

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 397 963**

51 Int. Cl.:

C07D 451/02 (2006.01)

C07D 451/04 (2006.01)

C07D 451/06 (2006.01)

C07D 519/00 (2006.01)

A01N 43/90 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

A01P 7/00 (2006.01)

A01P 9/00 (2006.01)

A01P 5/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **10.07.2008** **E 08773955 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.10.2012** **EP 2167503**

54 Título: **Derivados de tropano útiles como plaguicidas**

30 Prioridad:

12.07.2007 GB 0713602

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

12.03.2013

73 Titular/es:

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (50.0%)

SCHWARZWALDALLEE 215

4058 BASEL, CH y

SYNGENTA LIMITED (50.0%)

72 Inventor/es:

SELLES, PATRICE;

CLARKE, ERIC, DANIEL;

ELLIOTT, ALISON, CLARE;

FAWKE, DELPHINE, RAYMONDE, SUZANNE;

HUETER, OTTMAR, FRANZ;

MUELLER, URS;

RENOLD, PETER;

TARGETT, SARAH, MARGARET y

WHITTINGHAM, WILLIAM, GUY

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 397 963 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

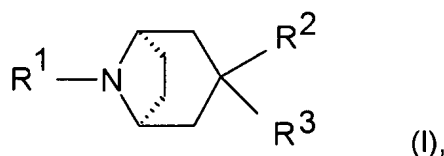
Derivados de tropano útiles como plaguicidas

El presente invento se refiere a unos derivados de tropano, a unos procedimientos para prepararlos, a unas composiciones plaguicidas, en particular fungicidas, insecticidas, acaricidas, molusquicidas y nematocidas que los comprenden y a unos métodos para aplicarlas a una planta con el fin de combatir y reprimir plagas de hongos, insectos, ácaros, moluscos y nematodos. El presente invento se refiere también al uso de un compuesto de la fórmula (I) en la producción de un medicamento destinado a reprimir plagas en animales domésticos y en el ganado productivo.

Se describen ciertos derivados de tropano con actividad insecticida, por ejemplo, en los documentos de solicitudes de patentes internacionales WO-A-2006/100037 y WO 96/37494. El documento WO 01/44249 y el de solicitud de patente europea EP-A-435381 describen ciertos derivados de tropano con actividad farmacéutica.

Se han encontrado ahora unos nuevos derivados de tropano que tienen propiedades fungicidas e insecticidas, acaricidas, molusquicidas y nematocidas.

Por lo tanto, el presente invento proporciona unos compuestos de fórmula (I)



en la que

R¹ es pirimidinilo, quinazolinilo o tienopirimidinilo, en donde estos anillos están sustituidos opcionalmente con alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, alquiltio de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, halógeno, ciano o alquil de C₁₋₄-carbonilo

R³ conjuntamente con **R²** forman un radical de la fórmula =CH-R⁴, en la que **R⁴** es fenilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, o halógeno, o **R⁴** es aliloximetilo o fenoximetilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, o halógeno, o **R⁴** es piridiloximetilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C₁₋₄, o **R⁴** es pirimidiniloximetilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C₁₋₄, o **R⁴** es alquil de C₁₋₆-carbonilo, alquil de C₁₋₄-aminocarbonilo, bencilaminocarbonilo, fenilaminocarbonilo, que opcionalmente está sustituido con halógeno, piridilaminocarbonilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C₁₋₄, o piridazinaminocarbonilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C₁₋₄ o halógeno, o

R³ conjuntamente con **R²** forman un radical de la fórmula =N-O-(CH₂)_n-R⁵, en donde **n** es 0 ó 1, o **R⁵** es alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, alquenilo de C₂₋₄ o alquinilo de C₂₋₄, o **R⁵** es fenilo, piridilo u oxadiazolilo, en donde estos anillos están opcionalmente sustituidos con alquilo de C₁₋₄, alcoxi de C₁₋₄, haloalquilo de C₁₋₄, halógeno o -SO₂alquilo de C₁₋₄,

o sales o N-óxidos de los mismos.

Los compuestos de fórmula (I) pueden existir en diferentes isómeros geométricos u ópticos o formas tautoméricas. Este invento cubre todos dichos isómeros y tautómeros y mezclas de los mismos en todas las proporciones así como unas formas isotópicas tales como compuestos deuterados.

Cada resto de alquilo, ya sea a solas o como una parte de un grupo de mayor tamaño (tal como alcoxi, alquilcarbonilo, es una cadena lineal o ramificada y es, por ejemplo, metilo, etilo, n-propilo, n-butilo, n-pentilo, n-hexilo, iso-propilo, n-butilo, sec-butilo, iso-butilo, terc-butilo o neo-pentilo. Los grupos alquilo son apropiadamente grupos alquilo de C₁-C₄.

Un halógeno es fluoro, cloro, bromo o yodo.

Los grupos y compuestos que contienen carbono, sustituidos con halógeno, tales como por ejemplo un alquilo sustituido con halógeno, pueden ser halogenados parcialmente o perhalogenados, en donde en el caso de una polihalogenación los sustituyentes halógenos pueden ser idénticos o diferentes. Ejemplos de haloalquilo son metilo, que está desde mono- hasta trisustituido con fluoro, cloro y/o bromo, tal como CHF₂ ó CF₃; etilo que está desde mono- hasta penta-sustituido con fluoro, cloro y/o bromo, tal como CH₂CF₃, CF₂CF₃, CF₂CCl₃, CF₂CHCl₂, CF₂CHF₂, CF₂CFCl₂, CF₂CHBr₂, CF₂CHClF, CF₂CHBrF o CCIFCHClF; un propilo o isopropilo, que está desde mono- hasta hepta-sustituido con fluoro, cloro y/o bromo, tal como CH₂CHBrCH₂Br, CF₂CHF₂CF₃, CH₂CF₂CF₃, CF(CF₃)₂ o CH(CF₃)₂; un butilo o uno de sus isómeros, que están desde mono- hasta nona-sustituidos con fluoro, cloro y/o bromo, tal como CF(CF₃)CHFCF₃ o CH₂(CF₂)₂CF₃.

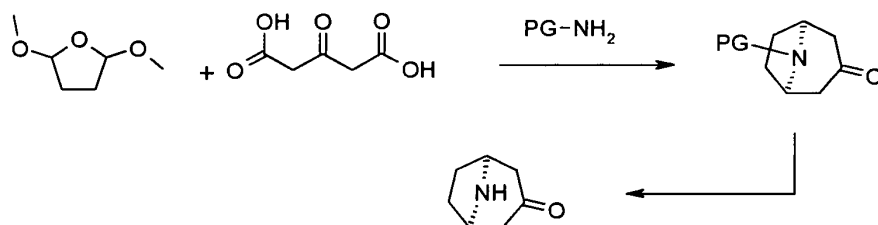
De manera sumamente preferible, R^1 es tienopirimidinilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} , que opcionalmente está sustituido adicionalmente, alcoxi de C_{1-4} , alquiltio de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halógeno, ciano o alquil de C_{1-4} -carbonilo.

De manera preferible, R^4 es fenilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} , alcoxi de C_{1-4} , o halógeno.

- 5 De manera preferible, R^5 es fenilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} , alcoxi de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , o halógeno, o R^5 es oxadiazolilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} .

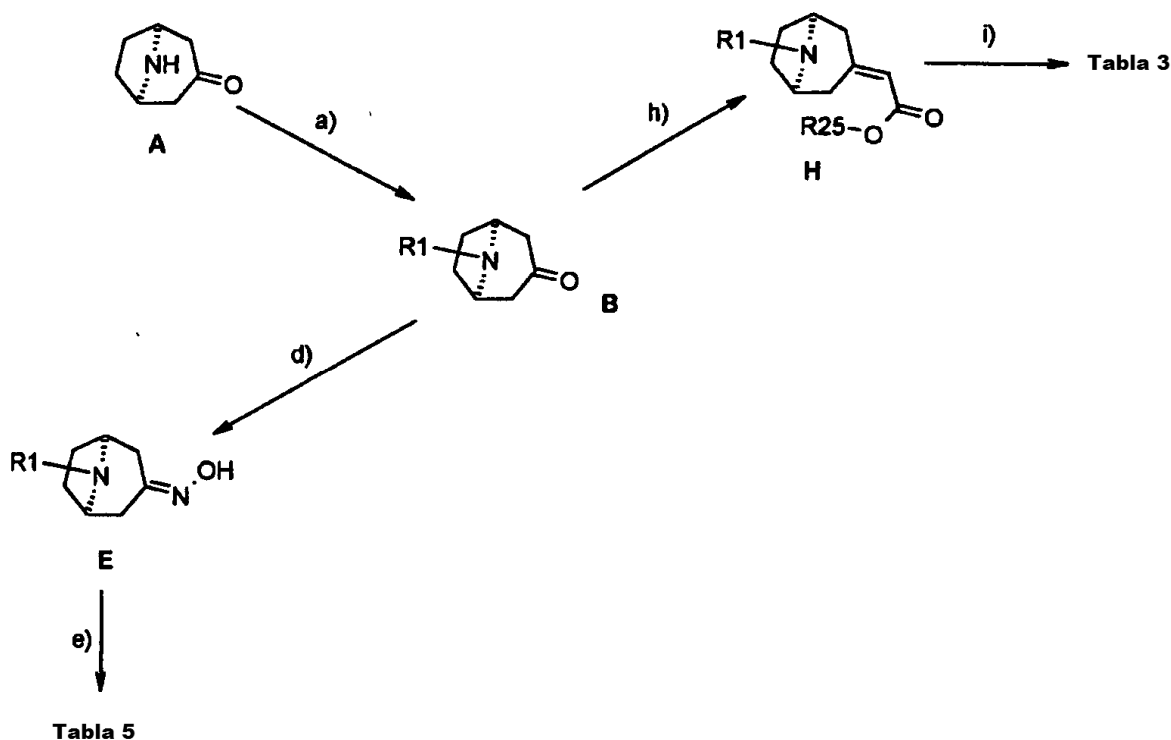
Los compuestos del invento se pueden preparar de una diversidad de maneras. En la sección que sigue, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 y n son como se han definido para la fórmula (I) anterior, a menos que se señale otra cosa distinta.

- 10 Los compuestos del invento se pueden preparar a partir de un material de partida fácilmente disponible. El compuesto de la fórmula general (I) se puede preparar mediante una reacción del estado de la técnica, presentada seguidamente, pero también por otros métodos descritos en la bibliografía. El anillo de tropano, en donde **PG** es un grupo protector tal como bencilo, metilo, BOC, se puede preparar mediante un material de partida fácilmente disponible siguiendo la síntesis de Robinson (J. Chem. Soc., 1917, 111, 762) o una síntesis de Robinson modificada (Synlett, 2004, 1, 143-145) ilustrada como ejemplo en el siguiente esquema.



- 15 El grupo protector se puede eliminar desde el anillo de tropano por métodos usuales descritos en la obra Protective groups in Organic Synthesis [Grupos protectores en síntesis orgánicas] (Greene y Wuts, tercera edición, Wiley Interscience, 1999) para preparar la tropinona libre o la correspondiente sal (generalmente de HBr ó HCl) dependiendo de la metodología de desprotección.

- 20 La preparación de compuestos de fórmula general (I) se puede conseguir entonces por medio de la secuencia descrita en el siguiente esquema a partir de la tropinona previamente descrita:



a) La tropinona A en la forma de amina libre o de una sal de la misma se puede hacer reaccionar en condiciones básicas; típicamente con NaH, K₂CO₃, Na₂CO₃, Cs₂CO₃, NaOH, LiOH en el seno de un disolvente polar tal como DMF, DMAC, THF, NMP con un sistema anular activado R¹-X en donde R¹ ya se había descrito y X puede ser un halógeno (Cl, I, Br, F) o un triflato a unas temperaturas que van desde la ambiente hasta las de los puntos de ebullición de los correspondientes disolventes con el fin de generar el tropano sustituido de fórmula B.

Alternativamente, la tropinona se puede hacer reaccionar con el mismo R¹-X en una reacción de acoplamiento catalítico con un metal en la presencia de un catalizador basado en especies químicas de paladio (p.ej. Pd(TPP)₄), con una base, tal como una amina (p.ej. trietilamina) o un carbonato de metal alcalino (p.ej. K₂CO₃, Na₂CO₃, Cs₂CO₃) en el seno de un disolvente tal como tolueno, DMF (dimetilformamida) a una temperatura que va desde la ambiente hasta 140°C.

d) El compuesto de la fórmula B puede ser transformado en las correspondientes oximas de fórmula E haciéndolo reaccionar con hidrocloreto de hidroxilamina en la presencia de un carbonato de metal alcalino (p.ej. K₂CO₃) o de una base orgánica (p.ej. trietilamina, piridina) en el seno de un disolvente alcohólico tal como iPrOH o alternativamente agua a una temperatura que va desde -20°C hasta la del punto de ebullición del disolvente usado.

e) Las oximas de fórmula E pueden ser fácilmente alquiladas en condiciones básicas; típicamente con NaH, K₂CO₃, Na₂CO₃, Cs₂CO₃, NaOH, LiOH en el seno de un disolvente polar tal como DMF, DMAC, THF, NMP con un sistema R⁵-X activado en donde R⁵ es como ya se ha descrito y X puede ser un halógeno (Cl, I, Br, F) u otro grupo lábil (p.ej. mesilato, N₂⁺) a unas temperaturas que van desde la ambiente hasta la de los puntos de ebullición de los correspondientes disolventes para generar el tropano sustituido de fórmula general que se describe en la Tabla 5.

La tropinona del tipo H se puede preparar por una reacción de condensación del tipo de Knoevenagel de una tropinona del tipo B con un malonato. En toda esta reacción, los dos posibles isómeros podrían ser tratados adicionalmente como una mezcla o ser aislados por separado.

El éster H puede ser reducido en la presencia de un hidruro metálico (p.ej. LiAlH₄) en el seno de un disolvente aprótico (p.ej. tolueno, THF) para generar el alcohol alílico. Estos alcoholes alílicos pueden ser activados y hechos reaccionar para generar los compuestos enumerados en la Tabla 3.

Deberá reconocerse que algunos reaccionantes y algunas condiciones de reacción pueden no ser compatibles con ciertas funcionalidades que pueden estar presentes en las moléculas descritas. En dichos casos puede ser necesario emplear unos protocolos clásicos de protección/desprotección que se informan detalladamente en la bibliografía y son bien conocidos para una persona experta en la especialidad.

Además, en algunos casos puede ser necesario realizar otras etapas de síntesis rutinarias, no descritas aquí, con el fin de completar la síntesis de los compuestos deseados. Un profesional experto reconocerá también que puede ser posible conseguir la síntesis de los compuestos deseados por realización de algunas de las etapas de estas rutas sintéticas en un orden diferente al que se ha descrito.

Una persona experta en la especialidad reconocerá también que puede ser posible realizar unas clásicas interconversiones de grupos funcionales o reacciones de sustitución en los compuestos descritos aquí, con el fin de introducir o modificar los sustituyentes.

Los compuestos de fórmula (I) se pueden usar para combatir y reprimir infestaciones por plagas de insectos tales como Lepidópteros, Dípteros, Hemípteros, Tisanópteros, Ortópteros, Dictiópteros, Coleópteros, Sifonápteros, Himenópteros y también otras plagas de invertebrados, por ejemplos plagas de ácaros, nematodos y moluscos. Los insectos, ácaros, nematodos y moluscos son citados colectivamente en lo sucesivo como plagas. Las plagas que se pueden combatir y reprimir mediante el uso de los compuestos del invento incluyen aquellas plagas que están asociadas con la agricultura (cuyo término incluye el crecimiento de plantas cultivadas para proporcionar productos alimenticios y fibrosos), con la horticultura y economía de animales, con animales de compañía, bosques y con el almacenamiento de productos de origen vegetal (tales como frutas, granos y madera); las plagas que están asociadas con el deterioro de estructuras producidas por el hombre y la transmisión de enfermedades de seres humanos y animales y también plagas molestas (tales como moscas).

Ejemplos de especies de plagas que pueden ser reprimidas por los compuestos de fórmula (I) incluyen: *Mizas persicae* (áfido), *Aphis gossypii* (áfido), *Aphis fabae* (áfido), *Lygus* spp. (chinches), *Dysdercus* spp. (chinches), *Nilaparvata lugens* (delfácido), *Nephotettix inciticeps* (cicadela), *Nezara* spp. (pudentas), *Euschistus* spp. (pudentas), *Leptocoris* spp. (pudentas), *Frankliniella occidentalis* (trip), *Thrips* spp. (trips), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata de Colorado), *Anthonomus grandis* (oruga de las cápsulas), *Aonidiella* spp. (insectos cócidos), *Trialeurodes* spp. (moscas blancas), *Bemisia tabaci* (mosca blanca), *Ostrinia nubilalis* (piral del maíz), *Spodoptera littoralis* (cicadela del algodón), *Heliothis virescens* (gusano de las yemas del tabaco), *Helicoverpa armigera* (gusano del algodón), *Helicoverpa zea* (gusano del algodón), *Sylepta derogata* (enrollador de hojas del algodón), *Pieris brassicae* (mariposa blanca), *Plutella xylostella* (palomilla de dorso de diamante), *Agrotis* spp. (agrotis), *Chilo suppressalis* (barrenador de tallos de arroz), *Locusta migratoria* (langosta), *Chortiocetes terminifera* (langosta), *Diabrotica* spp. (gusanos de las raíces), *Panonychus ulmi* (ácaro rojo europeo), *Panonychus citri* (ácaro

rojo del limonero), *Tetranychus urticae* (arácnido de dos motas), *Tetranychus cinnabarinus* (arácnido carmín), *Phyllocoptruta oleivora* (ácaro de la sarna del limonero), *Polyphagotarsonemus latus* (ácaro ancho), *Brevipalpus* spp. (ácaros aplanados), *Boophilus microplus* (garrapata de ganado), *Dermacentor variabilis* (garrapata americana de perros), *Ctenocephalides felis* (pulga de gatos), *Liriomyza* spp. (gusano barrenador), *Musca domestica* (mosca doméstica), *Aedes aegypti* (mosquito), *Anopheles* spp. (mosquitos), *Culex* spp. (mosquitos), *Lucilia* spp. (moscardas), *Blattella germanica* (cucaracha), *Periplaneta americana* (cucaracha), *Blatta orientalis* (cucaracha), termatas de las Mastotermitidae (por ejemplo *Mastotermes* spp.), de las Kalotermitidae (por ejemplo *Neotermes* spp.), de las Rhinotermitidae (por ejemplo *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes flavipes*, *R. speratu*, *R. virginicus*, *R. hesperus*, y *R. santonensis*) y de las Termitidae (por ejemplo *Globitermes sulphureus*), *Solenopsis geminata* (hormiga de fuego), *Monomorium pharaonis* (hormiga faraón), *Damalinia* spp. y *Linognathus* spp. (piojos mordedores y chupadores), *Meloidogyne* spp. (nematodos de nudos de raíces), *Globodera* spp. y *Heterodera* spp. (nematodos de quistes), *Pratylenchus* spp. (nematodos de lesiones), *Rhodopholus* spp. (nematodos horadores de bananas), *Tylenchulus* spp. (nematodos del limonero), *Haemonchus contortus* (barber pole worm), *Caenorhabditis elegans* (*anguilula del vinagre*), *Trichostrongylus* spp. (nematodos gastrointestinales) y *Deroceras reticulatum* (babosa).

El invento proporciona por lo tanto un método de combatir y reprimir insectos, ácaros, nematodos y moluscos, que comprende aplicar una cantidad eficaz como insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida de un compuesto de la fórmula (I), o una composición que contiene un compuesto de la fórmula (I), a una planta susceptible de ataque por una plaga. Los compuestos de fórmula (I) se usan de manera preferible contra insectos, ácaros o nematodos.

El término "planta", como se usa en el presente contexto, incluye plántulas, arbustos y árboles.

Con el fin de aplicar un compuesto de la fórmula (I) como un insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida a una plaga, al sitio (locus) donde está una plaga, o a una planta susceptible de ataque por una plaga, un compuesto de la fórmula (I) se formula usualmente para dar una composición que incluye, además del compuesto de la fórmula (I), un apropiado diluyente o vehículo inerte y, opcionalmente, un agente activo superficialmente (SFA, acrónimo de surface active agent). Los SFA's son unos productos químicos que son capaces de modificar las propiedades de una interfase (por ejemplo interfases entre un líquido y un sólido, entre un líquido y aire o entre un líquido y otro líquido) disminuyendo la tensión interfacial y conduciendo de esta manera a cambios en otras propiedades (por ejemplo dispersamiento, emulsionamiento y humectación). Se prefiere que todas las composiciones (formulaciones tanto sólidas como líquidas) comprendan, en peso, de 0,0001 a 95 %, de manera más preferible de 1 a 85 %, por ejemplo 5 a 60 %, de un compuesto de la fórmula (I). La composición se usa generalmente para la represión de plagas, de tal manera que un compuesto de la fórmula (I) es aplicado en una tasa de 0,1 g a 10 kg por hectárea, de manera preferible de 1 g a 6 kg por hectárea, de manera más preferible de 1 g hasta 1 kg por hectárea.

Cuando se usa como un desinfectante de semillas, un compuesto de la fórmula (I) se usa en una tasa de 0,0001 g hasta 10, g (for ejemplo de 0,001 g ó 0,05 g), de manera preferible de 0,005 g a 10 g, de manera más preferible de 0,005 g a 4 g, por kilogramo de semillas.

En otro aspecto, el presente invento proporciona una composición insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida que comprende una cantidad eficaz como insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida de un compuesto de la fórmula (I) y un vehículo o diluyente apropiado para el mismo. La composición es de manera preferible una composición insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida.

Los compuestos de fórmula (I) se usan de manera preferible contra insectos, ácaros o nematodos.

Las composiciones se pueden escoger entre cierto número de tipos de formulaciones, incluyendo polvos para espolvorear (DP), polvos solubles (SP), granulados solubles en agua (SG), granulados dispersables en agua (WG), polvos humectables (WP), granulados (GR) (de liberación lenta o rápida), concentrados solubles (SL), líquidos miscibles con aceites (OL), líquidos de volumen ultra bajo (UL), concentrados emulsionables (EC), concentrados dispersables (DC), emulsiones (del tipo tanto de aceite en agua (EW) como de agua en aceite (EO)), micro-emulsiones (ME), concentrados para suspensión (SC), aerosoles, formulaciones para nebulización y fumigación, suspensiones para encapsular (CS) y formulaciones para el tratamiento de semillas. El tipo escogido de formulación en cualquier caso dependerá de la finalidad particular tomada en consideración y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto fórmula (I).

Los polvos para espolvorear (DP) se pueden preparar mezclando un compuesto de la fórmula (I) con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo arcillas naturales, caolín, pirofilita, bentonita, alúmina, montmorillonita, tierra de infusorios (kieselgur), greda, tierra de diatomeas, fosfato de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros vehículos sólidos orgánicos e inorgánicos y triturando mecánicamente la mezcla para dar un polvo fino.

Los polvos solubles (SP) se pueden preparar mezclando un compuesto de la fórmula (I) con una o más sales inorgánicas solubles en agua (tales como bicarbonato de sodio, carbonato de sodio o sulfato de magnesio) o bien

uno o más materiales sólidos orgánicos solubles en agua (tales como un polisacárido) y, opcionalmente, uno o más agentes humectantes, uno o más agentes dispersantes o una mezcla de dichos agentes con el fin de mejorar la dispersabilidad o la solubilidad. Luego la mezcla es triturada para dar un polvo fino. Unas composiciones similares pueden también ser granuladas para formar granulados solubles en agua (SG).

5 Los polvos humectables (WP) se pueden preparar mezclando un compuesto de la fórmula (I) con uno o más diluyentes o vehículos sólidos, uno o más agentes humectantes, y, de manera preferible, uno o más agentes dispersantes y, opcionalmente uno o más agentes suspendedores con el fin de facilitar el dispersamiento en líquidos. Luego la mezcla es triturada para dar un polvo fino. Unas composiciones similares pueden también ser granuladas para formar granulados dispersables en agua (WG).

10 Los granulados (GR) se pueden formar o bien por granulación de una mezcla de un compuesto de la fórmula (I) y de uno o más diluyentes o vehículos sólidos pulverulentos, o a partir de granulados desnudos previamente formados por absorción de un compuesto de la fórmula (I) (o de una solución del mismo, en un agente apropiado) en un material granular poroso (tal como piedra pómez, arcillas de attapulgita, tierra de batán, tierra de infusorios (kieselgur), tierras de diatomeas o mazorcas de maíz trituradas) o por adsorción de un compuesto de la fórmula (I) o
15 de una solución del mismo, de un agente apropiado, sobre un material de núcleo duro (tal como arenas, silicatos, carbonatos, sulfatos o fosfatos minerales) y por desecación si fuese necesario. Los agentes que corrientemente se usan para ayudar a la absorción o a la adsorción incluyen unos disolventes (tales como disolventes de petróleo alifáticos y aromáticos, alcoholes, éteres, cetonas y ésteres) y agentes conferidores de pegajosidad (adhesivos) (tales como poli(acetatos de vinilo), poli(alcoholes vinílicos), dextrinas, azúcares y aceites vegetales). Uno o más
20 aditivos de otros tipos se pueden incluir en los granulados (por ejemplo un agente emulsionante, un agente humectante o un agente dispersante).

Los concentrados dispersables (DC) se pueden preparar disolviendo un compuesto de la fórmula (I) en agua o en un disolvente orgánico, tal como una cetona, un alcohol o un éter glicólico. Estas soluciones pueden contener un agente activo superficialmente (por ejemplo para mejorar la dilución con agua o impedir la cristalización en un depósito de
25 atomización o proyección).

Los concentrados emulsionables (EC) o las emulsiones del tipo de aceite en agua (EW) se pueden preparar disolviendo un compuesto de la fórmula (I) en un disolvente orgánico (que opcionalmente contiene uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes o una mezcla de dichos agentes). Unos disolventes orgánicos apropiados para usarse en los EC's incluyen hidrocarburos aromáticos (tales como alquil-bencenos o alquil-naftalenos) ilustrados como ejemplos por SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO
30 es una Marca Comercial Registrada), cetonas (tales como ciclohexanona o metil-ciclohexanona) y alcoholes (tales como alcohol bencílico, alcohol furfurílico o butanol), N-alquil-pirrolidonas (tales como N-metil-pirrolidona o N-octil-pirrolidona), dimetil amidas de ácidos grasos (tales como una dimetil-amida de un ácido graso de C₈-C₁₀) e hidrocarburos clorados. Un producto EC puede emulsionarse espontáneamente al ser añadido al agua para producir una emulsión con una estabilidad suficiente para permitir una aplicación por atomización o proyección a través de un
35 equipo apropiado. La preparación de una EW implica obtener un compuesto de la fórmula (I) ya sea como un líquido (si no es un líquido a la temperatura ambiente, puede ser fundido a una temperatura razonable, situada típicamente por debajo de 70°C) o en solución (disolviéndolo en un disolvente apropiado) y luego emulsionando el líquido o la solución resultante en un agua que contiene uno o más SFA's, mediando alta cizalladura, para producir una
40 emulsión. Unos disolventes apropiados para su uso en las EW's incluyen aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobencenos), disolventes aromáticos (tales como alquil-bencenos o alquil-naftalenos) u otros disolventes orgánicos apropiados que tienen una baja solubilidad en agua.

Las microemulsiones (ME) se pueden preparar mezclando agua con una mezcla de uno o más disolventes con uno o más SFA's, para producir espontáneamente una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Un
45 compuesto de la fórmula (I) está presente inicialmente ya sea en el agua o en la mezcla de un disolvente y un SFA. Unos disolventes apropiados para su uso en las ME's incluyen los descritos aquí anteriormente para usarse en los EC's o en las EW's. Una ME puede ser o bien un sistema del tipo de aceite en agua o del tipo de agua en aceite (cuál es el sistema que está presente puede ser determinado por mediciones de la conductividad) y puede ser apropiada para mezclar plaguicidas solubles en agua y solubles en aceite en la misma formulación. Una ME es
50 apropiada para su dilución en agua, quedando o bien como una microemulsión o formando una convencional emulsión del tipo de aceite en agua.

Los concentrados para suspensión (SC) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas o partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de la fórmula (I). Los SC's se pueden preparar moliendo en
55 molino de bolas o de perlas el compuesto sólido de fórmula (I) en un medio apropiado, opcionalmente con uno o más agentes dispersantes, con el fin de producir una suspensión de partículas finas de este compuesto. Uno o más agentes humectantes se pueden incluir en la composición y un agente suspendedor se puede incluir para reducir la velocidad con la que se sedimentan las partículas. Alternativamente, un compuesto de la fórmula (I) puede ser molido en seco y añadido a un agua, que contiene los agentes descritos aquí anteriormente, para producir el deseado producto final.

Las formulaciones para aerosoles comprenden un compuesto de la fórmula (I) y un apropiado agente propulsor (por ejemplo *n*-butano). Un compuesto de la fórmula (I) puede también ser disuelto o dispersado en un medio apropiado (por ejemplo agua o un líquido miscible con agua, tal como *n*-propanol) para proporcionar unas composiciones destinadas a su uso en bombas de proyección accionadas a mano, no presurizadas.

- 5 Un compuesto de la fórmula (I) puede ser mezclado en el estado seco con una mezcla pirotécnica con el fin de formar una composición apropiada para generar, dentro de un espacio cerrado, un humo que contiene el compuesto.

Las suspensiones para encapsular (CS) se pueden preparar de una manera similar a la preparación de formulaciones EW pero con una etapa de polimerización adicional de manera tal que se obtenga una dispersión acuosa de gotitas de aceite, en la que cada gotita de aceite es encapsulada por una envoltura polimérica y contiene un compuesto de la fórmula (I) y, opcionalmente, un vehículo o diluyente para el mismo. La envoltura polimérica puede ser producida o bien por una reacción de policondensación interfacial o por un proceso de coacervación. Las composiciones pueden proporcionar una liberación controlada del compuesto de la fórmula (I) y se pueden usar para el tratamiento de semillas. Un compuesto de la fórmula (I) puede también ser formulado en una matriz polimérica biodegradable para proporcionar una liberación lenta y controlada del compuesto.

- 10
15 Una composición puede incluir uno o más aditivos destinados a mejorar el rendimiento biológico de la composición (por ejemplo por mejoramiento de la humectación, la retención o la distribución sobre las superficies, la resistencia a la lluvia en superficies tratadas; o la absorción o la movilidad de un compuesto de la fórmula (I)). Tales aditivos incluyen agentes activos superficialmente, aditivos para proyección basados en aceites, por ejemplos ciertos aceites minerales o aceites vegetales naturales (tales como aceite de soja y aceite de semilla de colza); y mezclas de éstos con otros coadyuvantes biológicamente intensificadores (ingredientes que pueden ayudar o modificar la acción de un compuesto de la fórmula (I)).

Un compuesto de la fórmula (I) puede también ser formulado para usarse como un agente para el tratamiento de semillas, por ejemplo como una composición de polvos, que incluye un polvo para el tratamiento en seco de semillas (DS), un polvo soluble en agua (SS) o un polvo dispersable en agua para el tratamiento de suspensiones (WS), o como una composición líquida, que incluye un concentrado capaz de fluir (FS), una solución (LS) o una suspensión para encapsular (CS). Las preparaciones de las composiciones DS, SS, WS, FS y LS son muy similares a las de, respectivamente, las composiciones DP, SP, WP, SC y DC antes descritas. Las composiciones para tratar semillas pueden incluir un agente para ayudar a la adhesión de la composición a la semilla (por ejemplo un aceite mineral o una barrera formadora de películas).

- 25
30 Los agentes humectantes, agentes dispersantes y agentes emulsionantes pueden ser SFA's de superficies de los tipos catiónico, aniónico, anfótero o no iónico.

Unos apropiados SFA's del tipo catiónico incluyen compuestos de amonio cuaternarios (por ejemplo bromuro de cetil-trimetil-amonio), imidazolininas y sales de aminas.

Unos apropiados SFA's aniónicos incluyen sales de metales alcalinos con ácidos grasos, sales de monoésteres alifáticos de ácido sulfúrico (por ejemplo lauril-sulfato de sodio), sales de compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo dodecil-benceno-sulfonato de sodio, dodecil-benceno-sulfonato de calcio, un butil-naftaleno-sulfonato y mezclas de di-*isopropil*- y tri-*isopropil*-naftaleno sulfonatos de sodio), éter sulfatos, alcohol éter sulfatos (por ejemplo lauret-3-sulfato de sodio), éter carboxilatos (por ejemplo lauret-3-carboxilato de sodio), ésteres fosfatos (productos procedentes de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y un ácido fosfórico (predominantemente mono-ésteres) o pentóxido de fósforo (predominantemente di-ésteres), por ejemplo la reacción entre el alcohol laurílico y el ácido tetrafosfórico; adicionalmente estos productos pueden ser etoxilados), sulfosuccinamatos, parafina u olefina sulfonatos, lauratos y lignosulfonatos.

Unos apropiados SFA's del tipo anfótero incluyen betaínas, propionatos y glicinatos.

Unos apropiados SFA's del tipo no iónico incluyen unos productos de condensación de óxidos de alquileño, tales como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos, con alcoholes grasos (tales como alcohol oleílico o alcohol cetílico) o con alquil-fenoles (tales como octil-fenol, nonil-fenol u octil-cresol); ésteres parciales derivados de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol; productos de condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno; polímeros de bloques (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno); alcanol-amidas; ésteres simples (por ejemplo poli(etilen glicol) ésteres con ácidos grasos); óxidos de aminas, (por ejemplo óxido de lauril dimetil amina); y lecitinas.

Unos apropiados agentes suspendedores incluyen unos coloides hidrófilos (tales como polisacáridos, una poli(vinilpirrolidona) o una carboximetilcelulosa de sodio) y arcillas hinchables (tales como una bentonita o atapulgita).

Un compuesto de la fórmula (I) puede ser aplicado por cualquiera de los medios conocidos de aplicar compuestos plaguicidas. Por ejemplo, él puede ser aplicado, en estado formulado o sin formular, directamente a las plagas o a un lugar donde están las plagas (tal como un hábitat de las plagas, o a una planta en crecimiento susceptible de infestación por las plagas) o a cualquier parte de la planta, incluyendo el follaje, los tallos, las ramas o las raíces, a la semilla antes de que ésta sea sembrada o a otros medios en los que las plantas están creciendo o han de ser plantadas (tal como la tierra que rodea a las raíces, a la tierra en general, el agua de arrozales o sistemas de cultivo hidropónico), o puede ser proyectada o atomizada sobre ellas, aplicada por inmersión, aplicada como una crema o como una formulación pastosa, aplicada como un vapor o aplicada mediante distribución o incorporación de una composición (tal como una composición granular o a una composición envasada en una bolsa soluble en agua) en la tierra o en un entorno acuoso.

Un compuesto de la fórmula (I) puede también ser inyectado en plantas o proyectado sobre una vegetación usando técnicas de proyección electrodinámica u otros métodos que usan bajos volúmenes o aplicado por sistemas de irrigación en el terreno o desde el aire.

Las composiciones destinadas a su uso como formulaciones acuosas (soluciones o dispersiones acuosas) se suministran generalmente en la forma de un concentrado que contiene una alta proporción del ingrediente activo, siendo añadido el concentrado al agua antes del uso. Estos concentrados, que pueden incluir DC's, SC's, EC's, EW's, ME's SG's, SP's, WP's, WG's y CS's, son requeridos con frecuencia para resistir a un almacenamiento durante periodos de tiempo prolongados y, después de dicho almacenamiento, para ser capaces de añadirse al agua para formar unas formulaciones acuosas que permanecen homogéneas durante un período de tiempo suficiente para hacer posible que ellas sean aplicadas por un equipo de proyección convencional. Dichas formulaciones acuosas pueden contener cantidades variables de un compuesto de la fórmula (I) (por ejemplo de 0,0001 a 10 % en peso) dependiendo de la finalidad para las que ellas tengan que ser usadas.

Un compuesto de la fórmula (I) se puede usar en mezclas con fertilizantes, (por ejemplo unos fertilizantes que contienen nitrógeno, potasio o fósforo). Unos apropiados tipos de formulaciones incluyen granulados del fertilizante. Las mezclas pueden contener apropiadamente hasta 25 % en peso del compuesto de la fórmula (I).

El invento proporciona por lo tanto también una composición fertilizante que comprende un fertilizante y un compuesto de la fórmula (I).

Las composiciones de este invento pueden contener otros compuestos que posean una actividad biológica, por ejemplo micronutrientes o unos compuestos que tengan una actividad fungicida o que posean una actividad reguladora del crecimiento de las plantas, herbicida, insecticida, nematocida o acaricida.

El compuesto de la fórmula (I) puede ser el único ingrediente activo de la composición o puede ser mezclado con uno o mas ingredientes activos adicionales tales como un plaguicida, fungicida, agente sinérgico, herbicida o regulador del crecimiento de las plantas, cuando ello sea apropiado. Un adicional ingrediente activo puede proporcionar una composición que tenga un espectro más amplio de actividades o una persistencia aumentada en un sitio; activar sinérgicamente la actividad o complementar la actividad (por ejemplo aumentando la velocidad del efecto o superando una repelencia) del compuesto de fórmula (I); o ayudar a superar o impedir el desarrollo de una resistencia a componentes individuales. El ingrediente activo adicional particular dependerá de la utilidad pretendida de la composición. Ejemplos de plaguicidas apropiados incluyen los siguientes:

a) Piretroides, tales como permetrina, cipermetrina, fenvalerato, esfenvalerato, deltametrina, cihalotrina (en particular lambda-cihalotrina), bifentrina, fenpropatrina, ciflutrina, teflutrina, piretroides seguros para peces (por ejemplo etofenprox), una piretrina natural, tetrametrina, s-bioaletrina, fenflutrina, praletrina o carboxilato de 5-bencil-3-furilmetil-(E)-(1R,3S)-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenmetil)ciclopropano;

b) Órganofosfatos, tales como, profenofos, sulprofos, acefato, metil paratión, azinfos-metilo, demeton-s-metilo, heptenofos, tiometona, fenamifos, monocrotofos, profenofos, triazofos, metamidofos, dimetoato, fosfamidona, malatión, clorpirifos, fosalona, terbufos, fensulfotona, fonofos, forato, foxima, pirimifos-metilo, pirimifos-etilo, fenitrotrona, fostiazato o diazinona;

c) Carbamatos (incluyendo los aril carbamatos), tales como pirimicarb, triazamato, cloetocarb, carbofurano, furatiocarb, etiofencarb, aldicarb, tiofurox, carbosulfano, bendiocarb, fenobucarb, propoxur, metomilo u oxamilo;

d) Benzoil ureas, tales como diflubenzurón, triflumurón, hexaflumurón, flufenoxurón o clorofluazurón;

e) Compuestos orgánicos de estaño, tales como cihexatina, óxido de fenbutatina o azociclotina;

f) Pirazoles, tales como tebufenpirad y fenpiroximato;

g) Macrólidos, tales como avermectinas o milbemicinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemicina, espinosad o azadiractina;

h) Hormonas o feromonas;

i) Compuestos orgánicos clorados tales como endosulfano, hexacloruro de benceno, DDT, clordano o dieldrina;

j) Amidinas, tales como clordimeform o amitraz;

k) Agentes fumigantes, tales como cloropicrina, dicloropropano, bromuro de metilo o metam;

l) Compuestos de cloronicotínico tales como imidacloprida, tiacloprida, acetamiprida, nitenpiram o tiametoxam;

m) Diacilhidrazinas, tales como tebufenozida, cromafenozida o metoxifenozida;

- n) Difenil éteres, tales como diofenolano o piriproxifeno;
- o) Indoxacarb;
- p) Clorfenapir;
- q) Pimetrozina;
- 5 r) Espirotetramato, espiromesifeno; o
- s) Flubendiamida o rinaxipir.

Además de las clases químicas principales de plaguicidas que antes se han enumerado, se pueden emplear en la composición otros plaguicidas que tengan unas objetivos particulares, si fuese apropiado para la utilidad pretendida de la composición. Por ejemplo, unos insecticidas selectivos para plantas cultivadas particulares, por ejemplo insecticidas específicos para insectos barrenadores de tallos (tales como cartap) o insecticidas específicos de insectos saltadores (tales como buprofezina) para su uso en arroz. Alternativamente, se pueden incluir también en las composiciones unos insecticidas o acaricidas específicos para ciertas especies o ciertos estadios particulares de insectos (por ejemplo ovo-larvicidas acaricidas, tales como clofentezina, flubenzimina, hexitiazox o tetradifona; motilicidas acaricidas, tales como dicofol o propargita; acaricidas, tales como bromopropilato o cloobenzilato; o reguladores del crecimiento, tales como hidrametilnona, ciromazina, metopreno, clorofluazurón o diflubenzurón).

Ejemplos de compuestos fungicidas que se pueden incluir en la composición del invento son

(*E*)-*N*-metil-2-[2-(2,5-dimetilfenoximetil)fenil]-2-metoxi-iminoacetamida (SSF-129), 4-bromo-2-ciano-*N,N*-dimetil-6-trifluorometil-bencimidazol-1-sulfonamida, α -[*N*-(3-cloro-2,6-xilil)-2-metoxi-acetamido]- γ -butirolactona, 4-cloro-2-ciano-*N,N*-dimetil-5-*p*-tolilimidazol-1-sulfonamida (IKF-916, ciamidazosulfamida), 3-5-dicloro-*N*-(3-cloro-1-etil-1-metil-2-oxopropil)-4-metilbenzamida (RH-7281, zoxamida), *N*-alil-4,5,-dimetil-2-trimetilsilitiofeno-3-carboxamida (MON65500), *N*-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenoxi)propionamida (AC382042), *N*-(2-metoxi-5-piridil)-ciclopropano carboxamida, acibenzolar (CGA245704), alanicarb, aldimorf, anilazina, azaconazol, azoxiestrobina, benalaxilo, benomilo, biloxazol, bitertanol, blasticidina S, bromuconazol, bupirimato, captafol, captan, carbendazima, clorhidrato de carbendazima, carboxina, carpropamida, carvona, CGA41396, CGA41397, quinometionato, clorotalonilo, clorozolinato, clozilacona, compuestos que contienen cobre tales como oxiclورو de cobre, oxiquinolato de cobre, sulfato de cobre, tallato de cobre y la mezcla de Burdeos, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, debacarb, disulfuro de di-2-piridilo 1,1'-dióxido, diclofluanida, diclomezina, diclorano, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflumetorim, tiofosfato de *O,O*-di-*iso*-propil-*S*-bencilo, dimefluaol, dimetconazol, dimetmorf, dimetirimol, diniconazol, dinocap, ditianona, cloruro de dodecil dimetil amonio, dodemorf, dodina, doguadina, edifenfos, epiconazol, etirimol, (*Z*)-*N*-bencil)-*N*[(metil(metil-tioetilidenamino-oxicarbonil)amino]tio)- β -alaninato de etilo, etridiazol, famoxadona, fenamidona (RPA407213), fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida (KBR2738), fencpiclonilo, fenpropidina, fenpropimorf, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumetover, fluoroimida, fluquinconazol, flusilazol, flutolanilo, flutriafol, folpet, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, hexaconazol, hidroxiisoxazol, himexazol, imazalilo, imibenconazol, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb (SZX0722), butil carbamato de isopropanilo, isoprotiolano, kasugamicina, kresoxima-metilo, LY186054, LY211795, LY248908, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepanipirim, mepronilo, metalaxilo, metconazol, metiram, metiram-zinc, metominoestrobina, miclobutanilo, neoasozina, dimetil-ditiocarbamato de níquel, nitroal-isopropilo, nuarimol, ofurace, compuestos orgánicos de mercurio, oxadixilo, oxasulfurón, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, pefurazoato, penconazol, pencicurona, óxido de fenazina, foseetil-Al, ácidos con fósforo, ftalida, picoxiestrobina (ZA1963), polioxina D, poliram, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propiconazol, propineb, ácido propiónico, pirazofos, pirifenox, pirimetanilo, piroquilona, piroxifur, pirrolnitrina, compuestos de amonio cuaternarios, quinometionato, quinoxifeno, quintozeno, sipconazol (F-155), pentaclorofenato de sodio, espiroxamina, estreptomina, azufre, tebuconazol, tecloftalam, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifluzamida, 2-(tiocianometiltio)benzotiazol, tiofanato-metilo, tiram, timibenconazol, tolclofos-metilo, tolilfluanida, triadimefona, triadimenol, triazabutilo, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxiestrobina (CGA279202), triforina, triflumizol, triticonazol, validamicina A, vapam, vinclozolina, zineb y ziram.

Los compuestos de fórmula (I) pueden ser mezclados con tierra, turba u otros medios de enraizamiento para la protección de las plantas contra enfermedades fúngicas llevadas por las semillas, llevadas por la tierra o foliares.

Ejemplos de apropiados agentes sinérgicos para usarse en las composiciones incluyen butóxido de piperonilo, sesamex, safroximo o dodecil imidazol.

Los apropiados herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas destinados a su inclusión en las composiciones dependerán del objetivo pretendido y del efecto requerido.

Un ejemplo de un herbicida selectivo para el arroz que se puede incluir es propanilo. Un ejemplo de un agente regulador del crecimiento de las plantas para su uso en algodón es PIX®.

Algunas mezclas pueden comprender unos ingredientes activos que tengan unas propiedades físicas, químicas o biológicas significativamente diferentes, de manera tal que ellas no se presten por si mismas al mismo tipo de formulación convencional. En estas circunstancias se pueden preparar otros tipos de formulaciones. Por ejemplo, cuando un ingrediente activo es un material sólido insoluble en agua y el otro es un material líquido insoluble en

agua, no obstante puede ser posible dispersar cada uno de los ingredientes activos en la misma fase acuosa continua por dispersamiento del ingrediente activo sólido en forma de una suspensión (usando un modo de preparación análogo al de un SC) pero por dispersamiento del ingrediente activo líquido en forma de una emulsión (usando un modo de preparación análogo al de una EW). La composición resultante es una formulación de suspoemulsión (SE).

Los compuestos de fórmula (I) son también fungicidas activos y se pueden usar para reprimir uno o más de los siguientes patógenos: *Pyricularia oryzae* (*Magnaporthe grisea*) en arroz y trigo y otros *Pyricularia* spp. en otros anfitriones; *Puccinia triticina* (o *recondita*), *Puccinia striiformis* y otros tizones en trigo, *Puccinia hordei*, *Puccinia striiformis* y otros tizones en cebada, y tizones en otros anfitriones (por ejemplo césped, centeno, café, peras, manzanas, cacahuets, remolacha azucarera, legumbres y plantas ornamentales); *Erysiphe cichoracearum* en cucúrbitas (por ejemplo melón); *Blumeria* (o *Erysiphe*) *graminis* (mildiu polvoriento) en cebada, trigo, centeno y césped y otros mildius polvorientos en diversos anfitriones, tales como *Sphaerotheca macularis* en lúpulos, *Sphaerotheca fusca* (*Sphaerotheca fuliginea*) en cucúrbitas (por ejemplo pepino), *Leveillula taurica* en tomates, berenjena y pimiento verde, *Podosphaera leucotricha* en manzanas y *Uncinula necator* en viñas; *Cochliobolus* spp., *Helminthosporium* spp., *Drechslera* spp. (*Pyrenophora* spp.), *Rhynchosporium* spp., *Mycosphaerella graminicola* (*Septoria tritici*) y *Phaeosphaeria nodorum* (*Stagonospora nodorum* o *Septoria nodorum*), *Pseudocercospora herpotrichoides* y *Gaeumannomyces graminis* en cereales (por ejemplo trigo, cebada y centeno), césped y otros anfitriones; *Cercospora arachidicola* y *Cercosporidium personatum* en cacahuets y otros *Cercospora* spp. en otros anfitriones, por ejemplo remolacha azucarera, bananas, soja y arroz; *Botrytis cinerea* (moho gris) en tomates, fresas, legumbres, viñas y otros anfitriones y otros *Botrytis* spp. en otros anfitriones; *Alternaria* spp. en legumbres (por ejemplo zanahorias), colza oleaginosa, manzanas, tomates, patatas, cereales (por ejemplo trigo) y otros anfitriones; *Venturia* spp. (que incluyen *Venturia inaequalis* (scab)) en manzanas, peras, frutas de hueso, frutos de cáscara arbóreos (nueces) y otros anfitriones; *Cladosporium* spp. en una gama de anfitriones que incluyen cereales (por ejemplo trigo) y tomates; *Monilinia* spp. en frutas de hueso, frutos de cáscara arbóreos y otros anfitriones; *Didymella* spp. en tomates, césped, trigo, cucúrbitas y otros anfitriones; *Phoma* spp. en colza oleaginosa, césped, arroz, patatas, trigo y otros anfitriones; *Aspergillus* spp. y *Aureobasidium* spp. en trigo, madera aserrada y otros anfitriones; *Ascochyta* spp. en guisantes, trigo, cebada y otros anfitriones; *Stemphylium* spp. (*Pleospora* spp.) en manzanas, peras, cebollas y otros anfitriones; enfermedades y plagas veraniegas (por ejemplo roña amarga (*Glomerella cingulata*), roña negra o mancha ojo de rana en hojas (*Botryosphaeria obtusa*), mancha grasosa en frutas (*Mycosphaerella pom/*), roya de cedro manzana (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*), mancha fuliginosa de manzana (*Gloeodes pomigena*), excremento de la mosca (*Schizothryrium pomi*); y roña blanca (*Botryosphaeria dothidea*)) en manzanas y peras; *Plasmopara viticola* en viñas; otros mildius vellosos, tales como *Bremia lactucae* en lechuga, *Peronospora* spp. en soja, tabaco, cebollas y otros anfitriones, *Pseudoperonospora humuli* en lúpulos y *Pseudoperonospora cubensis* en cucúrbitas; *Pythium* spp. (que incluye *Pythium ultimum*) en césped y otros anfitriones; *Phytophthora infestans* en patatas y tomates y otros *Phytophthora* spp. en legumbres, fresas, aguacate, pimiento, plantas ornamentales, tabaco, cacao y otros anfitriones; *Thanatephorus cucumeris* en arroz y césped y otros *Rhizoctonia* spp. en diversos anfitriones tales como trigo y cebada, cacahuets, legumbres, algodón y césped; *Sclerotinia* spp. en césped, cacahuets, patatas, colza oleaginosa y otros anfitriones; *Sclerotium* spp. en césped, cacahuets y otros anfitriones; *Gibberella fujikuroi* en arroz; *Colletotrichum* spp. en una gama de anfitriones que incluyen césped, café y legumbres; *Laetisaria fuciformis* en césped; *Mycosphaerella* spp. en bananas, cacahuets, limón, pecanas, papaya y otros anfitriones; *Diaporthe* spp. en limón, soja, melon, peras, altramuza y otros anfitriones; *Elsinoe* spp. en limón, viñas, olivas, pecanas, rosas y otros anfitriones; *Verticillium* spp. en una gama de anfitriones que incluyen lúpulos, patatas y tomates; *Pyrenopeziza* spp. en colza oleaginosa y otros anfitriones; *Oncobasidium theobromae* en cacao que causa fusariosis vascular; *Fusarium* spp., *Typhula* spp., *Microdochium nivale*, *Ustilago* spp., *Urocystis* spp., *Tilletia* spp. y *Claviceps purpurea* en una diversidad de anfitriones pero particularmente en trigo, cebada, césped y maíz; *Ramularia* spp. en remolacha azucarera, cebada y otros anfitriones; enfermedades de después de la cosecha particularmente de frutas (por ejemplo *Penicillium digitatum*, *Penicillium italicum* y *Trichoderma viride* en naranjas, *Colletotrichum musae* y *Gloeosporium musarum* en bananas y *Botrytis cinerea* en uvas); otros patógenos en viñas, notablemente *Eutypa lata*, *Guignardia bidwellii*, *Phellinus igniarius*, *Phomopsis viticola*, *Pseudopeziza tracheiphila* y *Stereum hirsutum*; otros patógenos en árboles (por ejemplo *Lophodermium seditiosum*) o madera aserrada, notablemente *Cephaloscypha fragrans*, *Ceratocystis* spp., *Ophiostoma piceae*, *Penicillium* spp., *Trichoderma pseudokoningii*, *Trichoderma viride*, *Trichoderma harzianum*, *Aspergillus niger*, *Leptographium lindbergii* y *Aureobasidium pullulans*; y vectores fúngicos de enfermedades fúngicas (por ejemplo *Polymyxa graminis* en cereales como el vector del virus del mosaico amarillo de la cebada (BYMV) y *Polymyxa betae* en remolacha azucarera como el vector de rizomanía).

Los compuestos de fórmula (I) muestran una actividad particularmente buena contra clases de Oomicetos de patógenos tales como *Phytophthora infestans*, *Plasmopara* especies, p.ej. *Plasmopara viticola* y especies de *Pythium* p.ej. *Pythium ultimum*.

Un compuesto de la fórmula (I) se puede mover con acropétalos, con basipétalos o localmente en un tejido de plantas que ha de ser activo contra uno o más hongos. Además, un compuesto de la fórmula (I) puede ser suficientemente volátil para resultar activo en la fase de vapor contra uno o más hongos en la planta.

El invento proporciona por lo tanto un método de combatir o reprimir hongos fitopatógenos, que comprende aplicar una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de la fórmula (I), o una composición que contiene un compuesto de la fórmula (I), a una planta, a una semilla de una planta, al sitio donde está la planta o la semilla o a la tierra o cualquier otro medio de crecimiento de plantas, p.ej. una solución nutriente.

- 5 El término "planta" como se usa en el presente contexto incluye plántulas, arbustos y árboles. Además, el método fungicida del invento incluye tratamientos protectores, curativos, sistémicos, erradicadores y antiesporulantes.

Los compuestos de fórmula (I) se usan de manera preferible para finalidades agrícolas, hortícolas y de hierbas de césped en la forma de una composición.

- 10 Con el fin de aplicar un compuesto de la fórmula (I) a una planta, a una semilla de una planta, o al sitio donde está la planta o la semilla, a la tierra o a cualquier otro medio de crecimiento, un compuesto de la fórmula (I) es formulado usualmente a la forma de una composición que incluye, además del compuesto de compuesto de la fórmula (I), un apropiado diluyente o vehículo inerte y, opcionalmente, un agente activo superficialmente (SFA). Los SFA's son unos productos químicos que son capaces de modificar las propiedades de una interfase (por ejemplo, interfaces entre un líquido y un sólido, entre un líquido y aire o entre un líquido y otro líquido) por disminución de la tensión
- 15 interfacial y conduciendo de esta manera a cambios en otras propiedades (por ejemplo dispersamiento, emulsiónamiento y humectación). Se prefiere que todas las composiciones (tanto formulaciones sólidas como líquidas) comprendan en o peso, 0,0001 a 95 %, de manera más preferible de 1 a 85 %, por ejemplo de 5 a 60 %, de un compuesto de la fórmula (I). La composición se usa generalmente para la represión de hongos de manera tal que un compuesto fórmula (I) es aplicado en una tasa de 0,1 g a 10 kg por hectárea, de manera preferible de 1 g a 6 kg
- 20 por hectárea, de manera más preferible de 1 g a 1 kg por hectárea.

Cuando se usa en un desinfectante de semillas, un compuesto de la fórmula (I) se puede usar en una tasa de 0,0001 g a 10 g (por ejemplo 0,001 g o 0,05 g), de manera preferible de 0,005 g a 10 g, de manera más preferible de 0,005 g a 4 g, por kilogramo de semillas.

- 25 En otro aspecto del presente invento proporciona una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de la fórmula (I) y un vehículo o diluyente apropiado para el mismo.

En todavía otro aspecto del invento proporciona un método de combatir y reprimir hongos en un sitio, que comprende tratar a los hongos o al sitio donde están los hongos con una cantidad eficaz como fungicida de una composición que comprende un compuesto de la fórmula (I).

- 30 Las composiciones se pueden escoger a partir de un cierto número de tipos de formulaciones, incluyendo polvos para espolvorear (DP), polvos solubles (SP), granulados solubles en agua (SG), granulados dispersables en agua (WG), polvos humectables (WP), granulados (GR) (de liberación lenta o rápida), concentrados solubles (SL), líquidos miscibles con aceites (OL), líquidos de volumen ultra bajo (UL), concentrados emulsionables (EC), concentrados dispersables (DC), emulsiones (del tipo tanto de aceite en agua (EW) como de agua en aceite (EO)), micro-emulsiones (ME), concentrados para suspensión (SC), aerosoles, formulaciones para nebulización y fumigación,
- 35 suspensiones para encapsular (CS) y formulaciones para el tratamiento de semillas. El tipo escogido de formulación en cualquier caso dependerá de la finalidad particular tomada en consideración y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto fórmula (I).

- 40 Los polvos para espolvorear (DP) se pueden preparar mezclando un compuesto de la fórmula (I) con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo arcillas naturales, caolín, pirofilita, bentonita, alúmina, montmorillonita, tierra de infusorios (kieselgur), greda, tierra de diatomeas, fosfato de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros vehículos sólidos orgánicos e inorgánicos y triturando mecánicamente la mezcla para dar un polvo fino.

- 45 Los polvos solubles (SP) se pueden preparar mezclando un compuesto de la fórmula (I) con una o más sales inorgánicas solubles en agua (tales como bicarbonato de sodio, carbonato de sodio o sulfato de magnesio) o bien uno o más materiales sólidos orgánicos solubles en agua (tales como un polisacárido) y, opcionalmente, uno o más agentes humectantes, uno o más agentes dispersantes o una mezcla de dichos agentes con el fin de mejorar la dispersabilidad o la solubilidad. Luego la mezcla es triturada para dar un polvo fino. Unas composiciones similares pueden también ser granuladas para formar granulados solubles en agua (SG).

- 50 Los polvos humectables (WP) se pueden preparar mezclando un compuesto de la fórmula (I) con uno o más diluyentes o vehículos sólidos, uno o más agentes humectantes, y, de manera preferible, uno o más agentes dispersantes y, opcionalmente uno o más agentes suspendedores con el fin de facilitar el dispersamiento en líquidos. Luego la mezcla es triturada para dar un polvo fino. Unas composiciones similares pueden también ser granuladas para formar granulados dispersables en agua (WG).

Los granulados (GR) se pueden formar o bien por granulación de una mezcla de un compuesto de la fórmula (I) y de uno o más diluyentes o vehículos sólidos pulverulentos, o a partir de granulados desnudos previamente formados por absorción de un compuesto de la fórmula (I) (o de una solución del mismo en un agente apropiado) en un material granular poroso (tal como piedra pómez, arcillas de attapulgita, tierra de batán, tierra de infusorios (kieselgur), tierras de diatomeas o mazorcas de maíz trituradas) o por adsorción de un compuesto de la fórmula (I) o de una solución del mismo, de un agente apropiado, sobre un material de núcleo duro (tal como arenas, silicatos, carbonatos, sulfatos o fosfatos minerales) y por desecación si fuese necesario. Los agentes que corrientemente se usan para ayudar a la absorción o a la adsorción incluyen unos disolventes (tales como disolventes de petróleo alifáticos y aromáticos, alcoholes, éteres, cetonas y ésteres) y agentes conferidores de pegajosidad (adhesivos) (tales como poli(acetatos de vinilo), poli(alcoholes vinílicos), dextrinas, azúcares y aceites vegetales). Uno o más aditivos de otros tipos se pueden incluir en los granulados (por ejemplo un agente emulsionante, un agente humectante o un agente dispersante).

Los concentrados dispersables (DC) se pueden preparar disolviendo un compuesto de la fórmula (I) en agua o en un disolvente orgánico, tal como una cetona, un alcohol o un éter glicólico. Estas soluciones pueden contener un agente activo superficialmente (por ejemplo para mejorar la dilución con agua o impedir la cristalización en un depósito de atomización o proyección).

Los concentrados emulsionables (EC) o las emulsiones del tipo de aceite en agua (EW) se pueden preparar disolviendo un compuesto de la fórmula (I) en un disolvente orgánico (que opcionalmente contiene uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes o una mezcla de dichos agentes). Unos disolventes orgánicos apropiados para usarse en los EC's incluyen hidrocarburos aromáticos (tales como alquil-bencenos o alquil-naftalenos) ilustrados como ejemplos por SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO es una Marca Comercial Registrada), cetonas (tales como ciclohexanona o metil-ciclohexanona) y alcoholes (tales como alcohol bencílico, alcohol furfurílico o butanol), N-alquil-pirrolidonas (tales como N-metil-pirrolidona o N-octil-pirrolidona), dimetil amidas de ácidos grasos (tales como una dimetil-amida de un ácido graso de C₈-C₁₀) e hidrocarburos clorados. Un producto EC puede emulsionarse espontáneamente al ser añadido al agua para producir una emulsión con una estabilidad suficiente para permitir una aplicación por atomización o proyección a través de un equipo apropiado. La preparación de una EW implica obtener un compuesto de la fórmula (I) ya sea como un líquido (si no es un líquido a la temperatura ambiente, puede ser fundido a una temperatura razonable, situada típicamente por debajo de 70°C) o en solución (disolviéndolo en un disolvente apropiado) y luego emulsionando el líquido o la solución resultante en un agua que contiene uno o más SFA's, mediando alta cizalladura, para producir una emulsión. Unos disolventes apropiados para su uso en las EW's incluyen aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobencenos), disolventes aromáticos (tales como alquil-bencenos o alquil-naftalenos) u otros disolventes orgánicos apropiados que tienen una baja solubilidad en agua.

Las microemulsiones (ME) se pueden preparar mezclando agua con una mezcla de uno o más disolventes con uno o más SFA's, para producir espontáneamente una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Un compuesto de la fórmula (I) está presente inicialmente ya sea en el agua o en la mezcla de un disolvente y un SFA. Unos disolventes apropiados para su uso en las ME's incluyen los descritos aquí anteriormente para usarse en los EC's o en las EW's. Una ME puede ser o bien un sistema del tipo de aceite en agua o del tipo de agua en aceite (cuál es el sistema que está presente puede ser determinado por mediciones de la conductividad) y puede ser apropiada para mezclar plaguicidas solubles en agua y solubles en aceite en la misma formulación. Una ME es apropiada para su dilución en agua, quedando o bien como una microemulsión o formando una convencional emulsión del tipo de aceite en agua.

Los concentrados para suspensión (SC) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas o partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de la fórmula (I). Los SC's se pueden preparar moliendo en molino de bolas o de perlas el compuesto sólido de fórmula (I) en un medio apropiado, opcionalmente con uno o más agentes dispersantes, con el fin de producir una suspensión de partículas finas de este compuesto. Uno o más agentes humectantes se pueden incluir en la composición y un agente suspendedor se puede incluir para reducir la velocidad con la que se sedimentan las partículas. Alternativamente, un compuesto de la fórmula (I) puede ser molido en seco y añadido a un agua, que contiene los agentes descritos aquí anteriormente, para producir el deseado producto final.

Las formulaciones para aerosoles comprenden un compuesto de la fórmula (I) y un apropiado agente propulsor (por ejemplo *n*-butano). Un compuesto de la fórmula (I) puede también ser disuelto o dispersado en un medio apropiado (por ejemplo agua o un líquido miscible con agua, tal como *n*-propanol) para proporcionar unas composiciones destinadas a su uso en bombas de proyección accionadas a mano, no presurizadas.

Un compuesto de la fórmula (I) puede ser mezclado en el estado seco con una mezcla pirotécnica con el fin de formar una composición apropiada para generar, dentro de un espacio cerrado, un humo que contiene el compuesto.

Las suspensiones para encapsular (CS) se pueden preparar de una manera similar a la preparación de formulaciones EW pero con una etapa de polimerización adicional de manera tal que se obtenga una dispersión

acuosa de gotitas de aceite, en la que cada gotita de aceite es encapsulada por una envoltura polimérica y contiene un compuesto de la fórmula (I) y, opcionalmente, un vehículo o diluyente para el mismo. La envoltura polimérica puede ser producida o bien por una reacción de policondensación interfacial o por un proceso de coacervación. Las composiciones pueden proporcionar una liberación controlada del compuesto de la fórmula (I) y se pueden usar para el tratamiento de semillas. Un compuesto de la fórmula (I) puede también ser formulado en una matriz polimérica biodegradable para proporcionar una liberación lenta y controlada del compuesto.

Una composición puede incluir uno o más aditivos destinados a mejorar el rendimiento biológico de la composición (por ejemplo por mejoramiento de la humectación, la retención o la distribución sobre las superficies, la resistencia a la lluvia en superficies tratadas; o la absorción o la movilidad de un compuesto de la fórmula (I)). Tales aditivos incluyen agentes activos superficialmente, aditivos para proyección basados en aceites, por ejemplos ciertos aceites minerales o aceites vegetales naturales (tales como aceite de soja y aceite de semilla de colza); y mezclas de éstos con otros coadyuvantes biológicamente intensificadores (ingredientes que pueden ayudar o modificar la acción de un compuesto de la fórmula (I)).

Un compuesto de la fórmula (I) puede también ser formulado para usarse como un agente para el tratamiento de semillas, por ejemplo como una composición de polvos, que incluye un polvo para el tratamiento en seco de semillas (DS), un polvo soluble en agua (SS) o un polvo dispersable en agua para el tratamiento de suspensiones (WS), o como una composición líquida, que incluye un concentrado capaz de fluir (FS), una solución (LS) o una suspensión para encapsular (CS). Las preparaciones de las composiciones DS, SS, WS, FS y LS son muy similares a las de, respectivamente, las composiciones DP, SP, WP, SC y DC antes descritas. Las composiciones para tratar semillas pueden incluir un agente para ayudar a la adhesión de la composición a la semilla (por ejemplo un aceite mineral o una barrera formadora de películas).

Los agentes humectantes, agentes dispersantes y agentes emulsionantes pueden ser SFA's de los tipos catiónico, aniónico, anfótero o no iónico.

Unos apropiados SFA's del tipo catiónico incluyen compuestos de amonio cuaternarios (por ejemplo bromuro de cetil-trimetil-amonio), imidazolinas y sales de aminas.

Unos apropiados SFA's aniónicos incluyen sales de metales alcalinos con ácidos grasos, sales de monoésteres alifáticos de ácido sulfúrico (por ejemplo lauril-sulfato de sodio), sales de compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo dodecil-benceno-sulfonato de sodio, dodecil-benceno-sulfonato de calcio, un butil-naftaleno-sulfonato y mezclas de di-*isopropil*- y tri-*isopropil*-naftaleno sulfonatos de sodio), éter sulfatos, alcohol éter sulfatos (por ejemplo lauret-3-sulfato de sodio), éter carboxilatos (por ejemplo lauret-3-carboxilato de sodio), ésteres fosfatos (productos procedentes de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y un ácido fosfórico (predominantemente mono-ésteres) o pentóxido de fósforo (predominantemente di-ésteres), por ejemplo la reacción entre el alcohol laurílico y el ácido tetrafosfórico; adicionalmente estos productos pueden ser etoxilados), sulfosuccinamatos, parafina u olefina sulfonatos, lauratos y lignosulfonatos.

Unos apropiados SFA's del tipo anfótero incluyen betaínas, propionatos y glicinatos.

Unos apropiados SFA's del tipo no iónico incluyen unos productos de condensación de óxidos de alquileo, tales como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos, con alcoholes grasos (tales como alcohol oleílico o alcohol cetílico) o con alquil-fenoles (tales como octil-fenol, nonil-fenol u octil-cresol); ésteres parciales derivados de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol; productos de condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno; polímeros de bloques (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno); alcanol-amidas; ésteres simples (por ejemplo poli(etilen glicol) ésteres con ácidos grasos); óxidos de aminas, (por ejemplo óxido de lauril dimetil amina); y lecitinas.

Unos apropiados agentes suspendedores incluyen unos coloides hidrófilos (tales como polisacáridos, una poli(vinilpirrolidona) o una carboximetilcelulosa de sodio) y arcillas hinchables (tales como una bentonita o atapulgita).

Un compuesto de la fórmula (I) puede ser aplicado por cualquiera de los medios conocidos de aplicar compuestos plaguicidas. Por ejemplo, él puede ser aplicado, en estado formulado o sin formular, a cualquier parte de la planta, incluyendo el follaje, los tallos, las ramas o las raíces, a la semilla antes de que ésta sea sembrada o a otros medios en los que las plantas están creciendo o han de ser plantadas (tal como la tierra que rodea a las raíces, a la tierra en general, el agua de arrozales o sistemas de cultivo hidropónico), o puede ser proyectada o atomizada sobre ellas, aplicada por inmersión, aplicada como una crema o como una formulación pastosa, aplicada como un vapor o aplicada mediante distribución o incorporación de una composición (tal como una composición granular o a una composición envasada en una bolsa soluble en agua) en la tierra o en un entorno acuoso.

Un compuesto de la fórmula (I) puede también ser inyectado en plantas o proyectado sobre una vegetación usando técnicas de proyección electrodinámica u otros métodos que usan bajos volúmenes o aplicado por sistemas de irrigación en el terreno o desde el aire.

Las composiciones destinadas a su uso como formulaciones acuosas (soluciones o dispersiones acuosas) se suministran generalmente en la forma de un concentrado que contiene una alta proporción del ingrediente activo, siendo añadido el concentrado al agua antes del uso. Estos concentrados, que pueden incluir DC's, SC's, EC's, EW's, ME's SG's, SP's, WP's, WG's y CS's, son requeridos con frecuencia para resistir a un almacenamiento durante períodos de tiempo prolongados y, después de dicho almacenamiento, para ser capaces de añadirse al agua para formar unas formulaciones acuosas que permanecen homogéneas durante un período de tiempo suficiente para hacer posible que ellas sean aplicadas por un equipo de proyección convencional. Dichas formulaciones acuosas pueden contener cantidades variables de un compuesto de la fórmula (I) (por ejemplo de 0,0001 a 10 % en peso) dependiendo de la finalidad para las que ellas tengan que ser usadas.

Un compuesto de la fórmula (I) se puede usar en mezclas con fertilizantes, (por ejemplo unos fertilizantes que contienen nitrógeno, potasio o fósforo). Unos apropiados tipos de formulaciones incluyen granulados del fertilizante. Las mezclas pueden contener apropiadamente hasta 25 % en peso del compuesto de la fórmula (I).

El invento proporciona por lo tanto también una composición fertilizante que comprende un fertilizante y un compuesto de la fórmula (I).

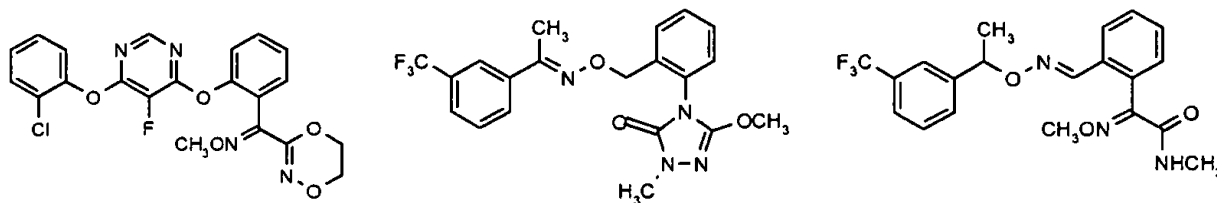
Las composiciones de este invento pueden contener otros compuestos que posean una actividad biológica, por ejemplo micronutrientes o unos compuestos que tengan una actividad fungicida o que posean una actividad reguladora del crecimiento de las plantas, herbicida, insecticida, nematocida o acaricida.

Por inclusión de otro fungicida, la composición resultante puede tener un espectro de actividades más amplio o un mayor nivel de actividad intrínseca que el compuesto de la fórmula (I) a solas. Además, el otro fungicida puede tener un efecto sinérgico sobre la actividad fungicida del compuesto de la fórmula (I).

El compuesto de la fórmula (I) puede ser el único ingrediente activo de la composición o puede ser mezclado con uno o más ingredientes activos adicionales tal como un plaguicida, fungicida, agente sinérgico, herbicida o regulador del crecimiento de las plantas cuando sea apropiado. Un ingrediente activo adicional puede proporcionar una composición que tenga un espectro más amplio de actividad o una persistencia aumentada en un sitio; activar sinérgicamente la actividad o complementar la actividad (por ejemplo por aumento de la velocidad del efecto o superando una repelencia del compuesto de la fórmula (I); o ayudar a superar o impedir el desarrollo de resistencia a componentes individuales. El ingrediente activo adicional dependerá de la utilidad pretendida de la composición.

Ejemplos de compuestos fungicidas que se pueden incluir en la composición del invento son AC 382042 (N-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenoxi)propionamida), acibenzolar-S-metilo, alanicarb, aldimorf, anilazina, azaconazol, azafenidina, azoxiestrobina, benalaxilo, benomilo, bentiavalicarb, biloxazol, biteranol, blasticidina S, boscalida (nuevo nombre para el nicobifeno), bromuconazol, bupirimato, captafol, captan, carbendazima, clorhidrato de carbendazima, carboxina, carpropamida, carvona, CGA41396, CGA41397, quinometionato, clorotalonilo, clorozolinato, clozilacona, compuestos que contienen cobre tales como oxiclورو de cobre, oxiquinolato de cobre, sulfato de cobre, tallato de cobre y la mezcla de Burdeos, ciamidazosulfamida, ciazofamida (IKF-916), ciflufenamida, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, debacarb, disulfuro de di-2-piridilo 1,1'-dióxido, diclofluanida, diclocimet, diclomezina, diclorano, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflumetorim, tiofosfato de O,O-di-iso-propilo-S-bencilo, dimefluazol, dimetconazol, dimetirimol, dimetomorf, dimoxiestrobina, diniconazol, dinocap, ditianona, cloruro de dodecil dimetil amonio, dodemorf, dodina, doguadina, edifenfos, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, (Z)-N-bencil-N([metil(metil-tioetilidenoaminooxicarbonil)amino]tio)-β-alaninato de etilo, etridiazol, famoxadone, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenoxanil (AC 382042), fencpiclonilo, fenpropidina, fenpropimorf, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumetover, flumorf, fluoroimida, fluoxaestrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanilo, flutriafol, folpet, fosetil-aluminio, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, hexaconazol, hidroxiisoxazol, hymexazol, imazalilo, imibenconazol, iminocadina, triacetato de iminocadina, ipconazol, iprobenfos, iprodione, iprovalicarb, butil carbamato de isopropanilo, isoprotiolano, kasugamicina, kresoxima-metilo, LY186054, LY211795, LY 248908, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepanipirim, mepronilo, metalaxilo, metalaxilo M, metconazol, metiram, metiram-zinc, metominoestrobina, metrafenona, MON65500 (N-alil-4,5-dimetil-2-trimetilsililtiofeno-3-carboxamida), miclobutanilo, NTN0301, neosozina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitroal-isopropilo, nuarimol, ofurace, compuestos orgánicos de mercurio, orisaestrobina, oxadixilo, oxasulfurón, ácido oxolinico, oxpoconazol, oxicarboxina, pefurazoate, penconazol, pencicurón, óxido de fenazina, ácidos con fósforo, ftalida, picoxiestrobina, polioxina D, poliram, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, hidrocloreuro de propamocarb, propiconazol, propineb, ácido propiónico, proquinazida, protioconazol, piracloestrobina, pirazofos, pirifenox, pirimetanilo, piroquilona, piroxifur, pirrolnitrina, compuestos de amonio cuaternarios, quinometionato, quinoxifeno, quintozeno, siltiofam (MON 65500), S-imazalilo, simeconazol, sipconazol, pentaclorofenato de sodio, espiroxamina, estreptomocina, azufre, tebuconazol, tecloftalam, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifulamida, 2-(tiocianometil)tiobenzotiazol, tiofanato-metilo, tiram,

tiadinilo, timibenconazol, tolclofos-metilo, tolilfluanida, triadimefona, triadimenol, triazbutilo, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxiestrobina, triflumizol, triforina, triticonazol, validamicina A, vapam, vinclozolina, XRD-563, zineb, ziram, zoxamida y compuestos de las formulas:



- 5 Los compuestos de fórmula (I) pueden ser mezclados con tierra, turba u otros medios de enraizamiento para la protección de las plantas contra enfermedades fúngicas llevadas por las semillas, llevadas por la tierra o foliares.

Algunas mezclas pueden comprender unos ingredientes activos que tengan unas propiedades físicas, químicas o biológicas significativamente diferentes, de manera tal que ellas no se presten por si mismas al mismo tipo de formulación convencional. En estas circunstancias se pueden preparar otros tipos de formulaciones. Por ejemplo, cuando un ingrediente activo es un material sólido insoluble en agua y el otro es un material líquido insoluble en agua, no obstante puede ser posible dispersar cada uno de los ingredientes activos en la misma fase acuosa continua por dispersamiento del ingrediente activo sólido en forma de una suspensión (usando un modo de preparación análogo al de un SC) pero por dispersamiento del ingrediente activo líquido en forma de una emulsión (usando un modo de preparación análogo al de una EW). La composición resultante es una formulación de suspoemulsión (SE).

Otros sectores de uso de las composiciones de acuerdo con el invento son la protección de mercancías almacenadas y de despensas y bodegas y la protección de materiales en bruto, tales como madera, materiales textiles, cubrimientos de suelos y edificios, y también en el sector de la higiene.

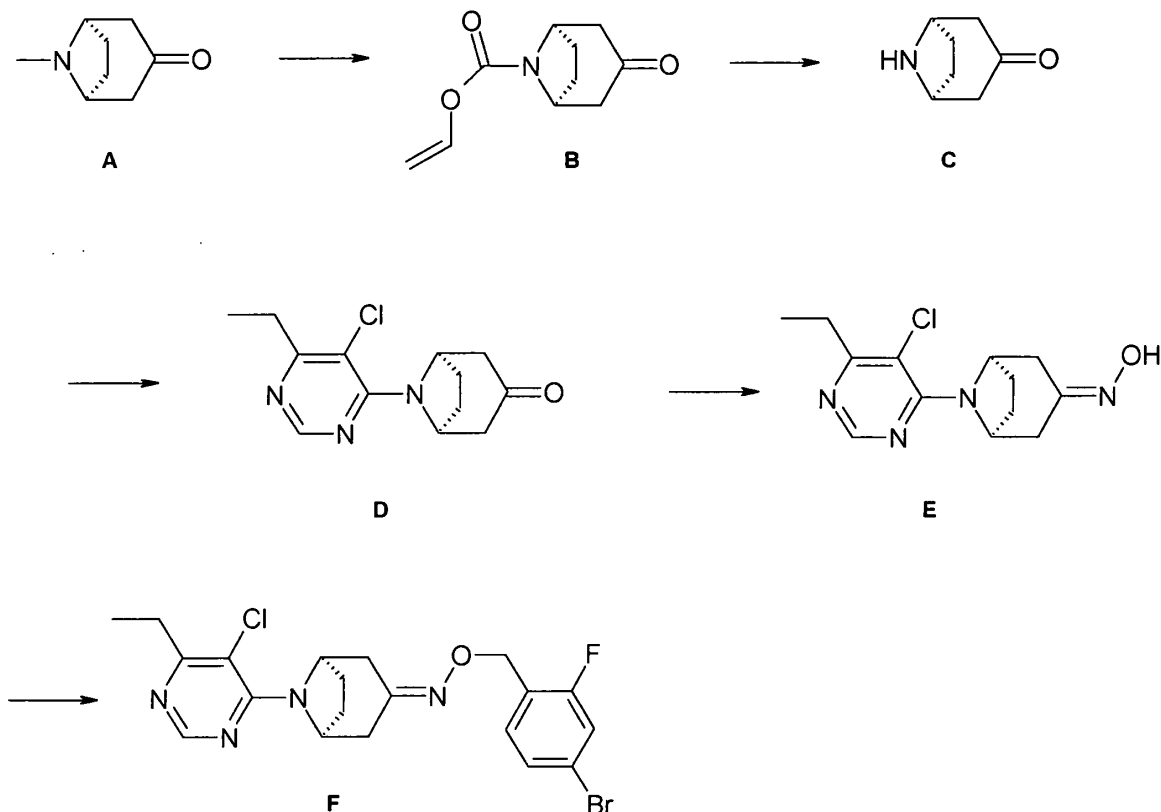
El invento se refiere también al uso de un compuesto de la fórmula (I) en la producción de un medicamento para reprimir plagas en animales domésticos y en el ganado productivo.

En el sector de la higiene, las composiciones de acuerdo con el invento son activas contra ectoparásitos tales como garrapatas duras, garrapatas blandas, ácaros sarcópticos, moscas (mordedoras y lamedoras), larvas de moscas parasitarias, piojos, piojos del cabello, piojos de aves y pulgas

Ejemplos de dichos parásitos son:

- 25 Del orden de los Anoplurida: Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp. y Phtirus spp., Solenopotes spp..
Del orden de los Mallophagida: Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp. y Felicola spp..
Del orden de los Diptera y los subórdenes de los Nematocera y Brachycera, por ejemplo Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp. y Melophagus spp..
30 Del orden de los Siphonaptera, por ejemplo Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..
Del orden de los Heteroptera, por ejemplo Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..
Del orden de los Blattaria, por ejemplo Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica y Supella spp..
De la subclase de los Acaria (Acarida) y de los órdenes de los Meta- y Meso-stigmata, por ejemplo Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp. y Varroa spp..
35 Del orden de los Actiniedida (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata), por ejemplo Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletiella spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Citodites spp. y Laminosioptes spp..
40

El invento es ilustrado por los siguientes Ejemplos:

EJEMPLO 1**O-(4-bromo-2-fluoro-bencil)-oxima de 8-(5-cloro-6-etil-pirimidin-4-il)-8-aza-biciclo[3.2.1]octan-3-ona F****Preparación del éster vinílico de ácido 3-oxo-8-aza-biciclo[3.2.1]octano-8-carboxílico B**

- 5 A una solución de 37,6 g de tropinona en 180 ml de THF se le añadieron 57,5 g de de cloroformiato de vinilo a 0°. La suspensión resultante se agitó durante 1 hora a la temperatura ambiente y durante 1 hora a reflujo. A la temperatura ambiente se añadieron lentamente 400 ml de una solución acuosa saturada de NaHCO₃. La mezcla resultante se agitó durante 15 minutos y luego se extrajo con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se evaporaron. Los resultantes 57,7 g de un aceite de naranja que cristalizaron durante una noche
- 10 se purificaron por cromatografía en columna sobre gel de sílice (con una mezcla de gradientes de hexano y acetato de etilo 3:1 → 2:1) que proporcionó el producto éster vinílico de ácido 3-oxo-8-aza-biciclo[3.2.1]octano-8-carboxílico como un material sólido de color blanco (52,7 g).

15 ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) 1,70 (m, 2H), 2,15 (m, 2H), 2,40 (m, 2H), 2,70 (m, 2H), 4,55 (d, 1H), 4,65 (s, 2H), 4,75 (d, 1H), 7,25 (dd, 1H),

Preparación de 8-aza-biciclo[3.2.1]octan-3-ona C

- 100 ml de HCl al 37 % se añadieron gota a gota a una solución de 48 g del éster vinílico del ácido 3-oxo-8-aza-biciclo[3.2.1]octano-8-carboxílico bruto en 200 ml de metanol. La resultante mezcla de reacción se agitó durante una hora a reflujo. El metanol se separó por destilación y la fase acuosa se neutralizó con una solución acuosa saturada de carbonato de sodio. La mezcla resultante se extrajo con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se evaporaron. El producto cristalino resultante de color anaranjado (8,9 g) se usó en la siguiente etapa sin ninguna purificación adicional.
- 20

¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) 1,70 (m, 2H), 1,90 (m, 3H), 2,32 (m, 2H), 2,58 (m, 2H), 3,85 (s, 2H),

- 25 **Preparación de 8-(5-cloro-6-etil-pirimidin-4-il)-8-aza-biciclo[3.2.1]octan-3-ona D**

- 5 2,6 g de carbonato de potasio se añadieron a una solución de 2,0 g de 8-aza-biciclo[3.2.1]octan-3-ona y 2,8 g de 4,5-dicloro-6-etilpirimidina en 20 ml de DMF a la temperatura ambiente. La mezcla resultante se agitó durante 3 horas a 65°. La mezcla de reacción se vertió sobre una mezcla de hielo y agua y se extrajo con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se evaporaron. La purificación del residuo por cromatografía en columna sobre gel de sílice (con una mezcla de hexano y acetato de etilo 3:1) proporcionó el producto 8-(5-cloro-6-etil-pirimidin-4-il)-8-aza-biciclo[3.2.1]octan-3-ona como un aceite de color amarillo (2,8 g),

^1H RMN (300 MHz, CDCl_3) 1,30 (t, 3H), 1,82 (m, 2H), 2,18 (m, 2H), 2,42 (m, 2H), 2,88 (m, 4H), 5,25 (s, 2H), 5,20 (s, 1H), 8,50 (s, 1H),

Preparación de la oxima de 8-(5-cloro-6-etil-pirimidin-4-il)-8-aza-biciclo[3.2.1]octan-3-ona E

- 10 236 mg de hidrocloreto de hidroxilamina se añadieron a una solución de solución de 900 mg de 8-(5-cloro-6-etil-pirimidin-4-il)-8-aza-biciclo[3.2.1]octan-3-ona en 20 ml de una mezcla de metanol y agua 1:1. Se añadieron 556 mg de acetato de sodio y la suspensión se agitó durante 2,5 horas a la temperatura ambiente. La mezcla de reacción se vertió sobre agua y se extrajo con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se evaporaron. El resultante producto cristalino de color blanco (950 mg) se usó en la siguiente etapa sin ninguna purificación adicional.

^1H RMN (300 MHz, CDCl_3) 1,30 (t, 3H), 1,78 (m, 2H), 2,10 (m, 2H), 2,40 (m, 2H), 2,73 (d, 1H), 2,90 (q, 2H), 3,25 (d, 1H) 5,13 (s, 1H), 5,20 (s, 1H), 8,50 (s, 1H).

Preparación de la O-(4-bromo-2-fluoro-bencil)-oxima de 8-(5-cloro-6-etil-pirimidin-4-il)-8-aza-biciclo[3.2.1]octan-3-ona F

- 20 162 mg de hidruro de sodio (50%) se añadieron en porciones a una solución de 860 mg de la oxima de 8-(5-cloro-6-etil-pirimidin-4-il)-8-aza-biciclo[3.2.1]octan-3-ona en 15 ml de DMF a 0°. La solución resultante se agitó durante 20 minutos a 0-5°, y luego se añadieron 904 mg de bromuro de 4-bromo-2-fluorobencilo. La mezcla de reacción se agitó durante 16 horas a la temperatura ambiente. Se añadieron a 0-5° 15 ml de una solución acuosa saturada de cloruro de amonio. La mezcla de reacción se vertió sobre agua y se extrajo con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se evaporaron. El producto resultante se purificó por HPLC (cromatografía de fase líquida de alto rendimiento) preparativa para proporcionar 807 mg de la O-(4-bromo-2-fluoro-bencil)-oxima de 8-(5-cloro-6-etil-pirimidin-4-il)-8-aza-biciclo[3.2.1]octan-3-ona como un aceite de color amarillo.

^1H RMN (300 MHz, CDCl_3) 1,28 (t, 3H), 1,70 (m, 2H), 2,05 (m, 2H), 2,35 (m, 2H), 2,78 (d, 1H), 2,85 (q, 2H), 3,15 (d, 1H) 5,05 (m, 3H), 5,15 (s, 1H), 7,22 (m, 3H), 8,45 (s, 1H).

- 30 Los siguientes compuestos se prepararon de acuerdo con procedimientos análogos a los descritos en el Ejemplo 1.

Tabla 3

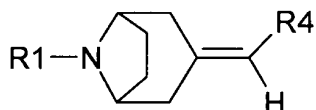
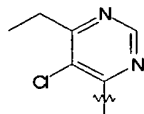
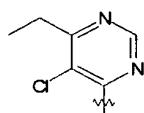
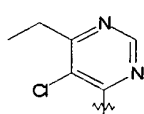
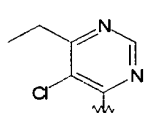
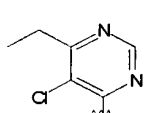
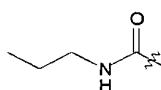
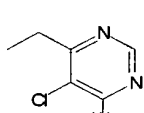
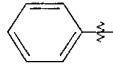
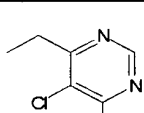
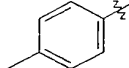
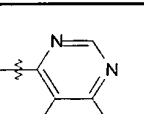
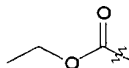
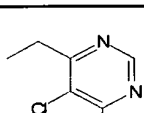
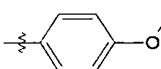
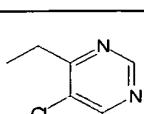
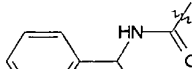
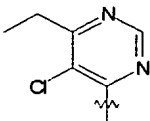
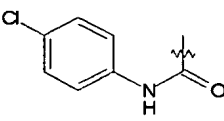
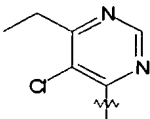
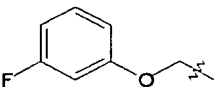
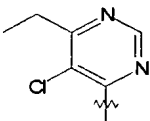
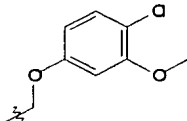
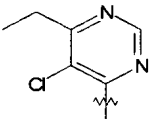
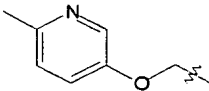
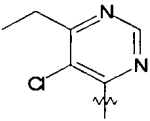
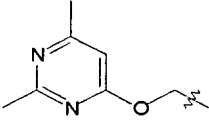
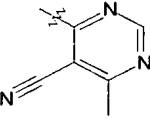
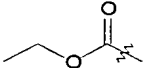
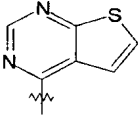
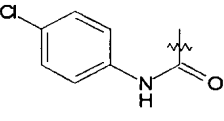
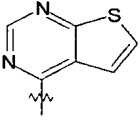
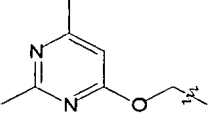
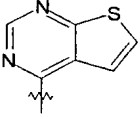
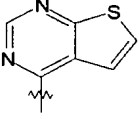
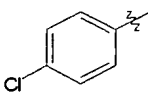
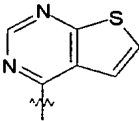
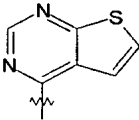
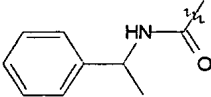
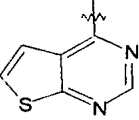
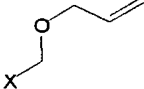
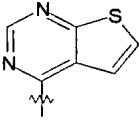
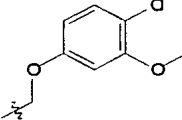
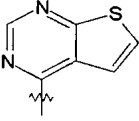
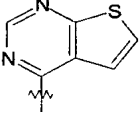
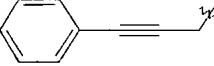
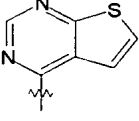
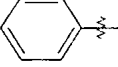
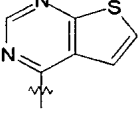
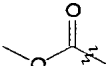
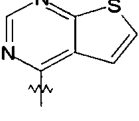
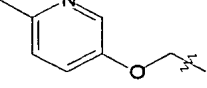
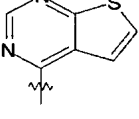
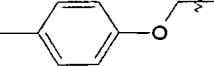
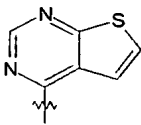
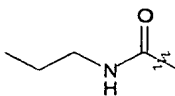
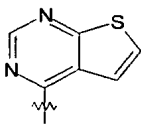
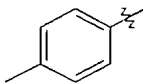
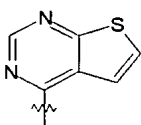
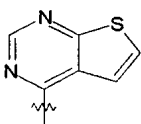
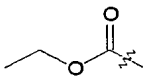
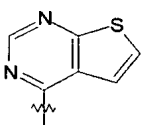
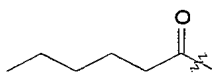
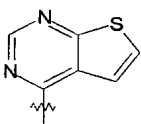
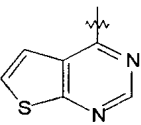
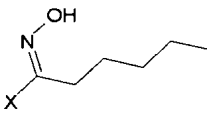
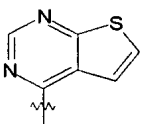
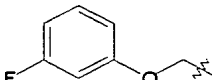
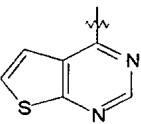
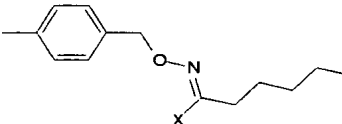
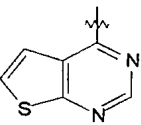
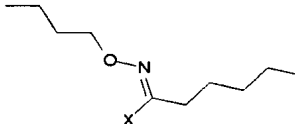


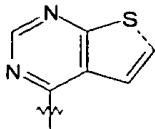
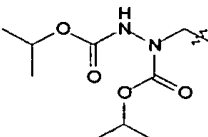
Tabla 3

N°	R1	R4	p.f. (°C)
3.1			73
3.2			
3.3			
3.4			162
3.5			
3.6			
3.7			
3.8			
3.9			
3.10			

N°	R1	R4	p.f. (°C)
3.11			
3.12			
3.13			
3.14			
3.15			
3.16			
3.17			
3.18			
3.19			
3.20			

N°	R1	R4	p.f. (°C)
3.21			
3.22			
3.23			
3.24			
3.25			
3.26			
3.27			
3.28			
3.29			
3.30			

N°	R1	R4	p.f. (°C)
3.31			
3.32			
3.33			
3.34			101
3.35			
5.36			
3.37			127
3.38			
3.39			
3.40			

N°	R1	R4	p.f. (°C)
3.41			

5

Tabla 5

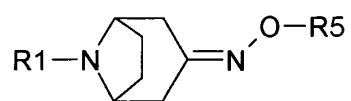
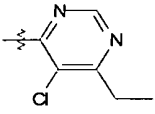
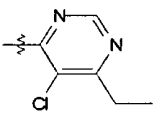
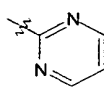
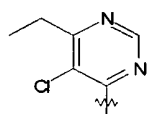
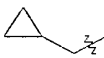
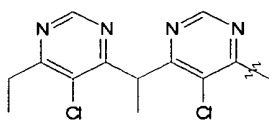
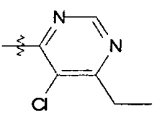
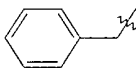
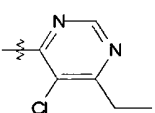
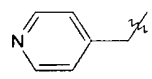
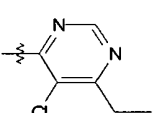
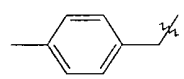
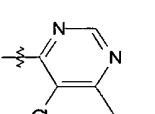
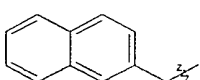
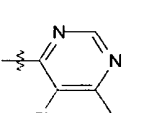
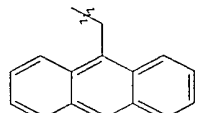
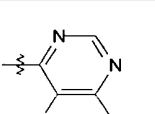
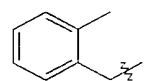
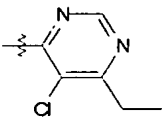
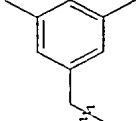
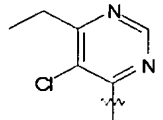
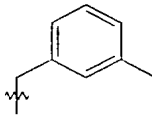
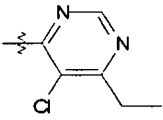
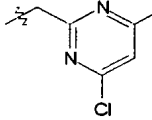
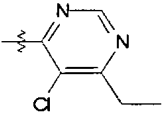
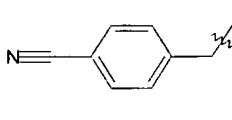
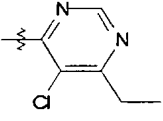
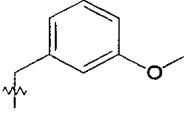
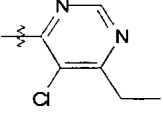
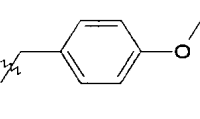
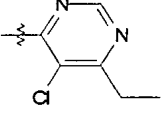
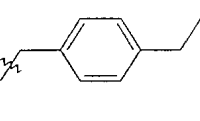
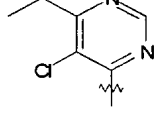
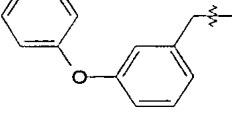
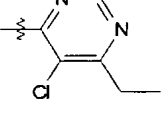
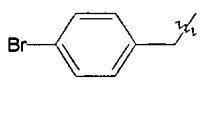
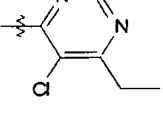
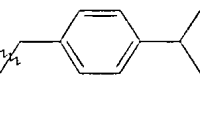
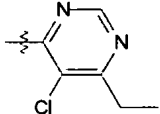
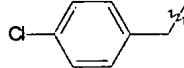
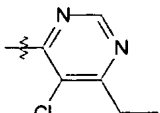
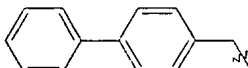
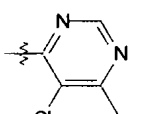
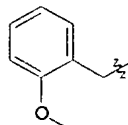
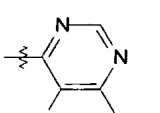
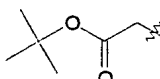
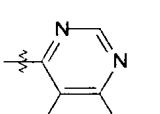
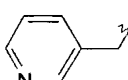
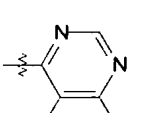
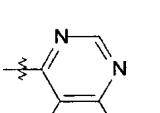
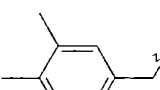
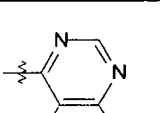
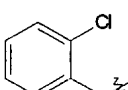
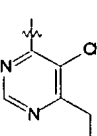
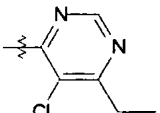
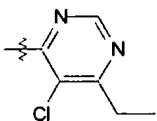
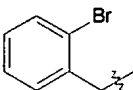
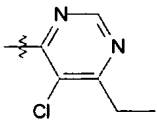
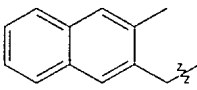
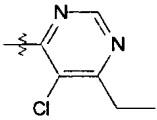
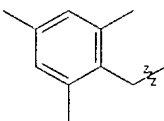
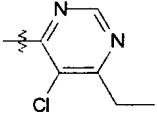
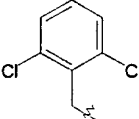
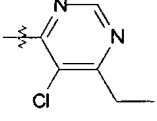
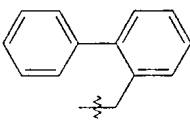
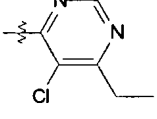
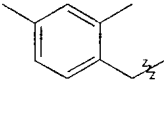
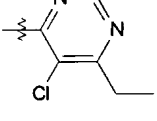
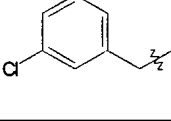
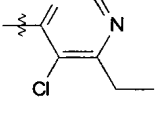
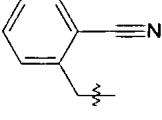
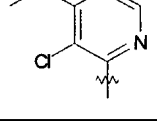
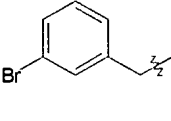
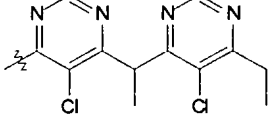


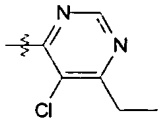
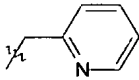
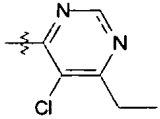
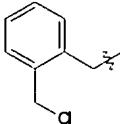
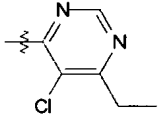
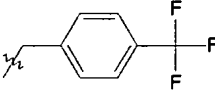
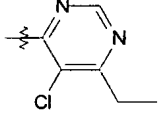
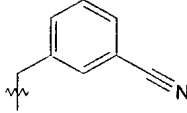
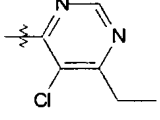
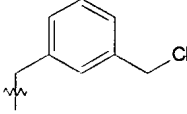
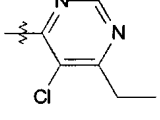
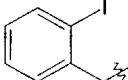
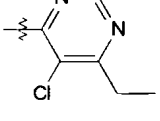
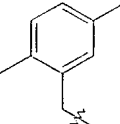
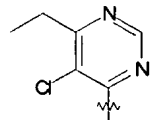
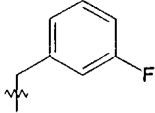
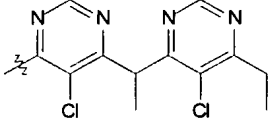
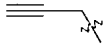
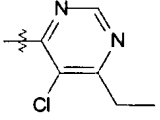
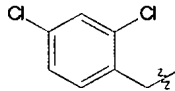
Tabla 5

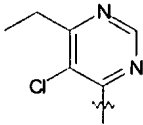
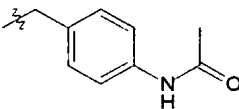
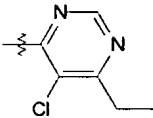
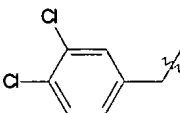
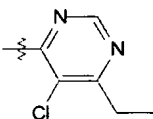
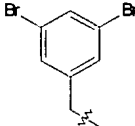
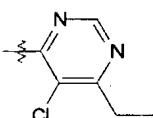
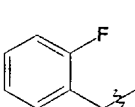
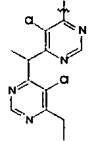
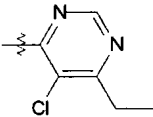
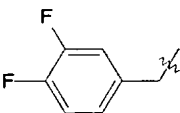
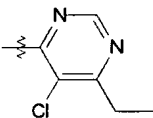
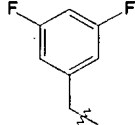
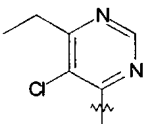
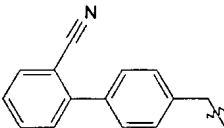
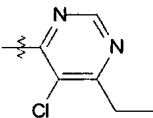
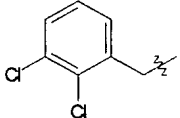
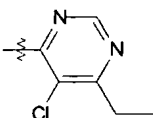
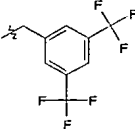
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.1			73
5.2			
5.3			
5.4			162
5.5			
5.6			
5.7			
5.8			
5.9			
5.10			

N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.11			
5.12			
5.13			
5.14			
5.15			
5.16			
5.17			
5.18			
5.19			
5.20			

N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.21			
5.22			
5.23			
5.24			
5.25			
5.26			
5.27			
5.28			
5.29			
5.30			

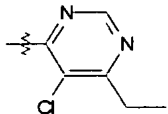
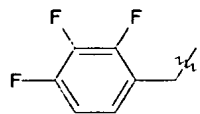
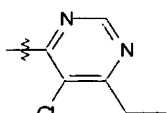
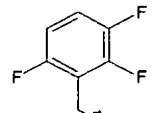
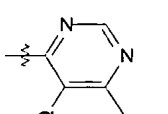
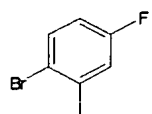
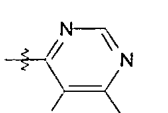
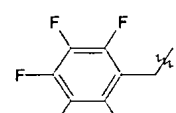
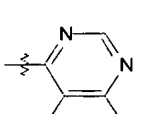
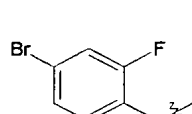
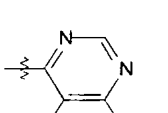
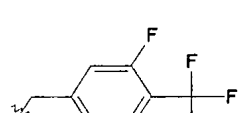
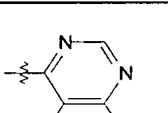
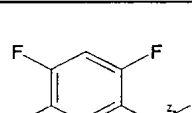
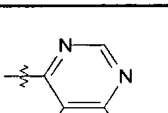
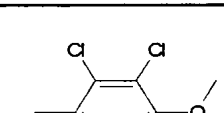
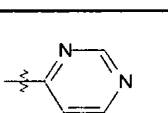
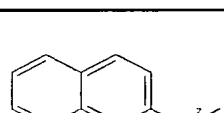
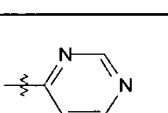
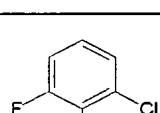
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.31			
5.32			
5.33			
5.34			
5.35			
5.36			
5.37			
5.38			
5.39			
5.40			

N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.41			
5.42			
5.43			
5.44			
5.45			
5.46			
5.47			
5.48			
5.49			
5.50			

N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.51			
5.52			
5.53			
5.54			
5.55			
5.56			
5.57			
5.58			
5.59			
5.60			

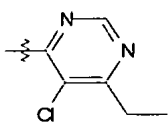
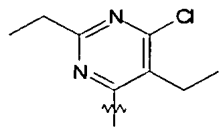
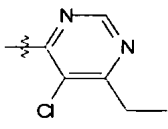
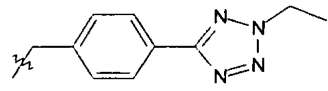
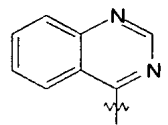
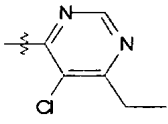
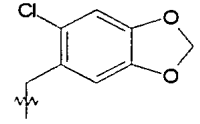
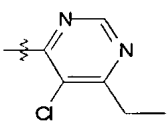
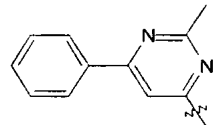
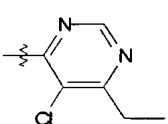
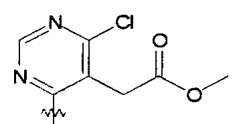
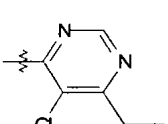
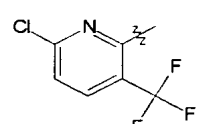
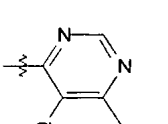
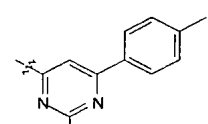
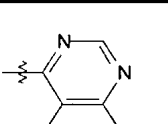
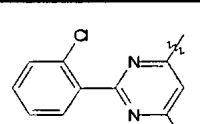
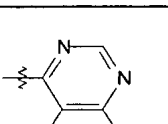
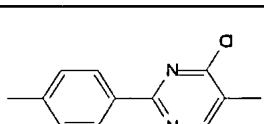
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.61			
5.62			
5.63			
5.64			
5.65			
5.66			
5.67			
5.68			
5.69			
5.70			

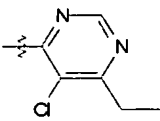
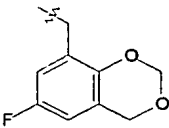
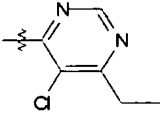
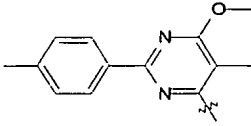
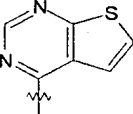
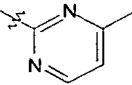
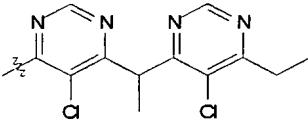
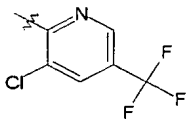
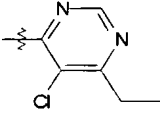
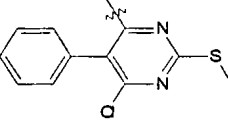
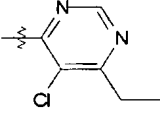
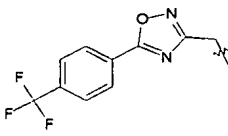
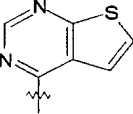
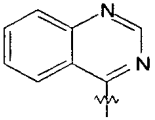
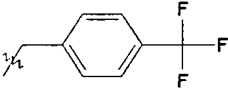
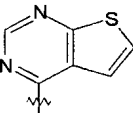
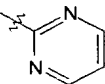
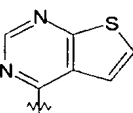
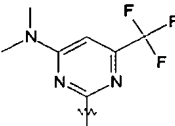
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.71			
5.72			
5.73			
5.74			
5.75			
5.76			
5.77			
5.78			
5.79			
5.80			

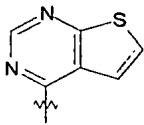
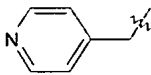
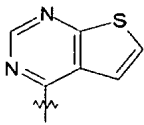
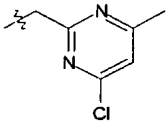
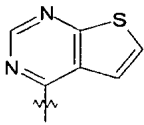
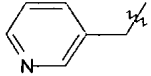
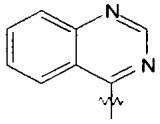
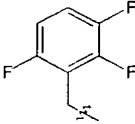
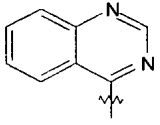
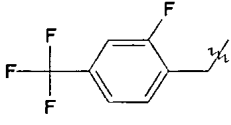
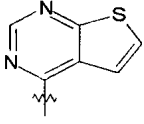
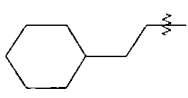
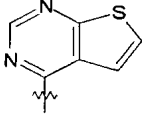
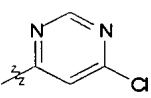
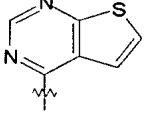
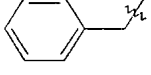
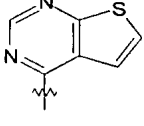
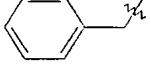
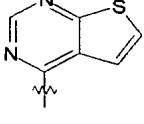
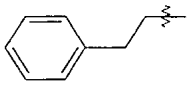
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.81			
5.82			
5.83			
5.84			
5.85			Oil
5.86			
5.87			
5.88			
5.89			
5.90			

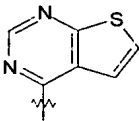
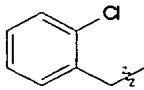
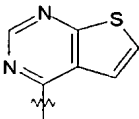
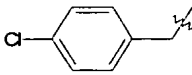
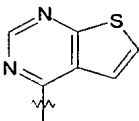
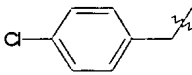
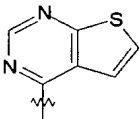
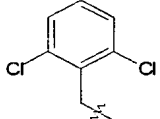
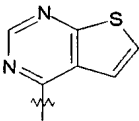
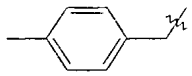
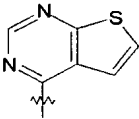
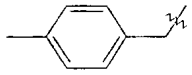
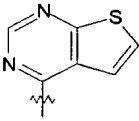
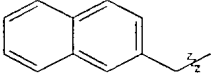
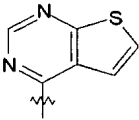
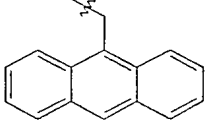
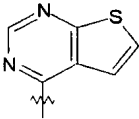
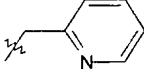
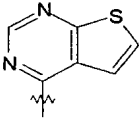
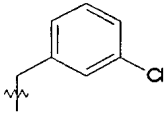
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.91			
5.92			
5.93			
5.94			
5.95			
5.96			
5.97			
5.98			
5.99			
5.100			

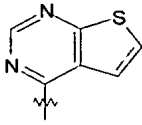
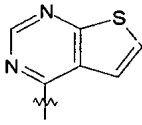
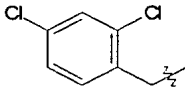
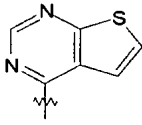
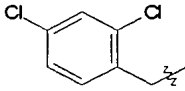
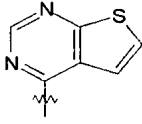
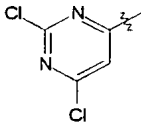
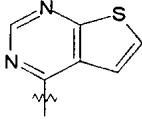
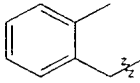
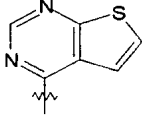
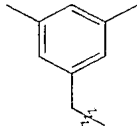
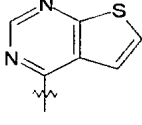
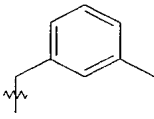
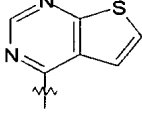
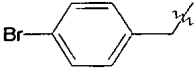
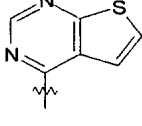
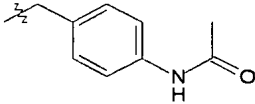
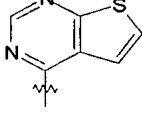
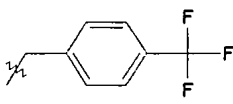
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.101			
5.102			
5.103			
5.104			
5.105			
5.106			
5.107			
5.108			
5.109			
5.110			

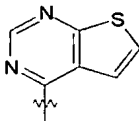
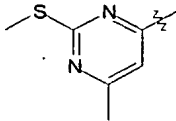
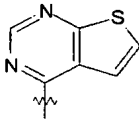
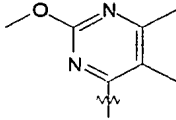
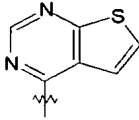
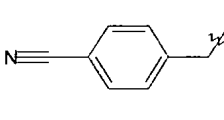
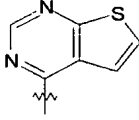
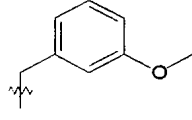
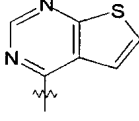
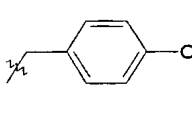
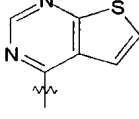
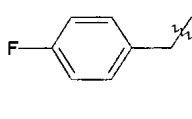
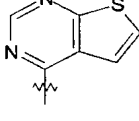
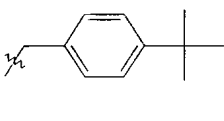
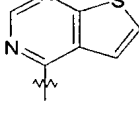
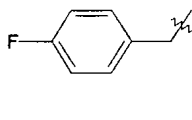
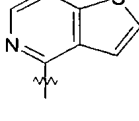
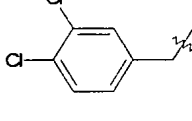
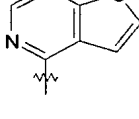
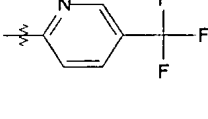
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.111			
5.112			
5.113			
5.114			
5.115			
5.116			
5.117			
5.118			
5.119			
5.120			

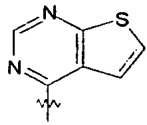
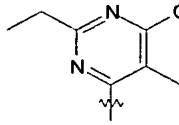
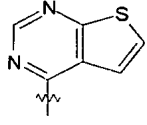
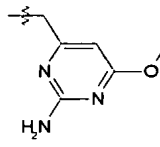
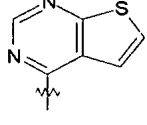
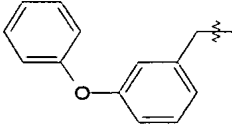
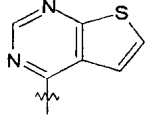
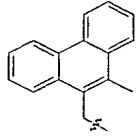
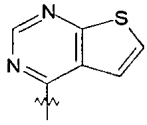
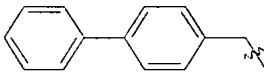
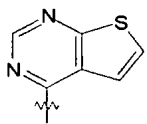
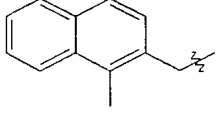
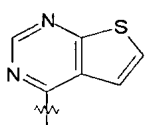
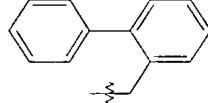
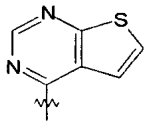
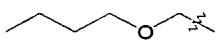
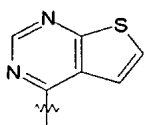
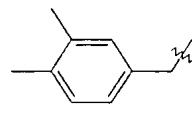
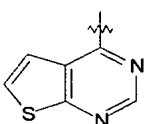
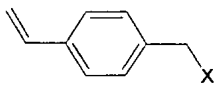
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.121			
5.122			
5.123			
5.124			
5.125			
5.126			
5.127			
5.128			
5.129			
5.130			

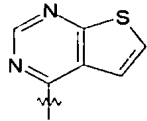
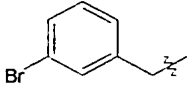
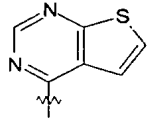
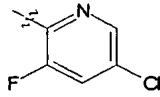
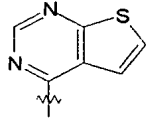
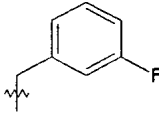
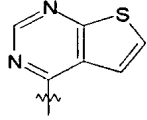
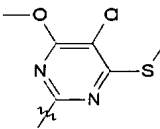
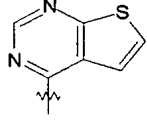
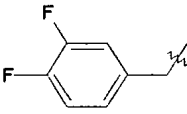
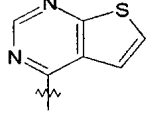
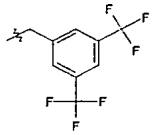
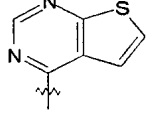
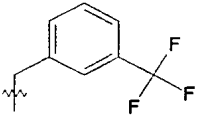
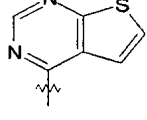
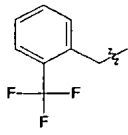
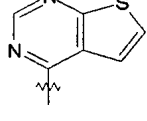
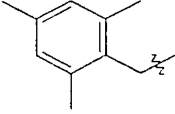
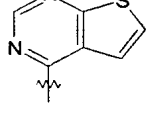
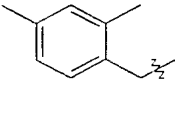
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.131			
5.132			
5.133			
5.134			
5.135			
5.136			
5.137			
5.138			89
5.139			
5.140			

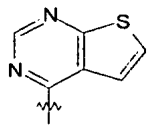
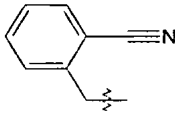
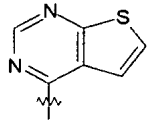
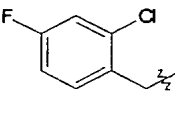
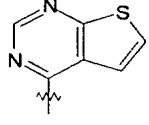
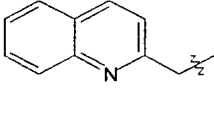
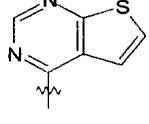
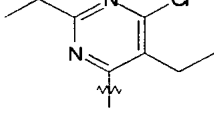
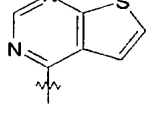
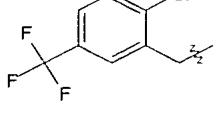
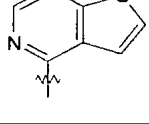
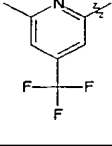
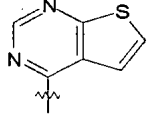
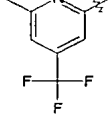
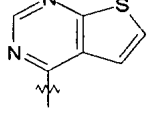
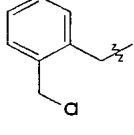
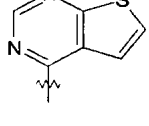
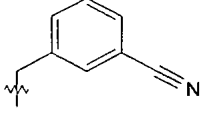
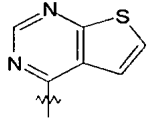
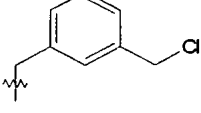
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.141			
5.142			171
5.143			
5.144			
5.145			138
5.146			
5.147			
5.148			
5.149			
5.150			

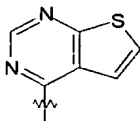
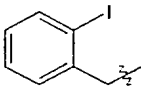
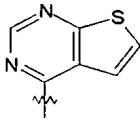
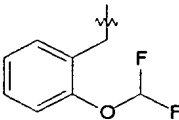
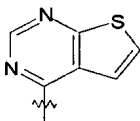
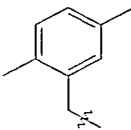
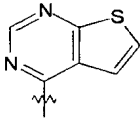
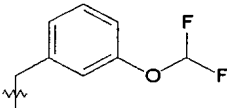
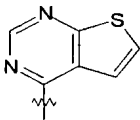
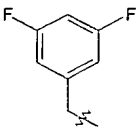
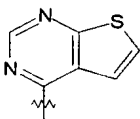
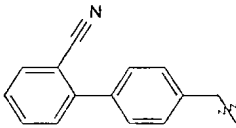
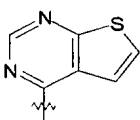
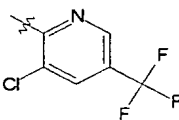
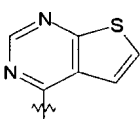
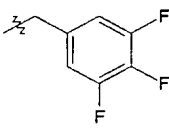
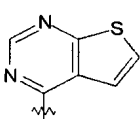
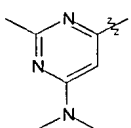
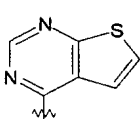
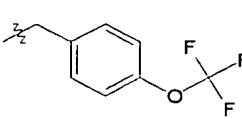
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.151			
5.152			
5.153			
5.154			
5.155			
5.156			
5.157			
5.158			
5.159			
5.160			

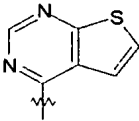
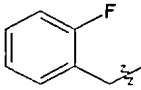
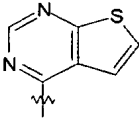
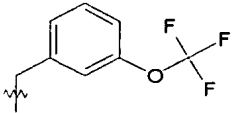
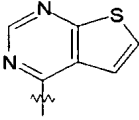
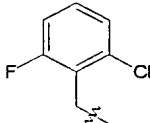
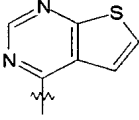
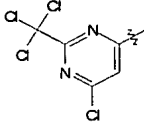
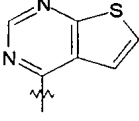
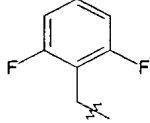
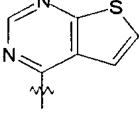
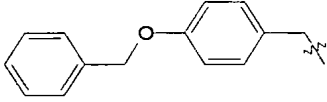
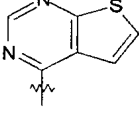
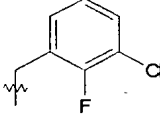
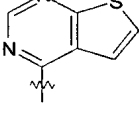
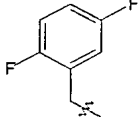
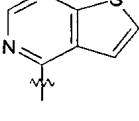
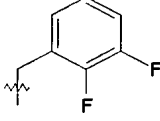
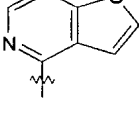
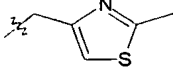
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.161			
5.162			
5.163			
5.164			
5.165			
5.166			
5.167			
5.168			
5.169			
5.170			160

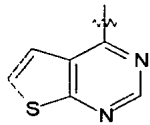
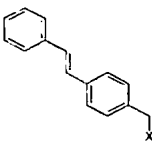
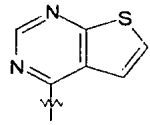
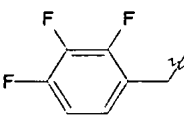
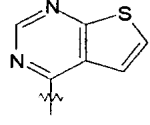
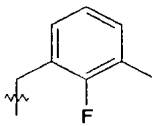
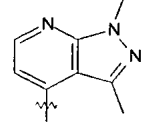
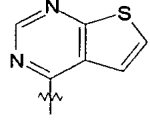
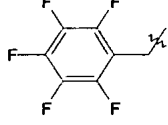
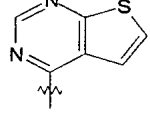
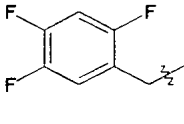
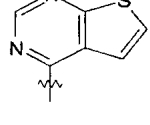
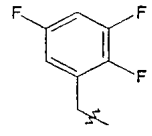
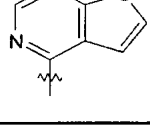
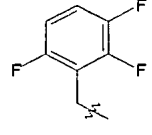
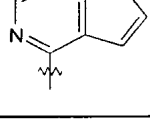
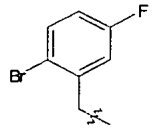
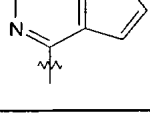
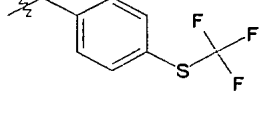
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.171			
5.172			
5.173			
5.174			
5.175			
5.176			
5.177			
5.178			
5.179			
5.180			

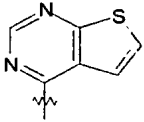
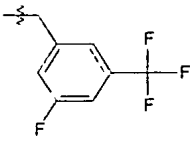
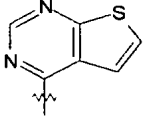
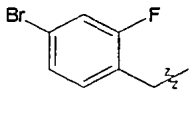
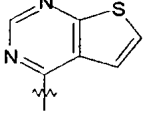
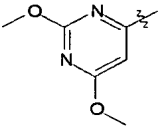
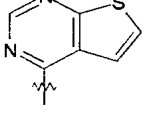
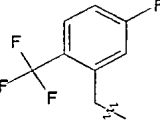
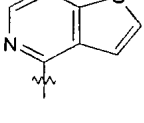
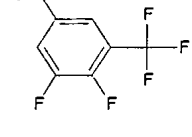
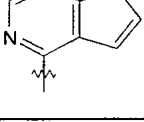
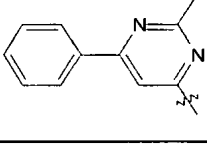
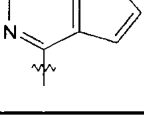
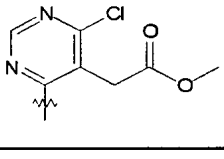
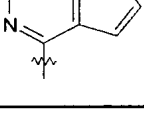
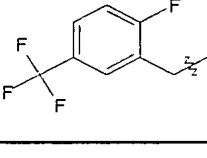
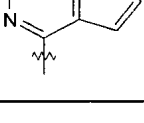
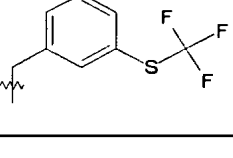
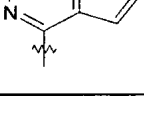
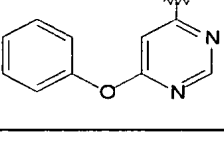
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.181			
5.182			
5.183			
5.184			
5.185			
5.186			
5.187			
5.188			
5.189			
5.190			

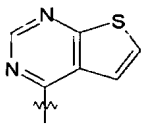
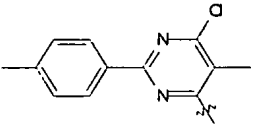
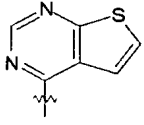
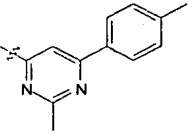
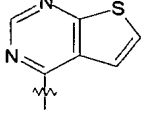
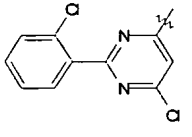
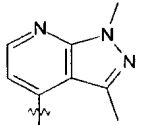
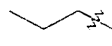
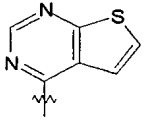
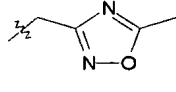
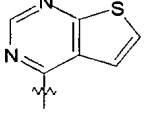
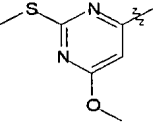
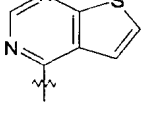
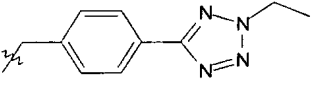
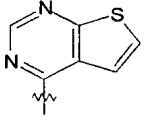
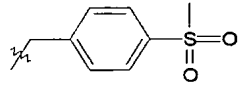
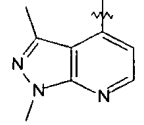
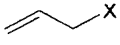
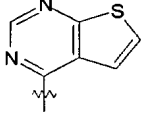
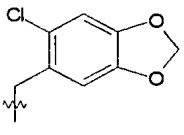
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.191			
5.192			
5.193			
5.194			
5.195			
5.196			167
5.197			
5.198			
5.199			
5.200			

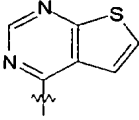
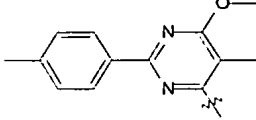
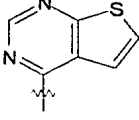
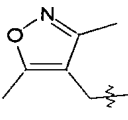
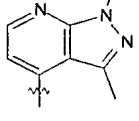
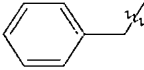
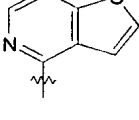
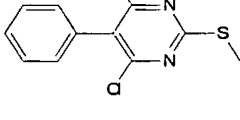
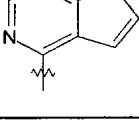
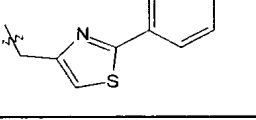
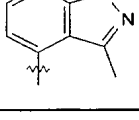
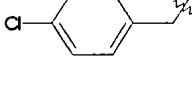
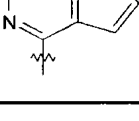
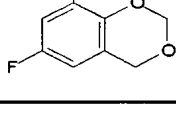
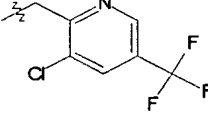
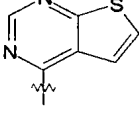
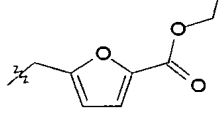
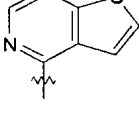
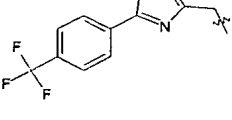
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.201			
5.202			
5.203			
5.204			
5.205			
5.206			
5.207			156
5.208			
5.209			
5.210			

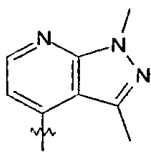
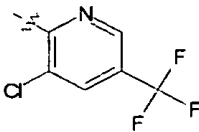
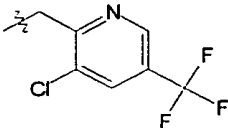
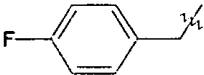
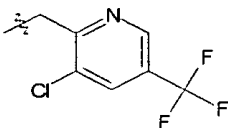
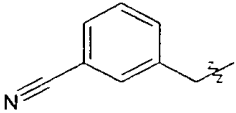
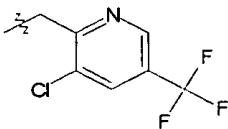
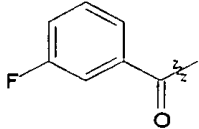
N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.211			
5.212			
5.213			
5.214			
5.215			
5.216			
5.217			
5.218			
5.219			
5.220			

N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.221			
5.222			124
5.223			
5.224			201
5.225			
5.226			106
5.227			
5.228			
5.229			
5.230			

N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.231			
5.232			
5.233			
5.234			
5.235			
5.236			
5.237			
5.238			
5.239			
5.240			

N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.241			
5.242			
5.243			
5.244			
5.245			
5.246			
5.247			
5.248			
5.249			151
5.250			

N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.251			
5.252			
5.253			
5.254			
5.255			
5.256			
5.257			
5.258			
5.259			
5.260			

N°	R1	R5	p.f. (°C)
5.261			153
5.262			
5.263			
5.264			

EJEMPLO 2

Este Ejemplo ilustra las propiedades plaguicidas/insecticidas de compuestos de fórmula (I). Los ensayos contra ciertos organismos se realizaron de la siguiente manera:

Spodoptera littoralis (cicadela del algodón):

- 5 Unos discos de hojas de algodón se colocaron sobre un agar en una placa de microtitulación de 24 pocillos y se rociaron con soluciones de ensayo con una tasa de aplicación de 200 ppm. Después de haberlos secado, los discos de hojas fueron infestados con larvas 5 L₁. Las muestras fueron comprobadas en cuanto a la mortalidad, al efecto repelente, al comportamiento de alimentación y a la regulación del crecimiento a los 3 días después del tratamiento (DAT acrónimo de Days After Treatment). Los siguientes compuestos dieron una represión de *Spodoptera littoralis* de por lo menos un 80 %:

3,7, 3,9, 3,14, 3,20, 3,27, 3,32, 3,36, 5,29, 5,30, 5,211, 5,215, 5,232.

Heliothis virescens (gusano de las yemas del tabaco):

- 15 Unos huevos (con una edad de 0-24 h) se colocaron sobre una placa de microtitulación de 24 pocillos con una dieta artificial y se trataron con unas soluciones de ensayo en una tasa de aplicación de 200 ppm mediante adición con pipeta. Después de un período de tiempo de incubación de 4 días, las muestras fueron comprobadas en cuanto a la mortalidad de los huevos, la mortalidad de las larvas y la regulación del crecimiento. Los siguientes compuestos dieron una represión de *Heliothis virescens* de por lo menos un 80 %:

3,7, 3,8, 3,9, 3,12, 3,13, 3,14, 3,15, 3,20, 3,23, 3,27, 3,29, 3,30, 3,32, 3,36, 5,5, 5,14, 5,16, 5,21, 5,29, 5,30, 5,41, 5,73, 5,85, 5,87, 5,92, 5,128, 5,134, 5,135, 5,138, 5,139, 5,145, 5,146, 5,152, 5,153, 5,163, 5,211, 5,245.

- 20 *Plutella xylostella* (palomilla de dorso de diamante):

- Una placa de microtitulación (MTP, acrónimo de Micro Titer Plate) de 24 pocillos con una dieta artificial se trató con unas soluciones de ensayo en una tasa de aplicación de 200 ppm mediante adición con pipeta. Después de haberlas secado, las MTP's fueron infestadas con larvas (L2) (10-15 por pocillo). Después de un período de tiempo de incubación de 5 días, las muestras fueron comprobadas en cuanto a la mortalidad de las larvas, la represión de la alimentación y la regulación del crecimiento. Los siguientes compuestos dieron una represión de *Plutella xylostella* de por lo menos un 80 %:

- 3,6, 3,7, 3,9, 3,12, 3,20, 3,27, 3,29, 3,32, 3,35, 3,36, 3,38, 5,5, 5,7, 5,8, 5,10, 5,12, 5,14, 5,16, 5,17, 5,19, 5,21, 5,27, 5,28, 5,29, 5,30, 5,31, 5,33, 5,34, 5,36, 5,43, 5,44, 5,50, 5,54, 5,61, 5,66, 5,68, 5,70, 5,73, 5,74, 5,76, 5,79, 5,82, 5,85, 5,87, 5,88, 5,92, 5,128, 5,134, 5,135, 5,138, 5,139, 5,141, 5,142, 5,143, 5,145, 5,146, 5,147, 5,152, 5,153, 5,155, 5,160, 5,163, 5,164, 5,166, 5,168, 5,169, 5,179, 5,180, 5,185, 5,187, 5,188, 5,190, 5,192, 5,204, 5,210, 5,211, 5,213, 5,215, 5,217, 5,218, 5,219, 5,222, 5,223, 5,228, 5,232, 5,238, 5,245.

Aedes aegypti (mosquito de la fiebre amarilla):

- 35 10-15 larvas de *Aedes* (L2), conjuntamente con una mezcla de nutrición, se colocan en placas de microtitulación de 96 pocillos. Las soluciones de ensayo en una tasa de aplicación de 2 ppm se añaden con pipeta a los pocillos. 2 días más tarde, los insectos se comprobaron en cuanto a la mortalidad y la inhibición del crecimiento. Los siguientes compuestos dieron una represión de *Aedes aegypti* de por lo menos un 80 %:

- 3,6, 3,7, 3,8, 3,9, 3,12, 3,13, 3,14, 3,15, 3,18, 3,20, 3,23, 3,27, 3,28, 3,29, 3,30, 3,32, 3,35, 3,36, 3,38, 5,3, 5,5, 5,6, 5,7, 5,12, 5,15, 5,16, 5,17, 5,21, 5,25, 5,28, 5,29, 5,30, 5,36, 5,38, 5,41, 5,44, 5,48, 5,54, 5,61, 5,68, 5,70, 5,73, 5,76, 5,81, 5,82, 5,87, 5,88, 5,90, 5,92, 5,98, 5,112, 5,114, 5,128, 5,131, 5,134, 5,135, 5,138, 5,139, 5,141, 5,142, 5,143, 5,144, 5,145, 5,146, 5,147, 5,149, 5,150, 5,151, 5,152, 5,153, 5,155, 5,160, 5,163, 5,164, 5,166, 5,168, 5,179, 5,180, 5,181, 5,183, 5,185, 5,187, 5,188, 5,190, 5,191, 5,192, 5,193, 5,202, 5,204, 5,210, 5,211, 5,213, 5,215, 5,217, 5,218, 5,219, 5,222, 5,223, 5,227, 5,228, 5,232, 5,238, 5,245, 5,250, 5,255.

- 45 *Myzus persicae* (áfido de albaricque verde): Unos discos de hojas de girasol se colocan sobre un agar en una placa de microtitulación de 24 pocillos y se rocían con las soluciones de ensayo en una tasa de aplicación de 200 ppm. Después de haberlos secado, los discos de hojas son infestados con una población de áfidos de edades mixtas. Después de un período de incubación de 6 DAT, las muestras son comprobadas en cuanto a la mortalidad y a unos efectos especiales (p.ej. la fitotoxicidad). Los siguientes compuestos dieron una represión de *Myzus persicae* de por lo menos un 80 %:

- 2,33, 3,14, 3,29, 3,32, 3,36, 5,7, 5,21, 5,29, 5,30, 5,43, 5,54, 5,76, 5,82, 5,114, 5,152, 5,153, 5,166, 5,168, 5,180, 5,190, 5,215, 5,218, 5,222, 5,232, 5,245.

- 50 *Tetranychus urticae* (arácnido de dos motas): Unos discos de hojas de judía sobre un agar en placas de microtitulación de 24 pocillos se rocían con las soluciones de ensayo en una tasa de aplicación de 200 ppm. Después de haberlos secado, los discos de hojas son infestados con poblaciones de ácaros de edades mixtas. 8 días más tarde, los discos son comprobados en cuanto a la mortalidad de los huevos, la mortalidad de las larvas y la mortalidad de los adultos. Los siguientes compuestos dieron una represión de *Tetranychus urticae* de por lo menos un 80 %:

3,6, 3,7, 3,9, 3,14, 3,20, 3,27, 3,32, 3,36, 5,6, 5,16, 5,20, 5,22, 5,29, 5,43, 5,54, 5,66, 5,85, 5,86, 5,92, 5,99, 5,106, 5,128, 5,135, 5,138, 5,139, 5,145, 5,146, 5,147, 5,151, 5,160, 5,167, 5,170, 5,179, 5,180, 5,192, 5,210, 5,215, 5,217, 5,218, 5,228, 5,248, 5,260.

EJEMPLO 3

Este Ejemplo ilustra las propiedades fungicidas de compuestos de fórmula (I).

Los compuestos se ensayaron en un ensayo de discos de hojas, con los métodos que se describen seguidamente.

Los compuestos de ensayo fueron disueltos en DMSO y diluidos en agua hasta 200 ppm. En el caso del ensayo con *Pythium ultimum*, ellos fueron disueltos en DMSO y diluidos en agua hasta 20 ppm.

Erysiphe graminis f.sp. hordei (mildiu polvoriento de la cebada): Unos segmentos de hojas de cebada se colocaron sobre un agar en una placa de 24 pocillos y rociados con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejarlos secarse completamente, durante un período comprendido entre 12 y 24 horas, los discos de hojas fueron inoculados con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación apropiada, la actividad de un compuesto se comprobó cuatro días después de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Erysiphe graminis f.sp. tritici (mildiu polvoriento del trigo): Unos segmentos de hoja de trigo se colocaron sobre un agar en una placa de 24 pocillos y rociados con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejarlos secarse completamente, durante un período comprendido entre 12 y 24 horas, los discos de hojas fueron inoculados con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación apropiada, la actividad de un compuesto se comprobó cuatro días después de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Puccinia recondita f.sp. tritici (tizón pardo del trigo): Unos segmentos de hojas de trigo se colocaron sobre un agar en una placa de 24 pocillos y rociados con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejarlos secarse completamente, durante un período comprendido entre 12 y 24 horas, los discos de hojas fueron inoculados con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación apropiada, la actividad de un compuesto se comprobó a los cuatro días después de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Septoria nodorum (tizón de gluma del trigo): Unos segmentos de hojas de trigo se colocaron sobre un agar en una placa de 24 pocillos y rociados con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejarlos secarse completamente, durante un período comprendido entre 12 y 24 horas, los discos de hojas fueron inoculados con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación apropiada, la actividad de un compuesto se comprobó cuatro días después de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Pyrenophora teres (mancha reticular de la cebada): Unos segmentos de hoja de cebada se colocaron sobre un agar en una placa de 24 pocillos y rociados con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejarlos secarse completamente, durante un período comprendido entre 12 y 24 horas, los discos de hojas fueron inoculados con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación apropiada, la actividad de un compuesto se comprobó cuatro días después de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Pyricularia oryzae (quemado del arroz): Unos segmentos de hojas de arroz se colocaron sobre un agar en una placa de 24 pocillos y rociados con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejarlos secarse completamente, durante un período comprendido entre 12 y 24 horas, los discos de hojas fueron inoculados con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación apropiada, la actividad de un compuesto se comprobó cuatro días después de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Botrytis cinerea (moho gris): Unos discos de hojas de judía se colocaron sobre un agar en una placa de 24 pocillos y rociados con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejarlos secarse completamente, durante un período comprendido entre 12 y 24 horas, los discos de hojas fueron inoculados con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación apropiada, la actividad de un compuesto se comprobó cuatro días después de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Phytophthora infestans (tizón tardío de la patata en tomate): Unos discos de hojas de tomate se colocaron en un agar en agua en una placa de 24 pocillos y rociados con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejarlos secarse completamente, durante un período comprendido entre 12 y 24 horas, los discos de hojas fueron inoculados con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación apropiada, la actividad de un compuesto se comprobó cuatro días después de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Plasmopara viticola (mildiu lanoso de la vid): Unos discos de hojas de viña se colocaron sobre un agar en una placa de 24 pocillos y rociados con una solución del compuesto de ensayo. Después de dejarlos secarse completamente, durante un período comprendido entre 12 y 24 horas, los discos de hojas fueron inoculados con una suspensión de esporas del hongo. Después de una incubación apropiada, la actividad de un compuesto se comprobó cuatro días después de la inoculación como actividad fungicida preventiva.

Septoria tritici (mancha de hojas de trigo): Unos conidios del hongo procedentes de un almacenamiento criogénico fueron mezclados directamente dentro de un caldo nutriente (caldo de dextrosa de patata PDB). Después de colocar una solución (en DMSO) de los compuestos de ensayo dentro de una placa de microtitulación (con el formato de 96 pocillos) se añadió el caldo nutriente que contenía las esporas del hongo. Las placas de ensayo fueron incubadas a 24°C y se determinó fotométricamente después de 72 horas la inhibición del crecimiento.

Botrytis cinerea (moho gris): Unos conidios del hongo procedentes de un almacenamiento criogénico fueron mezclados directamente dentro de un caldo nutriente (caldo de dextrosa de patata PDB). Después de colocar una solución (en DMSO) de los compuestos de ensayo dentro de una placa de microtitulación (con el formato de 96 pocillos) se añadió el caldo nutriente que contenía las esporas del hongo. Las placas de ensayo fueron incubadas a 24°C y se determinó fotométricamente después de 72 horas la inhibición del crecimiento.

Rhizoctonia solani (podredumbre del pie y marchitamiento): Unos conidios del hongo procedentes de un almacenamiento criogénico fueron mezclados directamente dentro de un caldo nutriente (caldo de dextrosa de patata PDB). Después de colocar una solución (DMSO) de los compuestos de ensayo dentro de una placa de microtitulación (con el formato de 96 pocillos) se añadió el caldo nutriente que contenía las esporas del hongo. Las

placas de ensayo fueron incubadas a 24°C y se determinó fotométricamente después de 72 horas la inhibición del crecimiento

Fusarium culmorum (Podredumbre de raíces): Unos conidios del hongo procedentes de un almacenamiento criogénico fueron mezclados directamente dentro de un caldo nutriente (caldo de dextrosa de patata PDB). Después de colocar una solución (en DMSO) de los compuestos de ensayo dentro de una placa de microtitulación (con el formato de 96 pocillos) se añadió el caldo nutriente que contenía las esporas del hongo. Las placas de ensayo fueron incubadas a 24°C y se determinó fotométricamente después de 48 horas la inhibición del crecimiento

Pythium ultimum (marchitamiento): Unos fragmentos de micelios del hongo, preparados a partir de un cultivo líquido reciente se mezclaron en un caldo de dextrosa de patata. Una solución del compuesto del ensayo en dimetil sulfoxido se diluyó con agua hasta 20 ppm y luego se colocó en una placa de microtitulación de 96 pocillos y se añadió el caldo nutriente que contenía las esporas del hongo. La placa de ensayo se incubó a 24°C y se determinó fotométricamente después de 48 horas la inhibición del crecimiento

Los siguientes compuestos (el número del compuesto está relacionado con las Tablas) dieron una represión de por lo menos un 80 % de la siguiente infección fúngica a 200 ppm:

Plasmopara viticola, compuestos 3.5; 3.17; 3.18; 3.20; 3.22; 3.23; 3.27; 3.29; 3.30; 3.32; 3.34; 3.35; 3.36; 3.38; 5.13; 5.16; 5.17; 5.19; 5.20; 5.23; 5.114; 5.117; 5.136; 5.138; 5.139; 5.141; 5.142; 5.143; 5.145; 5.146; 5.151; 5.154; 5.155; 5.157; 5.160; 5.166; 5.168; 5.169; 5.190; 5.191; 5.193; 5.215; 5.222; 5.228; 5.231; 5.238; 5.246; 5.250; 5.253; 5.255; 5.259;

Phytophthora infestans, compuestos 3.3; 3.6; 3.25; 3.27; 3.29; 3.30; 5.2; 5.5; 5.6; 5.7; 5.10; 5.17; 5.19; 5.21; 5.24; 5.29; 5.41; 5.48; 5.51; 5.69; 5.81; 5.82; 5.91; 5.106; 5.110; 5.138; 5.139; 5.140; 5.141; 5.145; 5.146; 5.147; 5.150; 5.151; 5.157; 5.158; 5.159; 5.160; 5.163; 5.165; 5.166; 5.168; 5.177; 5.180; 5.181; 5.185; 5.189; 5.190; 5.199; 5.205; 5.210; 5.211; 5.219; 5.220; 5.227; 5.228; 5.232; 5.235; 5.237; 5.248; 5.255;

Erysiphe graminis f.sp. tritici, compuestos 5.3; 5.4; 5.5; 5.7; 5.8; 5.9; 5.10; 5.12; 5.13; 5.14; 5.15; 5.16; 5.17; 5.18; 5.19; 5.20; 5.21; 5.22; 5.23; 5.24; 5.25; 5.26; 5.27; 5.28; 5.29; 5.30; 5.31; 5.33; 5.34; 5.35; 5.36; 5.37; 5.38; 5.39; 5.41; 5.42; 5.43; 5.44; 5.45; 5.46; 5.47; 5.48; 5.49; 5.51; 5.52; 5.53; 5.54; 5.56; 5.57; 5.58; 5.59; 5.61; 5.62; 5.64; 5.65; 5.66; 5.67; 5.68; 5.70; 5.71; 5.72; 5.73; 5.74; 5.75; 5.77; 5.79; 5.80; 5.81; 5.82; 5.84; 5.87; 5.88; 5.89; 5.90; 5.91; 5.92; 5.93; 5.94; 5.96; 5.97; 5.98; 5.99; 5.101; 5.102; 5.103; 5.106; 5.108; 5.112; 5.114; 5.121; 5.125; 5.126; 5.127; 5.130; 5.131; 5.132; 5.133; 5.138; 5.139; 5.140; 5.141; 5.142; 5.143; 5.144; 5.145; 5.146; 5.147; 5.149; 5.150; 5.151; 5.152; 5.153; 5.155; 5.156; 5.157; 5.158; 5.159; 5.160; 5.163; 5.164; 5.165; 5.166; 5.167; 5.168; 5.169; 5.170; 5.171; 5.172; 5.173; 5.175; 5.176; 5.178; 5.179; 5.181; 5.182; 5.183; 5.185; 5.186; 5.187; 5.188; 5.189; 5.190; 5.191; 5.193; 5.194; 5.195; 5.196; 5.197; 5.199; 5.200; 5.201; 5.202; 5.203; 5.204; 5.205; 5.207; 5.208; 5.209; 5.210; 5.211; 5.212; 5.213; 5.215; 5.217; 5.218; 5.219; 5.220; 5.222; 5.223; 5.225; 5.226; 5.227; 5.228; 5.230; 5.231; 5.232; 5.234; 5.235; 5.237; 5.238; 5.239; 5.244; 5.245; 5.247; 5.248; 5.249; 5.250; 5.251; 5.255; 5.256; 5.257; 5.259; 5.260; 5.261;

Pyricularia oryzae, compuestos 3.9; 3.12; 3.13; 3.14; 3.15; 3.20; 3.23; 3.24; 3.27; 3.28; 3.29; 3.30; 3.31; 3.32; 3.34; 3.35; 3.36; 3.37; 3.38; 4.5; 4.9; 4.10; 5.14; 5.21; 5.43; 5.57; 5.86; 5.88; 5.128; 5.135; 5.140; 5.144; 5.149; 5.151; 5.158; 5.160; 5.163; 5.166; 5.168; 5.169; 5.173; 5.185; 5.199; 5.205; 5.215; 5.217; 5.218; 5.219; 5.234; 5.239; 5.245;

Puccinia recondita f.sp. tritici, compuestos 3.1; 3.5; 3.7; 3.8; 3.10; 3.11; 3.12; 3.13; 3.14; 3.15; 3.18; 3.20; 3.22; 3.23; 3.24; 3.26; 3.27; 3.28; 3.29; 3.30; 3.31; 3.32; 3.34; 3.35; 3.36; 3.38; 5.3; 5.5; 5.6; 5.7; 5.8; 5.10; 5.11; 5.12; 5.14; 5.15; 5.16; 5.17; 5.18; 5.19; 5.20; 5.21; 5.22; 5.23; 5.27; 5.28; 5.29; 5.30; 5.31; 5.35; 5.36; 5.37; 5.38; 5.39; 5.41; 5.43; 5.44; 5.45; 5.46; 5.47; 5.48; 5.51; 5.54; 5.56; 5.57; 5.58; 5.59; 5.61; 5.64; 5.65; 5.66; 5.67; 5.68; 5.70; 5.73; 5.74; 5.76; 5.79; 5.80; 5.81; 5.82; 5.83; 5.84; 5.86; 5.87; 5.88; 5.89; 5.90; 5.91; 5.92; 5.93; 5.98; 5.99; 5.106; 5.110; 5.112; 5.114; 5.121; 5.126; 5.128; 5.134; 5.135; 5.138; 5.139; 5.140; 5.141; 5.142; 5.143; 5.144; 5.145; 5.146; 5.147; 5.149; 5.150; 5.151; 5.152; 5.153; 5.155; 5.156; 5.157; 5.158; 5.160; 5.163; 5.164; 5.166; 5.167; 5.168; 5.169; 5.170; 5.172; 5.173; 5.175; 5.178; 5.179; 5.181; 5.182; 5.183; 5.185; 5.187; 5.188; 5.189; 5.190; 5.191; 5.193; 5.196; 5.197; 5.199; 5.201; 5.202; 5.203; 5.204; 5.205; 5.206; 5.207; 5.208; 5.210; 5.211; 5.212; 5.213; 5.215; 5.217; 5.218; 5.219; 5.220; 5.222; 5.223; 5.225; 5.226; 5.227; 5.228; 5.230; 5.232; 5.234; 5.235; 5.238; 5.239; 5.245; 5.246; 5.247; 5.248; 5.250; 5.254; 5.255; 5.256; 5.257; 5.259; 5.260;

Los siguientes compuestos (el número del compuesto está relacionado con las Tablas) dieron una represión de por lo menos un 60 % de la siguiente infección fúngica a 20 ppm:

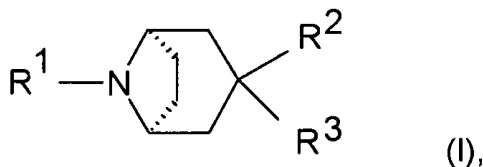
Septoria tritici, compuestos 3.8; 3.14; 3.15; 3.35; 3.36; 5.128; 5.134; 5.135;

Pyricularia oryzae, compuestos 3.6; 3.9; 3.11; 3.20; 3.27; 3.32; 3.34; 3.35; 3.36; 3.38; 5.30; 5.38; 5.61; 5.73; 5.76; 5.81; 5.82; 5.124; 5.128; 5.134; 5.135; 5.138; 5.139; 5.140; 5.141; 5.142; 5.143; 5.145; 5.146; 5.150; 5.152; 5.153; 5.155; 5.156; 5.157; 5.166; 5.168; 5.169; 5.170; 5.173; 5.178; 5.179; 5.181; 5.185; 5.187; 5.188; 5.192; 5.202; 5.203; 5.204; 5.207; 5.212; 5.215; 5.217; 5.218; 5.219; 5.222; 5.227; 5.228; 5.231; 5.232; 5.235; 5.236; 5.238; 5.256;

Pythium ultimum, compuestos 5.3; 5.6; 5.41; 5.91; 5.98; 5.106; 5.128; 5.134; 5.135; 5.138; 5.139; 5.149; 5.165; 5.205; 5.218; 5.219; 5.222; 5.232; 5.248.

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de fórmula (I)



en la que

R^1 es pirimidinilo, quinazolinilo o tienopirimidinilo, en donde estos anillos están sustituidos opcionalmente con alquilo de C_{1-4} , alcoxi de C_{1-4} , alquiltio de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halógeno, ciano o alquil de C_{1-4} -carbonilo

R^3 conjuntamente con R^2 forman un radical de la fórmula $=CH-R^4$, en la que R^4 es fenilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} , alcoxi de C_{1-4} , o halógeno, o R^4 es aliloximetilo o fenoximetilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} , alcoxi de C_{1-4} , o halógeno, o R^4 es piridiloximetilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} , o R^4 es pirimidiniloximetilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} , o R^4 es alquil de C_{1-6} -carbonilo, alquil de C_{1-4} -aminocarbonilo, bencilaminocarbonilo, fenilaminocarbonilo, que opcionalmente está sustituido con halógeno, piridilaminocarbonilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} , o piridazinaminocarbonilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} o halógeno, o

R^3 conjuntamente con R^2 forman un radical de la fórmula $=N-O-(CH_2)_n-R^5$, en donde n es 0 ó 1, o R^5 es alquilo de C_{1-4} , alcoxi de C_{1-4} , alquenilo de C_{2-4} o alquinilo de C_{2-4} , o R^5 es fenilo, piridilo u oxadiazolilo, en donde estos anillos están opcionalmente sustituidos con alquilo de C_{1-4} , alcoxi de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halógeno o $-SO_2$ alquilo de C_{1-4} ,

o sales o N-óxidos de los mismos.

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, en los que R^1 es tienopirimidinilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} , alcoxi de C_{1-4} , alquiltio de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , halógeno, ciano o alquil de C_{1-4} -carbonilo.

3. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, en los que R^4 es fenilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} , alcoxi de C_{1-4} o halógeno.

4. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, en los que n es 1 y R^5 es fenilo que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} , alcoxi de C_{1-4} , haloalquilo de C_{1-4} , o halógeno, o R^5 es oxadiazolilo, que opcionalmente está sustituido con alquilo de C_{1-4} .

5. Una composición insecticida, acaricida, molusquicida o nematocida que comprende una cantidad eficaz como insecticida, acaricida, molusquicida o nematocida de un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1.

6. Una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1.

7. Un método de combatir y reprimir insectos, ácaros, nematodos o moluscos, que comprende aplicar a una planta susceptible al ataque por una plaga, una cantidad eficaz como insecticida, acaricida, nematocida o molusquicida de un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1.

8. Un método de combatir y reprimir hongos fitopatógenos, que comprende aplicar a una planta, a una semilla de una planta, al sitio donde está la planta o la semilla o a la tierra o a cualquier otro medio de crecimiento de plantas, una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1,

9. Uso de un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 en la producción de un medicamento para reprimir plagas en animales domésticos y ganado productivo.