo, los provocados por *Ustilaginales* tales como *Ustilago virens*, *Ustilago nuda*, *Ustilago tritici*, *Ustilago zeae*, royas, por ejemplo, las provocadas por *Pucciniales* tales como *Cerotelium fici*, *Chrysomyxa arctostaphyli*, *Coleosporium ipomoeae*, *Hemileia vastatrix*, *Puccinia arachidis*, *Puccinia cacabata*, *Puccinia graminis*, *Puccinia recondita*, *Puccinia sorghi*, *Puccinia hordei*, *Puccinia striiformis* f.sp. *Hordei*, *Puccinia striiformis* f.sp. *Secalis*, *Pucciniastrum coryli* o *Uredinales* tales como *Cronartium ribicola*, *Gymnosporangium juniperi-viginianae*, *Melampsora medusae*, *Phakopsora pachyrhizi*, *Phragmidium mucronatum*, *Physopella ampelosisidis*, *Tranzschelia discolor* y *Uromyces viciae-fabae*; y otras royas y enfermedades tales como las provocadas por *Cryptococcus* spp., *Exobasidium vexans*, *Marasmiellus inoderma*, *Mycena* spp., *Sphacelotheca reiliana*, *Typhula ishikariensis*, *Urocystis agropyri*, *Uromyces perplexans*, *Corticium invisum*, *Laetisaria fuciformis*, *Waitea circinata*, *Rhizoctonia solani*, *Thanetophorus cucurmeris*, *Entyloma dahliae*, *Entylomella microspora*, *Neovossia molinae* y *Tilletia caries*.

Blastocladiomicetos tales como *Physoderma maydis*.

Mucoromicetos tales como *Choanephora cucurbitarum*; *Mucor* spp.; *Rhizopus arrhizus*.

Así como también enfermedades provocadas por otras especies y géneros estrechamente relacionados con los enumerados anteriormente.

Además de su actividad fungicida, los compuestos y las composiciones que los comprenden también pueden presentar actividad contra bacterias tales como *Erwinia amylovora*, *Erwinia caratovora*, *Xanthomonas campestris*, *Pseudomonas syringae*, *Streptomyces scabies* y otras especies relacionadas, así como también ciertos protozoos.

Dentro del alcance de la presente invención, los cultivos diana y/o plantas útiles que se han de proteger comprenden normalmente cultivos perennes y anuales tales como plantas de bayas, por ejemplo, moras, arándanos azules, arándanos rojos, frambuesas y frutillas; cereales, por ejemplo, cebada, maíz, mijo, avena, arroz, centeno, sorgo, triticale y trigo; plantas que producen fibra, por ejemplo, algodón, lino, cáñamo, yute y sisal; cultivos de campo, por ejemplo, azúcar y remolacha forrajera, café, lúpulos, mostaza, colza oleaginosa (canola), amapola, caña de azúcar, girasol, té y tabaco; árboles frutales, por ejemplo, los que producen manzana, damasco, palta, banana, cereza, cítricos, nectarina, durazno, pera y ciruela; pastos, por ejemplo, grama común, pasto azul, *Agrostis*, *Eremocloa ophiuroides*, festuca, *Lolium*, pasto de San Agustín y pasto Zoysia; hierbas tales como albahaca, borraja, cebolletas, cilantro, lavanda, apio de monte, menta, orégano, perejil, romero, salvia y tomillo; legumbres, por ejemplo, porotos, lentejas, arvejas y soja; frutos secos, por ejemplo, almendra, anacardo, cacahuete, avellana, maní, pacana, pistacho y nuez; palmeras, por ejemplo, palmera oleaginosa; plantas ornamentales, por ejemplo, flores, arbustos y árboles; otros árboles, por ejemplo, de cacao, coco, oliva y caucho; hortalizas, por ejemplo, espárragos, berenjena, brócoli, col, zanahoria, pepino, ajo, lechuga, zapallito, melón, quingombó, cebolla, pimienta, papa, calabaza, ruibarbo, espinaca y tomate; y vides, por ejemplo, uvas.

Las plantas útiles y/o cultivos diana de acuerdo con la invención incluyen variedades convencionales, así como también variedades mejoradas o modificadas genéticamente tales como, por ejemplo, variedades resistentes a insectos (p. ej., variedades Bt. y VIP), así como también resistentes a enfermedades, tolerantes a herbicidas (p. ej., variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato comercializadas con los nombres comerciales RoundupReady® y LibertyLink®) y tolerantes a nematodos. A modo de ejemplo, las variedades de cultivos mejoradas o modificadas genéticamente adecuadas incluyen las variedades del algodón Stoneville 5599BR y Stoneville 4892BR.

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

También se debe sobreentender que la expresión "plantas útiles" y/o "cultivos diana" incluye aquellos que son resistentes por naturaleza o se han modificado para que sean resistentes a insectos dañinos. Esto incluye plantas que han sido transformadas mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, por ejemplo, para que sean capaces de sintetizar una o más toxinas que actúan selectivamente tales como, por ejemplo, las conocidas que proceden de bacterias productoras de toxinas. Los ejemplos de toxinas que pueden ser expresadas incluyen δ -endotoxinas, proteínas insecticidas vegetativas (Vip), proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nematodos, y toxinas producidas por escorpiones, arácnidos, avispas y hongos. Un ejemplo de un cultivo que ha sido modificado para que exprese la toxina de *Bacillus thuringiensis* es el maíz Bt KnockOut® (Syngenta Seeds). Un ejemplo de un cultivo que comprende más de un gen que codifica resistencia a insecticidas y que expresa de este modo más de una toxina es VipCot® (Syngenta Seeds). Los cultivos o el material seminal de estos también pueden ser resistentes a múltiples tipos de plagas (los denominados eventos transgénicos apilados cuando se crean mediante modificación genética). Por ejemplo, una planta puede tener la capacidad de expresar una proteína insecticida a la vez que es tolerante a herbicidas, por ejemplo, Herculex I® (Dow AgroSciences, Pioneer Hi-Bred International).

Se debe sobreentender que la expresión "plantas útiles" y/o "cultivos diana" también incluye las plantas útiles que se han transformado utilizando técnicas de ADN recombinante, las cuales son capaces de sintetizar sustancias antipatógenas con una acción selectiva tales como, por ejemplo, las denominadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (PRP, remítase, p. ej., a EP-A-0 392 225). Algunos ejemplos de estas sustancias antipatógenas y de plantas transgénicas capaces de sintetizar estas sustancias antipatógenas se describen, por ejemplo, en EP-A-0 392 225, WO 95/33818 y EP-A-0 353 191. Los expertos en la técnica generalmente conocen los métodos para producir tales plantas transgénicas y estos se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente.

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

Además, en el contexto de la presente invención, se debe sobreentender que las δ -endotoxinas son, por ejemplo, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 o Cry9C, o proteínas insecticidas vegetativas (Vip), por ejemplo, Vip1, Vip2, Vip3 o Vip3A, expresamente también toxinas híbridas, toxinas truncadas y toxinas modificadas. Las toxinas híbridas se producen de manera recombinante mediante una combinación nueva de diferentes dominios de estas proteínas (remítase a, por ejemplo, el documento WO 02/15701). Existe constancia de toxinas truncadas, por ejemplo, una toxina Cry1Ab truncada. En el caso de las toxinas modificadas, se reemplazan uno o más aminoácidos de la toxina de origen natural. En estos reemplazos de aminoácidos, se insertan preferentemente en la toxina secuencias de reconocimiento de proteasas no naturales, tales como, por ejemplo, en el caso de Cry3A055, se inserta una secuencia de reconocimiento de la catepsina G en una toxina Cry3A (remítase a WO03/018810).

Se describen más ejemplos de tales toxinas o plantas transgénicas capaces de sintetizar tales toxinas, por ejemplo, en EP-A-0 374 753, WO93/07278, WO95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878 y WO03/052073.

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

La toxina contenida en las plantas transgénicas les confiere a las plantas tolerancia a insectos dañinos. Estos insectos pueden pertenecer a cualquier grupo taxonómico de insectos, pero de forma habitual pertenecen especialmente al grupo de los escarabajos (coleópteros), insectos con dos alas (dípteros) y mariposas (lepidópteros).

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

Algunos ejemplos adicionales de tales cultivos transgénicos son:

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

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

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

se describe en el documento WO 03/018810.

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

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

contener un portador líquido, tal como xileno, naftas aromáticas pesadas, isoforona y otros disolventes orgánicos no volátiles. Cuando se utilizan, estos concentrados se dispersan en agua u otro líquido y se aplican normalmente como un aerosol a la zona que se desee tratar. La cantidad de principio activo puede variar entre un 0,5% y un 95% del concentrado.

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

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

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

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

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

Los portadores líquidos que se pueden utilizar incluyen, por ejemplo, agua, tolueno, xileno, nafta de petróleo crudo, aceite de cultivos, acetona, cetona etil metílica, ciclohexanona, anhídrido de ácido, acetonitrilo, acetofenona, acetato de amilo, 2-butanona, clorobenceno, ciclohexano, ciclohexanol, acetatos alquílicos, diacetonoalcohol, 1,2-dicloropropano, dietanolamina, p-dietilbenceno, dietilenglicol, abietato de dietilenglicol, éter butílico de dietilenglicol, éter etílico de dietilenglicol, éter metílico de dietilenglicol, N,N-dimetilformamida, sulfóxido de dimetilo, 1,4-dioxano, dipropilenglicol, éter metílico de dipropilenglicol, dibenzoato de dipropilenglicol, diproxitol, alquilpirrolidona, acetato de etilo, 2-etilhexanol, carbonato de etileno, 1,1,1-tricloroetano, 2-heptanona, alfa-pineno, d-limoneno, etilenglicol, éter butílico de etilenglicol, éter metílico de etilenglicol, gamma-butirolactona, glicerol, diacetato de glicerol, monoacetato de glicerol, triacetato de glicerol, hexadecano, hexilenglicol, acetato de isoamilo, acetato de isobornilo, isooctano, isoforona, isopropilbenceno, miristato de isopropilo, ácido láctico, laurilamina, óxido de mesitilo, metoxipropanol, cetona isoamil metílica, cetona isobutil metílica, laurato de metilo, octanoato de metilo, oleato de metilo, cloruro de metileno, m-xileno, n-hexano, n-octilamina, ácido octadecanoico, acetato de octilamina, ácido oleico, oleilamina, o-xileno, fenol, polietilenglicol (PEG400), ácido propiónico, propilenglicol, éter monometílico de propilenglicol, p-xileno, tolueno, fosfato de trietilo, trietilenglicol, ácido xilenosulfónico, parafina, aceite mineral, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etilo, acetato de amilo, acetato de butilo, metanol, etanol, isopropanol y alcoholes de peso molecular superior tales como el alcohol amílico, alcohol tetrahidrofurfurílico, hexanol, octanol, etc., etilenglicol, propilenglicol, glicerina y N-metil-2-pirrolidinona. Generalmente el portador elegido para la dilución de los concentrados es agua.

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

Se emplea convenientemente una amplia gama de agentes tensioactivos tanto en dichas composiciones líquidas como sólidas, especialmente en las diseñadas para ser diluidas con un portador antes de su aplicación. Estos agentes, cuando se utilizan, normalmente comprenden entre un 0,1% y un 15% en peso de la formulación. Estos pueden ser

de naturaleza aniónica, catiónica, no iónica o polimérica y se pueden emplear como agentes emulsionantes, agentes humectantes, agentes de suspensión o con otros fines. Los agentes tensioactivos típicos incluyen sales de sulfatos de alquilo, tales como laurilsulfato de dietanolamonio; sales de alquilarilsulfonato, tales como dodecilbencenosulfonato de calcio; productos de adición de óxido de alquileo-alquilfenol, tales como nonilfenol-C.sub. 18 etoxilato; productos de adición de alcohol y óxido de alquileo, tales como alcohol tridecílico C-.sub. 16 etoxilado; jabones, tales como estearato de sodio; sales de alquilnaftalenosulfonato, tales como dibutilnaftalenosulfonato de sodio; ésteres dialquílicos de sales de sulfosuccinato, tales como sulfosuccinato sódico de di(2-etilhexilo); ésteres de sorbitol, tales como oleato de sorbitol; aminas cuaternarias, tales como cloruro de lauriltrimetilamonio; ésteres polietilenglicólicos de ácidos grasos, tales como estearato de polietilenglicol; copolímeros en bloque de óxido de etileno y óxido de propileno; y sales de ésteres de fosfato mono- y dialquílicos.

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

La invención también proporciona el uso de una composición que comprende un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con la presente invención junto con uno o más pesticidas, nutrientes de plantas o fertilizantes de plantas. La combinación también puede abarcar rasgos específicos de plantas incorporados en la planta utilizando cualquier medio, por ejemplo, modificación genética o cultivo selectivo convencional.

Los ejemplos adecuados de nutrientes de plantas o fertilizantes de plantas son sulfato de calcio (CaSO_4), nitrato de calcio ($\text{Ca}(\text{NO}_3)_2 \cdot 4\text{H}_2\text{O}$), carbonato de calcio (CaCO_3), nitrato de potasio (KNO_3), sulfato de magnesio (MgSO_4), hidrogenofosfato de potasio (KH_2PO_4), sulfato de manganeso (MnSO_4), sulfato de cobre (CuSO_4), sulfato de zinc (ZnSO_4), cloruro de níquel (NiCl_2), sulfato de cobalto (CoSO_4), hidróxido de potasio (KOH), cloruro de sodio (NaCl), ácido bórico (H_3BO_3) y sales metálicas de estos (Na_2MoO_4). Los nutrientes pueden estar presentes en una cantidad comprendida entre un 5% y un 50% en peso, preferentemente entre un 10% y un 25% en peso o entre un 15% y un 20% en peso cada uno. Los nutrientes adicionales preferidos son urea ($(\text{NH}_2)_2\text{CO}$), melamina ($\text{C}_3\text{H}_6\text{N}_6$), óxido de potasio (K_2O) y nitratos inorgánicos. El nutriente de plantas adicional más preferido es el óxido de potasio. Cuando el nutriente adicional preferido es la urea, esta está presente en una cantidad comprendida generalmente entre un 1% y un 20% en peso, preferentemente entre un 2% y un 10% en peso o entre un 3% y un 7% en peso.

Algunos ejemplos adecuados de pesticidas son fungicidas aminoácidos acíclicos, fungicidas alifáticos nitrogenados, fungicidas de tipo amida, fungicidas de tipo anilida, fungicidas antibióticos, fungicidas aromáticos, fungicidas que contienen arsénico, fungicidas de tipo cetona aril fenólica, fungicidas de tipo benzamida, fungicidas de tipo benzanilida, fungicidas de tipo bencimidazol, fungicidas de tipo benzotiazol, fungicidas botánicos, fungicidas difenílicos con puente, fungicidas de tipo carbamato, fungicidas de tipo carbanilato, fungicidas de tipo conazol, fungicidas que contienen cobre, fungicidas de tipo dicarboximida, fungicidas de tipo dinitrofenol, fungicidas de tipo ditiocarbamato, fungicidas de tipo ditiolano, fungicidas de tipo furamida, fungicidas de tipo furanilida, fungicidas de tipo hidrazida, fungicidas de tipo imidazol, fungicidas que contienen mercurio, fungicidas morfolínicos, fungicidas organofosforados, fungicidas de organoestaño, fungicidas de tipo oxatiño, fungicidas de tipo oxazol, fungicidas de tipo fenilsulfamida, fungicidas de tipo polisulfuro, fungicidas de tipo pirazol, fungicidas de tipo piridina, fungicidas de tipo pirimidina, fungicidas de tipo pirrol, fungicidas de tipo amonio cuaternario, fungicidas de tipo quinolina, fungicidas de tipo quinona, fungicidas de tipo quinoxalina, fungicidas de tipo estrobilurina, fungicidas de tipo sulfonanilida, fungicidas de tipo tiadiazol, fungicidas de tipo tiazol, fungicidas de tipo tiazolidina, fungicidas de tipo tiocarbamato, fungicidas de tipo tiofeno, fungicidas de tipo triazina, fungicidas de tipo triazol, fungicidas de tipo triazolopirimidina, fungicidas de tipo urea, fungicidas de tipo valinamida y fungicidas que contienen zinc, benzoilureas, carbamatos, cloronicotinilos, diacilhidrazinas, diamidas, fiproles, macrólidos, nitroiminas, nitrometilenos, organocloruros, organofosfatos, organosilícicos, organoestaños, fenilpirazoles, ésteres fosfóricos, piretroides, espinosinas, derivados del ácido tetrámico y derivados del ácido tetrónico, nematocidas antibióticos, nematocidas de tipo avermectina, nematocidas botánicos, nematocidas de tipo carbamato, nematocidas de tipo oxima, nematocidas organofosforados, bacterias u hongos nematófagos, herbicidas de tipo amida, herbicidas de tipo anilida, herbicidas que contienen arsénico, herbicidas de tipo arilalanina, herbicidas ariloxifenoxipropiónicos, herbicidas de tipo benzofuranilo, herbicidas de tipo ácido benzoico, herbicidas de tipo benzotiazol, herbicidas de tipo benzoilciclohexanodiona, herbicidas de tipo carbamato, herbicidas de tipo carbanilato, herbicidas de tipo cloroacetanilida, herbicidas de tipo clorotriazina, herbicidas de tipo oxima ciclohexénica, herbicidas de tipo ciclopropilisoxazol, herbicidas de tipo dicarboximida, herbicidas de tipo dinitroanilina, herbicidas de tipo dinitrofenol, herbicidas de tipo éter difenílico, herbicidas de tipo ditiocarbamato, herbicidas de tipo fluoroalquiltriazina, herbicidas alifáticos halogenados, herbicidas de tipo imidazolinona, herbicidas inorgánicos, herbicidas de tipo metoxitriazina, herbicidas de tipo metiltiotriazina, herbicidas de tipo nitrilo, herbicidas de tipo éter nitrofenílico, herbicidas organofosforados, herbicidas de tipo oxadiazolona, herbicidas de tipo oxazol, herbicidas de tipo fenoxi, herbicidas fenoxiacéticos, herbicidas fenoxibutíricos, herbicidas fenoxipropiónicos, herbicidas de tipo fenilendiamina, herbicidas de tipo fenilurea, herbicidas de tipo ácido ftálico, herbicidas de tipo ácido picolínico, herbicidas de tipo pirazol, herbicidas de tipo piridazina, herbicidas de tipo piridazinona, herbicidas de tipo piridina, herbicidas de tipo pirimidindiamina, herbicidas de tipo pirimidiniloxibencilamina, herbicidas de tipo pirimidinilsulfonilurea, herbicidas de

tipo amonio cuaternario, herbicidas de tipo ácido quinolinocarboxílico, herbicidas de tipo sulfonamida, herbicidas de tipo sulfonanilida, herbicidas de tipo sulfonilurea, herbicidas de tipo tiadiazolilurea, herbicidas de tipo tioamida, herbicidas de tipo tiocarbamato, herbicidas de tipo tiocarbonato, herbicidas de tipo tiourea, herbicidas de tipo triazina, herbicidas de tipo triazinona, herbicidas de tipo triazinilsulfonilurea, herbicidas de tipo triazol, herbicidas de tipo triazolona, herbicidas de tipo triazolopirimidina, herbicidas de tipo uracilo, herbicidas de tipo urea, agentes microbianos, extractos vegetales, feromonas, agentes macrobianos y otros agentes biológicos.

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

El término "controlar" o "prevenir" se refiere a reducir la infestación por parte de insectos o microorganismos fitopatógenos o responsables de la descomposición, u organismos potencialmente dañinos para el ser humano, especialmente organismos fúngicos, hasta un nivel tal que se demuestra una mejora.

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

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

Los métodos de aplicación para las composiciones, es decir, los métodos para controlar las plagas del tipo mencionado anteriormente, por ejemplo, mediante pulverización, atomización, espolvoración, con cepillo, revestimiento, dispersión o vertido, que deben seleccionarse para adecuarse a los fines deseados de las circunstancias predominantes, y el uso de las composiciones para controlar las plagas del tipo mencionado anteriormente son otros objetos de la invención. Las tasas habituales de concentración están comprendidas entre 0,1 y 1000 ppm, preferentemente entre 0,1 y 500 ppm, de principio activo. La tasa de aplicación por hectárea está comprendida preferentemente entre 1 g y 2000 g de principio activo por hectárea, más preferentemente entre 10 y 1000 g/ha, de la manera más preferida entre 10 y 600 g/ha. Cuando se emplea como un agente para empapar las semillas, las dosis convenientes son de 10 mg a 1 g de sustancia activa por kg de semillas.

Cuando las composiciones se emplean para el tratamiento de semillas, en general son suficientes tasas comprendidas entre 0,001 y 50 g de un compuesto de fórmula (I) por kg de semillas, preferentemente entre 0,01 y 10 g por kg de semillas.

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

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

Estas composiciones se pueden producir empleando métodos convencionales, p. ej., mezclando los principios activos

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

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

En general, las formulaciones incluyen de un 0,01 a un 90% en peso de agente activo, de un 0 a un 20% de tensioactivo aceptable en agricultura y de un 10 a un 99,99% de material o materiales inertes y adyuvantes de formulación sólidos o líquidos, estando constituido el agente activo por al menos el compuesto de fórmula (I) junto con los componentes (B) y (C), y opcionalmente otros agentes activos, particularmente microbicidas, conservantes o similares. Las formas concentradas de las composiciones contienen generalmente entre aproximadamente un 2 y un 80%, preferentemente entre aproximadamente un 5 y un 70% en peso de agente activo. Las formas de aplicación de la formulación pueden contener, por ejemplo, entre un 0,01 y un 20% en peso, preferentemente entre un 0,01 y un 5% en peso de agente activo. Aunque los productos comerciales se formularán preferentemente como concentrados, el usuario final normalmente empleará formulaciones diluidas.

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

Ejemplos

Los siguientes Ejemplos sirven para ilustrar la invención. Ciertos compuestos de la invención se pueden diferenciar de los compuestos conocidos debido a su mayor eficacia con tasas de aplicación bajas, que puede ser verificada por un experto en la técnica utilizando los procedimientos experimentales que se exponen en los Ejemplos, empleando tasas de aplicación más bajas, cuando proceda, por ejemplo, 50 ppm, 12,5 ppm, 6 ppm, 3 ppm, 1,5 ppm, 0,8 ppm o 0,2 ppm.

En toda esta descripción, las temperaturas se proporcionan en grados Celsius y "p.f." quiere decir punto de fusión. LC/MS quiere decir cromatografía líquida/espectroscopia de masas, y la descripción del equipo y los métodos es:

Ejemplos de formulaciones

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

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

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

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

Concentrado emulsionable

principio activo [compuesto de fórmula (I)]	10 %
éter octilfenólico de polietilenglicol (4-5 mol de óxido de etileno)	3 %
dodecibencenosulfonato de calcio	3 %
éter poliglicólico de aceite de ricino (35 mol de óxido de etileno)	4 %
Ciclohexanona	30 %
mezcla de xilenos	50 %

- 5 Se pueden obtener emulsiones de cualquier dilución requerida, que se pueden utilizar en la protección de plantas, a partir del mismo concentrado diluyendo con agua.

<u>Polvos</u>	a)	b)	c)
Principio activo [compuesto de fórmula (I)]	5 %	6 %	4 %
talco	95 %	-	-
Caolín	-	94 %	-
relleno mineral	-	-	96 %

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

Gránulos extrusores

Principio activo [compuesto de fórmula (I)]	15 %
lignosulfonato de sodio	2 %
carboximetilcelulosa	1 %
Caolín	82 %

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

Gránulos recubiertos

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

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

Concentrado en suspensión

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

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

Concentrado fluido para el tratamiento de semillas

principio activo [compuesto de fórmula (I)]	40 %
propilenglicol	5 %
copolímero de butanol PO/OE	2 %
triestirenofenol con 10-20 moles de OE	2 %
1,2-bencisotiazolin-3-ona (en forma de una disolución al 20% en agua)	0,5 %

(continuación)

sal de calcio de pigmento monoazo	5 %
Aceite de silicona (en forma de una emulsión al 75% en agua)	0,2 %
Agua	45,3 %

El principio activo finamente molido se mezcla íntimamente con los adyuvantes, para obtener un concentrado en suspensión a partir del cual se pueden obtener suspensiones de cualquier dilución deseada diluyendo con agua. Utilizando tales diluciones, se pueden tratar tanto plantas vivas como material de propagación vegetal y se pueden

5 proteger contra la infestación por parte de microorganismos mediante pulverización, vertido o inmersión.

Suspensión de cápsulas de liberación lenta

10 Se mezclan 28 partes de una combinación del compuesto de fórmula (I) con 2 partes de un disolvente aromático y 7 partes de una mezcla de diisocianato de tolueno/polifenilisocianato de polimetileno (8:1). Se emulsiona esta mezcla en una mezcla de 1,2 partes de alcohol polivinílico, 0,05 partes de un desespumante y 51,6 partes de agua, hasta que se obtiene el tamaño de partícula deseado. Se añade a esta emulsión una mezcla de 2,8 partes de 1,6-diaminohexano en 5,3 partes de agua. Se agita la mezcla hasta que finaliza la reacción de polimerización.

15 Se estabiliza la suspensión de cápsulas obtenida añadiendo 0,25 partes de un espesante y 3 partes de un agente dispersante. La formulación de suspensión de cápsulas contiene un 28% de los principios activos. El diámetro medio de cápsula es de 8-15 micrómetros.

Se aplica la formulación resultante a semillas como una suspensión acuosa en un equipo adecuado para dicho fin.

20

Ejemplos de preparación

Utilizando las técnicas descritas anteriormente y más adelante, además de en el documento WO 08/101682 y el documento WO 12/146125, junto con técnicas adicionales generalmente conocidas por los expertos en la técnica, se

25

Preparación de N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(isobutoximetil-etil)fenil]-N-metil-formamidina

Preparación de 4-bromo-5-metoxi-2-metil-anilina

30

Se añadió N-bromosuccinimida (1,28 g, 7,29 mmol) en porciones a una solución helada (0-5 °C) de 5-metoxi-2-metil-anilina (1,0 g, 7,29 mmol) en CHCl_3 (15 ml). La solución resultante se agitó durante 60 minutos a 0 °C, se calentó a temperatura ambiente y se diluyó con CH_2Cl_2 . La mezcla se lavó con NaHCO_3 acuoso (+ 2 ml de solución de $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$), salmuera y se secó sobre MgSO_4 . Los sólidos se retiraron mediante filtración y se eliminaron los volátiles al vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida en gel de sílice para dar el compuesto del título en forma de un sólido blanquecino.

35

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3): δ 7,17 (s, 1H), 6,27 (s, 1H), 3,82 (s, 3H), 3,53-3,73 (s a, 2H), 2,08 (s, 3H).

Preparación de N'-(4-bromo-5-metoxi-2-metil-fenil)-N-etil-N-metil-formamidina

40

A una suspensión de 4-bromo-5-metoxi-2-metil-anilina (1,4 g, 6,48 mmol) y *p*-tolueno ácido sulfónico (0,05 g, 0,32 mmol) en tolueno (13 ml) se añadió N-(dimetoximetil)-N-metil-etanamina (1,3 g, 9,7 mmol) a temperatura ambiente. La solución transparente resultante se calentó a 50 °C y se agitó durante 24 horas a esta temperatura. Después de enfriar hasta temperatura ambiente, la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo, se lavó con NaHCO_3 acuoso, salmuera y se secó sobre MgSO_4 . Los sólidos se retiraron mediante filtración y se eliminaron los volátiles al vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía ultrarrápida en gel de sílice para dar el compuesto del título en forma de un líquido amarillo.

45

^1H RMN (400 MHz, CDCl_3): δ 7,40 (s a, 1H), 7,26 (s, 1H), 6,33 (s, 1H), 3,85 (s, 3H), 3,34 (s a, 2H), 3,00 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 1,22 (t, 3H).

50

Preparación de N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-(2,2,2-trifluoroacetil)fenil]-N-metil-formamidina

55 Una solución de N'-(4-bromo-5-metoxi-2-metil-fenil)-N-etil-N-metil-formamidina (0,94 g, 3,30 mmol) en THF (7 ml) en atmósfera inerte se enfrió a -78 °C y se añadió *n*-butil litio (2,5 M en hexanos, 2,5 ml, 3,96 mmol) gota a gota. La solución resultante se curó durante 30 min a -78 °C, después se añadió 2,2,2-trifluoroacetato de etilo (1,40 g, 9,89 mmol), el matraz se retiró del baño de enfriamiento y se le dejó alcanzar la temperatura ambiente. La mezcla se inactivó con NH_4Cl ac. y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 , se filtró y se concentró al vacío hasta un aceite de color amarillo. Purificación mediante cromatografía sobre gel de sílice para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color amarillo claro.

60

^1H NMR (400 MHz, CDCl_3): δ 7,55 (s, 1H), 7,36-7,54 (m, 1H), 6,32 (s, 1H), 3,89 (s, 3H), 3,27-3,64 (m, 2H), 3,05 (s,

3H), 2,20 (s, 3H), 1,16-1,35 (m, 3H).

Preparación de N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2-(trifluorometil)oxiran-2-il]fenil]-N-metil-formamidina

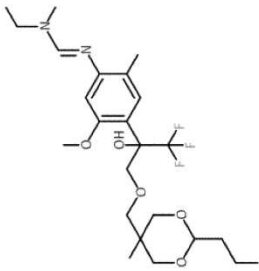
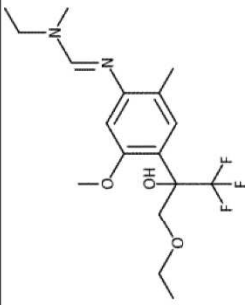
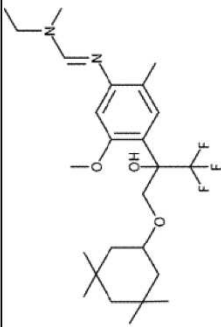
- 5 Se añadió yoduro de trimetil sulfonio (0,52 g, 2,48 mmol) en porciones pequeñas a una suspensión enfriada en hielo de hidruro de sodio (60 % en aceite, 0,11 g, 2,48 mmol) en tetrahidrofurano (8 ml) y dimetilsulfóxido (6 ml). El baño de refrigeración se eliminó y la mezcla se agitó durante 30 min a temperatura ambiente. Se añadió una solución de N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-(2,2,2-trifluoroacetil)fenil]-N-metil-formamidina (0,50 g, 1,65 mmol) en tetrahidrofurano (5 ml) y la reacción se agitó a temperatura ambiente hasta que la HPLC indicó la conversión completa del material de partida.
- 10 La mezcla se enfrió con un baño de hielo, se inactivó cuidadosamente con solución ac. de NH₄Cl y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO₄, se filtró y se concentró al vacío hasta un sólido de color pardo claro el cual se purificó mediante cromatografía sobre gel de sílice para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido de color pardo claro.
- 15 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃): δ 7,43 (br s, 1H), 7,20 (s, 1H), 6,31 (s, 1H), 3,81 (s, 3H), 3,40 (d, 1H), 3,15-3,66 (m, 2H), 3,00 (s, 3H), 2,95-2,93 (m, 1H), 2,18 (s, 3H), 1,21 (t, 3H).

Preparación de N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(isobutoximetil)-etil]fenil]-N-metil-formamidina

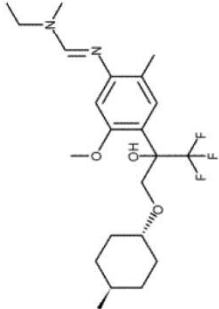
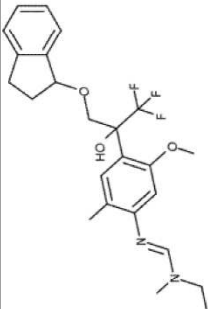
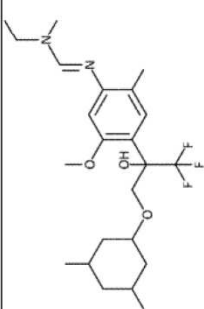
- 20 Se añadió 2-metilpropan-1-ol (0,11 g, 1,52 mmol) lentamente a una suspensión de hidruro de sodio (60 %, 0,04 g, 1,0 mmol) en DMF (1 ml) a 0 °C y la mezcla se curó durante 5 min a 0 °C. Se añadió una solución de N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2-(trifluorometil)oxiran-2-il]fenil]-N-metil-formamidina (0,20 g, 0,51 mmol) en DMF (1 ml), la solución resultante se calentó a 65 °C y se agitó a esta temperatura hasta que la HPLC indicó la conversión completa del material de partida. La reacción se enfrió a temperatura ambiente, se diluyó con solución ac. de NH₄Cl y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO₄, se filtró y se concentró al vacío hasta un aceite de color pardo. Purificación mediante cromatografía sobre gel de sílice para proporcionar el compuesto del título en forma de un líquido de color amarillo claro.
- 25 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃-d) δ 7,43 (br s, 1H), 7,31 (s, 1H), 6,34 (s, 1H), 5,49 (s, 1H), 4,13 (d, 1H), 3,89 (d, 1H), 3,83 (s, 3H), 3,17-3,59 (m, 4H), 3,00 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,81-1,98 (m, 1H), 1,21 (t, 3H), 0,88 (dd, 6H).

30

Tabla E: Datos físicos de los compuestos de fórmula (I)

Los compuestos de fórmula (I) en la Tabla E se prepararon usando técnicas análogas a las descritas anteriormente y/o técnicas sintéticas habituales conocidas generalmente por el experto en la materia, así como las descritas en el documento WO 12/146125 y en el documento WO 08/101682.						
Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.001	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-[(5-metil-2-propil-1,3-dioxan-5-il)metoximetil]etil]fenil]-N-metil-formamidina		1,34	492	A	
E.002	N'-[4-[1-(etoximetil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamidina		1,08	363	A	
E.003	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-[(3,3,5-tetrametilciclohexoxi)metil]etil]fenil]-N-metil-formamidina		1,64	473	A	

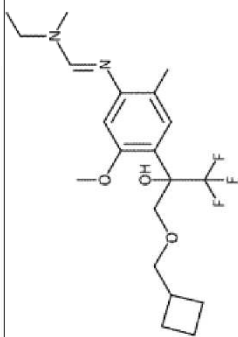
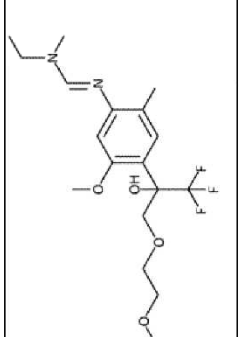
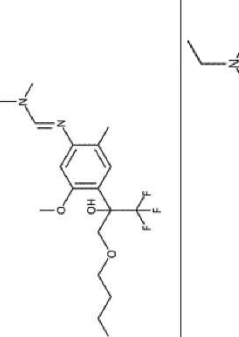
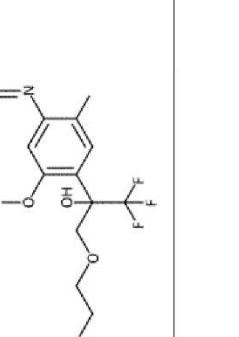
(continuación)

Los compuestos de fórmula (I) en la Tabla E se prepararon usando técnicas análogas a las descritas anteriormente y/o técnicas sintéticas habituales conocidas generalmente por el experto en la materia, así como las descritas en el documento WO 12/146125 y en el documento WO 08/101682.						
Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.004	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-[(4-metilciclohexoxi)metil]etil]fenil]-N-metil-formamidina		1,47	431	A	
E.005	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-[(indan-1-iloximetil)etil]fenil]-N-metil-formamidina		1,34	452	A	
E.006	N'-[4-[1-[(3,5-dimetilciclohexoxi)metil]-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamidina		1,50	446	A	
Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C

(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.007	N'-[4-[1-[1-(4-clorofenil)ciclopropil]metoximetil]-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		1,44	499	A	
E.008	N'-[4-[1-(2,2-dimetilpropoximetil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		1,37	406	A	
E.009	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(2-naftilmetoximetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		1,37	476	A	
E.010	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(indan-2-iloximetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		1,35	452	A	

(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.011	N'-[4-[1-(ciclobutylmetoximetil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		1,30	404	A	
E.012	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(2-metoxietoximetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		0,99	393	A	
E.013	N'-[4-[1-(butoximetil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		1,26	392	A	
E.014	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(propoximetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		1,16	377	A	

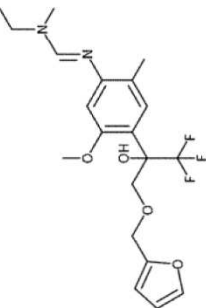
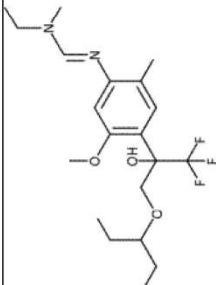
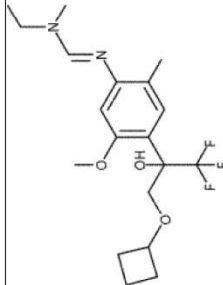
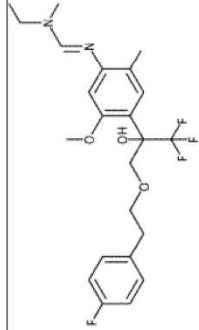
(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.015	N'-[4-[1-[(3-terc-butoxi-2,2-dimetil-propoxi)metil]-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamidina		1,54	478	A	
E.016	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-[2-(isopropilidenamino)oxietoximetil]etil]fenil]-N-metil-formamidina		1,12	435	A	
E.017	N-etil-N'-[4-[1-[(2-etil-5-metil-1,3-dioxan-5-il)metoximetil]-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-metil-formamidina		1,29	478	A	
E.018	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-[(3-metiloxetan-3-il)metoximetil]etil]fenil]-N-metil-formamidina		1,05	420	A	

(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.019	N'-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-[(3-metoxi-3-metil-butoxi)metil]etil]fenil]-N-metil-formamida		1,18	436	A	
E.020	N'-[4-[1-(2-etoxietoximetil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		1,08	408	A	
E.021	N'-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(2-feniloetoximetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		1,30	440	A	
E.022	N'-[4-[1-[2-(3,4-dimetoxifenil)etoximetil]-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		1,24	500	A	

(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.023	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-(2-furilmetoximetil)-1-hidroxietil]fenil]-N-metil-formamidina		1,14	416	A	
E.024	N-etil-N'-[4-[1-(1-etilpropoximetil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-metil-formamidina		1,40	405	A	
E.025	N-[4-[1-(ciclobutoximetil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamidina		1,18	389	A	
E.026	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-[2-(4-fluorofenil)etoximetil]-1-hidroxietil]fenil]-N-metil-formamidina		1,30	458	A	

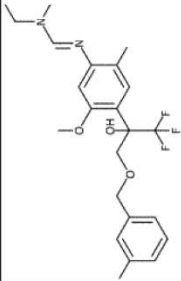
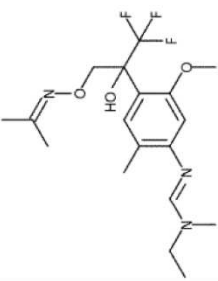
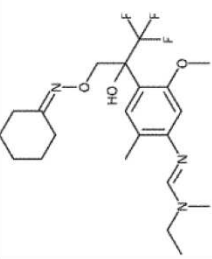
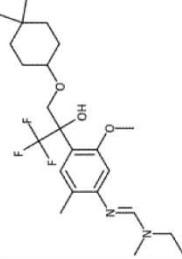
(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.027	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(p-tolilmetoximetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		1,31	440	A	
E.028	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(1-fenilettoximetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		1,31	440	A	
E.029	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(o-tolilmetoximetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		1,30	440	A	
E.030	N'-[4-[1-(2-alloxiotometil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		1,13	420	A	

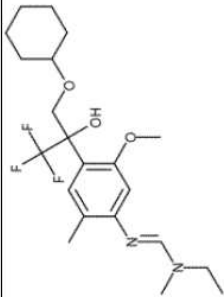
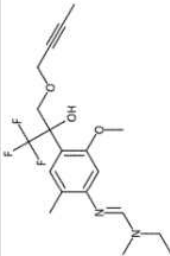
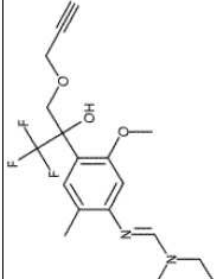
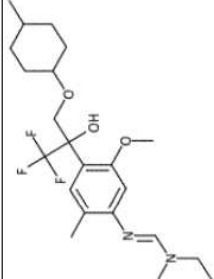
(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E. 031	N'-[4-[1-[(2,2-difluorociclopropil)metoximetil]-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		1,14	426	A	
E. 032	N'-[4-[1-(ciclopentoximetil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		1,33	403	A	
E. 033	N-etil-N'-[4-[1-[(4-etilciclohexoxi)metil]-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-metil-formamida		1,50	446	A	
E. 034	N-etil-N'-[4-[1-[(3-etiloxetan-3-il)metoximetil]-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-metil-formamida		1,15	433	A	

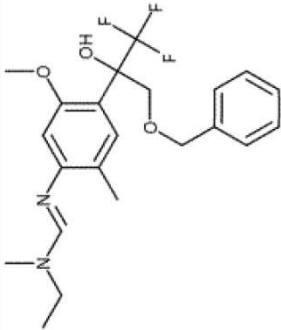
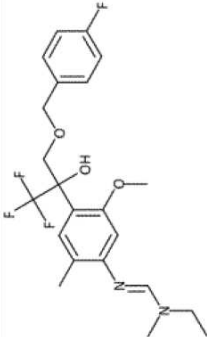
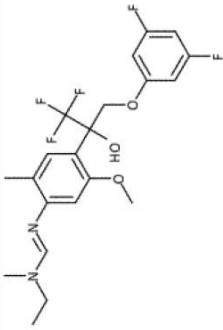
(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.035	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(m-tolilmetoximetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		1,32	440	A	
E.036	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-[(isopropilidenamino)oximetil]etil]fenil]-N-metil-formamida		0,76	390	B	
E.037	N'-[4-[1-[(ciclohexilidenamino)oximetil]-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,87	430	B	
E.038	N'-[4-[1-[(4,4-dimetilciclohexoxi)metil]-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,96	445	B	

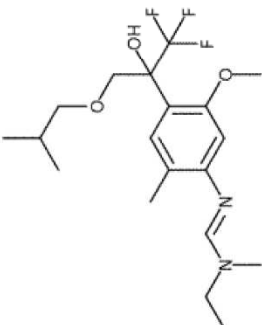
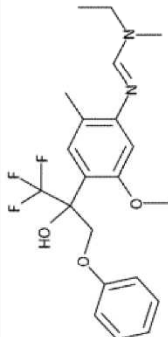
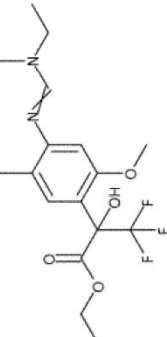
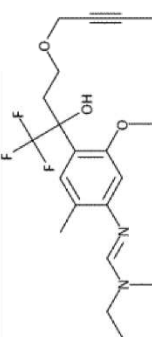
(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.039	N'-[4-[1-(ciclohexoximetil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,89	417	B	
E.040	N'-[4-[1-(but-2-inoximetil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,75	387	B	
E.041	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(prop-2-inoximetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		0,69	373	B	
E.042	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-[(4-metilciclohexoxi)metil]etil]fenil]-N-metil-formamida		0,92	431	B	

(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.043	N'-[4-[1-(benciloximetil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,81	425	B	
E.044	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2,2-trifluoro-1-[(4-fluorofenil)metoximetil]-1-hidroxi-etil]fenil]-N-metil-formamida		0,82	443	B	
E.045	N'-[4-[1-[(3,5-difluorofenoxi)metil]-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,82	447	B	86 - 89

(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.046	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(isobutoximetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		0,82	391	B	
E.047	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(fenoximetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		0,83	411	B	
E.048	2-[4-[[etil(metil)amino]metilenamino]-2-metoxi-5-metil-fenil]-3,3,3-trifluoro-2-hidroxi-propanoato de etilo		1,03	377	B	
E.049	N'-[4-[3-but-2-inoxi-1-hidroxi-1-(trifluorometil)propil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,78	401	B	

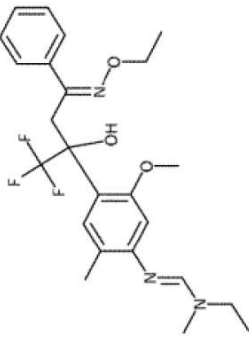
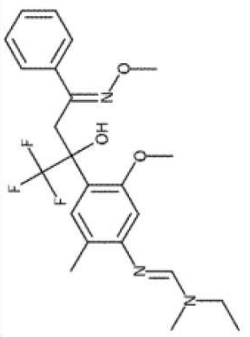
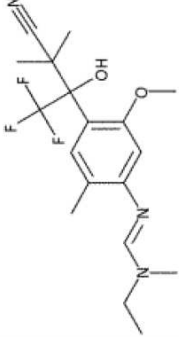
(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E. 050	N-etil-N'-[4-[1-hidroxi-3-prop-2-inoxi-1-(trifluorometil)propil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-metil-formamidina		0,73	397	B	
E. 051	N'-[4-[3-benciloxi-1-hidroxi-1-(trifluorometil)propil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamidina		0,86	439	B	
E. 052	N-etil-N'-[4-[1-hidroxi-3-propoxi-1-(trifluorometil)propil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-metil-formamidina			391		
E. 053	N-etil-N'-[4-[3-(4-fluorofenoxi)-1-hidroxi-1-(trifluorometil)propil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-metil-formamidina		0,84	443	B	

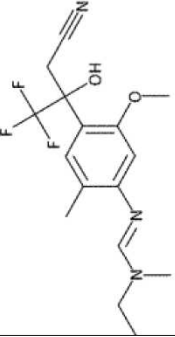
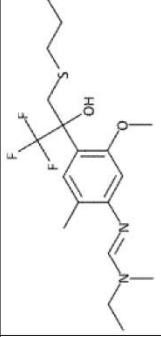
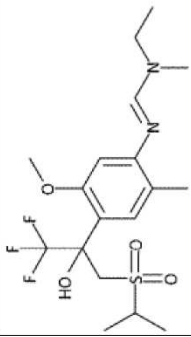
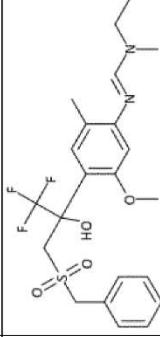
(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.054	N-etil-N'-[4-[1-hidroxí-3-fenoxi-1-(trifluorometil)propil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-metil-formamida		0.83	425	B	
E.055	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-(2,2,2-trifluoro-1-hidroxí-1-tetrahidropirano-4-il-etil)fenil]-N-metil-formamida		0.70	389	B	
E.056	N'-[4-[(3E)-3-etoxiimino-1-hidroxí-1-(trifluorometil)propil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0.76	390	B	
E.057	N'-[4-[(3E)-3-etoxiimino-1-hidroxí-1-(trifluorometil)butil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0.81	404	B	

(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.058	N'-[4-[(3Z)-3-etoxiimino-1-hidroxi-3-fenil-1-(trifluorometil)propil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,90	466	B	
E.059	N-etil-N'-[4-[(3Z)-1-hidroxi-3-metoxiimino-3-fenil-1-(trifluorometil)propil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-metil-formamida		0,86	452	B	105 - 107
E.060	N[4-[2-ciano-1-hidroxi-2-metil-1-(trifluorometil)propil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,74	372	B	90 - 93

(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.061	N'-[4-[1-(cianometil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,61	344	B	86 - 88
E.062	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(propilsulfonilmetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		0,80	393	B	
E.063	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(isopropilsulfonilmetil)etil]fenil]-N-metil-formamida			425		
E.064	N'-[4-[1-(benzilsulfonilmetil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,76	473	B	56 - 58

(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.065	N'-[4-[1-(benzenosulfonilmetil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,73	459	B	103 - 105
E.066	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(metilsulfonilometil)etil]fenil]-N-metil-formamida		0,59	397	B	
E.067	N-etil-N'-[4-[1-(etilsulfonilmetilo)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-metil-formamida			411		

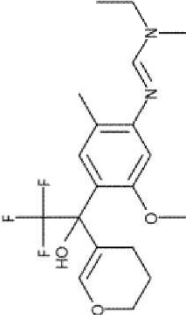
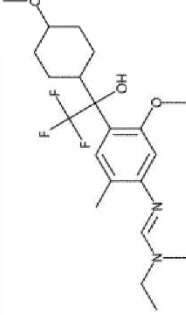
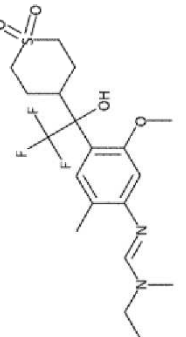
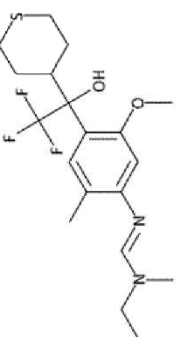
(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.068	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-[(4-fluorofenil)sulfanilmetil]-1-hidroxi-etil]fenil]-N-metil-formamida		0,84	445	B	
E.069	N'-[4-[1-(benzilsulfanilmetilo)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,86	441	B	
E.070	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-((metilsulfanilmetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		0,70	365	B	

(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.071	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(isopropilsulfanilmetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		0,78	393	B	
E.072	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(fenilsulfanilmetil)etil]fenil]-N-metil-formamida		0,81	427	B	
E.073	N-etil-N'-[4-[1-(etilsulfanilmetilo)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-metil-formamida		0,74	379	B	81 - 83

(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.074	N'-[4-[1-(3,4-dihidro-2H-piran-5-il)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamidina		0,75	387	B	115 116,6
E.075	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(4-metoxiciclohexil)etil]fenil]-N-metil-formamidina		0,76	417	B	
E.076	N'-[4-[1-(1,1-dioxotian-4-il)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamidina		0,62	437	B	
E.077	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-(2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-tetrahidrotiopiran-4-il-etil)fenil]-N-metil-formamidina		0,78	405	B	

(continuación)

Entrada	Nombre IUPAC	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] (medida)	Método	PF °C
E.078	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(4-isopropoxyciclohexil)etil]fenil]-N-metil-formamida		0,86, 0,90	446	B	
E.079	N-etil-N'-[5-metoxi-2-metil-4-[2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-1-(4-propoxyciclohexil)etil]fenil]-N-metil-formamida		0,87, 0,91	446	B	
E.080	N'-[4-[1-(4-etoxiciclohexil)-2,2,2-trifluoro-1-hidroxi-etil]-5-metoxi-2-metil-fenil]-N-etil-N-metil-formamida		0,81, 0,86	431	B	
E.081			0,86	466	B	

Método de HPLC usado

Método A:

- 5 Los espectros de masas se registraron en un espectrómetro de masas (ACQUITY UPLC) de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo simple SQD, SQDII) equipado con una fuente de electropulverización (Polaridad: iones positivos o negativos, capilar: 3,0 kV, intervalo del cono: 30 V, extractor: 3,00 V, temperatura de la fuente: 150 °C, temperatura de desolvatación: 400 °C, flujo del gas del cono: 60 l/h, flujo del gas de desolvatación : 700 l/h, intervalo de masas: de 140 a 800 Da), intervalo de longitudes de onda del DAD (nm): de 210 a 400 y un UPLC Acquity de Waters: desgasificador de disolventes, bomba binaria, compartimento térmico para la columna y detector de haz de diodos. Columna: UPLC HSS T3 de Waters, 1,8 µm, 30 x 2,1 mm, Temp: 60 °C, intervalo de longitudes de onda del DAD (nm): de 210 a 500, gradiente de disolventes: A = agua/metanol 9:1, ácido fórmico al 0,1 %, B= acetonitrilo + ácido fórmico al 0,1 %, gradiente: B al 0-100 % en 2,5 min; flujo (ml/min) 0,75

Método B:

- 15 Los espectros de masas se registraron en un espectrómetro de masas ACQUITY UPLC) de Waters 10 (espectrómetro de masas de cuadrupolo simple SQD, SQDII o ZQ) equipado con una fuente de electropulverización (Polaridad: iones positivos o negativos, Capilar: 3,00 kV, intervalo del cono: 30-60 V, extractor: 2,00 V, temperatura de la fuente: 150 °C, temperatura de desolvatación: 350 °C, flujo del gas del cono: 0 l/h, flujo del gas de desolvatación: 650 l/h; intervalo de masas: de 100 a 900 Da) y un UPLC Acquity de Waters: bomba binaria, compartimento térmico para la columna y detector de haz de diodos. 15 Desgasificador de disolventes, bomba binaria, compartimento térmico para la columna y detector de haz de diodos. Columna: UPLC HSS T3 de Waters, 1,8 mm, 30 x 2,1 mm, temp.: 60 °C, intervalo de longitudes de onda del DAD (nm): de 210 a 500, gradiente de disolventes: A = agua + MeOH al 5% + HCOOH al 0,05% , B= Acetonitrilo + HCOOH al 0,05 %, gradiente: B al 10-100% en 1,2 min; flujo (ml/min) 0,85

Ejemplos biológicos

- 30 *Blumeria graminis* f. sp. *tritici* (*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*) / disco de trigo / hoja preventivo (oídio del trigo)

- Se colocan segmentos foliares de trigo cv. Kanzler sobre agar en una placa de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizaron con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Los discos de hoja se inoculan agitando plantas infectadas con oídio sobre las placas del ensayo 1 día después de la aplicación. Los segmentos de hojas inoculados se incuban a 20 °C y un 60% de HR con un régimen de luz que consistía en 24 h de oscuridad seguidas de 12 h de luz/12 h de oscuridad en una cámara climática, y se determina la actividad de un compuesto como el porcentaje de control de la enfermedad, en comparación con los discos foliares no tratados, cuando se observó un nivel adecuado de daños debidos a la enfermedad en segmentos de hojas de control no tratados (6–8 días después de la aplicación).

- 40 Los siguientes compuestos dieron al menos 80 % de control de *Blumeria graminis* f. sp. *tritici* a 200 ppm en comparación con los controles sin tratar en las mismas condiciones, que mostraron un amplio desarrollo de la enfermedad:

- 45 E.001, E.002, E.005, E.006, E.007, E.008, E.009, E.010, E.011, E.012, E.013, E.014, E.015, E.016, E.017, E.018, E.019, E.020, E.021, E.022, E.023, E.025, E.026, E.027, E.028, E.029, E.030, E.031, E.033, E.034, E.035, E.036, E.037, E.038, E.039, E.040, E.041, E.042, E.043, E.044, E.045, E.046, E.047, E.049, E.050, E.051, E.052, E.053, E.054, E.055, E.056, E.057, E.058, E.059, E.060, E.061, E.062, E.063, E.064, E.065, E.067, E.068, E.069, E.070, E.071, E.072, E.073, E.074, E.075, E.078, E.079, E.080, E.081

- 50 *Phakopsora pachyrhizi* / soja/ preventivo (roya de la soja)

- Discos foliares de soja se colocan en agar en agua en placas multipocillo (formato de 24 pocillos) y se pulverizan con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Un día después de la aplicación los discos foliares se inoculan pulverizando una suspensión de esporas sobre su superficie foliar inferior. Tras un periodo de incubación en una cámara climática de 24-36 horas en la oscuridad a 20 °C y un 75% de HR, los discos foliares se mantienen a 20 °C con 12 h de luz/día y un 75% de HR. Se determina la actividad de un compuesto como porcentaje de control de la enfermedad comparado con los no tratados cuando se observa un nivel adecuado de daño por la enfermedad en discos foliares de control no tratados (12 - 14 días después de la aplicación).

- 60 Los siguientes compuestos dieron al menos 80 % de control de *Phakopsora pachyrhizi* a 200 ppm en comparación con los de control sin tratar en las mismas condiciones, que mostraron un amplio desarrollo de la enfermedad:
E.002, E.004, E.006, E.011, E.013, E.014, E.020, E.021, E.024, E.027, E.028, E.032, E.036, E.037, E.039, E.040, E.041, E.042, E.043, E.044, E.045, E.046, E.047, E.049, E.050, E.051, E.052, E.053, E.054, E.055, E.056, E.057, E.059, E.060, E.068, E.069, E.072, E.075, E.078, E.079, E.080, E.081

65

Puccinia recondita f. sp. Tritici / disco curativo de trigo / hoja (roya parda)

Se colocan segmentos foliares de trigo cv. Kanzler sobre agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos). Los segmentos foliares se inoculan con una suspensión de esporas del hongo. Las placas se almacenan en la oscuridad a 19 °C y un 75 % de HR. El compuesto formulado del ensayo diluido en agua se aplica 1 día después de la inoculación. Los segmentos de hojas se incuban a 19 °C y un 75% de HR con un régimen de luz que consistía en 12 h de luz/12 h de oscuridad en una cámara climática, y se determina la actividad de un compuesto como el porcentaje de control de la enfermedad, en comparación con los discos foliares no tratados, cuando se observó un nivel adecuado de daños debidos a la enfermedad en segmentos de hojas de control no tratados (6 – 8 días después de la aplicación).

Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 80% de control de *Puccinia recondita* f. sp. tritici a 200 ppm en comparación con los de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentaron un desarrollo considerable de la enfermedad:

E.001 , E.002 , E.005 , E.006 , E.007 , E.008 , E.009 , E.010 , E.011 , E.012 , E.013 , E.014 , E.015 , E.016 , E.017 , E.018 , E.019 , E.020 , E.021 , E.022 , E.023 , E.025 , E.026 , E.027 , E.028 , E.029 , E.030 , E.031 , E.033 , E.034 , E.035 , E.036 , E.037 , E.038 , E.039 , E.040 , E.041 , E.042 , E.046 , E.047 , E.049 , E.050 , E.051 , E.052 , E.053 , E.054 , E.055 , E.056 , E.057 , E.058 , E.059 , E.060 , E.061 , E.062 , E.063 , E.064 , E.065 , E.067 , E.068 , E.069 , E.074 , E.0075 , E.076 , E.078 , E.079 , E.080 , E.081

Puccinia recondita f. sp. tritici / disco preventivo de trigo / hoja (roya parda)

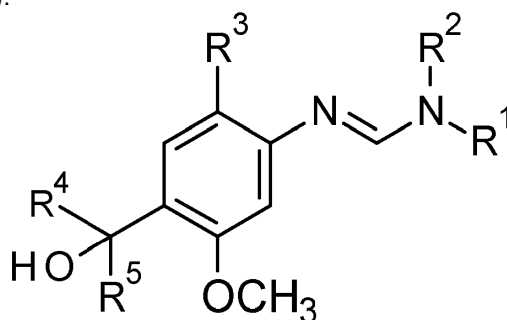
Se colocan segmentos foliares de trigo cv. Kanzler sobre agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizan con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Los discos foliares se inoculan con una suspensión de esporas del hongo 1 día después de la aplicación. Los segmentos foliares inoculados se incuban a 19 °C y 75% de HR en un régimen de luz de 12 h de luz / 12 h de oscuridad en una cámara climática y se determina la actividad de un compuesto como el porcentaje de control de la enfermedad en comparación con los no tratados cuando aparece un nivel adecuado de daños por la enfermedad en segmentos de hojas de control no tratados (7 - 9 días después de la aplicación).

Los siguientes compuestos proporcionaron al menos un 80% de control de *Puccinia recondita* f. sp. tritici a 200 ppm cuando se compararon con los de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentaron un desarrollo considerable de la enfermedad:

E.001 , E.002 , E.005 , E.006 , E.007 , E.008 , E.009 , E.010 , E.011 , E.012 , E.013 , E.014 , E.015 , E.016 , E.017 , E.018 , E.019 , E.020 , E.021 , E.023 , E.025 , E.026 , E.027 , E.028 , E.029 , E.030 , E.031 , E.033 , E.034 , E.035 , E.036 , E.037 , E.038 , E.039 , E.040 , E.041 , E.042 , E.043 , E.044 , E.045 , E.046 , E.047 , E.049 , E.050 , E.051 , E.052 , E.053 , E.054 , E.055 , E.056 , E.057 , E.058 , E.059 , E.060 , E.061 , E.063 , E.064 , E.065 , E.067 , E.068 , E.069 , E.070 , E.071 , E.072 , E.073 , E.074 , E.075 , E.078 , E.079 , E.080 , E.081

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



(I)

donde,

R¹ y R² se seleccionan cada uno independientemente de alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆; o

R¹ y R² junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un grupo cíclico saturado de tres a seis miembros, que opcionalmente pueden contener un átomo de oxígeno o un átomo de azufre;

R³ es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆;

R⁴ es haloalquilo C₁-C₄;

R⁵ es C₃-C₈ cicloalquilo donde el cicloalquilo está sustituido con de 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, halógeno, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆, alqueniloxi C₃-C₆, alquililoxi C₃-C₆, ariloxi, =N-OR⁹ o

R⁵ es cicloalquilo C₃-C₈ donde el grupo cíclico contiene uno o dos átomos de oxígeno o azufre no contiguos o donde uno de los miembros en el anillo representa SO o SO₂ o

R⁵ es alquiloalcarbonilo C₁-C₆ o

R⁵ es alquilo C₁-C₆ donde el alquilo está sustituido con 1 o 2 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ alquiloxi (C₁-C₆), haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆ (donde el grupo cicloalquilo opcionalmente contiene uno o dos átomos de oxígeno o azufre no contiguos o donde uno de los miembros en el anillo opcionalmente representa SO o SO₂ y donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con de uno a cuatro grupos independientemente seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₆, alquiloxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y/o un fenilo (donde el fenilo está él mismo opcionalmente sustituido con halógeno)), cicloalquil C₃-C₆alquiloxi (C₁-C₆) (donde el grupo cicloalquilo opcionalmente contiene uno o dos átomos de oxígeno o azufre no contiguos o donde uno de los miembros en el anillo opcionalmente representa SO o SO₂ y donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con de uno a cuatro grupos independientemente seleccionados de halógeno, alquilo C₁-C₆, alquiloxi C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ y/o un fenilo (donde el fenilo está él mismo opcionalmente sustituido con halógeno)), benzociclopentaniloxi, benzociclohexaniloxi, alqueniloxi C₃-C₆, alquililoxi C₃-C₆, alquililoxi C₁-C₄, haloalquililoxi C₁-C₄, cicloalquililoxi C₃-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₄, arilsulfonilo (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), arilalquilsulfonilo (C₁-C₄) (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), ariltio (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), arilalquiltio (C₁-C₄) (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), ariloxi (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), heteroariloxi (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con de uno a cuatro R⁶), Si(alquil C₁-C₄)₃alcoxi C₁-C₄, arilalquiloxi (C₁-C₄) (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), heteroarilalquiloxi (C₁-C₄) (donde el heteroarilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), =N-OR⁹, -ON=C(R⁷)(R⁸), -O-(alquil C₁-C₆)-O-N=C(R⁷)(R⁸), -N(OR⁹)R¹⁰ o

R⁵ es -CH₂C(=N-OR⁹)- alquilo C₁-C₂ o -CH₂C(=N-OR⁹)-fenilo;

cada R⁶ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆, alquililoxi C₁-C₄, haloalquililoxi C₁-C₄, cicloalquililoxi C₃-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, haloalqueniloxi C₂-C₆, alquililoxi C₂-C₆, cicloalquil C₃-C₆alquililoxi C₂-C₆, alquililoxi C₂-C₆, arilo, ariloxi, heteroarilo, heteroariloxi;

R⁷ y R⁸ se selecciona cada uno independientemente de hidrógeno, alquilo C₁-C₄, arilo (donde el arilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶) y cicloalquilo C₃-C₈ o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un grupo cíclico saturado de cuatro a ocho miembros el cual opcionalmente puede contener uno átomo de oxígeno o uno de azufre;

R⁹ es alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquililoxi C₃-C₆, arilalquilo (C₁-C₄) o cicloalquilo C₃-C₈ y

R¹⁰ es alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquililoxi C₃-C₆, arilalquilo (C₁-C₄), arilo o cicloalquilo C₃-C₈ o

R⁹ y R¹⁰ junto con el átomo de nitrógeno y de oxígeno al cual están unidos forman un grupo cíclico saturado de cuatro a seis miembros

o un enantiómero, sal o N-óxido del mismo.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde R¹ y R² se selecciona cada uno independientemente entre

alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o 2, donde R³ es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆.

4. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2 o 3, donde R⁴ es haloalquilo C₁-C₃.

5. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3 o 4 donde R⁵ es cicloalquilo C₃-C₆ donde el cicloalquilo está sustituido con de 1 a 3 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, halógeno, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆, alqueniloxi C₃-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, feniloxi, =N-OR⁹ o R⁵ es alquilo C₁-C₆ donde el alquilo está sustituido con de 1 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆, alqueniloxi C₃-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), piridiniloxi (donde el piridinilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), Si(alquil C₁-C₄)₃alcoxi C₁-C₄, fenilalquiloxi (C₁-C₄) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con de uno a tres grupos R⁶), =N-OR⁹, -O-N=C(R⁷)(R⁸), -N(OR⁹)R¹⁰, donde cada R⁶ se selecciona independientemente de fluoro, cloro, ciano, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₂, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalquiloxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₃, haloalquiltio C₁-C₃, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilsulfinilo C₁-C₃, haloalquilsulfinilo C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, haloalquilsulfonilo C₁-C₃, alquilcarbonilo C₁-C₃, alquenilo C₂-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alqueniloxi C₂-C₄, haloalqueniloxi C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquil C₃-C₆alquinilo C₂-C₄, alquiniloxi C₂-C₄, fenilo, feniloxi; R⁷ y R⁸ se selecciona cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₄, fenilo (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶) y cicloalquilo C₃-C₆ o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un grupo cíclico saturado de cuatro a seis miembros el cual opcionalmente puede contener un átomo de oxígeno o uno de azufre o R⁵ es -CH₂C(=N-OR⁹)- alquilo C₁-C₂ o -CH₂C(=N-OR⁹)-fenilo; R⁹ es alquilo C₁-C₆ o fenilalquilo (C₁-C₄) y R¹⁰ es alquilo C₁-C₆, fenilalquilo (C₁-C₄), fenilo o cicloalquilo C₃-C₆ o R⁹ y R¹⁰ junto con los átomos de nitrógeno y oxígeno a los que están unidos forman un grupo cíclico saturado de cinco a seis miembros.

6. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4 o 5, donde R¹ y R² se selecciona cada uno independientemente metilo, etilo, propilo o isopropilo.

7. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las realizaciones 1, 2, 3, 4, 5 o 6, donde R³ es hidrógeno, fluoro, metilo, etilo o ciclopropilo.

8. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6 o 7, donde R⁴ es trifluorometilo, pentafluoroetilo o clorodifluorometilo.

9. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 u 8, donde R⁵ es cicloalquilo C₄-C₆ donde el cicloalquilo está sustituido con 1 o 2 sustituyentes independientemente seleccionados de ciano, fluoro, cloro, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-C₆, alqueniloxi C₃-C₄, alquiniloxi C₃-C₄, feniloxi, =N-OR⁹ o R⁵ es alquilo C₁-C₃ donde el alquilo está sustituido con de 1 a 2 sustituyentes independientemente seleccionados de alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₂, cicloalquiloxi C₃-C₆, alqueniloxi C₃-C₄, alquiniloxi C₃-C₄, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), fenilalquiloxi (C₁-C₂) (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), =N-OR⁹, -O-N=C(R⁷)(R⁸), donde cada R⁶ se selecciona independientemente de fluoro, cloro, metilo, etilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, ciclopropilo, metiltio, trifluorometiltio, metilsulfinilo y etinilo; R⁷ se selecciona de alquilo C₁-C₄, fenilo (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶) y cicloalquilo C₃-C₆; R⁸ es alquilo C₁-C₄ o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un grupo cíclico saturado de cuatro a seis miembros o R⁵ es -CH₂C(=N-OR⁹)- alquilo C₁-C₂ o -CH₂C(=N-OR⁹)-fenilo y R⁹ es alquilo C₁-C₄ o fenilalquilo (C₁-C₂).

10. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 o 9, R¹ es metilo o etilo; R² es metilo, etilo, propilo o isopropilo; y R³ es hidrógeno, metilo o etilo.

11. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde R¹ es metilo o etilo;

R² es metilo, etilo, propilo o isopropilo;

R³ es hidrógeno, metilo o etilo;

R⁴ es trifluorometilo o clorodifluorometilo;

R⁵ es cicloalquilo C₄-C₆ donde el cicloalquilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de fluoro, cloro, metoxi, etoxi, ciclopropoxi, aliloxi, propargiloxi, =N-OR⁹ o R⁵ es alquilo C₁-C₃ donde el alquilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de alcoxi C₁-C₄, trifluorometoxi, difluorometoxi, cicloalquiloxi C₃-C₆, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶), benciloxi (donde el fenilo del grupo bencilo está opcionalmente sustituido con un grupo R⁶) y =N-OR⁹;

cada R⁶ se selecciona independientemente de fluoro, cloro, metilo, trifluorometoxi, difluorometoxi, ciclopropilo y metiltio o

R⁵ es -CH₂C(=N-OR⁹)- alquilo C₁-C₂ o -CH₂C(=N-OR⁹)-fenilo;

y R⁹ es alquilo C₁-C₄ o bencilo o un enantiómero, sal o N-óxido del mismo.

12. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde

R¹ es metilo o etilo;

5 R² es etilo, propilo o isopropilo;

R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es trifluorometilo o clorodifluorometilo;

R⁵ es ciclobutilo o ciclohexilo donde el ciclobutilo o ciclohexilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de metoxi, etoxi, ciclopropoxi, aliloxi, propargiloxi, =NOR⁹ o

10 R⁵ es metilo, etilo, propilo o isopropilo, donde el metilo, etilo, propilo o isopropilo está sustituido con 1 sustituyente seleccionado de alcoxi C₁-C₄, cicloalquiloxi C₃-C₆, feniloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos R⁶) y benciloxi (donde el fenilo del grupo bencilo está opcionalmente sustituido con un grupo R⁶) o

R⁵ es -CH₂C(=N-OR⁹)- alquilo C₁-C₂ o -CH₂C(=N-OR⁹)-fenilo;

cada R⁶ se selecciona independientemente de fluoro, cloro y metilo y

15 R⁹ es alquilo C₁-C₄ o bencilo o un enantiómero, sal o N-óxido del mismo.

13. Una composición que comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de fórmula

(I) según se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 – 12.

20 14. Una composición de acuerdo con la reivindicación 13, donde la composición comprende además al menos un principio activo adicional y/o un diluyente.

15. Un método para combatir, prevenir o controlar enfermedades fitopatogénicas, que comprende aplicar a un fitopatógeno, al locus de un fitopatógeno o a una planta susceptible de ser atacada por un fitopatógeno, o a material de propagación de la misma, una cantidad fungicidamente eficaz de un compuesto de fórmula (I) como se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 - 12 o una composición que comprende una cantidad fungicidamente eficaz de un compuesto de fórmula (I) como se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 - 12.

25