

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 968 172**

51 Int. Cl.:

C07D 413/04 (2006.01)

C07D 413/12 (2006.01)

C07D 417/04 (2006.01)

C07D 271/06 (2006.01)

A01N 43/82 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **18.10.2017 PCT/US2017/057081**

87 Fecha y número de publicación internacional: **03.05.2018 WO18080859**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **18.10.2017 E 17794827 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **18.10.2023 EP 3529246**

54 Título: **Oxadiazoles que tienen actividad fungicida**

30 Prioridad:

24.10.2016 US 201662411912 P

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

08.05.2024

73 Titular/es:

FMC CORPORATION (100.0%)

2929 Walnut Street

Philadelphia, PA 19104, US

72 Inventor/es:

PASTERIS, ROBERT JAMES;

BEREZNAK, JAMES FRANCIS y

CHITTABOINA, SRINIVAS

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 968 172 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

Oxadiazoles que tienen actividad fungicida

5 **CAMPO DE LA INVENCIÓN**

La presente invención se refiere a determinados oxadiazoles, sus *N*-óxidos, sales y composiciones, y a procedimientos para su uso como fungicidas.

10 **ANTECEDENTES DE LA INVENCIÓN**

El control de las enfermedades de plantas provocadas por patógenos fúngicos de plantas es extremadamente importante para lograr una alta eficacia en las cosechas. Los daños causados por enfermedades de plantas a cultivos ornamentales, de hortalizas, de campo, de cereales y de frutales pueden provocar una reducción significativa de la productividad y, por lo tanto, dar lugar a mayores costes para el consumidor. Existen muchos productos comercialmente disponibles para estos fines, pero sigue habiendo una necesidad de nuevos compuestos que sean más eficaces, menos costosos, menos tóxicos, más seguros para el medio ambiente o que tengan diferentes sitios de acción.

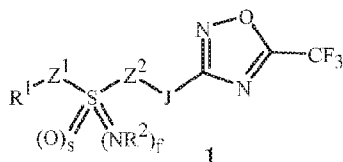
La publicación de patente PCT WO 2013/008162 divulga derivados de trifluorometiloxadiazol y su uso como productos farmacéuticos.

Las publicaciones de patente PCT WO 1994/05153, WO 1997/15576 y WO 1998/56789 divulgan herbicidas que incluyen oxadiazoles.

25 El documento U.S. 4.871.753 divulga 3-fenil-5-trifluorometil-1,2,4-oxadiazoles y su uso como fungicidas.

SUMARIO DE LA INVENCIÓN

30 La presente invención se define en las reivindicaciones adjuntas. A continuación se divulgan compuestos de Fórmula 1 (incluidos todos los estereoisómeros), *N*-óxidos y sales de los mismos, composiciones agrícolas que los contienen y su uso como fungicidas:



35 en la que

40 R^1 es alquilo C_1-C_6 , alquenido C_2-C_6 , alquínido C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_5 o alcoxicarbonilo C_2-C_5 , cada uno opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; o fenilo, bencilo, fenetilo o naftalenilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a} ; o un anillo carbocíclico de 3 a 7 miembros, en el que hasta 3 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre $C(=O)$ y $C(=S)$, estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a} ; o

45 R^1 es un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y de 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en el que hasta 3 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre $C(=O)$ y $C(=S)$, y los miembros de anillo de átomo de azufre se seleccionan independientemente de entre $S(=O)_u(=NR^{12})_v$, estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3b} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno;

Z^1 es un enlace directo, O, NR^{4a} o $NR^{4a}NR^{4b}$;

55 s y f son cada uno 0, 1 o 2, siempre que la suma de s y f sea 0, 1 o 2;

cada R^2 es independientemente H, ciano, alquilo C_1-C_3 o haloalquilo C_1-C_3 ;

60 Z^2 es un enlace directo, O, S, NR^5 o NR^5CH_2 ; o CH_2 , CH_2CH_2 o $CH_2CH_2CH_2$, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 o hasta 1 sustituyente seleccionado de R^{13} ;

siempre que estos materiales, etapas, características, componentes o elementos adicionales no afecten materialmente a las características básicas y novedosas) de la invención reivindicada. El término "que consiste esencialmente en" ocupa un lugar intermedio entre "que comprende" y "que consiste en".

5 Cuando los solicitantes hayan definido una invención o una parte de la misma con un término abierto tal como "que comprende", se entenderá fácilmente que (a menos que se indique lo contrario) la descripción debe interpretarse como que también describe dicha invención usando las expresiones "que consiste esencialmente en" o "que consiste en".

10 Además, a menos que se indique expresamente lo contrario, "o" se refiere a un o inclusivo y no a un o exclusivo. Por ejemplo, una condición A o B se satisface con cualquiera de las afirmaciones siguientes: A es cierto (o está presente) y B es falso (o no está presente), A es falso (o no está presente) y B es cierto (o está presente) y tanto A como B son cierto (o están presentes).

15 Además, se pretende que los artículos indefinidos "un" y "una" que preceden a un elemento o componente de la invención no sean restrictivos con respecto al número de casos (es decir, apariciones) del elemento o componente. Por lo tanto, "un" o "una" debe interpretarse de modo que incluya uno o al menos uno, y la forma de la palabra en singular del elemento o componente también incluye el plural, a menos que la cantidad indique claramente que es singular.

20 Tal como se menciona en la presente divulgación y las reivindicaciones, "planta" incluye miembros del reino Plantae, particularmente plantas de semilla (Spermatopsida), en todas las etapas de vida, incluidas plantas jóvenes (por ejemplo, semillas en germinación que se desarrollan para dar plántulas) y etapas reproductivas maduras (por ejemplo, plantas que producen flores y semillas). Las partes de plantas incluyen miembros geotrópicos que normalmente crecen debajo de la superficie del medio de cultivo (por ejemplo, el suelo), tales como raíces, tubérculos, bulbos y cormos, y también miembros que crecen por encima del medio de cultivo, tales como follaje (incluidos tallos y hojas), flores, frutos y semillas.

25 Tal como se menciona en el presente documento, el término "plántula", usado solo o en una combinación de palabras, significa una planta joven que se desarrolla a partir del embrión de una semilla o yema de una unidad de propagación vegetativa tal como un tubérculo, un cormo o un rizoma.

30 En las citas anteriores, el término "alquilo", usado solo o en palabras compuestas tales como "alquiltio" o "haloalquilo", incluye alquilo de cadena lineal y ramificado, tal como metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, y los diferentes isómeros de butilo, pentilo y hexilo. "Alquenilo" incluye alquenos de cadena lineal y ramificados tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo y los diferentes isómeros de butenilo, pentenilo y hexenilo. "Alquenilo" también incluye polienos tales como 1,2-propadienilo y 2,4-hexadienilo. "Alquinilo" incluye alquinos de cadena lineal y ramificados, tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, y los diferentes isómeros de butinilo, pentinilo y hexinilo. "Alquinilo" también puede incluir restos que comprenden múltiples triples enlaces tales como 2,5-hexadiinilo.

35 "Alquilamino" incluye un radical NH sustituido con un grupo alquilo de cadena lineal o ramificado. Los ejemplos de "alquilamino" incluyen $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NH}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}$, y $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2\text{NH}$. Los ejemplos de "dialquilamino" incluyen $(\text{CH}_3)_2\text{N}$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2)_2\text{N}$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{N}$.

40 "Alcoxi" incluye, por ejemplo, metoxi, etoxi, n-propiloxi, i-propiloxi, y los diferentes isómeros de butoxi, pentoxi y hexiloxi. "Alqueniloxi" incluye alquenilo de cadena lineal y ramificado unido a, y enlazado a través de, un átomo de oxígeno. Los ejemplos de "alqueniloxi" incluyen $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ y $\text{CH}_3\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$. "Alquiniloxi" incluye restos alquiniloxi de cadena lineal y ramificados. Los ejemplos de "alquiniloxi" incluyen $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ y $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$. "Alcoxialquilo" indica una sustitución alcoxi en un alquilo. Los ejemplos de "alcoxialquilo" incluyen CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

45 El término "alquiltio" incluye restos alquiltio de cadena lineal y ramificados tales como metiltio, etiltio y los diferentes isómeros de propiltio y butiltio. "Alquilsulfinito" incluye ambos enantiómeros de un grupo alquilsulfinito. Los ejemplos de "alquilsulfinito" incluyen $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(=\text{O})$, y los diferentes isómeros de butilsulfinito. Los ejemplos de "alquilsulfonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(=\text{O})_2$, y los diferentes isómeros de butilsulfonilo.

50 "Alquiltioalquilo" indica una sustitución alquiltio en un alquilo. Los ejemplos de "alquiltioalquilo" incluyen CH_3SCH_2 , $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$; "alquilsulfinitalquilo" y "alquilsulfonilalquilo" incluyen los correspondientes sulfóxidos y sulfonas, respectivamente.

55 "Alquilcarbonilo" indica un grupo alquilo de cadena lineal o ramificado unido a un resto $\text{C}(=\text{O})$. Los ejemplos de "alquilcarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})$ y $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})$. Los ejemplos de "alcoxycarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$, y los diferentes isómeros de butoxi- y pentoxycarbonilo. Los ejemplos de "alquilaminocarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})$, y los diferentes isómeros de butilamino- y pentilaminocarbonilo. Los

ejemplos de "dialquilaminocarbonilo" incluyen $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})$, $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ y $(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$.

El término "alquilcarboniloxi" indica un alquilo de cadena lineal o ramificado enlazado a un resto $\text{C}(=\text{O})\text{O}$. Los ejemplos de "alquilcarboniloxi" incluyen $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}$ y $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})\text{O}$. El término "alquilcarbonilalcoxi" indica alquilcarbonilo unido a un resto alcoxi. Los ejemplos de "alquilcarbonilalcoxi" incluyen $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{O}$. Los ejemplos de "alcoxicarboniloxi" incluyen $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{O}$ y $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})\text{O}$. "Alquilcarboniltio" indica un alquilcarbonilo de cadena lineal o ramificado unido a, y enlazado a través de, un átomo de azufre. Los ejemplos de "alquilcarboniltio" incluyen $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{S}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{S}$ y $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})\text{S}$.

El término "alquilaminocarbonilalquilo" indica un alquilaminocarbonilo de cadena lineal o ramificado unido a alquilo. Los ejemplos de "alquilaminocarbonilalquilo" incluyen $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2\text{NHC}(=\text{O})\text{CH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})\text{CH}_2$. Los ejemplos de "dialquilaminocarbonilalquilo" incluyen $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})\text{CH}_2$ y $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})\text{CH}_2$.

"Cicloalquilo" incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El término "cicloalquilalquilo" indica una sustitución de cicloalquilo en un resto alquilo. Los ejemplos de "cicloalquilalquilo" incluyen ciclopropilmetilo, ciclopentiletilo y otros restos cicloalquilo unidos a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificado.

"Cicloalquilamino" indica un radical NH sustituido con cicloalquilo. Los ejemplos de "cicloalquilamino" incluyen ciclopropilamino y ciclohexilamino.

El término "halógeno", ya sea solo o en palabras compuestas tales como "haloalquilo", o cuando se utiliza en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno" incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se usa en palabras compuestas tales como "haloalquilo", o cuando se usa en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno", dicho alquilo puede estar parcialmente o totalmente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Los ejemplos de "haloalquilo" o "alquilo sustituido con halógeno" incluyen F_3C , ClCH_2 , CF_3CH_2 y CF_3CCl_2 . Los términos "haloalquenilo", "haloalquinilo", "haloalcoxi", "haloalquiltio", "haloalquilsulfinito", "haloalquilsulfonilo", "halocicloalquilo" y similares, se definen de forma análoga al término "haloalquilo". Los ejemplos de "haloalquenilo" incluyen $\text{Cl}_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ y $\text{CF}_3\text{CH}=\text{CHCH}_2$. Los ejemplos de "haloalquinilo" incluyen $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$, $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$, $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ y $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$. Los ejemplos de "haloalcoxi" incluyen CF_3O , $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$, $\text{F}_2\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ y $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$. Los ejemplos de "haloalquiltio" incluyen CCl_3S , CF_3S , $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$ y $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$. Los ejemplos de "haloalquilsulfinito" incluyen $\text{CF}_3\text{S}(=\text{O})$, $\text{CCl}_3\text{S}(=\text{O})$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$ y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(=\text{O})$. Los ejemplos de "haloalquilsulfonilo" incluyen $\text{CF}_3\text{S}(=\text{O})_2$, $\text{CCl}_3\text{S}(=\text{O})_2$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$ y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(=\text{O})_2$. Los ejemplos de "halocicloalquilo" incluyen 2-clorociclopropilo, 2-fluorociclobutilo, 3-bromociclopentilo y 4-clorociclohexilo. El término "halodialquilo", ya sea solo o en palabras compuestas tales como "halodialquilamino", significa que al menos uno de los dos grupos alquilo está sustituido con al menos un átomo de halógeno, e independientemente cada grupo alquilo halogenado puede estar parcialmente o totalmente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Los ejemplos de "halodialquilamino" incluyen $(\text{BrCH}_2\text{CH}_2)_2\text{N}$ y $\text{BrCH}_2\text{CH}_2(\text{ClCH}_2\text{CH}_2)\text{N}$.

"Hidroalquilo" indica un grupo alquilo sustituido con un grupo hidroxilo. Los ejemplos de "hidroalquilo" incluyen HOCH_2CH_2 , $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{OH})\text{CH}$ y $\text{HOCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$.

"Trialkilsililo" incluye 3 radicales alquilo ramificados y/o de cadena lineal unidos a, y enlazados a través de, un átomo de silicio, tales como trimetilsililo, trietilsililo y terc-butildimetilsililo.

El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente se indica mediante el sufijo " $\text{C}_i\text{-C}_j$ ", en el que i y j son números del 1 al 8. Por ejemplo, alquilsulfonilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ designa de metilsulfonilo a butilsulfonilo; alcoxilalquilo C_2 designa CH_3OCH_2 ; alcoxilalquilo C_3 designa, por ejemplo, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ o $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$; y alcoxilalquilo C_4 designa los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi que contiene un total de cuatro átomos de carbono, incluyendo los ejemplos $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

La expresión "no sustituido", con respecto a un grupo tal como un anillo o sistema anular, significa que el grupo no tiene ningún sustituyente distinto de sus una o más uniones al resto de la Fórmula 1. La expresión "opcionalmente sustituido" significa que el número de los sustituyentes pueden ser cero. A menos que se indique lo contrario, los grupos opcionalmente sustituidos pueden estar sustituidos con tantos sustituyentes opcionales como puedan acomodarse reemplazando un átomo de hidrógeno por un sustituyente distinto de hidrógeno en cualquier átomo de carbono o nitrógeno disponible. Generalmente, el número de sustituyentes opcionales (cuando están presentes) varía de 1 a 4. Tal como se utiliza en el presente documento, la expresión "opcionalmente sustituido" se usa indistintamente con la expresión "sustituido o no sustituido", o con el término "(no) sustituido".

El número de sustituyentes opcionales puede estar restringido por una limitación expresa. Por ejemplo, en la definición de Z^2 la expresión "opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 " significa que pueden estar presentes 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes (si el número de puntos de conexión potenciales lo permite). De forma similar, la expresión "opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a} " significa que pueden estar presentes 0, 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes si el número de puntos de conexión disponibles lo permite. Cuando un intervalo especificado para el número de sustituyentes (por ejemplo, k

es un número entero de 1 a 2 en el Anexo A) excede el número de posiciones disponibles para sustituyentes (por ejemplo, 1 posición disponible para $(R^Y)_k$ en U-17 en el Anexo A), se reconoce que el extremo superior real del intervalo es el número de posiciones disponibles.

- 5 Cuando un compuesto se sustituye con un sustituyente que porta un subíndice que indica que el número de dichos sustituyentes puede variar (por ejemplo, $(R^Y)_k$ en el Anexo A en el que k es de 1 a 2), entonces dichos sustituyentes se seleccionan independientemente del grupo de sustituyentes definidos, a menos que se indique lo contrario. Cuando se muestra que un grupo de variables está opcionalmente unido a una posición, por ejemplo $(R^Y)_k$ en el Anexo A en el que k puede ser 0, entonces en la posición puede estar un hidrógeno incluso si no se menciona en la definición del grupo de variables. Cuando se dice que una posición en un grupo está "no sustituida" o "sin sustituir", entonces están unidos átomos de hidrógeno para ocupar cualquier valencia libre.

15 La nomenclatura de los sustituyentes en la presente divulgación utiliza terminología reconocida que proporciona concisión al transmitir con precisión a los expertos en la técnica la estructura química. En aras de la concisión, se pueden omitir los descriptores de localización.

A menos que se indique lo contrario, un "anillo" o "sistema anular" como componente de la Fórmula 1 (por ejemplo, sustituyente J) es carbocíclico o heterocíclico. El término "sistema anular" indica dos o más anillos conectados.

- 20 El término "miembro de anillo" se refiere a un átomo (por ejemplo, C, O, N o S) u otro resto (por ejemplo, $C(=O)$, $C(=S)$ o $S(=O)_u(=NR^{12})_v$) que forman el esqueleto de un anillo o sistema anular. El término "aromático" indica que cada uno de los átomos del anillo está esencialmente en el mismo plano y tiene una orbital p perpendicular al plano del anillo, y que $(4n + 2)$ electrones π , siendo n un número entero positivo, están asociados con el anillo para cumplir con la regla de Hückel.

- 25 El término "anillo carbocíclico" indica un anillo en el que los átomos que forman el esqueleto del anillo se seleccionan únicamente de carbono. A menos que se indique lo contrario, un anillo carbocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado. Cuando un anillo carbocíclico totalmente insaturado satisface la regla de Hückel, entonces también se denomina ese anillo un "anillo aromático". "Carbociclo saturado" se refiere a un anillo que tiene un esqueleto constituido por átomos de carbono unidos entre sí mediante enlaces sencillos; a menos que se especifique lo contrario, las valencias restantes de los carbonos están ocupadas por átomos de hidrógeno.

- 30 Tal como se utiliza en el presente documento, el término "anillo parcialmente insaturado" o "heterociclo parcialmente insaturado" se refiere a un anillo que contiene átomos insaturados y uno o más dobles enlaces, pero que no es aromático.

- 35 Los términos "anillo heterocíclico" o "heterociclo" denotan un anillo en el que al menos uno de los átomos que forman el esqueleto del anillo no es carbono. A menos que se indique lo contrario, un anillo heterocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado. Cuando un anillo heterocíclico completamente insaturado satisface la regla de Hückel, entonces dicho anillo también se denomina "anillo heteroaromático" o anillo heterocíclico aromático. "Anillo heterocíclico saturado" se refiere a un anillo heterocíclico que contiene solo enlaces sencillos entre los miembros del anillo.

- 40 A menos que se indique lo contrario, los anillos y sistemas anulares heterocíclicos están unidos al resto de la Fórmula 1 a través de cualquier átomo de carbono o de nitrógeno disponible mediante el reemplazo de un hidrógeno en dicho átomo de carbono o nitrógeno.

- 45 Tal como se ha indicado anteriormente, un par de sustituyentes R^1 y R^{4a} o un par de sustituyentes R^1 y R^{4b} pueden tomarse junto con los átomos a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 7 miembros opcionalmente sustituido. Este anillo de 5 a 7 miembros incluye como miembros de anillo los dos átomos a los que R^1 y R^{4a} están unidos directamente o los dos átomos a los que R^1 y R^{4b} están unidos directamente. Los otros miembros del anillo (es decir, átomos de enlace intermedios) se seleccionan de entre átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, en el que hasta 3 miembros del anillo se seleccionan independientemente de entre $C(=O)$, $C(=S)$, $S(=O)$ y $S(=O)_2$. El anillo está opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^9 . Los miembros de anillo de átomo de nitrógeno pueden oxidarse como N -óxidos, porque los compuestos relacionados con la Fórmula 1 también incluyen derivados de N -óxido.

- 50 Los compuestos de la presente invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los estereoisómeros son isómeros de constitución idéntica pero que difieren en la disposición de sus átomos en el espacio e incluyen enantiómeros, diastereómeros, isómeros *cis* y *trans* (también conocidos como isómeros geométricos) y atropisómeros. Los atropisómeros son el resultado de una rotación restringida alrededor de enlaces sencillos en los que la barrera rotacional es lo suficientemente alta como para permitir el aislamiento de las especies isoméricas. Un experto en la técnica apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede mostrar efectos beneficiosos cuando está enriquecido con respecto al otro o a los otros estereoisómeros, o cuando se separa del otro o de los otros estereoisómeros. Además, el experto en la técnica sabe cómo separar, enriquecer y/o preparar de forma selectiva

dichos estereoisómeros. Para una explicación exhaustiva de todos los aspectos de la estereoisomería, véase Ernest L. Eliel y Samuel H. Wilen, *Stereochemistry of Organic Compounds*, John Wiley & Sons, 1994.

5 Los compuestos de la presente invención pueden existir como uno o más isómeros conformacionales debido a la rotación restringida alrededor de un enlace amida (por ejemplo, C(=O)-N) en la Fórmula 1. La invención comprende mezclas de isómeros conformacionales. Además, la presente invención incluye compuestos que están enriquecidos en un conformero con respecto a otros.

10 La presente invención comprende todos los estereoisómeros, isómeros conformacionales y mezclas de los mismos en todas las proporciones, así como formas isotópicas tales como compuestos deuterados.

15 Un experto en la técnica apreciará que no todos los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar *N*-óxidos ya que el nitrógeno requiere un par solitario disponible para la oxidación al óxido; un experto en la técnica reconocerá aquellos heterociclos que contienen nitrógeno que pueden formar *N*-óxidos. Un experto en la técnica también reconocerá que las aminas terciarias pueden formar *N*-óxidos. Un experto en la técnica conoce muy bien los procedimientos de síntesis para la preparación de *N*-óxidos de heterociclos y aminas terciarias que incluyen la oxidación de heterociclos y aminas terciarias con peroxiácidos tales como ácido peracético y *m*-cloroperbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno, hidroperóxidos de alquilo tales como hidroperóxido de *t*-butilo, perborato de sodio y dioxiranos tales como dimetildioxirano. Estos procedimientos para la preparación de *N*-óxidos se han descrito y
20 revisado ampliamente en la literatura, véase, por ejemplo: T. L. Gilchrist en *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, páginas 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, páginas 18-20, A. J. Boulton y A. McKillop, Ed., Pergamon Press; M. R. Grimmett y B. R. T. Keene en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, páginas 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, páginas 285-291, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Ed., Academic Press; y
25 G. W. H. Cheeseman y E. S. G. Werstiuk en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, páginas 390-392, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Ed., Academic Press.

30 Un experto en la técnica reconoce que debido a que en el medio ambiente y en condiciones fisiológicas las sales de los compuestos químicos están en equilibrio con sus correspondientes formas no salinas, las sales comparten la utilidad biológica de las formas no salinas. Así, una amplia diversidad de sales de los compuestos de Fórmula 1 son útiles para el control de enfermedades de plantas provocadas por patógenos fúngicos (es decir, son adecuados para agricultura). Las sales de los compuestos de Fórmula 1 incluyen sales de adición de ácido con ácidos orgánicos o inorgánicos tales como los ácidos bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluenosulfónico o valérico. Cuando un compuesto
35 de Fórmula 1 contiene un resto ácido tal como un ácido carboxílico, las sales también incluyen las formadas con bases orgánicas o inorgánicas tales como piridina, trietilamina o amoniaco, o amidas, hidruros, hidróxidos o carbonatos de sodio, potasio, litio, calcio, magnesio o bario. En consecuencia, en el presente documento se divulgan los *N*-óxidos y sales agrícolamente adecuadas de los compuestos de Fórmula 1.

40 Los compuestos seleccionados de Fórmula 1, estereoisómeros, *N*-óxidos y sales de los mismos normalmente existen en más de una forma, por lo tanto, la Fórmula 1 incluye todas las formas cristalinas y no cristalinas de los compuestos que representa la Fórmula 1. Las formas no cristalinas incluyen formas de realización que son sólidas tales como ceras y gomas, así como también formas de realización que son líquidas tales como soluciones y masas fundidas. Las formas cristalinas incluyen formas de realización que representan esencialmente un único tipo de cristal y formas
45 de realización que representan una mezcla de polimorfos (es decir, diferentes tipos cristalinos). El término "polimorfo" se refiere a una forma cristalina particular de un compuesto químico que puede cristalizar en diferentes formas cristalinas, teniendo estas formas diferentes disposiciones y/o conformaciones de las moléculas en la red cristalina. Aunque los polimorfos pueden tener la misma composición química, también pueden diferir en su composición debido a la presencia o ausencia de agua u otras moléculas cocrystalizadas, que pueden estar unidas con interacciones débiles o fuertes a la red. Los polimorfos pueden diferir en propiedades químicas, físicas y biológicas tales como la forma del cristal, la densidad, la dureza, el color, la estabilidad química, el punto de fusión, la higroscopicidad, la suspensibilidad, la velocidad de disolución y la disponibilidad biológica. Un experto en la técnica apreciará que un polimorfo de un compuesto representado por la Fórmula 1 puede mostrar efectos beneficiosos (por ejemplo, idoneidad para la preparación de formulaciones útiles, rendimiento biológico mejorado) con respecto a otro polimorfo o una
50 mezcla de polimorfos del mismo compuesto representado por la Fórmula 1. La preparación y el aislamiento de un polimorfo particular de un compuesto representado por la Fórmula 1 se pueden realizar mediante procedimientos conocidos por los expertos en la técnica, que incluyen, por ejemplo, cristalización utilizando temperaturas y disolventes seleccionados.

60 Las formas de realización descritas en el Sumario de la invención incluyen las que se describen a continuación. No pertenecen a la invención de por sí. En las siguientes Formas de realización, la Fórmula 1 incluye estereoisómeros, *N*-óxidos y sales de los mismos, y la referencia a "un compuesto de Fórmula 1" incluye las definiciones de sustituyentes especificadas en el Sumario de la invención a menos que se definan adicionalmente en las Formas de realización.

65 Forma de realización 1. Un compuesto de Fórmula 1 en el que cuando R¹ está separado (es decir, no se toma junto con R^{4a} o R^{4b} para formar un anillo), entonces R¹ es alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, alquilcarbonilo C₂-

5 C₅ o alcoxycarbonilo C₂-C₅, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R³; o fenilo, bencilo o naftalenilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a}; o un anillo carbocíclico de 3 a 7 miembros, en el que hasta 2 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre C(=O) y C(=S), estando cada anillo
 10 opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a}; o un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y de 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en el que hasta 2 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre C(=O) y C(=S), estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados
 15 independientemente de R^{3a} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3b} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno.

Forma de realización 2. Un compuesto de la Forma de realización 1 en el que R¹ es alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₅ o alcoxycarbonilo C₂-C₅, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R³.

Forma de realización 3. Un compuesto de las Formas de realización 1 o 2 en el que R¹ es alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₅ o alcoxycarbonilo C₂-C₅, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R³.

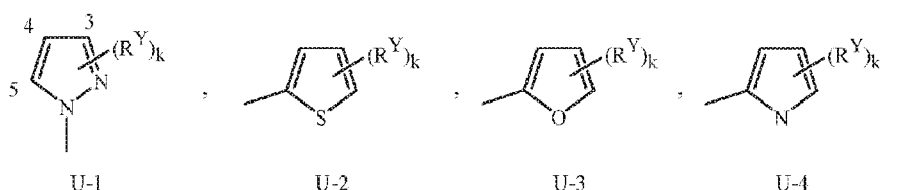
Forma de realización 4. Un compuesto de una cualquiera de las Formas de realización 1 a 3 en el que R¹ es alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxycarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R³.

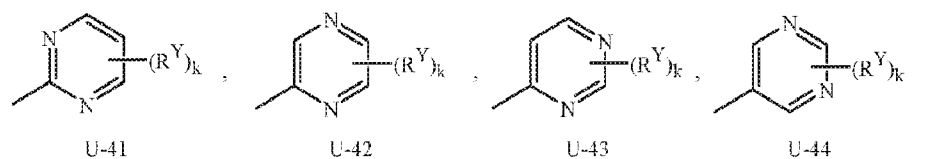
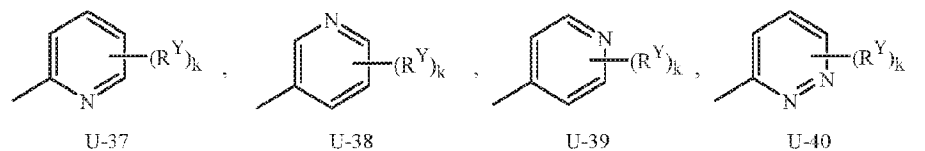
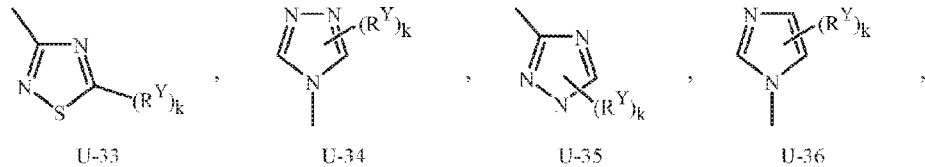
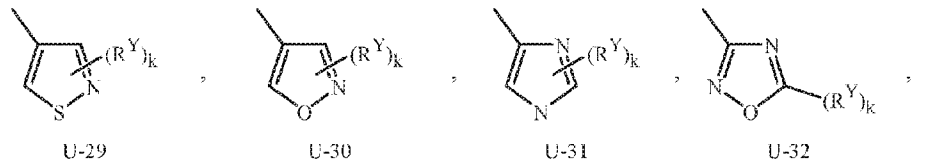
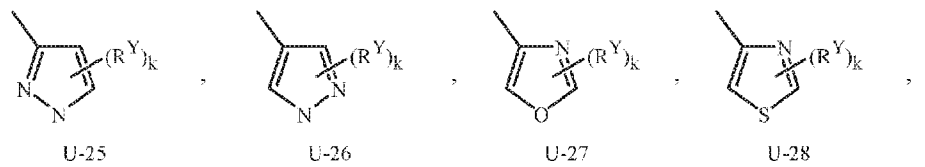
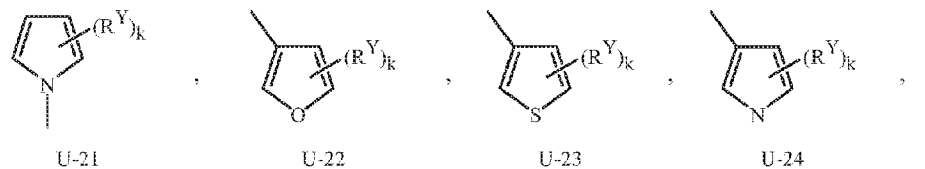
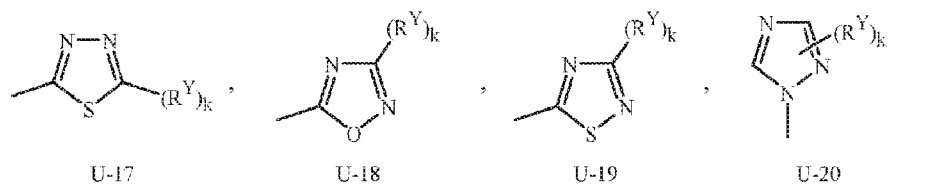
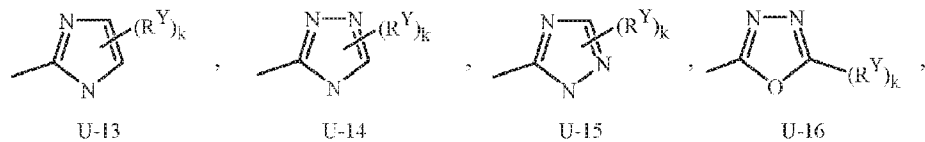
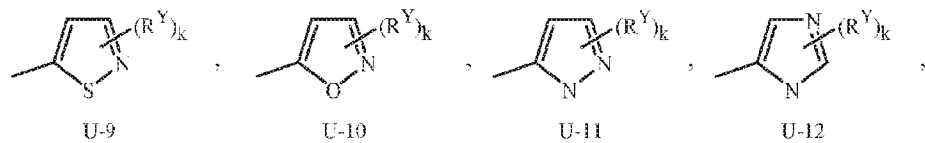
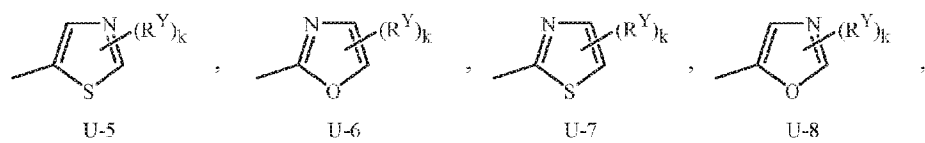
Forma de realización 5. Un compuesto de Fórmula 1 o la Forma de realización 1 en el que cuando R¹ está separado (es decir, no se toma junto con R^{4a} o R^{4b} para formar un anillo), entonces R¹ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₅ o alcoxycarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R³; o fenilo opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a}; o un anillo carbocíclico de 3 a 7 miembros, en el que hasta 2 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre C(=O) y C(=S), estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a}; o un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y de 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en el que hasta 2 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre C(=O) y C(=S), estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3b} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno.

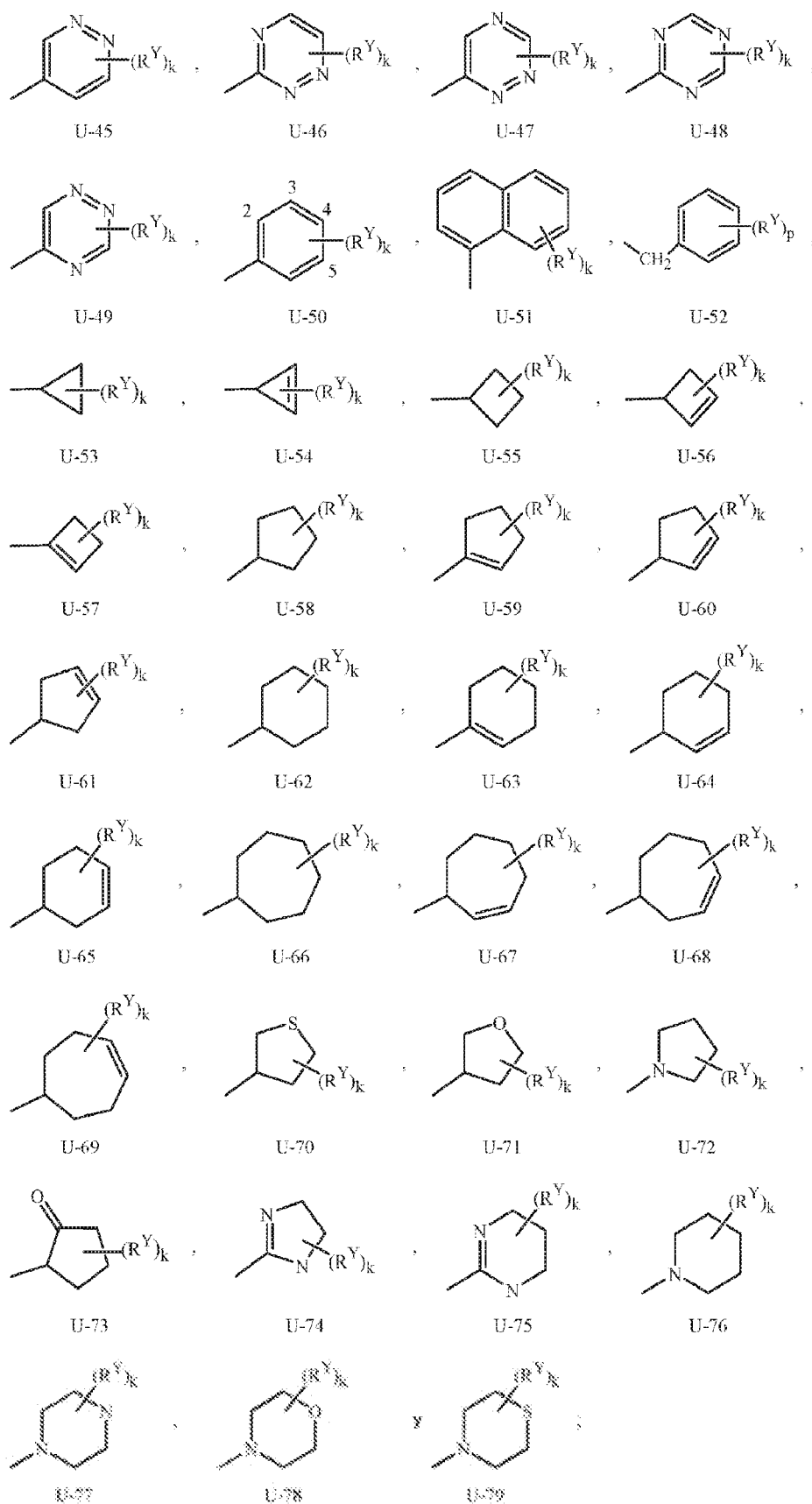
Forma de realización 6. Un compuesto de Fórmula 1 o la Forma de realización 5 en el que cuando R¹ está separado (es decir, no se toma junto con R^{4a} o R^{4b} para formar un anillo), entonces R¹ es fenilo opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a}; o un anillo carbocíclico de 3 a 7 miembros, en el que hasta 2 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre C(=O) y C(=S), estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a}; o un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y de 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en el que hasta 2 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre C(=O) y C(=S), estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3b} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno.

Forma de realización 7. Un compuesto de Fórmula 1 o la Forma de realización 1 en el que cuando R¹ está separado (es decir, no se toma junto con R^{4a} o R^{4b} para formar un anillo), entonces R¹ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxycarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R³; o R¹ se selecciona de U-1 a U-79 tal como se muestran en el Anexo A

55 **Anexo A**







en los que cuando R^Y está unido a un carbono miembro del anillo, dicho R^Y se selecciona de R^{3a} , y cuando R^Y está unido a un nitrógeno miembro del anillo (por ejemplo, en U-4, U-11 a U-15, U-24 a U-26, U-31, U-35, U-74, U-75 y U-77), dicho R^Y se selecciona de R^{3b} ; y k es 0, 1 o 2.

Forma de realización 7a Un compuesto de la Forma de realización 7 en el que R¹ se selecciona de U-1 a U-79.

5 Forma de realización 8. Un compuesto de la Forma de realización 7 en el que R¹ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxicarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R³, o U-1 a U-53, U-55, U-58, U-62, U-66 o U-74 a U-79.

Forma de realización 8a Un compuesto de la Forma de realización 8 en el que R¹ es U-1 a U-53, U-55, U-58, U-62, U-66 o U-74 a U-79.

10 Forma de realización 9. Un compuesto de la Forma de realización 8 en el que R¹ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxicarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R³, o U-1, U-2, U-3, U-5, U-20, U-21, U-28, U-36, U-37, U-38, U-39, U-41, U-43, U-50, U-53, U-55, U-58, U-62 o U-74 a U-78.

15 Forma de realización 9a Un compuesto de la Forma de realización 9 en el que R¹ es U-1, U-2, U-3, U-5, U-20, U-21, U-28, U-36, U-37, U-38, U-39, U-41, U-43, U-50, U-53, U-55, U-58, U-62 o U-74 a U-78.

20 Forma de realización 10. Un compuesto de la Forma de realización 9 en el que R¹ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxicarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R³, o U-37, U-38, U-39, U-41, U-50, U-53, U-55 o U-58.

Forma de realización 10a Un compuesto de la Forma de realización 10 en el que R¹ es U-37, U-38, U-39, U-41, U-50, U-53, U-55 o U-58.

25 Forma de realización 11. Un compuesto de la Forma de realización 10 en el que R¹ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxicarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R³; o U-50, U-53 o U-55.

30 Forma de realización 12. Un compuesto de la Forma de realización 11 en el que R¹ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxicarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R³.

35 Forma de realización 13. Un compuesto de la Forma de realización 11 en el que R¹ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R³; o U-50.

Forma de realización 14. Un compuesto de la Forma de realización 13 en el que R¹ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R³.

40 Forma de realización 15. Un compuesto de la Forma de realización 13 en el que R¹ es alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R³; o U-50.

45 Forma de realización 16. Un compuesto de la Forma de realización 15 en el que R¹ es alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R³.

Forma de realización 17. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 15 en el que R¹ es distinto de fenilo.

50 Forma de realización 18. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 17 en el que R¹ es un enlace directo, NR^{4a} o NR^{4a}NR^{4b}.

Forma de realización 19. Un compuesto de la Forma de realización 18 en el que Z¹ es un enlace directo o NR^{4a}.

55 Forma de realización 20. Un compuesto de la Forma de realización 19 en el que Z¹ es un enlace directo.

Forma de realización 21. Un compuesto de la Forma de realización 19 en el que Z¹ es NR^{4a}.

60 Forma de realización 22. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 21 en el que s es 0, 1 o 2 y f es 0 o 1, siempre que la suma de s y f sea 0, 1 o 2.

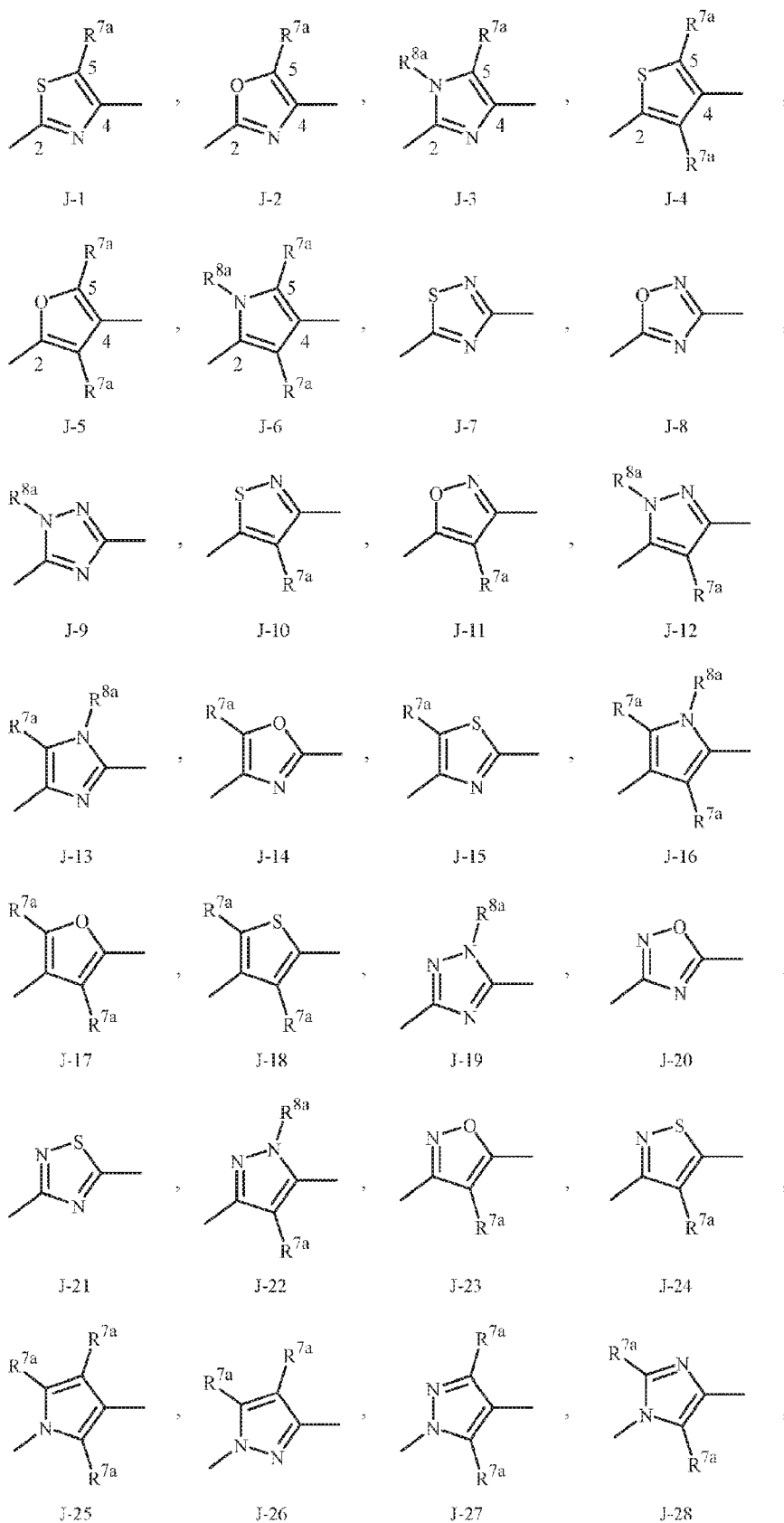
Forma de realización 23. Un compuesto de la Forma de realización 22 en el que s es 1 y f es 1.

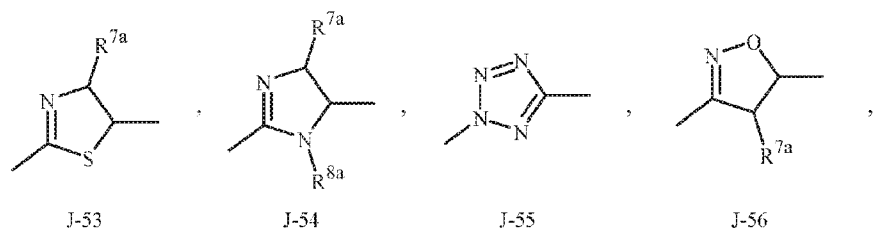
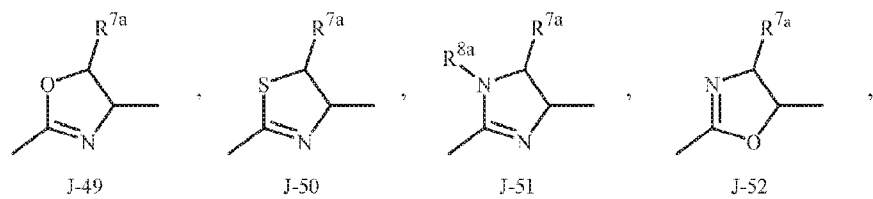
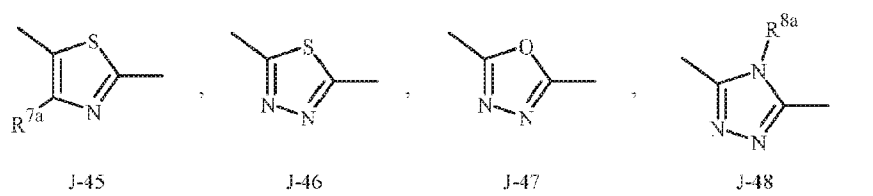
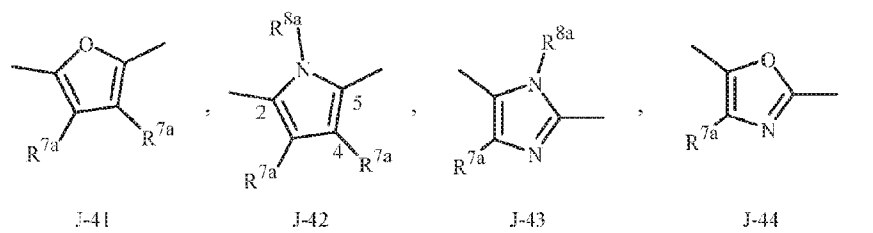
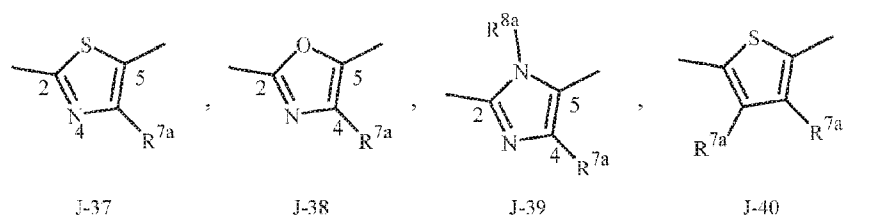
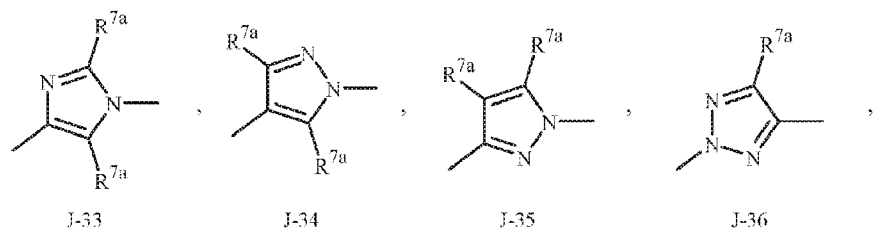
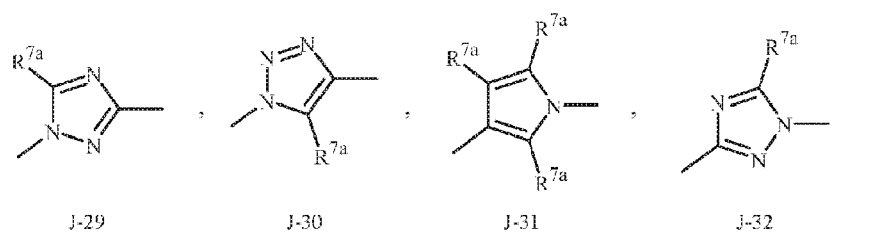
Forma de realización 24. Un compuesto de la Forma de realización 22 en el que s es 0, 1 o 2 y f es 0.

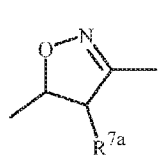
65 Forma de realización 25. Un compuesto de la Forma de realización 24 en el que s es 2.

- Forma de realización 26. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 25 en el que R^2 es H, ciano, metilo, etilo o halometilo.
- 5 Forma de realización 27. Un compuesto de la Forma de realización 26 en el que R^2 es H o metilo. Forma de realización 28. Un compuesto de la Forma de realización 27 en el que R^2 es ciano.
- 10 Forma de realización 29. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 28 en el que Z^2 es un enlace directo, O, S, NR^5 o NR^5CH_2 ; o CH_2 , CH_2CH_2 o $CH_2CH_2CH_2$, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 .
- 15 Forma de realización 30. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 29 en el que Z^2 es CH_2 , CH_2CH_2 o $CH_2CH_2CH_2$, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 o hasta 1 sustituyente seleccionado de R^{13} .
- 20 Forma de realización 31. Un compuesto de la Forma de realización 30 en el que Z^2 es $CH_2CH_2CH_2$ opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 o hasta 1 sustituyente seleccionado de R^{13} .
- Forma de realización 32. Un compuesto de la Forma de realización 31 en el que Z^2 es $CH_2CH_2CH_2$ opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 .
- 25 Forma de realización 33. Un compuesto de la Forma de realización 32 en el que Z^2 es $CH_2CH_2CH_2$ opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R^6 .
- Forma de realización 34. Un compuesto de la Forma de realización 33 en el que Z^2 es $CH_2CH_2CH_2$.
- Forma de realización 35. Un compuesto de la Forma de realización 31 en el que Z^2 es $CH_2CH_2CH_2$ opcionalmente con hasta 1 sustituyente seleccionado de R^{13} .
- 30 Forma de realización 36. Un compuesto de la Forma de realización 35 en el que Z^2 es $CH_2CH_2CH(R^{13})$.
- Forma de realización 37. Un compuesto de la Forma de realización 30 en el que Z^2 es un enlace directo, O, NR^5 o NR^5CH_2 ; o CH_2 o CH_2CH_2 , cada uno opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 .
- 35 Forma de realización 38. Un compuesto de la Forma de realización 37 en el que Z^2 es un enlace directo, NR^5 o NR^5CH_2 ; o CH_2 opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 .
- Forma de realización 39. Un compuesto de la Forma de realización 38 en el que Z^2 es un enlace directo o NR^5 , NR^5CH_2 o CH_2 .
- 40 Forma de realización 40. Un compuesto de la Forma de realización 39 en el que Z^2 es un enlace directo.
- Forma de realización 41. Un compuesto de la Forma de realización 39 en el que Z^2 es NR^5 .
- 45 Forma de realización 42. Un compuesto de la Forma de realización 39 en el que Z^2 es NR^5CH_2 .
- Forma de realización 43. Un compuesto de la Forma de realización 39 en el que Z^2 es CH_2 .
- 50 Forma de realización 44. Un compuesto de la Forma de realización 30 en el que Z^2 es $CH(R^{13})$.
- Forma de realización 45. Un compuesto de la Forma de realización 30 en el que Z^2 es $CH_2CH(R^{13})$.
- 55 Forma de realización 46. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 45 en el que J es fenilo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 ; o un anillo carbocíclico de 3 a 7 miembros, en el que hasta 2 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre C(=O) y C(=S), estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 ; o un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y de 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en el que hasta 2 miembros de anillo de carbono se seleccionan independientemente de entre C(=O) y C(=S), estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo de átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo de átomo de nitrógeno.
- 60 Forma de realización 47. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 46 en el que J se selecciona de J-1 a J-92 tal como se muestran en el Anexo B
- 65

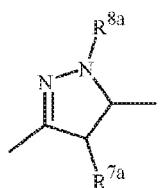
Anexo B



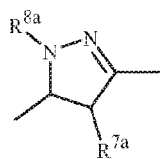




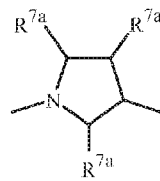
J-57



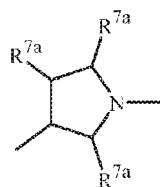
J-58



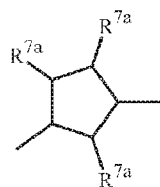
J-59



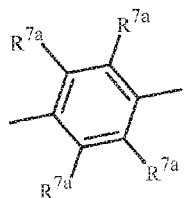
J-60



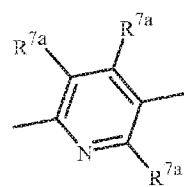
J-61



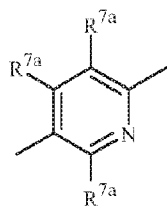
J-62



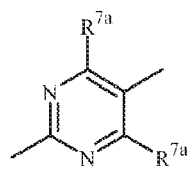
J-63



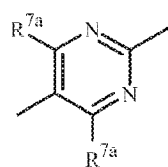
J-64



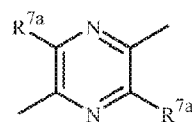
J-65



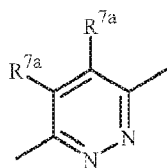
J-66



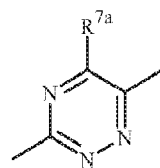
J-67



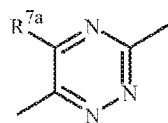
J-68



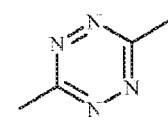
J-69



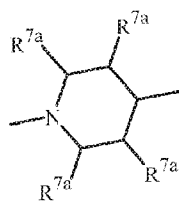
J-70



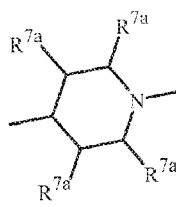
J-71



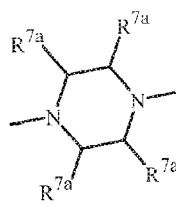
J-72



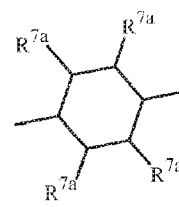
J-73



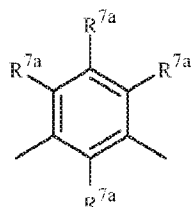
J-74



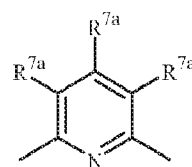
J-75



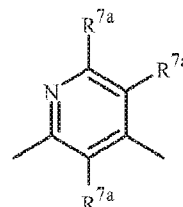
J-76



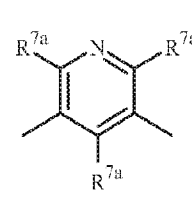
J-77



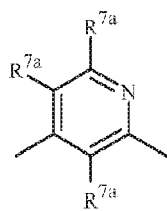
J-78



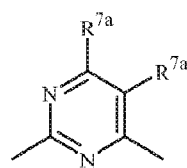
J-79



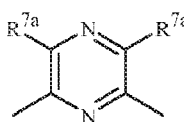
J-80



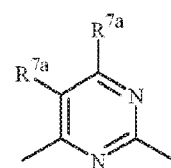
J-81



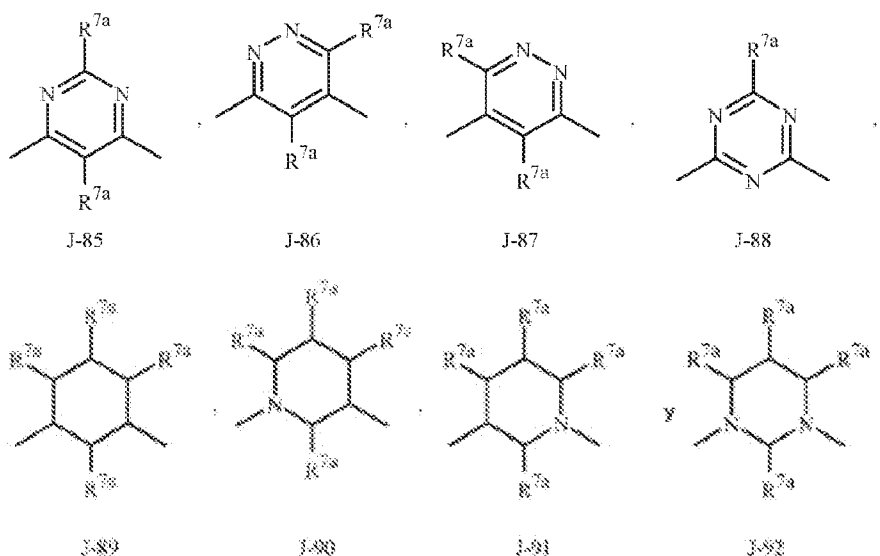
J-82



J-83



J-84



5 en los que el enlace que se proyecta hacia la izquierda está unido a Z^2 , y el enlace que se proyecta hacia la derecha está unido al anillo de oxadiazol en la Fórmula 1; cada R^{7a} es independientemente H o R^7 ; y R^{8b} es H; siempre que como máximo solo dos R^{7a} sean distintos de H.

10 Forma de realización 48. Un compuesto de la Forma de realización 47 en el que J es J-1 a J-5, J-17, J-18, J-37 a J-41, J-60, J-63 a J-71, J-73, J-74, J-75 o J-77 a J-85.

Forma de realización 49. Un compuesto de la Forma de realización 48 en el que J es J-4, J-5, J-40, J-41, J-63 a J-69, J-73 o J-77 a J-85.

15 Forma de realización 50. Un compuesto de la Forma de realización 49 en el que J es J-63 a J-69 o J-73.

Forma de realización 50a Un compuesto de la Forma de realización 49 en el que J es J-40.

20 Forma de realización 51. Un compuesto de la Forma de realización 50 en el que J es J-63 a J-69.

Forma de realización 52. Un compuesto de la Forma de realización 51 en el que J es J-63 a J-65.

Forma de realización 53. Un compuesto de la Forma de realización 52 en el que J es J-63.

25 Forma de realización 54. Un compuesto de la Forma de realización 52 en el que J es J-64.

30 Forma de realización 55. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 54 en el que cada R^3 es independientemente halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquilcarbonilo C_2-C_4 , haloalquilcarbonilo C_2-C_4 o alcoxicarbonilo C_2-C_5 ; o piridinilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tienilo, furanilo, pirrolidinilo, isoxazolinilo, tetrahidrofuranilo, piperidinilo, morfolinilo o piperazinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3c} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3d} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno.

35 Forma de realización 56. Un compuesto de la Forma de realización 55 en el que cada R^3 es independientemente halógeno, ciano, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_3 o haloalcoxi C_1-C_3 ; o piridinilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, pirrolidinilo, isoxazolinilo, tetrahidrofuranilo, piperidinilo, morfolinilo o piperazinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3c} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{2b} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno.

40 Forma de realización 57. Un compuesto de la Forma de realización 56 en el que cada R^3 es independientemente halógeno, ciano, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_3 o haloalcoxi C_1-C_3 ; o piridinilo, imidazolilo, triazolilo, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo o piperazinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3c} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3d} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno.

45 Forma de realización 57a Un compuesto de la Forma de realización 57 en el que cada R^3 es independientemente halógeno, ciano, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , halocicloalquilo C_3-C_6 o alcoxi C_1-C_3 ; o piridinilo, imidazolilo, triazolilo,

pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo o piperazinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R^{3c} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3d} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno.

5 Forma de realización 58. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 55 en el que cada R³ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄ o alcocicarbonilo C₂-C₅.

10 Forma de realización 59. Un compuesto de la Forma de realización 58 en el que cada R³ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃.

15 Forma de realización 60. Un compuesto de la Forma de realización 59 en el que cada R³ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃. Forma de realización 61. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 55 en el que cada R³ es independientemente piridinilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tienilo, furanilo, pirrolidinilo, isoxazolinilo, tetrahidrofuranilo, piperidinilo, morfolinilo o piperazinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3c} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3d} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno.

20 Forma de realización 62. Un compuesto de la Forma de realización 61 en el que cada R³ es independientemente piridinilo, imidazolilo, triazolilo, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo o piperazinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3c} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3d} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno.

25 Forma de realización 62a. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 55 en el que cada R³ es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄ o alcocicarbonilo C₂-C₅.

30 Forma de realización 62b. Un compuesto de la Forma de realización 62a en el que cada R³ es independientemente alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄ o alcocicarbonilo C₂-C₄.

Forma de realización 62c. Un compuesto de la Forma de realización 62b en el que cada R³ es independientemente alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcocicarbonilo C₂-C₄.

35 Forma de realización 63. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 62c en el que cada R^{3a} y R^{3c} cuando se toma solo (es decir, no se toma junto con R^{4a} o R^{4b}) es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquenoiloxi C₂-C₄, alquinoiloxi C₂-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfino C₁-C₄, haloalquilsulfino C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfoniloxi C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₃, cicloalquilamino C₃-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcocicarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₈.

45 Forma de realización 64. Un compuesto de la Forma de realización 63 en el que cada R^{3a} y R^{3c} es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquenoiloxi C₂-C₄, alquinoiloxi C₂-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfoniloxi C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₃, cicloalquilamino C₃-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcocicarbonilo C₂-C₅, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₇.

50 Forma de realización 65. Un compuesto de la Forma de realización 64 en el que cada R^{3a} y R^{3c} es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alqueno C₂-C₃, alquino C₂-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquenoiloxi C₂-C₃, alquinoiloxi C₂-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfoniloxi C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcocicarbonilo C₂-C₅, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₇.

55 Forma de realización 66. Un compuesto de la Forma de realización 65 en el que cada R^{3a} y R^{3c} es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃.

Forma de realización 67. Un compuesto de la Forma de realización 66 en el que cada R^{3a} y R^{3c} es independientemente halógeno, metilo, etilo, metoxi o haloalcoxi C₁-C₂.

60 Forma de realización 68. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 47 en el que cada R^{3b} y R^{3d} cuando se toma solo (es decir, no se toma junto con R^{4a} o R^{4b}) es independientemente alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquilcarbonilo C₂-C₃ o alcocicarbonilo C₂-C₃.

65 Forma de realización 69. Un compuesto de la Forma de realización 68 en el que cada R^{3b} y R^{3d} es independientemente metilo, metilcarbonilo o metocicarbonilo.

Forma de realización 70. Un compuesto de la Forma de realización 69 en el que cada R^{3b} y R^{3d} es metilo.

Forma de realización 71. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 70 en el que R^{4a} y R^{4b} cuando se toman solos (es decir, no se toman junto con R¹, R^{3a} o R^{3b}) son cada uno independientemente H, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi alquilo C₂-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₅, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅.

Forma de realización 71a. Un compuesto de la Forma de realización 71 en el que R^{4a} y R^{4b} son cada uno independientemente H, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄ o alquilcarbonilo C₂-C₄.

Forma de realización 71b. Un compuesto de la Forma de realización 71a en el que R^{4a} y R^{4b} son cada uno independientemente H, alquilo C₁-C₂, alqueno C₂-C₄, alcoxi C₁-C₂ o alquilcarbonilo C₂-C₄.

Forma de realización 72. Un compuesto de la Forma de realización 51 en el que R^{4a} y R^{4b} son cada uno independientemente H, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alqueno C₂-C₃, alquino C₂-C₃, alcoxi alquilo C₂-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, haloalquilsulfonilo C₁-C₃, alquilcarbonilo C₂-C₃, haloalquilcarbonilo C₂-C₃, alcoxycarbonilo C₂-C₃, alquilaminocarbonilo C₂-C₃ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅.

Forma de realización 73. Un compuesto de la Forma de realización 72 en el que R^{4a} y R^{4b} son cada uno independientemente H, metilo, haloalquilo C₁-C₂, metoximetilo, metilsulfonilo, metilcarbonilo o metoxycarbonilo.

Forma de realización 74. Un compuesto de la Forma de realización 73 en el que R^{4a} y R^{4b} son cada uno independientemente H o metilo.

Forma de realización 75. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 74 en el que cuando un par de sustituyentes R¹ y R^{4a} o un par de sustituyentes R¹ y R^{4b} se toman junto con los átomos a los que están unidos para formar un anillo, dicho anillo es un anillo de 5 a 7 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁹.

Forma de realización 76. Un compuesto de la Forma de realización 75 en el que un par de sustituyentes R¹ y R^{4a} o un par de sustituyentes R¹ y R^{4b} se toman junto con los átomos a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁹.

Forma de realización 77. Un compuesto de la Forma de realización 76 en el que un par de sustituyentes R¹ y R^{4a} o un par de sustituyentes R¹ y R^{4b} se toman junto con los átomos a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁹.

Forma de realización 78. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 77 en el que cuando un par de sustituyentes R^{3a} y R^{4a} o un par de sustituyentes R^{3a} y R^{4b} se toman junto con los átomos a los que están unidos para formar un anillo, dicho anillo es un anillo de 5 a 7 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰.

Forma de realización 79. Un compuesto de la Forma de realización 78 en el que un par de sustituyentes R^{3a} y R^{4a} o un par de sustituyentes R^{3a} y R^{4b} se toman junto con los átomos a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰.

Forma de realización 80. Un compuesto de la Forma de realización 79 en el que un par de sustituyentes R^{3a} y R^{4a} o un par de sustituyentes R^{3a} y R^{4b} se toman junto con los átomos a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰.

Forma de realización 81. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 80 en el que cuando un par de sustituyentes R^{3b} y R^{4a} o un par de sustituyentes R^{3b} y R^{4b} se toman junto con los átomos de nitrógeno a los que están unidos para formar un anillo, dicho anillo es un anillo de 5 a 7 miembros que contiene

miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹¹.

5 Forma de realización 82. Un compuesto de la Forma de realización 81 en el que un par de sustituyentes R^{3b} y R^{4a} o un par de sustituyentes R^{3b} y R^{4b} se toman junto con los átomos de nitrógeno a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹¹.

15 Forma de realización 83. Un compuesto de la Forma de realización 82 en el que un par de sustituyentes R^{3b} y R^{4a} o un par de sustituyentes R^{3b} y R^{4b} se toman junto con los átomos de nitrógeno a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹¹.

20 Forma de realización 84. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 83 en el que R⁵ es H, hidroxí, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₅, alcoxicarbonilalquilo C₃-C₅, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅.

25 Forma de realización 85. Un compuesto de la Forma de realización 84 en el que R⁵ es H, hidroxí, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₅, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅.

30 Forma de realización 86. Un compuesto de la Forma de realización 85 en el que R⁵ es H, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, alcoxialquilo C₂-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, haloalquilsulfonilo C₁-C₃, alquilcarbonilo C₂-C₃, haloalquilcarbonilo C₂-C₃, alcoxicarbonilo C₂-C₃, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅.

35 Forma de realización 87. Un compuesto de la Forma de realización 86 en el que R⁵ es H, metilo, metoximetilo, metilcarbonilo o metoxicarbonilo.

Forma de realización 88. Un compuesto de la Forma de realización 87 en el que R⁵ es H o metilo.

40 Forma de realización 89. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 88 en el que cada R⁶ es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂.

45 Forma de realización 90. Un compuesto de la Forma de realización 89 en el que cada R⁶ es independientemente halógeno, ciano, nitro, metilo, trifluorometilo o metoxi.

50 Forma de realización 91. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 90 en el que cada R⁷ es independientemente halógeno, hidroxí, ciano, amino, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alqueniloxi C₂-C₄, alquiniloxi C₂-C₄, alcoxialquilo C₂-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfoniloxi C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₆, cicloalquilamino C₃-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₆.

55 Forma de realización 92. Un compuesto de la Forma de realización 91 en el que cada R⁷ es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alqueniloxi C₂-C₄, alquiniloxi C₂-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfoniloxi C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₆, cicloalquilamino C₃-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₆.

60 Forma de realización 93. Un compuesto de la Forma de realización 92 en el que cada R⁷ es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alqueniloxi C₂-C₃, alquiniloxi C₂-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfoniloxi C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₆.

Forma de realización 94. Un compuesto de la Forma de realización 93 en el que cada R⁷ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alquenilo C₂-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcocarbonilo C₂-C₆.

5 Forma de realización 95. Un compuesto de la Forma de realización 94 en el que cada R⁷ es independientemente halógeno, metilo, trifluorometilo o metoxi.

Forma de realización 96. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 95 en el que cada R⁸ es independientemente metilo o etilo.

10

Forma de realización 97. Un compuesto de la Forma de realización 96 en el que R⁸ es metilo.

Forma de realización 98. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 97 en el que cada R⁹, R¹⁰ y R¹¹ es independientemente halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄, alcocarbonilo C₂-C₅, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅.

15

Forma de realización 99. Un compuesto de la Forma de realización 98 en el que cada R⁹, R¹⁰ y R¹¹ es independientemente halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, haloalquilsulfonilo C₁-C₃, alquilcarbonilo C₂-C₃, haloalquilcarbonilo C₂-C₃, alcocarbonilo C₂-C₄, alquilaminocarbonilo C₂-C₄ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅.

20

Forma de realización 100. Un compuesto de la Forma de realización 99 en el que cada R⁹, R¹⁰ y R¹¹ es independientemente halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃.

25

Forma de realización 101. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 100 en el que R¹³ es fenilo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁴.

Forma de realización 102. Un compuesto de la Forma de realización 101 en el que R¹³ es fenilo opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R¹⁴.

30

Forma de realización 103. Un compuesto de la Forma de realización 102 en el que cada R¹³ es fenilo.

Forma de realización 104. Un compuesto de Fórmula 1 o una cualquiera de las Formas de realización 1 a 102 en el que cada R¹⁴ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂ o alcoxi C₁-C₂.

35

Forma de realización 105. Un compuesto de la Forma de realización 104 en el que cada R¹⁴ es independientemente halógeno, ciano, metilo, halometilo o metoxi.

Forma de realización 106. Un compuesto de la Forma de realización 105 en el que cada R¹⁴ es independientemente halógeno, metilo o metoxi.

40

Forma de realización 107. Un compuesto de la Forma de realización 106 en el que cada R¹⁴ es independientemente halógeno o metilo.

45

Las formas de realización divulgadas en el presente documento, pero no reivindicadas, incluidas las Formas de realización 1-107 anteriores, así como cualquier otra forma de realización descrita en el presente documento, se pueden combinar de cualquier manera, y las descripciones de variables en las formas de realización pertenecen no solo a los compuestos de Fórmula 1 sino también a los compuestos de partida y los compuestos intermedios útiles para la preparación de los compuestos de Fórmula 1.

50

Las combinaciones de las Formas de realización 1-107 se ilustran mediante:

Forma de realización A. Un compuesto de Fórmula 1 en el que

55

R¹ es alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₅ o alcocarbonilo C₂-C₅, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R³; o fenilo, bencilo o naftalenilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a}; o un anillo carbocíclico de 3 a 7 miembros, en el que hasta 2 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre C(=O) y C(=S), estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a}; o un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y de 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en el que hasta 2 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre C(=O) y C(=S), estando cada anillo opcionalmente sustituido con

60

65

hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3b} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno.

Z¹ es un enlace directo, NR^{4a} o NR^{4a}NR^{4b};

s es 0, 1 o 2 y f es 0,

Z² es un enlace directo, O, NR⁵ o NR⁵CH₂; o CH₂ o CH₂CH₂, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶.

J es fenilo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁷; o un anillo carbocíclico de 3 a 7 miembros, en el que hasta 2 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre C(=O) y C(=S), estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁷; o un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y de 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en el que hasta 2 miembros de anillo de carbono se seleccionan independientemente de entre C(=O) y C(=S), estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁷ en miembros de anillo de átomo de carbono y R⁸ en miembros de anillo de átomo de nitrógeno.

cada R³ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxicarbonilo C₂-C₅; o piridinilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tienilo, furanilo, pirrolidinilo, isoxazolinilo, tetrahidrofuranilo, piperidinilo, morfolinilo o piperazinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3c} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3d} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno.

cada R^{3a} y R^{3c} es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquenoalcoxi C₂-C₄, alquinoxalcoxi C₂-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₈, cicloalquilamino C₃-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₈.

cada R^{3b} y R^{3d} es independientemente alquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, alquilcarbonilo C₂-C₃ o alcoxicarbonilo C₂-C₃;

R^{4a} y R^{4b} son cada uno independientemente H, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₅, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅; o

un par de sustituyentes R¹ y R^{4a} o un par de sustituyentes R¹ y R^{4b} se toman junto con los átomos a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 7 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁹; o

un par de sustituyentes R^{3a} y R^{4a} o un par de sustituyentes R^{3a} y R^{4b} se toman junto con los átomos a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 7 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰; o

un par de sustituyentes R^{3b} y R^{4a} o un par de sustituyentes R^{3b} y R^{4b} se toman junto con los átomos de nitrógeno a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 7 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹¹;

R⁵ es H, hidroxilo, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₅, alcoxicarbonilalquilo C₃-C₅, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅;

cada R⁶ es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂;

5 cada R⁷ es independientemente halógeno, hidroxilo, ciano, amino, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquenoilo C₂-C₄, alquinoilo C₂-C₄, alcoxialquilo C₂-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfino C₁-C₄, haloalquilsulfino C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₆, cicloalquilamino C₃-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₆.

10 cada R⁸ es independientemente metilo o etilo; y

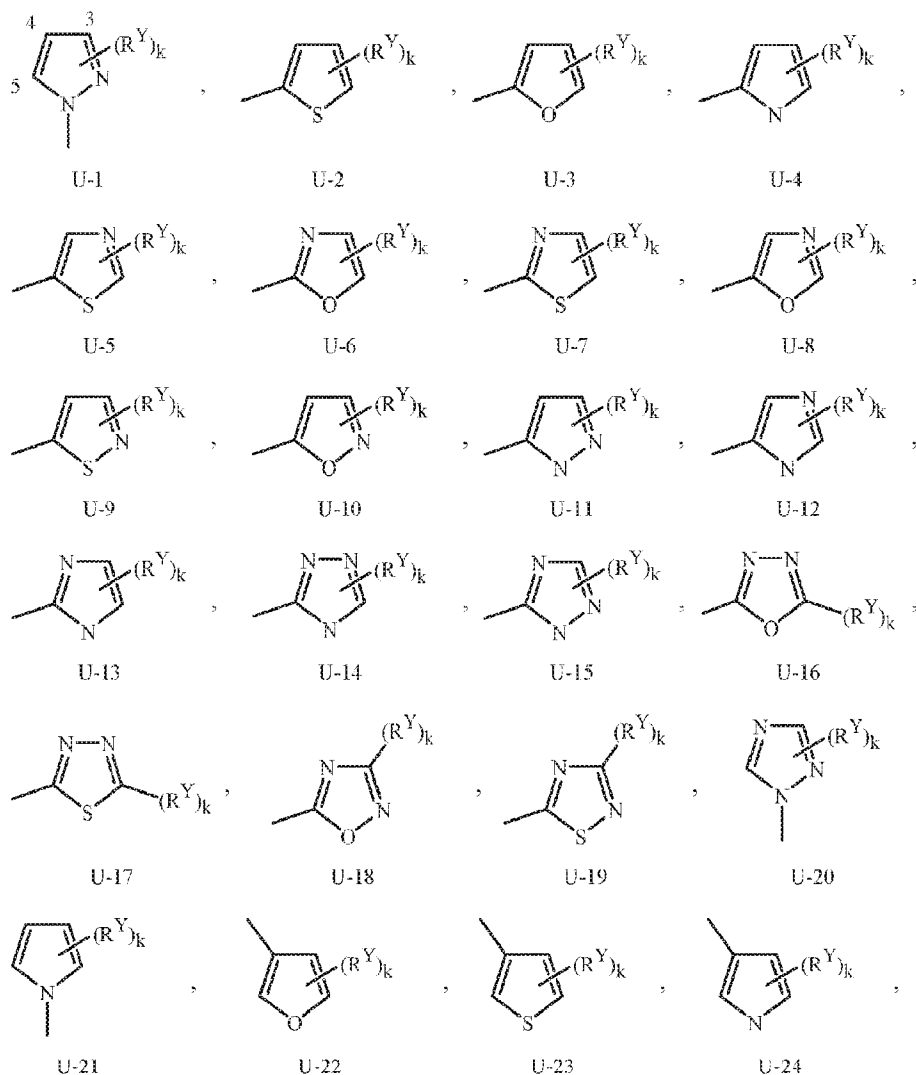
15 cada R⁹, R¹⁰ y R¹¹ es independientemente halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₅, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅.

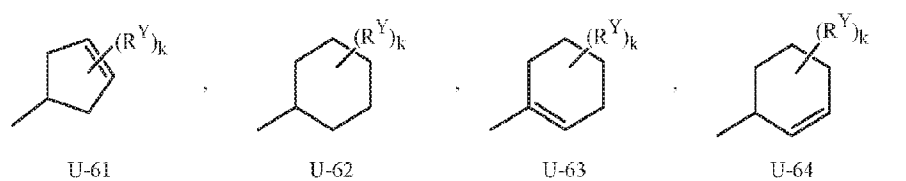
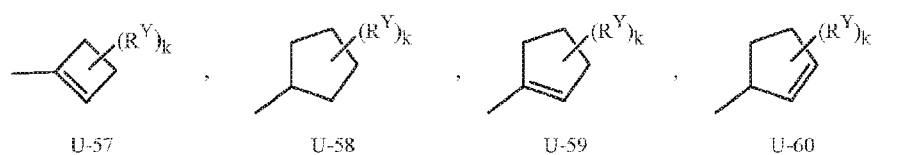
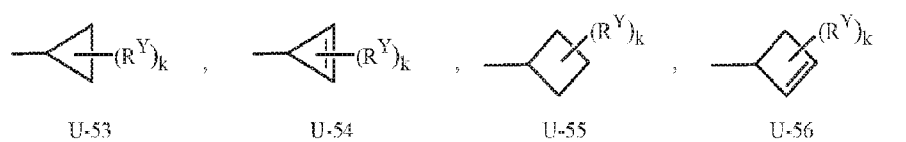
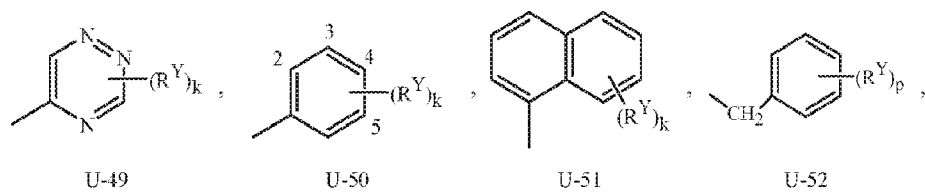
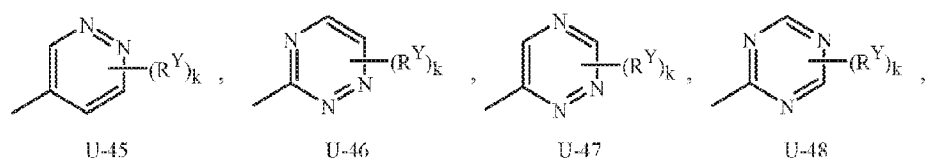
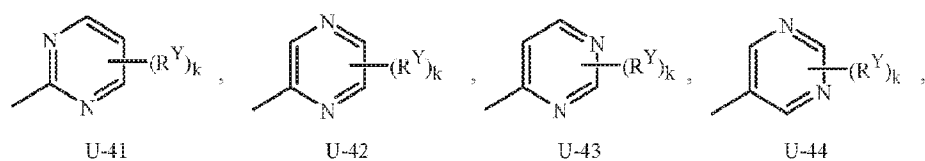
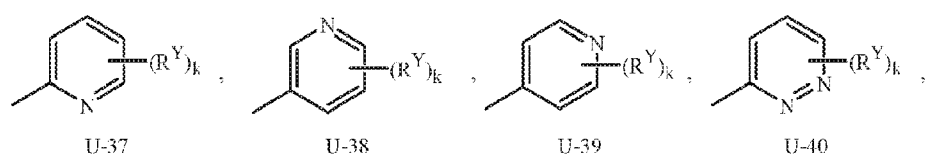
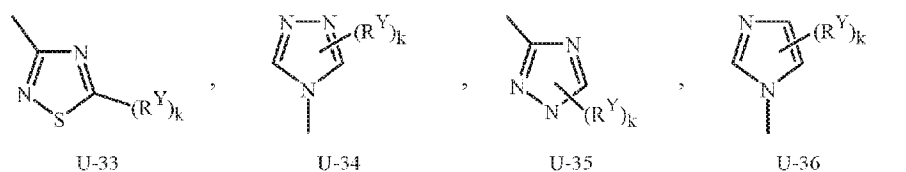
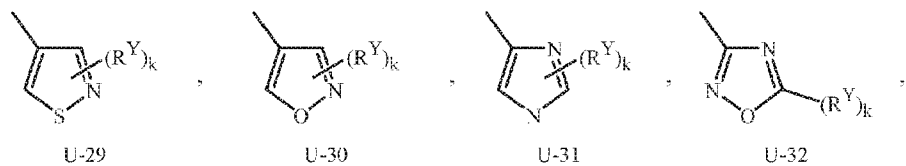
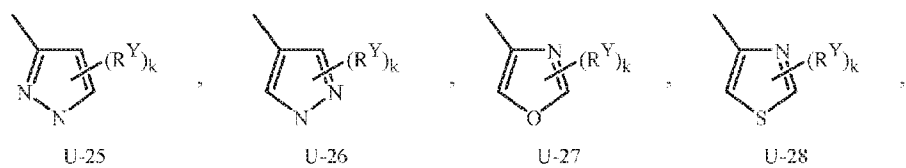
Forma de realización B. Un compuesto de la Forma de realización A en el que

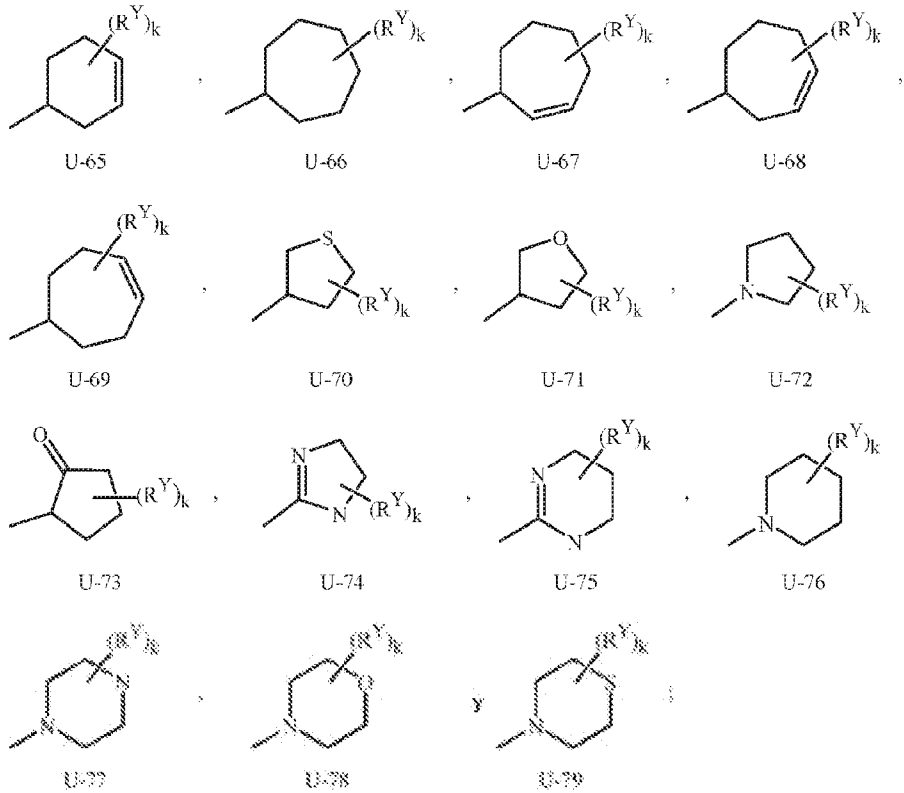
20 R¹ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxycarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R³, o R¹ se selecciona de U-1 a U-79 tal como se muestran en el Anexo A

Anexo A

25





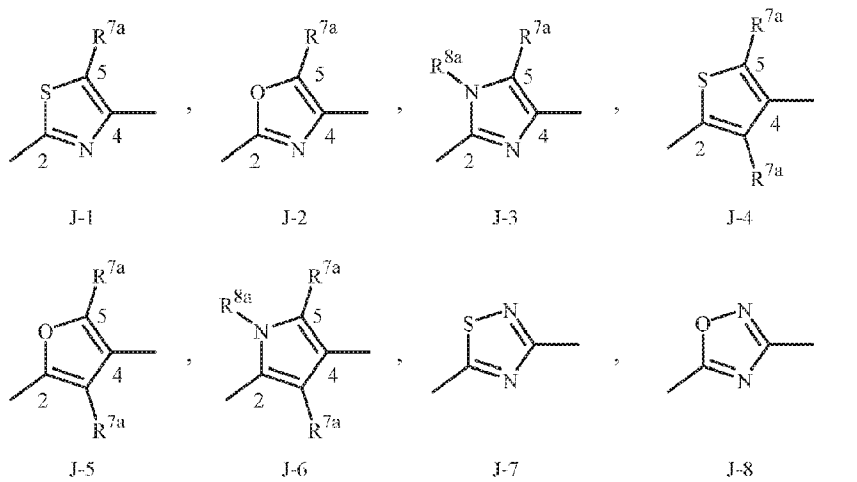


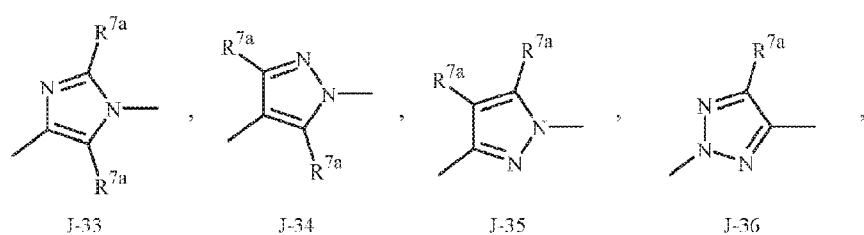
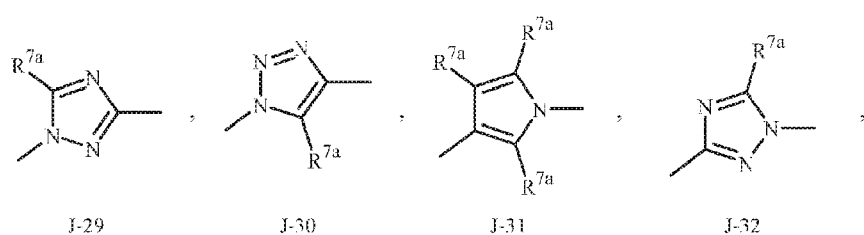
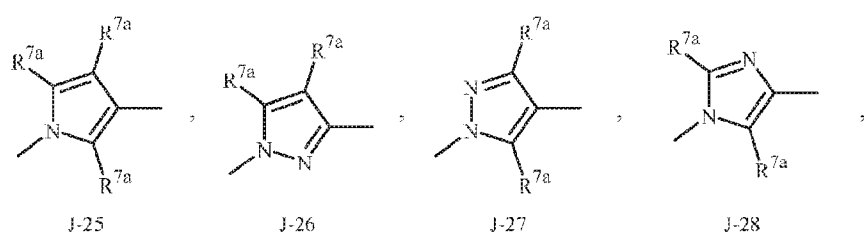
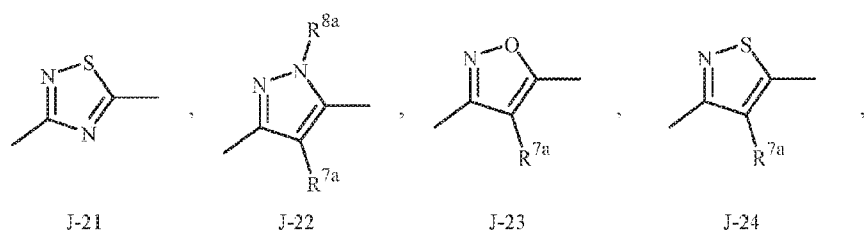
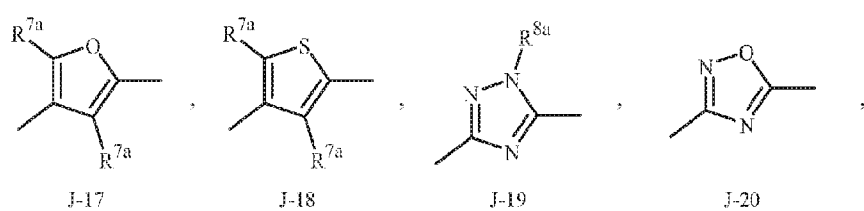
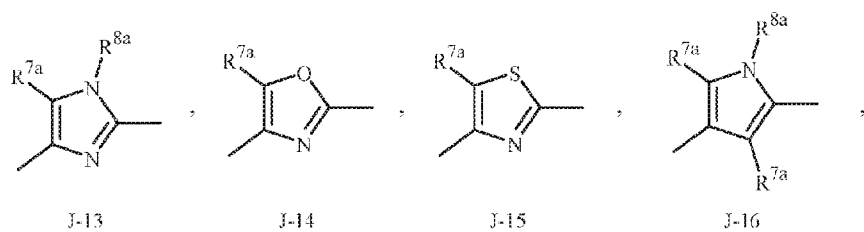
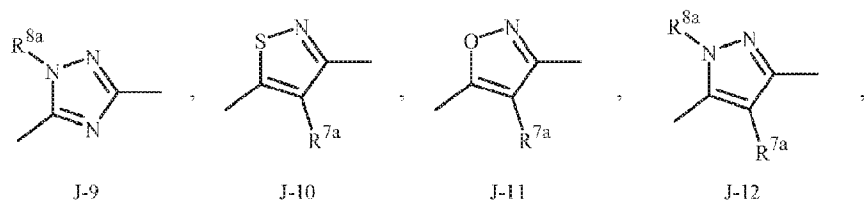
en los que cuando R^Y está unido a un carbono miembro del anillo, dicho R^Y se selecciona de R^{3a} , y cuando R^Y está unido a un nitrógeno miembro del anillo (por ejemplo, en U-4, U-11 a U-15, U-24 a U-26, U-31, U-35, U-74, U-75 y U-77), dicho R^Y se selecciona de R^{3b} , y k es 0, 1 o 2;

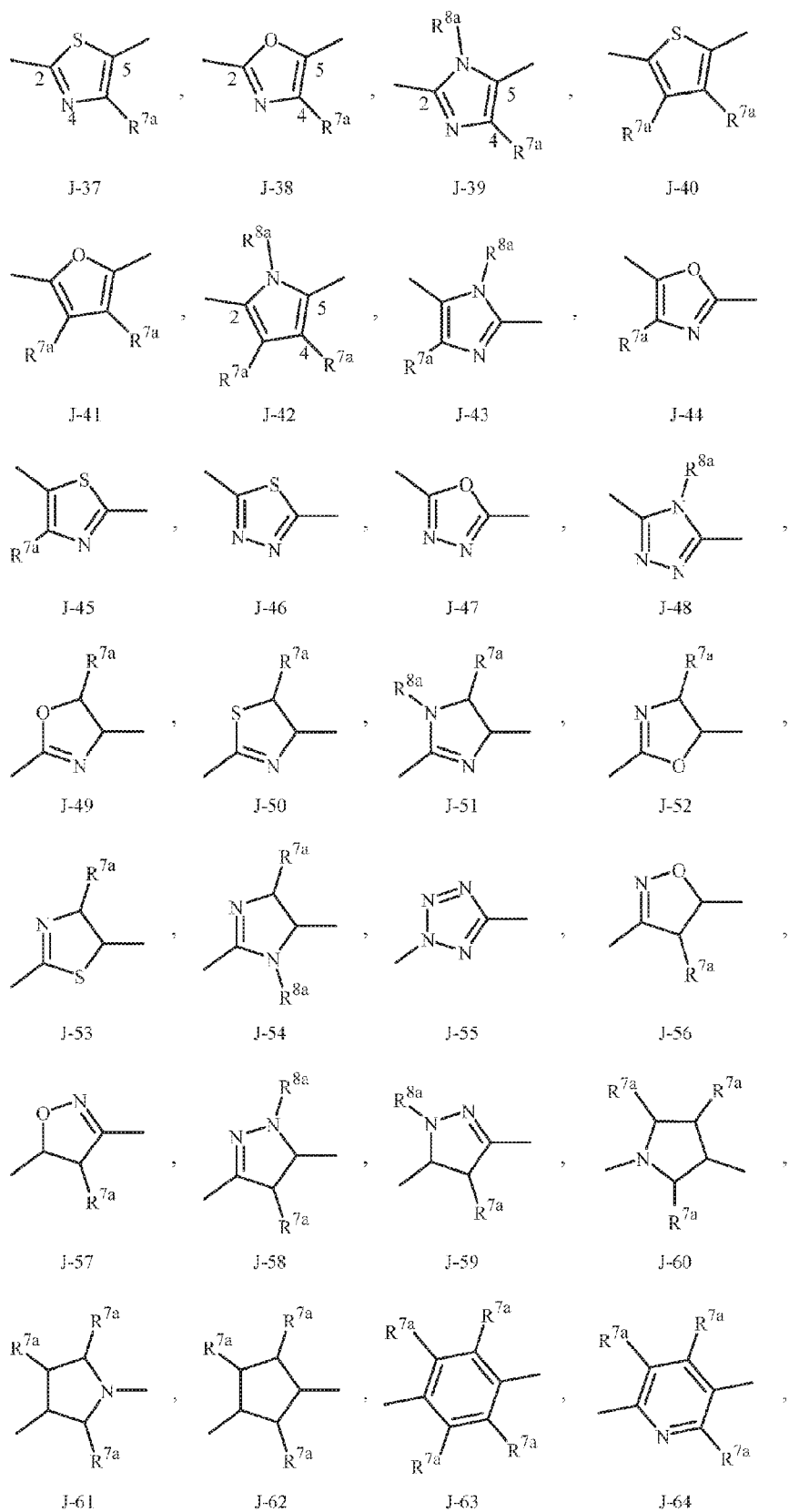
Z^2 es un enlace directo, NR^5 o NR^5CH_2 ; o CH_2 opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 ;

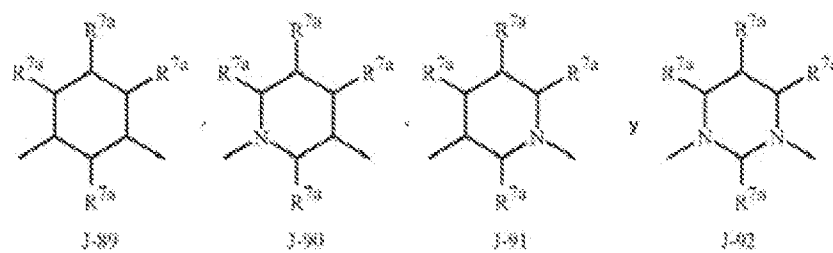
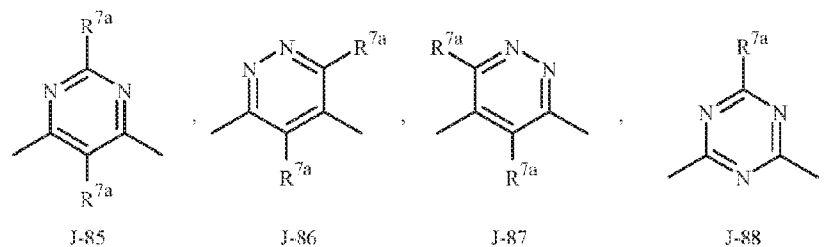
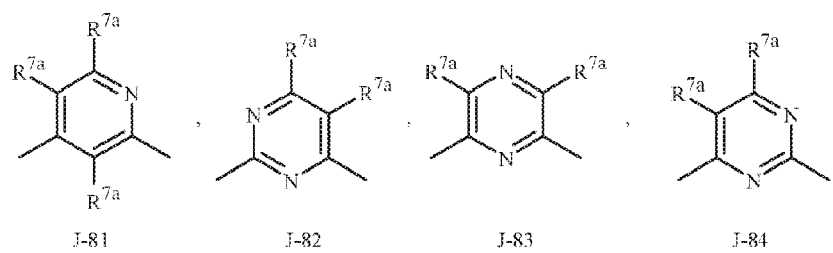
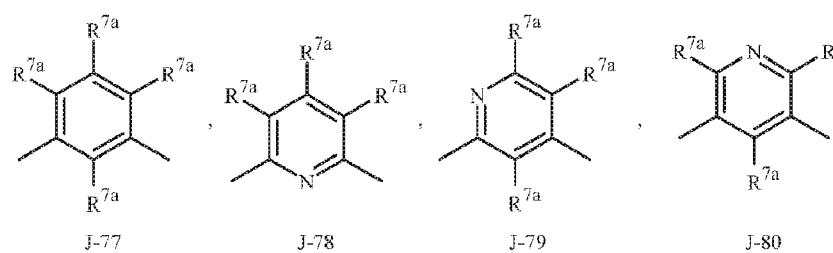
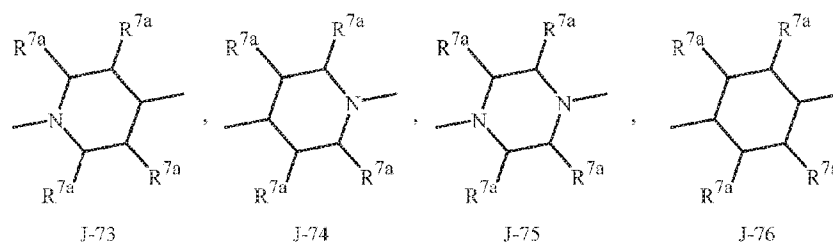
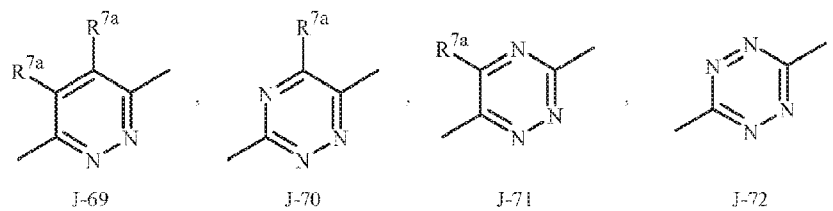
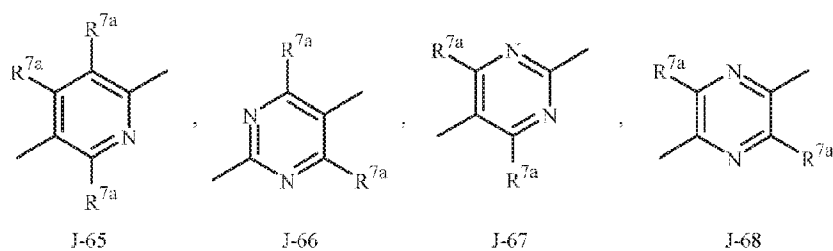
J se selecciona de J-1 a J-92 tal como se muestran en el Anexo B

Anexo B









en los que el enlace que se proyecta hacia la izquierda está unido a Z², y el enlace que se proyecta hacia la derecha está unido al anillo de oxadiazol en la Fórmula 1; cada R^{7a} es independientemente H o R⁷; y R^{8b} es H; siempre que como máximo solo dos R^{7a} sean distintos de H;

5 cada R³ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃; o piridinilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, pirrolidinilo, isoxazolinilo, tetrahidrofuranilo, piperidinilo, morfolinilo o piperazinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3c} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3d} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno;

10 cada R^{3a} y R^{3c} es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquiloxi C₁-C₄, haloalquiloxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₇;

15 cada R^{3b} y R^{3d} es independientemente metilo, metilcarbonilo o metoxicarbonilo;

20 R^{4a} y R^{4b} son cada uno independientemente H, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, alcoxialquilo C₂-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, haloalquilsulfonilo C₁-C₃, alquilcarbonilo C₂-C₃, haloalquilcarbonilo C₂-C₃, alcoxicarbonilo C₂-C₃, alquilaminocarbonilo C₂-C₃ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅;

25 un par de sustituyentes R¹ y R^{4a} o un par de sustituyentes R¹ y R^{4b} se toman junto con los átomos a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁹; o

30 un par de sustituyentes R^{3a} y R^{4a} o un par de sustituyentes R^{3a} y R^{4b} se toman junto con los átomos a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁰; o

35 un par de sustituyentes R^{3b} y R^{4a} o un par de sustituyentes R^{3b} y R^{4b} se toman junto con los átomos de nitrógeno a los que están unidos para formar un anillo de 5 a 6 miembros que contiene miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y opcionalmente hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 1 átomo de O, hasta 1 átomo de S y hasta 2 átomos de N, estando el anillo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹¹;

40 R⁵ es H, hidroxilo, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxicarbonilo C₂-C₅, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅;

45 cada R⁶ es independientemente halógeno, ciano, nitro, metilo, trifluorometilo o metoxi

50 cada R⁷ es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquiloxi C₁-C₄, haloalquiloxi C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₆; y

55 cada R⁹, R¹⁰ y R¹¹ es independientemente halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃.

Forma de realización C. Un compuesto de la Forma de realización B en el que

60 R¹ es alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxicarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R³, o U-1 a U-53, U-55, U-58, U-62, U-66 o U-74 a U-79;

65 Z¹ es un enlace directo, NR^{4a};

Z² es un enlace directo, NR⁵, NR⁵CH₂ o CH₂;

J es J-1 a J-5, J-17, J-18, J-37 a J-41, J-60, J-63 a J-71, J-73, J-74, J-75 o J-77 a J-85.

5 cada R^3 es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃; o piridinilo, imidazolilo, triazolilo, pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo o piperazinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3c} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3d} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno;

10 cada R^{3a} y R^{3c} es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alqueno C₂-C₃, alquino C₂-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquenoilo C₂-C₃, alquinoilo C₂-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₅, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₇;

15 R^{4a} es H, metilo, haloalquilo C₁-C₂, metoximetilo, metilsulfonilo, metilcarbonilo o metoxicarbonilo;

R^5 es H, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alqueno C₂-C₃, alquino C₂-C₃, alcoxialquilo C₂-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₃, haloalquilsulfonilo C₁-C₃, alquilcarbonilo C₂-C₃, haloalquilcarbonilo C₂-C₃, alcoxycarbonilo C₂-C₃, alquilaminocarbonilo C₂-C₅ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₅; y

20 cada R^7 es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alqueno C₂-C₃, alquino C₂-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquenoilo C₂-C₃, alquinoilo C₂-C₃, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆ o dialquilaminocarbonilo C₃-C₆.

25 Forma de realización D. Un compuesto de la Forma de realización C en el que

30 R^1 es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxycarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 , o U-1, U-2, U-3, U-5, U-20, U-21, U-28, U-36, U-37, U-38, U-39, U-41, U-43, U-50, U-53, U-55, U-58, U-62 o U-74 a U-78.

J es J-4, J-5, J-40, J-41, J-63 a J-69, J-73 o J-77 a J-85;

35 cada R^3 es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃;

cada R^{3a} es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃;

40 R^{4a} es H o metilo;

R^5 es H, metilo, metoximetilo, metilcarbonilo o metoxicarbonilo; y

45 cada R^7 es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alqueno C₂-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxycarbonilo C₂-C₆.

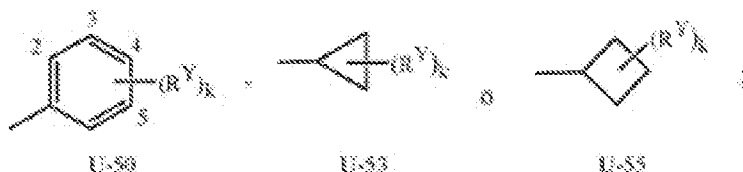
Forma de realización E. Un compuesto de la Forma de realización D en el que

50 R^1 es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxycarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R^3 ; o es U-37, U-38, U-39, U-41, U-50, U-53, U-55 o U-58; y

J es J-63 a J-69 o J-73.

Forma de realización F. Un compuesto de Fórmula 1 en el que

55 R^1 es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxycarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R^3 ; o



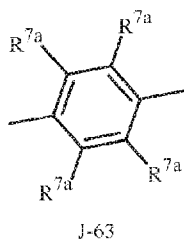
60 en los que R^Y se selecciona de R^{3a} ; y k es 0, 1 o 2;

Z¹ es un enlace directo o NR^{4a};

s es 0, 1 o 2 y f es 0;

Z² es un enlace directo, NR⁵ o NR⁵CH₂; o CH₂ opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶;

J es



en el que el enlace que se proyecta hacia la izquierda está unido a Z², y el enlace que se proyecta hacia la derecha está unido al anillo de oxadiazol en la Fórmula 1;

cada R^{7a} es independientemente H o R⁷;

R³ es halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxycarbonilo C₂-C₅;

cada R^{3a} es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃;

R^{4a} es H, metilo, haloalquilo C₁-C₂, metoximetilo, metilsulfonilo, metilcarbonilo o metoxycarbonilo;

R⁵ es H, metilo, metoximetilo, metilcarbonilo o metoxycarbonilo;

cada R⁶ es independientemente halógeno, ciano, nitro, metilo, trifluorometilo o metoxi; y

cada R⁷ es independientemente halógeno, metilo, trifluorometilo o metoxi.

Forma de realización G. Un compuesto de la Forma de realización F en el que

R¹ es alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxycarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R³;

Z¹ es un enlace directo;

Z² es CH₂;

cada R^{7a} es H; y

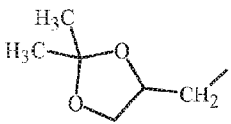
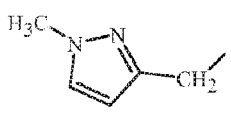
cada R³ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃.

Forma de realización H. Un compuesto de las Formas de realización F y G en el que

s es 2.

Las Formas de realización específicas incluyen compuestos de Fórmula 1 en los que R¹, Z¹, s, f, Z² y J se definen de la forma siguiente, en los que J está conectado a Z² y el anillo de oxadiazol en una orientación 1,4. Los compuestos marcados con un asterisco (*) son compuestos de la invención. Los demás no lo son.

R ¹	Z ¹	s	f	Z ²	J
PhCH ₂	enlace directo	0	0	CH ₂	fenilo
Et	enlace directo	0	0	CH ₂	fenilo
<i>n</i> -Pr	enlace directo	0	0	CH ₂	fenilo
<i>i</i> -Pr	enlace directo	0	0	CH ₂	fenilo

R ¹	Z ¹	s	f	Z ²	J
<i>i</i> -Bu	enlace directo	0	0	CH ₂	fenilo
<i>n</i> -Bu	enlace directo	0	0	CH ₂	fenilo
CH≡CCH ₂	enlace directo	0	0	CH ₂	fenilo
MeOC=OCH ₂ CH ₂	enlace directo	0	0	CH ₂	fenilo
Me	enlace directo	2	0	NH	fenilo *
Ph	enlace directo	2	0	NH	fenilo *
2-Cl-Ph	enlace directo	2	0	NH	fenilo *
Et	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo *
Me	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo *
4-MeO-Ph	NH	2	0	enlace directo	fenilo
<i>c</i> -Pr	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo
Me	NH	2	0	CH ₂	fenilo
CH≡CCH ₂	NH	2	0	CH ₂	fenilo
<i>c</i> -Pr	enlace directo	2	0	N(Me)CH ₂	fenilo
CH ₂ =CHCH ₂	NH	2	0	CH ₂	fenilo
<i>n</i> -Pr	NH	2	0	CH ₂	fenilo
Me	enlace directo	2	0	N(Me)CH ₂	fenilo
Me	enlace directo	2	0	N(C=OMe)CH ₂	fenilo
Et	enlace directo	2	0	N(Me)CH ₂	fenilo
Et	enlace directo	2	0	N(C=OMe)CH ₂	fenilo
Et	enlace directo	2	0	NHCH ₂	fenilo
<i>c</i> -Pr	enlace directo	2	0	NHCH ₂	fenilo
	NH	2	0	enlace directo	fenilo
	NH	2	0	enlace directo	fenilo
	NH	2	0	CH ₂	fenilo
<i>i</i> -Bu					
Me	enlace directo	2	0	N(SO ₂ Me)	fenilo
Et	N(Me)	2	0	CH ₂	fenilo
<i>c</i> -Pr	N(Me)	2	0	CH ₂	fenilo
Me	N(OMe)	2	0	enlace directo	fenilo
<i>c</i> -Pr	NH	2	0	CH ₂	fenilo
MeOCH ₂ CH ₂	NH	2	0	CH ₂	fenilo
<i>i</i> -Pr	NH	2	0	CH ₂	fenilo
Et	NH	2	0	CH ₂	fenilo
Me	enlace directo	2	0	(CH ₂) ₃	fenilo
Et	enlace directo	2	0	(CH ₂) ₃	fenilo

R ¹	Z ¹	s	f	Z ²	J
<i>c</i> -Pr	enlace directo	2	0	(CH ₂) ₃	fenilo
Et	enlace directo	2	0	CH(Ph)	fenilo
<i>n</i> -Pr	enlace directo	2	0	NHCH ₂	fenilo
Me	enlace directo	2	0	CH ₂ CH ₂	fenilo
<i>n</i> -Pr	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo
<i>i</i> -Pr	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo
<i>c</i> -Pr	enlace directo	2	0	CH ₂ CH ₂	fenilo
<i>i</i> -Bu	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo
<i>n</i> -Bu	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo
CH≡CCH ₂	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo
MeOC(=O)CH ₂ CH ₂	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo
Cl ₂ CH	enlace directo	1	0	enlace directo	fenilo *
PhCH ₂	enlace directo	1	0	CH ₂	fenilo
Me	enlace directo	1	0	CH ₂	fenilo
Et	enlace directo	1	0	CH ₂	fenilo
<i>n</i> -Pr	enlace directo	1	0	CH ₂	fenilo
<i>i</i> -Pr	enlace directo	1	0	CH ₂	fenilo
<i>i</i> -Bu	enlace directo	1	0	CH ₂	fenilo
<i>n</i> -Bu	enlace directo	1	0	CH ₂	fenilo
MeOC(=O)CH ₂ CH ₂	enlace directo	1	0	CH ₂	fenilo
EtOC(=O)CH ₂ CH ₂	enlace directo	1	0	CH ₂	fenilo

5 Cabe asimismo destacar formas de realización específicas que incluyen compuestos de Fórmula 1 en los que R¹, Z¹, s, f, Z² y J se definen de la forma siguiente, en los que J está conectado a Z² y el anillo de oxadiazol en una orientación 1.4. Los cinco primeros compuestos pertenecen a la invención, los dos últimos no.

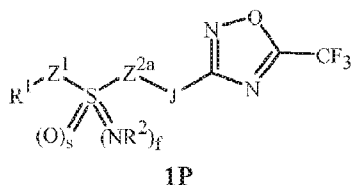
R ¹	Z ¹	s	f	Z ²	J
Me	enlace directo	2	0	NH	fenilo
Ph	enlace directo	2	0	NH	fenilo
2-Cl-Ph	enlace directo	2	0	NH	fenilo
Et	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo
Me	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo
4-MeO-Ph	NH	2	0	enlace directo	fenilo
<i>c</i> -Pr	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo

10 La presente invención proporciona una composición fungicida que comprende un compuesto de Fórmula 1 según la reivindicación 1 (incluidos todos los estereoisómeros y al menos otro fungicida). Cabe destacar como formas de realización de dichas composiciones las composiciones que comprenden un compuesto correspondiente a cualquiera de las formas de realización de compuestos descritas anteriormente.

15 La presente invención proporciona una composición fungicida que comprende un compuesto de Fórmula 1 según la reivindicación 1 (incluidos todos los estereoisómeros) (es decir, en una cantidad eficaz como fungicida), y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Cabe destacar como formas de realización de dichas composiciones las composiciones que comprenden un compuesto correspondiente a cualquiera de las formas de realización de compuestos descritas anteriormente.

La presente invención proporciona un procedimiento para controlar enfermedades de plantas provocadas por patógenos fúngicos de plantas que comprende aplicar a la planta o porción de la misma, o a la semilla de la planta, una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de Fórmula 1 según la reivindicación 1 (incluidos todos los estereoisómeros). Cabe destacar como formas de realización de dichos procedimientos los procedimientos que comprenden aplicar una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto correspondiente a cualquiera de las formas de realización de compuestos descritas anteriormente. Cabe destacar, en particular, las formas de realización en las que los compuestos se aplican como composiciones de la presente invención.

Cabe destacar como forma de realización los compuestos de Fórmula 1 que son compuestos de Fórmula 1P (incluidos todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), *N*-óxidos y sales de los mismos, así como las composiciones agrícolas que los contengan y su uso como fungicidas:



en la que

R^1 es alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_5 o alcoxicarbonilo C_2-C_5 , cada uno opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; o fenilo, bencilo, fenetilo o naftalenilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a} ; o un anillo carbocíclico de 3 a 7 miembros, en el que hasta 3 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre $C(=O)$ y $C(=S)$, estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a} ; o

R^1 es un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros de anillo seleccionados de entre átomos de carbono y de 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en el que hasta 3 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre $C(=O)$ y $C(=S)$, y los miembros de anillo de átomo de azufre se seleccionan independientemente de entre $S(=O)_u(=NR^{12})_v$, estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{3a} en miembros de anillo de átomo de carbono y R^{3b} en miembros de anillo de átomo de nitrógeno;

Z^1 es un enlace directo, O, NR^{4a} o $NR^{4a}NR^{4b}$;

s y f son cada uno 0, 1 o 2, siempre que la suma de s y f sea 0, 1 o 2;

cada R^2 es independientemente H, ciano, alquilo C_1-C_3 o haloalquilo C_1-C_3 ;

Z^{2a} es $CH_2CH_2CH_2$ opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 o hasta 1 sustituyente seleccionado de R^{13} .

J es fenilo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 ; o un anillo carbocíclico de 3 a 7 miembros, en el que hasta 3 miembros de anillo de átomo de carbono se seleccionan independientemente de entre $C(=O)$ y $C(=S)$, estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 ; o

J es un anillo heterocíclico de 5 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros de anillo seleccionados de átomos de carbono y de 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente de entre hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en el que hasta 2 miembros del anillo se seleccionan independientemente de entre $C(=O)$, $C(=S)$, $S(=O)$ y $S(=O)_2$, estando cada anillo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^7 en miembros de anillo de átomo de carbono y R^8 en miembros de anillo de átomo de nitrógeno;

cada R^3 es independientemente halógeno, hidroxilo, ciano, $-S-C\equiv N$, $-SH$, amino, nitro, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfino C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_4 , alquilcarbonilo C_2-C_4 , haloalquilcarbonilo C_2-C_4 , alcoxicarbonilo C_2-C_5 , haloalcoxicarbonilo C_2-C_5 , alquilaminocarbonilo C_2-C_5 o dialquilaminocarbonilo C_3-C_5 ; o piridinilo, pirimidinilo, pirazolilo, imidazolilo, triazolilo, tiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxetanilo, 1,3-dioxolanilo, tetrahidropiranilo, tienilo, furanilo, pirrolidinilo, isoxazolinilo, tetrahidrofuranilo, piperidinilo, morfolinilo o piperazinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 3

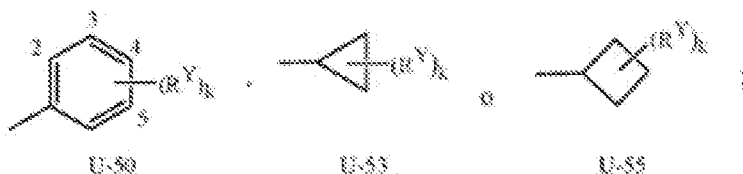
R¹³ es fenilo opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R¹⁴; y

5 cada R¹⁴ es independientemente halógeno, hidroxilo, ciano, nitro, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂.

10 En consecuencia, cabe destacar un compuesto seleccionado de la Fórmula 1P (incluidos todos los geométricos y estereoisómeros), N-óxidos y sales del mismo, tal como se han definido anteriormente. También cabe destacar las formas de realización equivalentes a las Formas de realización 1 a 107 y las Formas de realización A a H en las que en dichas formas de realización equivalentes "Fórmula 1" se reemplaza por "Fórmula 1P" y el alcance de dichas formas de realización equivalentes no excede el alcance definido anteriormente para la Fórmula 1P. Ejemplos de combinaciones de las Formas de realización 1 a 107 aplicadas a la Fórmula 1P son las Formas de realización AP, BP y CP siguientes.

15 Forma de realización AP. Un compuesto de Fórmula 1P en el que

R¹ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxicarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R³; o



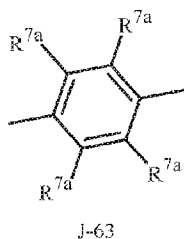
20 en los que R^Y se selecciona de R^{3a}; y k es 0, 1 o 2;

25 Z¹ es un enlace directo o NR^{4a};

s es 0, 1 o 2 y f es 0; o s es 1 y f es 1; o s es 1 y f es 1;

30 Z^{2a} es CH₂CH₂CH₂ opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶ o hasta 1 sustituyente seleccionado de R¹³.

J es



35 en el que el enlace que se proyecta hacia la izquierda está unido a Z^{2a}, y el enlace que se proyecta hacia la derecha está unido al anillo de oxadiazol en la Fórmula 1;

cada R^{7a} es independientemente H o R⁷;

40 R³ es halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, haloalquilcarbonilo C₂-C₄ o alcoxicarbonilo C₂-C₅;

cada R^{3a} es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃;

45 R^{4a} es H, metilo, haloalquilo C₁-C₂, metoximetilo, metilsulfonilo, metilcarbonilo o metoxicarbonilo;

cada R⁶ es independientemente halógeno, ciano, nitro, metilo, trifluorometilo o metoxi; y

cada R⁷ es independientemente halógeno, metilo, trifluorometilo o metoxi.

50 Forma de realización BP. Un compuesto de la Forma de realización AP en el que

R¹ es alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄ o alcocarbonilo C₂-C₄, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 1 sustituyente seleccionado de R³;

Z¹ es un enlace directo;

Z^{2a} es CH₂CH₂CH₂ opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶ o hasta 1 sustituyente seleccionado de R¹³.

cada R^{7a} es H; y

R³ es halógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o haloalcoxi C₁-C₃.

Forma de realización CP. Un compuesto de las Formas de realización AP y BP en el que

s es 2; y

Z^{2a} es CH₂CH₂CH₂.

Las Formas de realización específicas incluyen compuestos de Fórmula 1P en los que R¹, Z¹, s, f, Z² y J se definen de la forma siguiente, en los que J está conectado a Z² y el anillo de oxadiazol en una orientación 14;

R ¹	Z ¹	s	f	Z ²	J
Me	enlace directo	2	0	(CH ₂) ₃	fenilo
Et	enlace directo	2	0	(CH ₂) ₃	fenilo
<i>c</i> -Pr	enlace directo	2	0	(CH ₂) ₃	fenilo

También cabe destacar una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de Fórmula 1P (incluidos todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos y sales del mismo) o una cualquiera de las formas de realización equivalentes que son equivalentes de forma de realización de las Formas de realización 1 a 107 y las Formas de realización A a H (por ejemplo, las Formas de realización AP, BP y CP), y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. También cabe destacar un procedimiento para controlar enfermedades de plantas provocadas por patógenos fúngicos de plantas que comprende aplicar a la planta o porción de la misma, o a la semilla de la planta, una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de Fórmula 1P (incluidos todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos y sales del mismo) o una cualquiera de dichas formas de realización equivalentes. Cabe destacar, en particular, las formas de realización en las que los compuestos de fórmula 1P se aplican como composiciones de la presente invención.

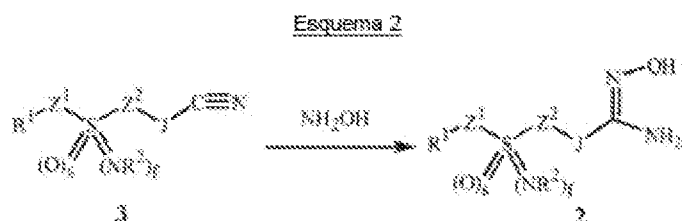
También cabe destacar como una forma de realización de la presente invención los compuestos de Fórmula 1 en los que Z¹ es O, NR^{4a} o NR^{4a}NR^{4b} y Z² es O, S, NR⁵ o NR⁵CH₂; o CH₂, CH₂CH₂ o CH₂CH₂CH₂, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶ o hasta 1 sustituyente seleccionado de R¹³. Cabe destacar como una forma de realización los compuestos de Fórmula 1 en los que Z¹ es NR^{4a} y Z² es NR⁵ o NR⁵CH₂; o CH₂, CH₂CH₂ o CH₂CH₂CH₂.

Para preparar los compuestos de Fórmula 1 se pueden utilizar uno o más de los siguientes procedimientos y variaciones tal como se describen en los Esquemas 1-7. Las definiciones de R¹, Z¹, R², Z², J, s y f en los compuestos de Fórmulas 1-7 siguientes son las definidas anteriormente en el Sumario de la invención a menos que se indique lo contrario. Los compuestos de Fórmulas 1a a 1d son varios subconjuntos de la Fórmula 1, y todos los sustituyentes de las Fórmulas 1a a 1d son tal como se han definido anteriormente para la Fórmula 1 a menos que se indique lo contrario.

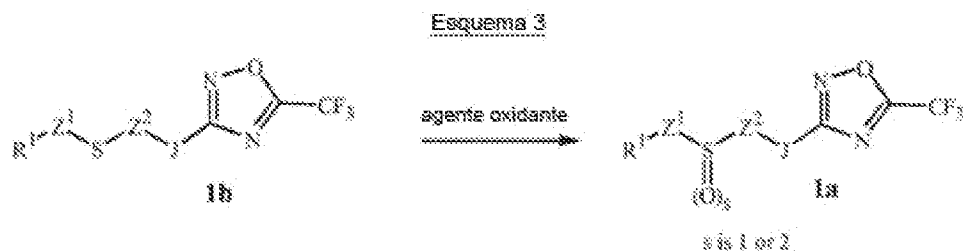
Tal como se muestra en el Esquema 1, los compuestos de Fórmula 1 se pueden preparar haciendo reaccionar amidoximas de Fórmula 2 con anhídrido trifluoroacético (TFAA) o un equivalente. La reacción del Esquema 1 se puede llevar a cabo sin disolventes distintos de los compuestos de Fórmula 2 y TFAA. Más típicamente, la reacción se lleva a cabo en una fase líquida con un disolvente tal como tetrahidrofurano o tolueno a una temperatura de entre aproximadamente 0 y 100 °C, y opcionalmente en presencia de una base tal como piridina o trimetilamina. En la técnica se conoce la preparación de anillos de oxadiazol mediante este procedimiento y otros; véase, por ejemplo, Comprehensive Heterocyclic Chemistry, Vol. 6, Parte 4B, páginas 365-391, editor: Kevin T. Potts, Pergamon Press, Nueva York, 1984. El procedimiento del Esquema 1 también se ilustra en el presente Ejemplo 1, Etapa C, Ejemplo 2, Etapa C y Ejemplo 3, Etapa B.



Tal como se muestra en el Esquema 2, las oximas de Fórmula 2 puede prepararse a partir de los correspondientes nitrilos de Fórmula 3 e hidroxilamina o una sal de hidroxilamina (por ejemplo, clorhidrato de hidroxilamina) en un disolvente tal como etanol o metanol a temperaturas que varían de aproximadamente 0 a 80 °C. Se necesita una base para liberar la hidroxilamina de su sal. Las bases adecuadas incluyen, pero sin limitación, hidróxido de sodio, bicarbonato de sodio o carbonato de sodio. Para las condiciones de reacción, véase el presente Ejemplo 1, Etapa B, Ejemplo 2, Etapa B y Ejemplo 3, Etapa A. Los intermedios de Fórmula 3 se preparan fácilmente mediante procedimientos conocidos en la técnica, que incluyen, por ejemplo, el acoplamiento de sales sódicas de ácido sulfínico y haluros orgánicos para proporcionar sulfonas tal como se describe en *Organic Letters* 2002, 4(25), 4423-4425. Procedimientos de acoplamiento cruzado catalizados por cobre se describen en *Journal of Organic Chemistry* 2005, 70(7), 2696-2700 y *Journal of Organic Chemistry* 2013, 78(23), 12194-12201. Las sulfonamidas de Fórmula 3 (es decir, la Fórmula 3 en la que Z¹ es NR^{4a} o NR^{4a}NR^{4b}) pueden prepararse haciendo reaccionar aminas con cloruros de sulfonilo tal como se describe en *Journal of Organic Chemistry* 2009, 74(24), 9287-9291. El presente Ejemplo 1, Etapa A, ilustra la preparación de una sulfona de Fórmula 3; y el Ejemplo 2, Etapa A ilustra la preparación de una sulfonamida de Fórmula 3.

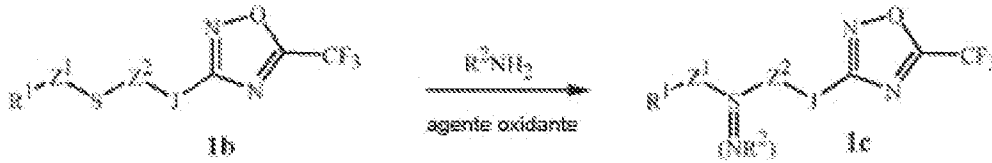


Los compuestos de Fórmula 1a (es decir, la Fórmula 1 en la que s es 1 o 2 y f es 0) pueden prepararse mediante oxidación de los compuestos correspondientes de Fórmula 1b (es decir, la Fórmula 1 en la que s es 0 y f es 0), tal como se muestra en el Esquema 3. En un procedimiento típico, se añade un agente oxidante en una cantidad que varía de aproximadamente 1 a 4 equivalentes, dependiendo del estado de oxidación del producto deseado, a un compuesto de Fórmula 1b en un disolvente. Los agentes oxidantes útiles incluyen Oxone[®] (peroximonosulfato de potasio) y ácido *m*-cloroperbenzoico. El disolvente se selecciona en función del agente oxidante empleado. Con Oxone[®] se utiliza preferentemente etanol o acetona acuosa, y se prefiere generalmente el diclorometano con ácido *m*-cloroperbenzoico. Las temperaturas de reacción útiles normalmente varían de aproximadamente 0 a 80 °C. Las condiciones de reacción para oxidar sulfuros a sulfóxidos y sulfonas se describen en *The Synthesis of Sulphones, Sulphoxides and Cyclic Sulphides*, Ed. S. Patai y Z. Rappoport, John Wiley & Sons, Nueva York, 1994. El procedimiento del Esquema 3 también se ilustra en los presentes Ejemplos 4 y 5.



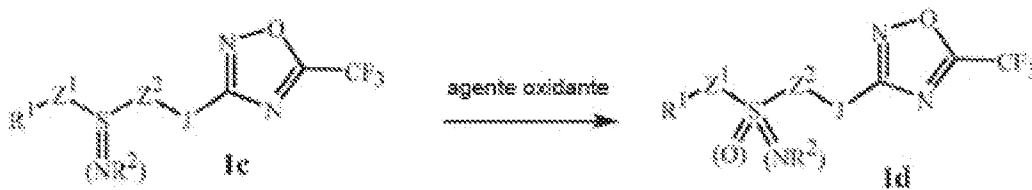
Tal como se muestra en el Esquema 4, las sulfiliminas de Fórmula 1c (es decir, la Fórmula 1 en la que s es 0 y f es 1) pueden prepararse haciendo reaccionar compuestos de Fórmula 1b (es decir, la Fórmula 1 en la que s es 0 y f es 0) y una amina de fórmula R²NH₂. La reacción se lleva a cabo en presencia de un agente oxidante adecuado tal como *N*-bromosuccinimida y una base tal como *tert*-butóxido de potasio en un disolvente tal como metanol, a una temperatura que varía de aproximadamente 0 a 60 °C. En la literatura se han descrito diversos procedimientos generales para la preparación de sulfiliminas; véase, por ejemplo, *The Chemistry of Sulfilimines*, T. L. Gilchrist y C. J. Moody, *Chemical Reviews* 1977, 77(3), páginas 409-435 y *Organic Chemistry of Sulfur*, Ed. S. Oae, Plenum Press, Nueva York, 1977, páginas 383-471. El procedimiento del Esquema 4 también se ilustra en el presente Ejemplo 6.

Esquema 4



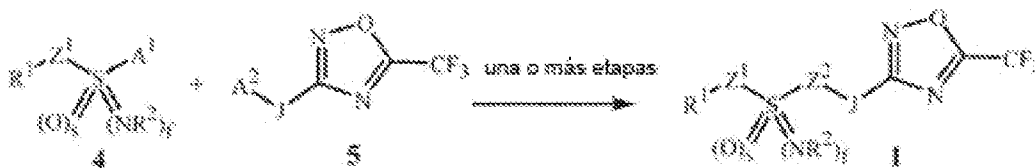
De manera análoga al procedimiento del Esquema 3, los compuestos de Fórmula 1d (es decir, la Fórmula 1 en la que s es 1 y f es 1) pueden prepararse mediante reacción de compuestos de Fórmula 1c (es decir, la Fórmula 1 en la que s es 0 y f es 1) y un agente oxidante adecuado en presencia de un disolvente, tal como se muestra en el Esquema 5. Las sulfoximinas se divulgan en una diversidad de referencias publicadas que incluyen The Sulfoximines, por P. D. Kennewell y J. B. Taylor, en Chemical Society Reviews 1975, Vol. 4, Edición 2, páginas 189-209. El procedimiento del Esquema 5 también se ilustra en el presente Ejemplo 7.

Esquema 5



Tal como se muestra en el Esquema 6, los compuestos de Fórmula 1 también pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmulas 4 y 5 en las que A¹ y A² son grupos funcionales adecuados, que cuando se someten a las condiciones de reacción apropiadas forman el compuesto deseado de Fórmula 1. Los grupos funcionales A¹ y A² se seleccionan de entre, pero sin limitación, hidrógeno, halógeno, alquilo, haloalquilo, carboxilo, amino, aminoalquilo, nitro, hidroxilo, hidroxialquilo, tiol, tioalquilo, alquiltio, alquiltio, clorosulfonilo, clorosulfonilalquilo y similares. Las condiciones de reacción adecuadas incluyen, por ejemplo, oxidaciones, reducciones, alquilaciones, aminaciones y sulfonilación. Por ejemplo, la reacción de un compuesto de Fórmula 4 en el que A¹ es Cl con un compuesto de Fórmula 5 en el que A² es OH dará un compuesto de Fórmula 1 en el que Z² es O (tal como se ilustra en el presente Ejemplo 8). De forma similar, la reacción de un compuesto de Fórmula 4 en el que A¹ es Cl con un compuesto de Fórmula 5 en el que A² es NH₂ dará un compuesto de Fórmula 1 en el que Z² es NH (tal como se ilustra en el presente Ejemplo 9). Un experto en la técnica puede determinar fácilmente el grupo funcional apropiado necesario para A¹ y A² para la construcción del compuesto deseado de Fórmula 1.

Esquema 6

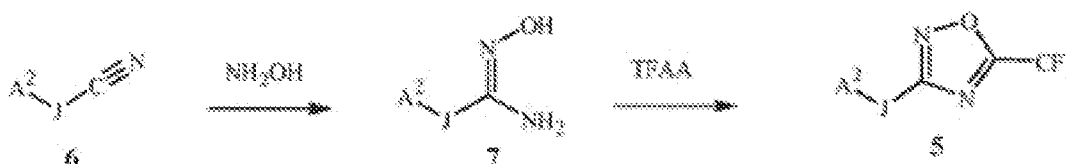


en los que A¹ y A² son grupos funcionales

capaces de formar un compuesto de Fórmula 1

Tal como se muestra en el Esquema 7, los compuestos de Fórmula 5 pueden prepararse mediante reacción de nitrilos de Fórmula 6 con hidroxilamina para dar las amidoximas de Fórmula 7 usando condiciones análogas a las descritas en el Esquema 2. El tratamiento de compuestos de Fórmula 7 con anhídrido trifluoroacético, de forma análoga a la transformación representada en el Esquema 1, proporciona compuestos de Fórmula 5. Los nitrilos de Fórmula 6 son conocidos o pueden prepararse fácilmente por un experto en la técnica.

Esquema 7



Se reconoce que algunos reactivos y condiciones de reacción descritos anteriormente para la preparación de los compuestos de Fórmula 1 pueden no ser compatibles con determinadas funcionalidades presentes en los intermedios. En estos casos, la incorporación de secuencias de protección/desprotección o de interconversiones de grupos funcionales en la síntesis ayudará a obtener los productos deseados. El uso y la elección de los grupos protectores serán evidentes para un experto en síntesis química (para referencias, véase, por ejemplo, T. W. Greene y P. G. M. Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2ª ed.; Wiley: Nueva York, 1991). Un experto en la técnica reconocerá que, en algunos casos, después de la introducción de un reactivo determinado tal como se representa en cualquier esquema individual anterior, puede ser necesario realizar etapas de síntesis rutinarias adicionales no descritas en detalle para completar la síntesis de compuestos de Fórmula 1. Un experto en la técnica también reconocerá que puede ser necesario realizar una combinación de las etapas ilustradas en los esquemas anteriores en un orden distinto al implícito en la secuencia particular presentada para preparar los compuestos de Fórmula 1.

Un experto en la técnica también reconocerá que los compuestos de Fórmula 1 y los intermedios descritos en el presente documento pueden someterse a diversas reacciones electrófilas, nucleófilas, radicalarias, organometálicas, de oxidación y de reducción, para añadir sustituyentes o modificar los sustituyentes existentes.

Sin entrar en más detalles, se cree que un experto en la técnica que utilice la descripción anterior puede emplear la presente invención en toda su extensión. Los Ejemplos siguientes, por lo tanto, deben interpretarse como meramente ilustrativos y no limitativos de la divulgación de ninguna forma. Las etapas indicadas en los Ejemplos siguientes ilustran un procedimiento para cada etapa en una transformación de síntesis general y el material de partida para cada etapa puede no haberse preparado necesariamente mediante una ejecución preparativa particular cuyo procedimiento se haya descrito en otros Ejemplos o Etapas. Los porcentajes son en peso, excepto para mezclas de disolventes cromatográficos o cuando se indique lo contrario. Las partes y los porcentajes de las mezclas de disolventes cromatográficos son en volumen, a menos que se indique lo contrario. Los espectros de RMN de ¹H se notifican en ppm campo abajo del tetrametilsilano; los espectros de RMN de ¹⁹F se notifican en ppm utilizando triclorofluorometano como referencia; "s" significa singlete, "d" significa doblete, "m" significa multiplete, "s ancho" significa singlete amplio y "m ancho" significa multiplete amplio.

Los ejemplos 1, 4, 5, 8 y 9 corresponden a compuestos de la invención. Los ejemplos 2, 3, 6 y 7 no.

EJEMPLO 1

Preparación de 3-[4-[(metilsulfonyl)metil]fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol (Compuesto 124)

Etapa A: Preparación de 4-[(metilsulfonyl)metil]benzonitrilo

Se agitó una mezcla de metanosulfonato de sodio (2,55 g, 25 mmol) y 4-(bromometil)benzonitrilo (3,92 g, 20 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (20 ml) a temperatura ambiente durante 16 h y después se añadió a agua helada agitada rápidamente. El precipitado sólido resultante se recogió mediante filtración, se lavó con agua y se secó para proporcionar el compuesto del título como un sólido blanco (3,41 g).

¹H RMN (CDCl₃): δ 2,84 (s, 3H), 4,31 (s, 2H), 7,55 (m, 2H), 7,72 (m, 2H).

Etapa B: Preparación de *N*-hidroxi-4-[(metilsulfonyl)metil]-bencenocarboximidamida

Una mezcla de 4-[(metilsulfonyl)metil]benzonitrilo (es decir, el producto de la Etapa A) (3,30 g, 16,9 mmol) e hidroxilamina (solución acuosa al 50%, 3,0 ml, 48 mmol) en etanol (50 ml) se calentó a 50 °C durante 4 h y después se agitó a temperatura ambiente durante la noche. El precipitado sólido resultante se recogió mediante filtración, se lavó con etanol y se secó para proporcionar el compuesto del título como un sólido blanco (3,50 g).

¹H RMN (DMSO-*d*₆): δ 2,90 (s, 3H), 4,50 (s, 2H), 5,82 (s a, 2H), 7,40 (m, 2H), 7,69 (m, 2H), 9,68 (s, 1H).

Etapa C: Preparación de 3-[4-[(metilsulfonyl)metil]fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol

A una mezcla de *N*-hidroxi-4-[(metilsulfonyl)metil]bencenocarboximidamida (es decir, el producto de la Etapa B) (3,45 g, 15,3 mmol) y piridina (1,5 ml, 18,5 mmol) en tetrahidrofurano (50 ml) a 0 °C se añadió una solución de anhídrido trifluoroacético (2,5 ml, 18 mmol) en tetrahidrofurano (20 ml) gota a gota a lo largo de un periodo de 30 minutos. La mezcla de reacción se calentó a 70 °C durante 3 h, se enfrió a temperatura ambiente y se concentró a presión reducida. El material resultante se diluyó con acetato de etilo, se lavó con agua, solución acuosa de ácido clorhídrico (1 N), solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio, solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a presión reducida hasta obtener un sólido blanco (4,28 g). El sólido se cristalizó en etanol para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco que funde a 138-141 °C.

¹H RMN (CDCl₃) δ 2,83 (s, 3H), 4,34 (s, 2H), 7,60 (m, 2H), 8,19 (m, 2H).

¹⁹F RMN (CDCl₃) δ -65,33.

EJEMPLO 2

5 Preparación de *N*-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencenosulfonamida (Compuesto 40)

Etapa A: Etapa A: Preparación de 4-ciano-*N*-metilbencenosulfonamida

10 A una mezcla de metilamina (2 M en tetrahidrofurano, 70 ml, 140 mmol) a 0 °C se añadió cloruro de 4-cianobencenosulfonilo (10,08 g, 50 mmol) en porciones. La mezcla de reacción se dejó calentar a temperatura ambiente, se agitó durante 2 h y después se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el material resultante se diluyó con acetato de etilo. La mezcla de acetato de etilo se lavó con una solución acuosa de ácido clorhídrico (1 N) y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a presión reducida para proporcionar un sólido amarillo (8,93 g). El sólido se suspendió en dietil éter y se filtró para proporcionar el compuesto del título como un sólido blanco (8,4 g).

15 ¹H RMN (CDCl₃): δ 2,72 (d, 3H), 4,70-4,80 (a m, 1H), 7,84 (m, 2H), 7,99 (m, 2H).

Etapa B: Preparación de *N*-hidroxi-4-[(metilamino)sulfonyl]-bencenocarboximidamida

20 Una mezcla de 4-ciano-*N*-metilbencenosulfonamida (es decir, el producto de la Etapa A) (8,4 g, 42,8 mmol) e hidroxilamina (solución acuosa al 50%, 5,0 ml, 81 mmol) en etanol (50 ml) se agitó a temperatura ambiente durante 16 h. El sólido resultante se filtró, se lavó con etanol y se secó para proporcionar el compuesto del título como un sólido blanco (8,50 g).

25 ¹H RMN (DMSO-*d*₆): δ 2,42 (d, 3H), 5,95 (s a, 2H), 7,48 (s a, 1H), 7,76 (m, 2H), 7,87 (m, 2H), 9,91 (s, 1H).

Etapa C: Preparación de *N*-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]bencenosulfonamida

30 A la mezcla de *N*-hidroxi-4-[(metilamino)sulfonyl]bencenocarboximidamida (es decir, el producto de la Etapa B) (8,5 g, 37 mmol) y piridina (3,6 ml, 44 mmol) en tetrahidrofurano (50 ml) a 0 °C se añadió anhídrido trifluoroacético (6,1 ml, 44 mmol) en tetrahidrofurano (20 ml) gota a gota a lo largo de un periodo de 30 minutos. La mezcla de reacción se calentó a 70 °C durante 3 h, se enfrió a temperatura ambiente y se concentró a presión reducida. El material resultante se diluyó con acetato de etilo, se lavó con agua, solución acuosa de ácido clorhídrico (1 N), solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio, solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a presión reducida hasta obtener un sólido blanco (10,35 g). El sólido se cristalizó en etanol para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco que funde a 139-141 °C. ¹H RMN (CDCl₃) δ 2,74 (d, 3H), 4,65-4,72 (s a, 1H), 8,04 (m, 2H), 8,30 (m, 2H).

40 ¹⁹F RMN (CDCl₃) δ -65,30.

EJEMPLO 3

45 Preparación de 3-[4-(metiltio)fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol (Compuesto 116)

Etapa A: Preparación de *N*-hidroxi-4-(metiltio)bencenocarboximidamida

50 Una mezcla de 4-(metiltio)benzocnitrilo (6,0 g, 40 mmol) e hidroxilamina (solución acuosa al 50%, 5,0 ml, 81 mmol) en etanol (100 ml) se agitó a temperatura ambiente durante 16 h. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y el material resultante se diluyó con acetonitrilo (50 ml) y se concentró a presión reducida (2x) para proporcionar el compuesto del título como un sólido blanco (7,38 g).

¹H RMN (DMSO-*d*₆): δ 2,48 (s, 3H), 5,77 (s a, 2H), 7,24 (m, 2H), 7,61 (m, 2H), 9,58 (s, 1H).

Etapa B: Preparación de 3-[4-(metiltio)fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol

60 A una mezcla de *N*-hidroxi-4-(metiltio)bencenocarboximidamida (es decir, el producto de la Etapa A) (7,3 g, 40 mmol) y piridina (3,9 ml, 48 mmol) en tetrahidrofurano (50 ml) a 0 °C se añadió anhídrido trifluoroacético (6,7 ml, 48 mmol) en tetrahidrofurano (20 ml) gota a gota a lo largo de un periodo de 15 minutos. La mezcla de reacción se calentó a 70 °C durante 3 h, se enfrió a temperatura ambiente y se concentró a presión reducida. El material resultante se diluyó con dietil éter, se lavó con agua, solución acuosa de ácido clorhídrico (1 N), solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio, solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a presión reducida para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco (9,71 g).

65 ¹H RMN (CDCl₃) δ 2,54 (s, 3H), 7,32 (m, 2H), 8,00 (m, 2H).

¹⁹F RMN (CDCl₃) δ -65,37.

EJEMPLO 4

Preparación de 3-[4-(metilsulfinil)fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol (Compuesto 118)

A una mezcla de 3-[4-(metiltio)fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol (es decir, el producto del Ejemplo 3) (3,90 g, 15 mmol) en diclorometano (50 ml) a 0 °C se añadió ácido *m*-cloroperbenzoico (77% en ensayo, 3,37 g, 15 mmol). La mezcla de reacción se dejó calentar lentamente hasta temperatura ambiente y se agitó durante la noche. A la mezcla de reacción se añadió una solución acuosa de metabisulfito de sodio (1 M, 10 ml). La mezcla de reacción se agitó vigorosamente durante 15 minutos y después se añadió una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se continuó con la agitación durante 30 minutos. La capa orgánica se separó, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a presión reducida para proporcionar un sólido blanco (4,35 g). El sólido se cristalizó en etanol para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco que funde a 110-112 °C.

¹H RMN (CDCl₃) δ 2,79 (s, 3H), 7,81 (m, 2H), 8,30 (m, 2H).

¹⁹F RMN (CDCl₃) δ -65,30.

EJEMPLO 5

Preparación de 3-[4-(metilsulfonyl)fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol (Compuesto 117)

A una mezcla de 3-[4-(metiltio)fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol (es decir, el producto del Ejemplo 3) (3,90 g, 15 mmol) en diclorometano (100 ml) a 0 °C se añadió ácido *m*-cloroperbenzoico (77% en ensayo, 6,72 g, 30 mmol). La mezcla de reacción se dejó calentar lentamente a temperatura ambiente y se agitó durante la noche. A la mezcla de reacción se añadió una solución acuosa de metabisulfito de sodio (1 M, 10 ml). La mezcla de reacción se agitó vigorosamente durante 15 minutos y después se añadió una solución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y se continuó con la agitación durante 30 minutos. La capa orgánica se separó, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a presión reducida para proporcionar un sólido blanco (4,37 g). El sólido se cristalizó en *i*-propanol para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco que funde a 152-154 °C.

¹H RMN (CDCl₃) δ 3,12 (s, 3H), 8,11 (m, 2H), 8,37 (m, 2H).

¹⁹F RMN (CDCl₃) δ -65,26.

EJEMPLO 6

Preparación de *N*-[metil[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]-λ⁴-sulfaniliden]cianamida (Compuesto 80)

Una mezcla de 3-[4-(metiltio)fenil]-5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol (es decir, el producto del Ejemplo 3) (1,04 g, 4 mmol), cianamida (218 mg, 5,2 mmol), terc-butóxido de potasio (538 mg, 4,8 mmol) y *N*-bromosuccinamida (1,07 g, 6,0 mmol) en metanol (20 ml) se agitó a temperatura ambiente durante 2 h y después se concentró a presión reducida. El material resultante se purificó mediante cromatografía líquida de media presión en gel de sílice (eluyendo con acetato de etilo) para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un aceite incoloro (820 mg).

¹H RMN (CDCl₃) δ 3,10 (s, 3H), 7,99 (m, 2H), 8,38 (m, 2H).

¹⁹F RMN (CDCl₃) δ -65,26.

EJEMPLO 7

Preparación de *N*-[metiloxido[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]-λ⁴-sulfaniliden]cianamida (Compuesto 87)

Una mezcla de *N*-[metil[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]-λ⁴-sulfaniliden]cianamida (es decir, el producto del Ejemplo 6) (600 mg, 2 mmol) y ácido *m*-cloroperbenzoico (77% en ensayo, 678 mg, 3 mmol) en diclorometano (20 ml) se agitó a temperatura ambiente durante la noche. A la mezcla de reacción se añadió una solución acuosa de metabisulfito de sodio (10%, 10 ml) y una solución acuosa de hidróxido de sodio (1 N). La mezcla de reacción se agitó vigorosamente durante 15 minutos y después la capa orgánica se separó, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a presión reducida. El material resultante se purificó mediante cromatografía líquida de media presión

en gel de sílice (eluyendo con un gradiente del 0 al 100% de acetato de etilo en hexanos) para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco (50 mg).

¹H RMN (CDCl₃) δ 3,41 (s, 3H), 8,19 (m, 2H), 8,45 (m, 2H).

¹⁹F RMN (CDCl₃) δ -65,19.

EJEMPLO 8

Preparación de metanosulfonato de 4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenilo (Compuesto 108)

A una mezcla de 4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenol (290 mg, 1,26 mmol) y trimetilamina (0,25 ml, 1,8 mmol) en diclorometano (20 ml) se añadió cloruro de metanosulfonilo (0,10 ml, 1,29 mmol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante tres días y después se diluyó con diclorometano, se lavó con una solución acuosa de ácido cítrico, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a presión reducida. El material resultante se purificó mediante cromatografía líquida de media presión en gel de sílice (eluyendo con un gradiente del 0 al 30% de acetato de etilo en hexanos) para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanco (220 mg).

¹H RMN (CDCl₃): δ 3,22 (s, 3H), 7,48 (m, 2H), 8,20 (m, 2H).

¹⁹F RMN (CDCl₃): δ -65,33.

EJEMPLO 9

Preparación de N-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]fenil]metanosulfonamida (Compuesto 26)

A una mezcla de 4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]anilina (229 mg, 1,3 mmol) en piridina (5 ml) se añadió cloruro de metanosulfonilo (0,50 ml, 6,5 mmol). La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante la noche y después se vertió en ácido clorhídrico acuoso frío (2 M) y se extrajo con acetato de etilo. El extracto se lavó con una solución acuosa de ácido clorhídrico (1 M) y una solución acuosa saturada de cloruro de sodio, se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a presión reducida. El material resultante se purificó mediante cromatografía líquida de media presión en gel de sílice (eluyendo con un gradiente del 0 al 50% de acetato de etilo en hexanos) para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido blanquecino (260 mg).

¹H RMN (CDCl₃): δ 3,13 (s, 3H), 6,99 (s a, 1H), 7,34 (m, 2H), 8,21 (m, 2H).

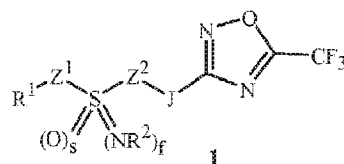
¹⁹F RMN (CDCl₃): δ -65,35.

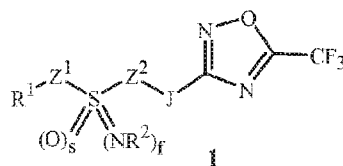
Mediante los procedimientos descritos en el presente documento, junto con procedimientos conocidos en la técnica, se pueden preparar los siguientes compuestos de las Tablas 1A a 392A. En las tablas se usan las abreviaturas siguientes: *t* significa terciario, *s* significa secundario, *n* significa normal, *i* significa iso, *c* significa ciclo, Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa propilo, *i*-Pr significa isopropilo, *c*-Pr significa ciclopropilo, Bu significa butilo, *c*-Bu significa ciclobutilo, CN significa ciano y Ph significa fenilo.

Tabla 1A

Z ² es CH ₂ y J es J-63.					Z ² es CH ₂ y J es J-63.				
R ¹	Z ¹	s	f	R ²	R ¹	Z ¹	s	f	R ²
Me	enlace	0	0	-	Cl ₃ C	enlace	0	1	Me
Et	enlace	0	0	-	N≡CCH ₂	enlace	0	1	Me
<i>n</i> -Pr	enlace	0	0	-	N≡CCH ₂ CH ₂	enlace	0	1	Me
<i>i</i> -Pr	enlace	0	0	-	MeOCH ₂ CH ₂	enlace	0	1	Me

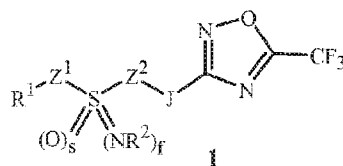
La definición de J en la tabla siguiente se muestra en el Anexo B anterior. Los sustituyentes R^{7a} y R⁸ unidos a J son hidrógeno a menos que se indique lo contrario.





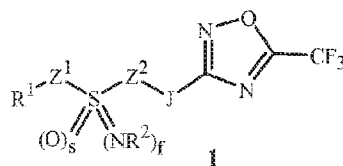
La definición de J en la tabla siguiente se muestra en el Anexo B anterior. Los sustituyentes R^{7a} y R⁸ unidos a J son hidrógeno a menos que se indique lo contrario.

Z ² es CH ₂ y J es J-63.					Z ² es CH ₂ y J es J-63.				
R ¹	Z ¹	s	f	R ²	R ¹	Z ¹	s	f	R ²
<i>c</i> -Pr	enlace	0	0	-	MeOCOCH ₂	enlace	0	1	Me
<i>n</i> -Bu	enlace	0	0	-	MeNHCOCH ₂	enlace	0	1	Me
<i>i</i> -Bu	enlace	0	0	-	Me ₂ NCOCH ₂	enlace	0	1	Me
<i>t</i> -Bu	enlace	0	0	-	Ph	enlace	0	1	Me
<i>c</i> -Bu	enlace	0	0	-	2-Cl-Ph	enlace	0	1	Me
<i>c</i> -pentilo	enlace	0	0	-	4-Cl-Ph	enlace	0	1	Me
<i>c</i> -hexilo	enlace	0	0	-	Bn	enlace	0	1	Me
ClCH ₂	enlace	0	0	-	Ph-CH ₂ CH ₂	enlace	0	1	Me
ClCH ₂ CH ₂	enlace	0	0	-	2-tienilo	enlace	0	1	Me
Cl ₂ CH	enlace	0	0	-	3-tienilo	enlace	0	1	Me
Cl ₃ C	enlace	0	0	-	2-furanilo	enlace	0	1	Me
N≡CCH ₂	enlace	0	0	-	3-furanilo	enlace	0	1	Me
N≡CCH ₂ CH ₂	enlace	0	0	-	2-piridinilo	enlace	0	1	Me
MeOCH ₂ CH ₂	enlace	0	0	-	Me	enlace	0	1	CN
MeOCOCH ₂	enlace	0	0	-	Et	enlace	0	1	CN
MeNHCOCH ₂	enlace	0	0	-	<i>n</i> -Pr	enlace	0	1	CN
Me ₂ NCOCH ₂	enlace	0	0	-	<i>i</i> -Pr	enlace	0	1	CN
Ph	enlace	0	0	-	<i>c</i> -Pr	enlace	0	1	CN
2-Cl-Ph	enlace	0	0	-	<i>n</i> -Bu	enlace	0	1	CN
4-Cl-Ph	enlace	0	0	-	<i>i</i> -Bu	enlace	0	1	CN
Bn	enlace	0	0	-	<i>t</i> -Bu	enlace	0	1	CN
Ph-CH ₂ CH ₂	enlace	0	0	-	<i>c</i> -Bu	enlace	0	1	CN
2-tienilo	enlace	0	0	-	<i>c</i> -pentilo	enlace	0	1	CN
3-tienilo	enlace	0	0	-	<i>c</i> -hexilo	enlace	0	1	CN
2-furanilo	enlace	0	0	-	ClCH ₂	enlace	0	1	CN
3-furanilo	enlace	0	0	-	ClCH ₂ CH ₂	enlace	0	1	CN
2-piridinilo	enlace	0	0	-	Cl ₂ CH	enlace	0	1	CN
Me	enlace	1	0	-	Cl ₃ C	enlace	0	1	CN
Et	enlace	1	0	-	NCCH ₂	enlace	0	1	CN
<i>n</i> -Pr	enlace	1	0	-	NCCH ₂ CH ₂	enlace	0	1	CN
<i>i</i> -Pr	enlace	1	0	-	MeOCH ₂ CH ₂	enlace	0	1	CN
<i>c</i> -Pr	enlace	1	0	-	MeOCOCH ₂	enlace	0	1	CN
<i>n</i> -Bu	enlace	1	0	-	MeNHCOCH ₂	enlace	0	1	CN



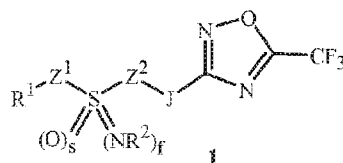
La definición de J en la tabla siguiente se muestra en el Anexo B anterior. Los sustituyentes R^{7a} y R⁸ unidos a J son hidrógeno a menos que se indique lo contrario.

Z ² es CH ₂ y J es J-63.					Z ² es CH ₂ y J es J-63.				
R ¹	Z ¹	s	f	R ²	R ¹	Z ¹	s	f	R ²
i-Bu	enlace	1	0	-	Me ₂ NCOCH ₂	enlace	0	1	CN
t-Bu	enlace	1	0	-	Ph	enlace	0	1	CN
c-Bu	enlace	1	0	-	2-Cl-Ph	enlace	0	1	CN
c-pentilo	enlace	1	0	-	4-Cl-Ph	enlace	0	1	CN
c-hexilo	enlace	1	0	-	Bn	enlace	0	1	CN
ClCH ₂	enlace	1	0	-	Ph-CH ₂ CH ₂	enlace	0	1	CN
ClCH ₂ CH ₂	enlace	1	0	-	2-tienilo	enlace	0	1	CN
Cl ₂ CH	enlace	1	0	-	3-tienilo	enlace	0	1	CN
Cl ₃ C	enlace	1	0	-	2-furanilo	enlace	0	1	CN
N≡CCH ₂	enlace	1	0	-	3-furanilo	enlace	0	1	CN
N≡CCH ₂ CH ₂	enlace	1	0	-	2-piridinilo	enlace	0	1	CN
MeOCH ₂ CH ₂	enlace	1	0	-	Me	enlace	1	1	H
MeOCOCH ₂	enlace	1	0	-	Et	enlace	1	1	H
MeNHCOCH ₂	enlace	1	0	-	n-Pr	enlace	1	1	H
Me ₂ NCOCH ₂	enlace	1	0	-	i-Pr	enlace	1	1	H
Ph	enlace	1	0	-	c-Pr	enlace	1	1	H
2-Cl-Ph	enlace	1	0	-	n-Bu	enlace	1	1	H
4-Cl-Ph	enlace	1	0	-	i-Bu	enlace	1	1	H
Bn	enlace	1	0	-	t-Bu	enlace	1	1	H
Ph-CH ₂ CH ₂	enlace	1	0	-	c-Bu	enlace	1	1	H
2-tienilo	enlace	1	0	-	c-pentilo	enlace	1	1	H
3-tienilo	enlace	1	0	-	c-hexilo	enlace	1	1	H
2-furanilo	enlace	1	0	-	ClCH ₂	enlace	1	1	H
3-furanilo	enlace	1	0	-	ClCH ₂ CH ₂	enlace	1	1	H
2-piridinilo	enlace	1	0	-	Cl ₂ CH	enlace	1	1	H
Me	enlace	2	0	-	Cl ₃ C	enlace	1	1	H
Et	enlace	2	0	-	N≡CCH ₂	enlace	1	1	H
n-Pr	enlace	2	0	-	N≡CCH ₂ CH ₂	enlace	1	1	H
i-Pr	enlace	2	0	-	MeOCH ₂ CH ₂	enlace	1	1	H
c-Pr	enlace	2	0	-	MeOCOCH ₂	enlace	1	1	H
n-Bu	enlace	2	0	-	MeNHCOCH ₂	enlace	1	1	H
i-Bu	enlace	2	0	-	Me ₂ NCOCH ₂	enlace	1	1	H
t-Bu	enlace	2	0	-	Ph	enlace	1	1	H



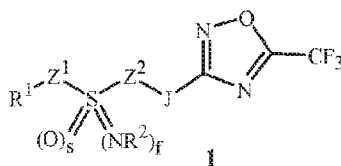
La definición de J en la tabla siguiente se muestra en el Anexo B anterior. Los sustituyentes R^{7a} y R⁸ unidos a J son hidrógeno a menos que se indique lo contrario.

Z ² es CH ₂ y J es J-63.					Z ² es CH ₂ y J es J-63.				
R ¹	Z ¹	s	f	R ²	R ¹	Z ¹	s	f	R ²
c-Bu	enlace	2	0	-	2-Cl-Ph	enlace	1	1	H
c-pentilo	enlace	2	0	-	4-Cl-Ph	enlace	1	1	H
c-hexilo	enlace	2	0	-	Bn	enlace	1	1	H
ClCH ₂	enlace	2	0	-	Ph-CH ₂ CH ₂	enlace	1	1	H
ClCH ₂ CH ₂	enlace	2	0	-	2-tienilo	enlace	1	1	H
Cl ₂ CH	enlace	2	0	-	3-tienilo	enlace	1	1	H
Cl ₃ C	enlace	2	0	-	2-furanilo	enlace	1	1	H
N≡CCH ₂	enlace	2	0	-	3-furanilo	enlace	1	1	H
N≡CCH ₂ CH ₂	enlace	2	0	-	2-piridinilo	enlace	1	1	H
MeOCH ₂ CH ₂	enlace	2	0	-	Me	enlace	1	1	Me
MeOCOCH ₂	enlace	2	0	-	Et	enlace	1	1	Me
MeNHCOCH ₂	enlace	2	0	-	n-Pr	enlace	1	1	Me
Me ₂ NCOCH ₂	enlace	2	0	-	i-Pr	enlace	1	1	Me
Ph	enlace	2	0	-	c-Pr	enlace	1	1	Me
2-Cl-Ph	enlace	2	0	-	n-Bu	enlace	1	1	Me
4-Cl-Ph	enlace	2	0	-	i-Bu	enlace	1	1	Me
Bn	enlace	2	0	-	t-Bu	enlace	1	1	Me
Ph-CH ₂ CH ₂	enlace	2	0	-	c-Bu	enlace	1	1	Me
Z ² es CH ₂ y J es J-63.					Z ² es CH ₂ y J es J-63.				
R ¹	Z ¹	s	f	R ²	R ¹	Z ¹	s	f	R ²
2-tienilo	enlace	2	0	-	c-pentilo	enlace	1	1	Me
3-tienilo	enlace	2	0	-	c-hexilo	enlace	1	1	Me
2-furanilo	enlace	2	0	-	ClCH ₂	enlace	1	1	Me
3-furanilo	enlace	2	0	-	ClCH ₂ CH ₂	enlace	1	1	Me
2-piridinilo	enlace	2	0	-	Cl ₂ CH	enlace	1	1	Me
Me	enlace	0	1	H	Cl ₃ C	enlace	1	1	Me
Et	enlace	0	1	H	N≡CCH ₂	enlace	1	1	Me
n-Pr	enlace	0	1	H	N≡CCH ₂ CH ₂	enlace	1	1	Me
i-Pr	enlace	0	1	H	MeOCH ₂ CH ₂	enlace	1	1	Me
c-Pr	enlace	0	1	H	MeOCOCH ₂	enlace	1	1	Me
n-Bu	enlace	0	1	H	MeNHCOCH ₂	enlace	1	1	Me
i-Bu	enlace	0	1	H	Me ₂ NCOCH ₂	enlace	1	1	Me
t-Bu	enlace	0	1	H	Ph	enlace	1	1	Me



La definición de J en la tabla siguiente se muestra en el Anexo B anterior. Los sustituyentes R^{7a} y R⁸ unidos a J son hidrógeno a menos que se indique lo contrario.

Z ² es CH ₂ y J es J-63.					Z ² es CH ₂ y J es J-63.				
R ¹	Z ¹	s	f	R ²	R ¹	Z ¹	s	f	R ²
c-Bu	enlace	0	1	H	2-Cl-fenilo	enlace	1	1	Me
c-pentilo	enlace	0	1	H	4-Cl-Ph	enlace	1	1	Me
c-hexilo	enlace	0	1	H	Bn	enlace	1	1	Me
ClCH ₂	enlace	0	1	H	Ph-CH ₂ CH ₂	enlace	1	1	Me
ClCH ₂ CH ₂	enlace	0	1	H	2-tienilo	enlace	1	1	Me
Cl ₂ CH	enlace	0	1	H	3-tienilo	enlace	1	1	Me
Cl ₃ C	enlace	0	1	H	2-furanilo	enlace	1	1	Me
NCCH ₂	enlace	0	1	H	3-furanilo	enlace	1	1	Me
NCCH ₂ CH ₂	enlace	0	1	H	2-piridinilo	enlace	1	1	Me
MeOCH ₂ CH ₂	enlace	0	1	H	Me	enlace	1	1	CN
MeOCOCH ₂	enlace	0	1	H	Et	enlace	1	1	CN
MeNHCOCH ₂	enlace	0	1	H	n-Pr	enlace	1	1	CN
Me ₂ NCOCH ₂	enlace	0	1	H	i-Pr	enlace	1	1	CN
Ph	enlace	0	1	H	c-Pr	enlace	1	1	CN
2-Cl-Ph	enlace	0	1	H	n-Bu	enlace	1	1	CN
4-Cl-Ph	enlace	0	1	H	i-Bu	enlace	1	1	CN
Bn	enlace	0	1	H	t-Bu	enlace	1	1	CN
Ph-CH ₂ CH ₂	enlace	0	1	H	c-Bu	enlace	1	1	CN
2-tienilo	enlace	0	1	H	c-pentilo	enlace	1	1	CN
3-tienilo	enlace	0	1	H	c-hexilo	enlace	1	1	CN
2-furanilo	enlace	0	1	H	ClCH ₂	enlace	1	1	CN
3-furanilo	enlace	0	1	H	ClCH ₂ CH ₂	enlace	1	1	CN
2-piridinilo	enlace	0	1	H	Cl ₂ CH	enlace	1	1	CN
Me	enlace	0	1	Me	Cl ₃ C	enlace	1	1	CN
Et	enlace	0	1	Me	NCCH ₂	enlace	1	1	CN
n-Pr	enlace	0	1	Me	NCCH ₂ CH ₂	enlace	1	1	CN
i-Pr	enlace	0	1	Me	MeOCH ₂ CH ₂	enlace	1	1	CN
c-Pr	enlace	0	1	Me	MeOCOCH ₂	enlace	1	1	CN
n-Bu	enlace	0	1	Me	MeNHCOCH ₂	enlace	1	1	CN
i-Bu	enlace	0	1	Me	Me ₂ NCOCH ₂	enlace	1	1	CN
t-Bu	enlace	0	1	Me	Ph	enlace	1	1	CN
c-Bu	enlace	0	1	Me	2-Cl-Ph	enlace	1	1	CN
c-pentilo	enlace	0	1	Me	4-Cl-Ph	enlace	1	1	CN



La definición de J en la tabla siguiente se muestra en el Anexo B anterior. Los sustituyentes R^{7a} y R⁸ unidos a J son hidrógeno a menos que se indique lo contrario.

Z ² es CH ₂ y J es J-63.					Z ² es CH ₂ y J es J-63.				
R ¹	Z ¹	s	f	R ²	R ¹	Z ¹	s	f	R ²
c-hexilo	enlace	0	1	Me	Bn	enlace	1	1	CN
ClCH ₂	enlace	0	1	Me	Ph-CH ₂ CH ₂	enlace	1	1	CN
ClCH ₂ CH ₂	enlace	0	1	Me	2-tienilo	enlace	1	1	CN
Cl ₂ CH	enlace	0	1	Me	3-tienilo	enlace	1	1	CN

5 La presente divulgación también incluye las Tablas 2A a 392A, cada una de las cuales está construida de la misma manera que la Tabla 1A anterior, excepto que el encabezado de fila en la Tabla 1A (es decir, "Z² es CH₂ y J es J-63") se reemplaza con el encabezado de fila respectivo que se muestra a continuación. Por ejemplo, en la Tabla 2A el encabezado de fila es "Z² es CH₂ y J es J-1", y R¹, z¹ s, f y R² son tal como se definen en la Tabla 1A anterior.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
2A	Z ² es CH ₂ y J es J-1.	198A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-11.
3A	Z ² es CH ₂ y J es J-2.	199A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-12 y R ^{8a} es Me.
4A	Z ² es CH ₂ , J es J-3 y R ^{8a} es Me.	200A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-13 y R ^{8a} es Me.
5A	Z ² es CH ₂ y J es J-4.	201A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-14.
6A	Z ² es CH ₂ y J es J-5.	202A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-15.
7A	Z ² es CH ₂ , J es J-6 y R ^{8a} es Me.	203A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-16 y R ^{8a} es Me.
8A	Z ² es CH ₂ y J es J-7.	204A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-17.
9A	Z ² es CH ₂ y J es J-8.	205A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-18.
10A	Z ² es CH ₂ , J es J-9 y R ^{8a} es Me.	206A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-19 y R ^{8a} es Me.
11A	Z ² es CH ₂ y J es J-10.	207A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-20.
12A	Z ² es CH ₂ y J es J-11.	208A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-21.
13A	Z ² es CH ₂ , J es J-12 y R ^{8a} es Me.	209A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-22 y R ^{8a} es Me.
14A	Z ² es CH ₂ , J es J-13 y R ^{8a} es Me.	210A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-23.
15A	Z ² es CH ₂ y J es J-14.	211A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-24.
16A	Z ² es CH ₂ y J es J-15.	212A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-25.
17A	Z ² es CH ₂ , J es J-16 y R ^{8a} es Me.	213A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-26.
18A	Z ² es CH ₂ y J es J-17.	214A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-27.
19A	Z ² es CH ₂ y J es J-18.	215A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-28.
20A	Z ² es CH ₂ , J es J-19 y R ^{8a} es Me.	216A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-29.
21A	Z ² es CH ₂ y J es J-20.	217A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-30.
22A	Z ² es CH ₂ y J es J-21.	218A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-31.
23A	Z ² es CH ₂ , J es J-22 y R ^{8a} es Me.	219A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-32.
24A	Z ² es CH ₂ y J es J-23.	220A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-33.
25A	Z ² es CH ₂ y J es J-24.	221A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-34.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
26A	Z ² es CH ₂ y J es J-25.	222A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-35.
27A	Z ² es CH ₂ y J es J-26.	223A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-36.
28A	Z ² es CH ₂ y J es J-27.	224A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-37.
29A	Z ² es CH ₂ y J es J-28.	225A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-38.
30A	Z ² es CH ₂ y J es J-29.	226A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-39 y R ^{8a} es Me.
31A	Z ² es CH ₂ y J es J-30.	227A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-40.
32A	Z ² es CH ₂ y J es J-31.	228A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-41.
33A	Z ² es CH ₂ y J es J-32.	229A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-42 y R ^{8a} es Me.
34A	Z ² es CH ₂ y J es J-33.	230A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-43 y R ^{8a} es Me.
35A	Z ² es CH ₂ y J es J-34.	231A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-44.
36A	Z ² es CH ₂ y J es J-35.	232A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-45.
37A	Z ² es CH ₂ y J es J-36.	233A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-46.
38A	Z ² es CH ₂ y J es J-37.	234A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-47.
39A	Z ² es CH ₂ y J es J-38.	235A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-48 y R ^{8a} es Me.
40A	Z ² es CH ₂ , J es J-39 y R ^{8a} es Me.	236A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-49.
41A	Z ² es CH ₂ y J es J-40.	237A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-50.
42A	Z ² es CH ₂ y J es J-41.	238A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-51 y R ^{8a} es Me.
43A	Z ² es CH ₂ , J es J-42 y R ^{8a} es Me.	239A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-52.
44A	Z ² es CH ₂ , J es J-43 y R ^{8a} es Me.	240A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-53.
45A	Z ² es CH ₂ y J es J-44.	241A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-54 y R ^{8a} es Me.
46A	Z ² es CH ₂ y J es J-45.	242A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-55.
47A	Z ² es CH ₂ y J es J-46.	243A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-56.
48A	Z ² es CH ₂ y J es J-47.	244A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-57.
49A	Z ² es CH ₂ , J es J-48 y R ^{8a} es Me.	245A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-58 y R ^{8a} es Me.
50A	Z ² es CH ₂ y J es J-49.	246A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-59 y R ^{8a} es Me.
51A	Z ² es CH ₂ y J es J-50.	247A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-60.
52A	Z ² es CH ₂ , J es J-51 y R ^{8a} es Me.	248A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-61.
53A	Z ² es CH ₂ y J es J-52.	249A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-62.
54A	Z ² es CH ₂ y J es J-53.	250A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 2-F
55A	Z ² es CH ₂ , J es J-54 y R ^{8a} es Me.	251A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-64.
56A	Z ² es CH ₂ y J es J-55.	252A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-65.
57A	Z ² es CH ₂ y J es J-56.	253A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-66.
58A	Z ² es CH ₂ J-57.	254A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-67.
59A	Z ² es CH ₂ , J es J-58 y R ^{8a} es Me.	255A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-68.
60A	Z ² es CH ₂ , J es J-59 y R ^{8a} es Me.	256A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-69.
61A	Z ² es CH ₂ y J es J-60.	257A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-70.
62A	Z ² es CH ₂ y J es J-61.	258A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-71.
63A	Z ² es CH ₂ y J es J-62.	259A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-72.
64A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 2-F.	260A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-73.
65A	Z ² es CH ₂ y J es J-64.	261A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-74.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
66A	Z ² es CH ₂ y J es J-65.	262A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-75.
67A	Z ² es CH ₂ y J es J-66.	263A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-76.
68A	Z ² es CH ₂ y J es J-67.	264A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-77.
69A	Z ² es CH ₂ y J es J-68.	265A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-78.
70A	Z ² es CH ₂ y J es J-69.	266A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-79.
71A	Z ² es CH ₂ y J es J-70.	267A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-80.
72A	Z ² es CH ₂ y J es J-71.	268A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-81.
73A	Z ² es CH ₂ y J es J-72.	269A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-82.
74A	Z ² es CH ₂ y J es J-73.	270A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-83.
75A	Z ² es CH ₂ y J es J-74.	271A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-84.
76A	Z ² es CH ₂ y J es J-75.	272A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-85.
77A	Z ² es CH ₂ y J es J-76.	273A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-86.
78A	Z ² es CH ₂ y J es J-77.	274A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-87.
79A	Z ² es CH ₂ y J es J-78.	275A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-88.
80A	Z ² es CH ₂ y J es J-79.	276A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-89.
81A	Z ² es CH ₂ y J es J-80.	277A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-90.
82A	Z ² es CH ₂ y J es J-81.	278A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-91.
83A	Z ² es CH ₂ y J es J-82.	279A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-92.
84A	Z ² es CH ₂ y J es J-83.	280A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH(Ph) y J es J-63.
85A	Z ² es CH ₂ y J es J-84.	281A	Z ² es un enlace y J es J-1.
86A	Z ² es CH ₂ y J es J-85.	282A	Z ² es un enlace y J es J-2.
87A	Z ² es CH ₂ y J es J-86.	283A	Z ² es un enlace, J es J-3 y R ^{8a} es Me.
88A	Z ² es CH ₂ y J es J-87.	284A	Z ² es un enlace y J es J-4.
89A	Z ² es CH ₂ y J es J-88.	285A	Z ² es un enlace y J es J-5.
90A	Z ² es CH ₂ y J es J-89.	286A	Z ² es un enlace, J es J-6 y R ^{8a} es Me.
91A	Z ² es CH ₂ y J es J-90.	287A	Z ² es un enlace y J es J-7.
92A	Z ² es CH ₂ y J es J-91.	288A	Z ² es un enlace y J es J-8.
93A	Z ² es CH ₂ y J es J-92.	289A	Z ² es un enlace, J es J-9 y R ^{8a} es Me.
94A	Z ² es CH(Ph) y J es J-63.	290A	Z ² es un enlace y J es J-10.
95A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-1.	291A	Z ² es un enlace y J es J-1 1.
96A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-2.	292A	Z ² es un enlace, J es J-12 y R ^{8a} es Me.
97A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-3 y R ^{8a} es Me.	293A	Z ² es un enlace, J es J-13 y R ^{8a} es Me.
98A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-4.	294A	Z ² es un enlace y J es J-14.
99A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-5.	295A	Z ² es un enlace y J es J-15.
100A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-6 y R ^{8a} es Me.	296A	Z ² es un enlace, J es J-16 y R ^{8a} es Me.
101A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-7.	297A	Z ² es un enlace y J es J-17.
102A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-8.	298A	Z ² es un enlace y J es J-18.
103A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-9 y R ^{8a} es Me.	299A	Z ² es un enlace, J es J-19 y R ^{8a} es Me.
104A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-10.	300A	Z ² es un enlace y J es J-20.
105A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-11.	301A	Z ² es un enlace y J es J-21.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
106A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-12 y R ^{8a} es Me.	302A	Z ² es un enlace, J es J-22 y R ^{8a} es Me.
107A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-13 y R ^{8a} es Me.	303A	Z ² es un enlace y J es J-23.
108A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-14.	304A	Z ² es un enlace y J es J-24.
109A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-15.	305A	Z ² es un enlace y J es J-31.
110A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-16 y R ^{8a} es Me.	306A	Z ² es un enlace y J es J-32.
111A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-17.	307A	Z ² es un enlace y J es J-33.
112A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-18.	308A	Z ² es un enlace y J es J-34.
113A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-19 y R ^{8a} es Me.	309A	Z ² es un enlace y J es J-35.
114A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-20.	310A	Z ² es un enlace y J es J-37.
115A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-21.	311A	Z ² es un enlace y J es J-38.
116A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-22 y R ^{8a} es Me.	312A	Z ² es un enlace, J es J-39 y R ^{8a} es Me.
117A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-23.	313A	Z ² es un enlace y J es J-40.
118A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-24.	314A	Z ² es un enlace y J es J-41.
119A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-25.	315A	Z ² es un enlace, J es J-42 y R ^{8a} es Me.
120A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-26.	316A	Z ² es un enlace, J es J-43 y R ^{8a} es Me.
121A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-27.	317A	Z ² es un enlace y J es J-44.
122A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-28.	318A	Z ² es un enlace y J es J-45.
123A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-29.	319A	Z ² es un enlace y J es J-46.
124A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-30.	320A	Z ² es un enlace y J es J-47.
125A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-31.	321A	Z ² es un enlace, J es J-48 y R ^{8a} es Me.
126A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-32.	322A	Z ² es un enlace y J es J-49.
127A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-33.	323A	Z ² es un enlace y J es J-50.
128A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-34.	324A	Z ² es un enlace, J es J-51 y R ^{8a} es Me.
129A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-35.	325A	Z ² es un enlace y J es J-52.
130A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-36.	326A	Z ² es un enlace y J es J-53.
131A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-37.	327A	Z ² es un enlace, J es J-54 y R ^{8a} es Me.
132A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-38.	328A	Z ² es un enlace y J es J-55.
133A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-39 y R ^{8a} es Me.	329A	Z ² es un enlace y J es J-56.
134A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-40.	330A	Z ² es un enlace y J es J-57.
135A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-41.	331A	Z ² es un enlace, J es J-58 y R ^{8a} es Me.
136A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-42 y R ^{8a} es Me.	332A	Z ² es un enlace, J es J-59 y R ^{8a} es Me.
137A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-43 y R ^{8a} es Me.	333A	Z ² es un enlace y J es J-60.
138A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-44.	334A	Z ² es un enlace y J es J-61.
139A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-45.	335A	Z ² es un enlace y J es J-62.
140A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-46.	336A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 2-F.
141A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-47.	337A	Z ² es un enlace y J es J-64.
142A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-48 y R ^{8a} es Me.	338A	Z ² es un enlace y J es J-65.
143A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-49.	339A	Z ² es un enlace y J es J-66.
144A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-50.	340A	Z ² es un enlace y J es J-67.
145A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-51 y R ^{8a} es Me.	341A	Z ² es un enlace y J es J-68.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
146A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-52.	342A	Z ² es un enlace y J es J-69.
147A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-53.	343A	Z ² es un enlace y J es J-70.
148A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-54 y R ^{8a} es Me.	344A	Z ² es un enlace y J es J-71.
149A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-55.	345A	Z ² es un enlace y J es J-72.
150A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-56.	346A	Z ² es un enlace y J es J-74.
151A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-57.	347A	Z ² es un enlace y J es J-76.
152A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-58 y R ^{8a} es Me.	348A	Z ² es un enlace y J es J-77.
153A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-59 y R ^{8a} es Me.	349A	Z ² es un enlace y J es J-78.
154A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-60.	350A	Z ² es un enlace y J es J-79.
155A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-61.	351A	Z ² es un enlace y J es J-80.
156A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-62.	352A	Z ² es un enlace y J es J-81.
157A	Z ² es CH ₂ CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 2-F.	353A	Z ² es un enlace y J es J-82.
158A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-64.	354A	Z ² es un enlace y J es J-83.
159A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-65.	355A	Z ² es un enlace y J es J-84.
160A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-66.	356A	Z ² es un enlace y J es J-85.
161A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-67.	357A	Z ² es un enlace y J es J-86.
162A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-68.	358A	Z ² es un enlace y J es J-87.
163A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-69.	359A	Z ² es un enlace y J es J-88.
164A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-70.	360A	Z ² es un enlace y J es J-89.
165A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-71.	361A	Z ² es un enlace y J es J-91.
166A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-72.	362A	Z ² es un enlace y J-63 y R ^{7a} es 2,4-diCl.
167A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-73.	363A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 2-Cl.
168A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-74.	364A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 2-Me.
169A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-75.	365A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 2-MeO.
170A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-76.	366A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 3-F.
171A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-77.	367A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 3-Cl.
172A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-78.	368A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 3-Me.
173A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-79.	369A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 3-MeO.
174A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-80.	370A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 2,6-diF.
175A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-81.	371A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 2,3-diF.
176A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-82.	372A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 3,5-diF.
177A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-83.	373A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 2,6-di-Cl.
178A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-84.	374A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 2,3-di-Cl.
179A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-85.	375A	Z ² es un enlace, J es J-63 y R ^{7a} es 3,5-di-Cl.
180A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-86.	376A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 2-Cl.
181A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-87.	377A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 2-Me.
182A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-88.	378A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 2-MeO.
183A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-89.	379A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 3-F.
184A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-90.	380A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 3-Cl.
185A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-91.	381A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 3-Me.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
186A	Z ² es CH ₂ CH ₂ y J es J-92.	382A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 3-MeO.
187A	Z ² es CH ₂ CH(Ph) y J es J-63.	383A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 2,6-diF.
188A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-1.	384A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 2,3-diF.
189A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-2.	385A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 3,5-diF.
190A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-3 y R ^{8a} es Me.	386A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 2,6-di-Cl.
191A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-4.	387A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 2,3-di-Cl.
192A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-5.	388A	Z ² es CH ₂ , J es J-63 y R ^{7a} es 3,5-di-Cl.
193A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-6 y R ^{8a} es Me.	389A	Z ² es CH ₂ CH(OH) y J es J-63.
194A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-7.	390A	Z ² es CH ₂ CH(OMe) y J es J-63.
195A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-8.	391A	Z ² es CH ₂ CH(OAc) y J es J-63.
196A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ , J es J-9 y R ^{8a} es Me.	392A	Z ² es CH ₂ CH(CN) y J es J-63.
197A	Z ² es CH ₂ CH ₂ CH ₂ y J es J-10.		

Formulación/Utilidad

5 Generalmente se usará un compuesto de Fórmula 1 de la presente invención como principio activo fungicida en una composición, es decir, una formulación, con al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, que sirven como vehículo. Los ingredientes de la formulación o composición se seleccionan de forma que sean coherentes con las propiedades físicas del principio activo, el modo de aplicación y factores ambientales tales como el tipo de suelo, la humedad y la temperatura.

10 Las formulaciones útiles incluyen composiciones tanto líquidas como sólidas. Las composiciones líquidas incluyen soluciones (incluidos concentrados emulsionables), suspensiones, emulsiones (incluidas microemulsiones y/o suspoemulsiones) y similares, que opcionalmente pueden espesarse para dar geles. Los tipos generales de composiciones líquidas acuosas son concentrado soluble, concentrado de suspensión, suspensión de cápsulas, emulsión concentrada, microemulsión y suspoemulsión. Los tipos generales de composiciones líquidas no acuosas son concentrado emulsionable, concentrado microemulsionable, concentrado dispersable y dispersión en aceite.

15 Los tipos generales de composiciones sólidas son polvos finos, polvos, gránulos, microgránulos, píldoras, pastillas, comprimidos, películas cargadas (incluidos recubrimientos de semillas) y similares, que pueden ser dispersables en agua ("humectables") o solubles en agua. Las películas y recubrimientos formados a partir de soluciones formadoras de películas o suspensiones fluidas son particularmente útiles para el tratamiento de semillas. El principio activo puede estar (micro)encapsulado y además conformado en una suspensión o formulación sólida; como alternativa, toda la formulación del principio activo puede estar encapsulada (o "recubierta"). La encapsulación puede controlar o retrasar la liberación del principio activo. Un gránulo emulsionable combina las ventajas tanto de una formulación concentrada emulsionable como de una formulación granular seca. Las composiciones de concentración elevada se utilizan principalmente como intermedios para su formulación adicional.

20 Las formulaciones pulverizables normalmente se diluyen en un medio adecuado antes de la pulverización. Dichas formulaciones líquidas y sólidas se formulan de forma que se diluyan fácilmente en el medio de pulverización, normalmente agua. Los volúmenes de pulverización pueden variar de aproximadamente uno a varios miles de litros por hectárea, pero más habitualmente están comprendidos en el intervalo de aproximadamente diez a varios cientos de litros por hectárea. Las formulaciones pulverizables se pueden mezclar en tanque con agua u otro medio adecuado para tratamiento foliar mediante aplicación aérea o terrestre, o para aplicación al medio de cultivo de la planta. Las formulaciones líquidas y secas se pueden dosificar directamente en los sistemas de riego por goteo o se pueden dosificar en el surco durante la plantación. Las formulaciones líquidas y sólidas se pueden aplicar sobre las semillas de los cultivos y otra vegetación deseable como tratamientos de las semillas antes de la plantación para proteger las raíces en desarrollo y otras partes subterráneas de las plantas y/o el follaje mediante absorción sistémica.

25 Las formulaciones contendrán normalmente cantidades eficaces de principio activo, diluyente y tensioactivo dentro de los siguientes intervalos aproximados que suman 100 por ciento en peso.

	Porcentaje en peso		
	Principio activo	Diluyente	Tensioactivo
Gránulos, comprimidos y polvos solubles en agua y dispersables en agua.	0,001-90	0-99,999	0-15
Dispersiones, suspensiones, emulsiones y soluciones en aceite (incluidos concentrados emulsionables)	1-50	40-99	0-50
Polvos finos	1-25	70-99	0-5
Gránulos y microgránulos	0,001-95	5-99,999	0-15
Composiciones de concentración elevada	90-99	0-10	0-2

5 Los diluyentes sólidos incluyen, por ejemplo, arcillas tales como bentonita, montmorillonita, atapulgita y caolín, yeso, celulosa, dióxido de titanio, óxido de zinc, almidón, dextrina, azúcares (por ejemplo, lactosa, sacarosa), sílice, talco, mica, tierra de diatomeas, urea, carbonato de calcio, carbonato y bicarbonato de sodio y sulfato de sodio. Los diluyentes sólidos típicos se describen por Watkins et al., Handbook of Insecticida Dust Diluents and Carriers, 2.^a edición, Dorland Books, Caldwell, Nueva Jersey.

10 Los diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, *N,N*-dimetilalcanamidas (por ejemplo, *N,N*-dimetilformamida), limoneno, dimetilsulfóxido, *N*-alquilpirrolidonas (por ejemplo, *N*-metilpirrolidinona), etilenglicol, trietilenglicol, propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (por ejemplo, aceites minerales blancos, parafinas normales, isoparafinas), alquilbencenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de glicerol, sorbitol, hidrocarburos aromáticos, alifáticos desaromatizados, alquilbencenos, alquilnaftalenos, cetonas tales como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, acetatos tales como acetato de isoamilo, acetato de hexilo, acetato de heptilo, acetato de octilo, acetato de nonilo, acetato de tridecilo y acetato de isobornilo, otros ésteres tales como ésteres de lactato alquilados, ésteres dibásicos y γ -butirolactona, y alcoholes, que pueden ser lineales, ramificados, saturados o insaturados, tales como metanol, etanol, *n*-propanol, alcohol isopropílico, *n*-butanol, alcohol isobutílico, *n*-hexanol, 2-etilhexanol, *n*-octanol, decanol, alcohol isodecílico, isooctadecanol, alcohol cetílico, alcohol laurílico, alcohol tridecílico, alcohol oleílico, ciclohexanol, alcohol tetrahidrofurfurílico, alcohol diacetona y alcohol bencílico. Los diluyentes líquidos también incluyen ésteres de glicerol de ácidos grasos saturados e insaturados (normalmente C₆-C₂₂), tales como aceites de semillas y frutas (por ejemplo, aceites de oliva, ricino, linaza, sésamo, maíz, cacahuete, girasol, semilla de uva, cártamo, semilla de algodón, soja, colza, coco y palmiste), grasas de origen animal (por ejemplo, sebo de vaca, sebo de cerdo, manteca de cerdo, aceite de hígado de bacalao, aceite de pescado) y mezclas de los mismos. Los diluyentes líquidos también incluyen ácidos grasos alquilados (por ejemplo, metilados, etilados, butilados), en los que los ácidos grasos pueden obtenerse por hidrólisis de ésteres de glicerol provenientes de fuentes vegetales y animales, y se pueden purificar por destilación. Los diluyentes líquidos típicos se describen por Marsden, Solvents Guide, 2.^a edición, Interscience, Nueva York, 1950.

30 Las composiciones sólidas y líquidas de la presente invención con frecuencia incluyen uno o más tensioactivos. Cuando se añaden a un líquido, los tensioactivos (también conocidos como "agentes con actividad superficial") generalmente modifican, y en la mayor parte de los casos reducen, la tensión superficial del líquido. Dependiendo de la naturaleza de los grupos hidrófilos y lipófilos en una molécula de tensioactivo, los tensioactivos pueden ser útiles como agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes o antiespumantes.

35 Los tensioactivos se pueden clasificar como no iónicos, aniónicos o catiónicos. Los tensioactivos no iónicos útiles para las presentes composiciones incluyen, pero sin limitación: alcoxilatos de alcohol tales como alcoxilatos de alcohol basados en alcoholes naturales y sintéticos (que pueden ser ramificados o lineales) y preparados a partir de alcoholes y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos; etoxilatos de amina, alcanolamidas y alcanolamidas etoxiladas; triglicéridos alcoxilados tales como aceites de soja, ricino y colza etoxilados; alcoxilatos de alquilfenol tales como etoxilatos de octilfenol, etoxilatos de nonilfenol, etoxilatos de dinonilfenol y etoxilatos de dodecilfenol (preparados a partir de fenoles y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); polímeros de bloques preparados a partir de óxido de etileno u óxido de propileno y polímeros de bloques inversos en los que los bloques terminales se preparan a partir de óxido de propileno; ácidos grasos etoxilados; ésteres y aceites grasos etoxilados; ésteres metílicos etoxilados; triestirilfenol etoxilado (incluidos los preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); ésteres de ácidos grasos, ésteres de glicerol, derivados basados en lanolina, ésteres de polietoxilato tales como ésteres de ácidos grasos de sorbitán polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de sorbitol polietoxilados y ésteres de ácidos grasos de glicerol polietoxilados; otros derivados de sorbitán tales como ésteres de sorbitán; tensioactivos poliméricos tales como copolímeros aleatorios, copolímeros de bloques, resinas alquídicas de peg (polietilenglicol), polímeros de injerto o de peine y polímeros en estrella; polietilenglicoles (pegs); ésteres de ácidos grasos de polietilenglicol; tensioactivos a base de silicona; y derivados de azúcares tales como ésteres de sacarosa, alquilpoliglicósidos y alquilpolisacáridos.

Los tensioactivos aniónicos útiles incluyen, pero sin limitación: ácidos alquilarilsulfónicos y sus sales; etoxilatos de alcohol o alquilfenol carboxilados; derivados de sulfonato de difenilo; lignina y derivados de lignina, tales como lignosulfonatos; ácidos maleico o succínico o sus anhídridos; sulfonatos de olefina; ésteres de fosfato tales como ésteres de fosfato de alcoxilatos de alcohol, ésteres de fosfato de alcoxilatos de alquilfenol y ésteres de fosfato de etoxilatos de estirilfenol; tensioactivos a base de proteínas; derivados de sarcosina; etersulfato de estirilfenol; sulfatos y sulfonatos de aceites y ácidos grasos; sulfatos y sulfonatos de alquilfenoles etoxilados; sulfatos de alcoholes; sulfatos de alcoholes etoxilados; sulfonatos de aminas y amidas tales como *N,N*-alquiltauratos; sulfonatos de benceno, cumeno, tolueno, xileno y dodecil- y tridecilbencenos; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno y alquilnaftaleno; sulfonatos de petróleo fraccionado; sulfosuccinamatos; y sulfosuccinatos y sus derivados tales como sales de dialquilsulfosuccinato.

Los tensioactivos catiónicos útiles incluyen, pero sin limitación: amidas y amidas etoxiladas; aminas tales como *N*-alquilpropanodiaminas, tripropilentriaminas y dipropilentetraminas, y aminas etoxiladas, diaminas etoxiladas y aminas propoxiladas (preparadas a partir de aminas y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); sales de aminas tales como acetatos de aminas y sales de diaminas; sales de amonio cuaternario tales como sales cuaternarias, sales cuaternarias etoxiladas y sales dicuaternarias; y óxidos de aminas tales como óxidos de alquildimetilamina y óxidos de bis-(2-hidroxietil)alquilamina.

También son útiles para las presentes composiciones mezclas de tensioactivos no iónicos y aniónicos o mezclas de tensioactivos no iónicos y catiónicos. Tensioactivos no iónicos, aniónicos y catiónicos, y sus usos recomendados, se divulgan en una diversidad de referencias publicadas, que incluyen McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, ediciones estadounidenses e internacionales anuales publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely y Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., Nueva York, 1964; y A. S. Davidson y B. Milwidsqui, Synthetic Detergents, séptima edición, John Wiley and Sons, Nueva York, 1987.

Las composiciones de la presente invención también pueden contener auxiliares de formulación y aditivos, conocidos por los expertos en la técnica como adyuvantes de formulación. Dichos auxiliares de formulación y aditivos pueden controlar: el pH (tampones), la formación de espuma durante el procesamiento (antiespumantes tales como poliorganosiloxanos (por ejemplo, Rhodorsil® 416)), la sedimentación de los principios activos (agentes de suspensión), la viscosidad (espesantes tixotrópicos), el crecimiento microbiano en el recipiente (antimicrobianos), la congelación del producto (anticongelantes), el color (tintes/dispersiones de pigmentos (por ejemplo, colorante rojo Prozed®)), la eliminación por lavado (formadores de película o adhesivos), la evaporación (retardantes de la evaporación) y otras propiedades de la formulación. Los formadores de película incluyen, por ejemplo, poli(acetatos de vinilo), copolímeros de poli(acetato de vinilo), copolímeros de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo, poli(alcoholes vinílicos), copolímeros de poli(alcohol vinílico) y ceras. Los ejemplos de auxiliares de formulación y aditivos incluyen los enumerados en el Volumen 2 de McCutcheon: Functional Materials, ediciones anuales internacional y norteamericana publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; y la publicación PCT WO 03/024222.

Se pueden preparar soluciones, incluidos los concentrados emulsionables, simplemente mezclando los ingredientes. Si el disolvente de una composición líquida destinada para su uso como concentrado emulsionable es inmisible con agua, normalmente se añade un emulsionante para emulsionar el disolvente que contiene el principio activo tras su dilución con agua. Las suspensiones de principios activos, con diámetros de partícula de hasta 2000 µm, se pueden moler en húmedo utilizando molinos de medios para obtener partículas con diámetros promedio inferiores a 3 µm. Las suspensiones acuosas se pueden convertir en concentrados de suspensión acabados (véase, por ejemplo, el documento U.S. 3.060.084) o se pueden procesar adicionalmente mediante secado por pulverización para formar gránulos dispersables en agua. Las formulaciones secas por lo general requieren procesos de molido en seco, que producen diámetros de partícula promedio comprendidos en el intervalo de 2 a 10 µm. Los polvos finos y los polvos se pueden preparar mezclándolos y, generalmente, moliéndolos como en un molino de martillos o en un molino de energía fluida. Los gránulos y microgránulos se pueden preparar pulverizando el material activo sobre vehículos granulares preformados o mediante técnicas de aglomeración. Véase Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre de 1967, páginas 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4ª Ed., McGraw-Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y siguientes, y el documento WO 91/13546. Los microgránulos se pueden preparar tal como se describe en el documento U.S. 4.172.714. Los gránulos dispersables en agua e hidrosolubles se pueden preparar tal como se muestra en los documentos U.S. 4.144.050, U.S. 3.920.442 y DE 3.246.493. Los comprimidos se pueden preparar tal como se muestra en los documentos U.S. 5.180.587, U.S. 5.232.701 y U.S. 5.208.030. Las películas se pueden preparar tal como se muestra en los documentos GB 2.095.558 y U.S. 3.299.566.

Para más información con respecto a la técnica de la formulación, véase T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" en Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks y T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, páginas 120-133. Véase también el documento U.S. 3.235.361, de la col. 6, línea 16 a la col. 7, línea 19 y los Ejemplos 10-41; el documento U.S. 3.309.192, de la col. 5, línea 43 a la col. 7, línea 62 y los Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; el documento U.S. 2.891.855, de la col. 3, línea 66 a la col. 5, línea 17 y los Ejemplos 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons,

Inc., Nueva York, 1961, páginas 81-96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8.^a Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; y Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, Reino Unido, 2000.

5 En los Ejemplos siguientes, todos los porcentajes son en peso y todas las formulaciones se preparan de formas convencionales. Los números de los compuestos se refieren a compuestos en el Índice

10 las Tablas de índices A-E. Sin más detalles, se cree que un experto en la técnica que utilice la descripción anterior puede utilizar la presente invención en toda su extensión. Los Ejemplos siguientes, por lo tanto, deben interpretarse como meramente ilustrativos y no limitativos de la divulgación de ninguna forma. Los porcentajes son en peso excepto cuando se indica lo contrario.

Ejemplo A

Concentrado de concentración elevada

15	Compuesto 245	98,5%
	aerogel de sílice	0,5%
	sílice fina amorfa sintética	1,0%

Ejemplo B

Polvo Humectable

20	Compuesto 240	65,0%
	dodecilfenol polietilenglicol éter	2,0%
	lignosulfonato de sodio	4,0%
	silicoaluminato de sodio	6,0%
	montmorillonita (calcinada)	23,0%

Ejemplo C

Gránulo

25	Compuesto 239	10,0%
	gránulos de atapulgita (material poco volátil, 0,71/0,30 mm; tamices de U.S.S. N.º 25-50)	90,0%

Ejemplo D

Suspensión acuosa

30	Compuesto 238	25,0%
	atapulgita hidratada	3,0%
	lignosulfonato de calcio bruto	10,0%
	dihidrogenofosfato de sodio	0,5%
	agua	61,5%

Ejemplo E

Microgránulo extruido

35	Compuesto 236	25,0%
	sulfato de sodio anhidro	10,0%
	lignosulfonato de calcio bruto	5,0%

alquilnaftalenosulfonato de sodio	1,0%
bentonita de calcio/magnesio	59,0%

Ejemplo F**Microemulsión**

5	Compuesto 234	5,0%
	copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	30,0%
	alquilpoliglicósido C ₈ -C ₁₀	30,0%
	monooleato de glicerilo	15,0%
	Agua	20,0%

Ejemplo G**Concentrado emulsionable**

10	Compuesto 220	10,0%
	hexoleato de polioxietilen-sorbitol	20,0%
	éster metílico de ácidos grasos C ₆ -C ₁₀	70,0%

15 Las formulaciones solubles y dispersables en agua normalmente se diluyen con agua para formar composiciones acuosas antes de la aplicación. Las composiciones acuosas para aplicaciones directas a la planta o una parte de la misma (por ejemplo, composiciones de tanque de pulverización) normalmente contienen al menos aproximadamente 1 ppm o más (por ejemplo, de 1 ppm a 100 ppm) del o de los compuestos de la presente invención.

20 Los compuestos de la presente invención son útiles como agentes de control de enfermedades de plantas. Por lo tanto, la presente invención comprende además un procedimiento para controlar enfermedades de las plantas provocadas por patógenos fúngicos de las plantas, que comprende aplicar a la planta o una parte de la misma que se ha de proteger, o a la semilla de la planta que se ha de proteger, una cantidad eficaz de un compuesto de la invención o una composición fungicida que contiene dicho compuesto. Este aspecto de la presente invención también se puede describir como un procedimiento para proteger una planta o semilla de planta de enfermedades provocadas por patógenos fúngicos que comprende aplicar una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de la invención (por ejemplo, como una composición descrita en el presente documento) a la planta (o parte de la misma) o semilla de la planta (directamente o a través del entorno (por ejemplo, medio de cultivo) de la planta o semilla de planta). Los compuestos y/o composiciones de la presente invención proporcionan un control de enfermedades provocadas por un amplio espectro de patógenos fúngicos de plantas en las clases de basidiomicetos, ascomicetos, oomicetos y deuteromicetos. Son eficaces para controlar un amplio espectro de enfermedades de las plantas, particularmente patógenos foliares de cultivos ornamentales, de césped, de hortalizas, de campo, de cereales y de frutales. Estos patógenos incluyen: Oomicetos, incluidas enfermedades por *Phytophthora* tales como *Phytophthora infestans*, *Phytophthora megasperma*, *Phytophthora parasitica*, *Phytophthora cinnamomi* y *Phytophthora capsid*, enfermedades por *Pythium* tales como *Pythium aphanidermatum*, y enfermedades en la familia de Peronosporaceas tales como *Plasmopara viticola*, *Peronospora* spp. (incluidas *Peronospora tabacina* y *Peronospora parasitica*), *Pseudoperonospora* spp. (incluida *Pseudoperonospora cubensis*) y *Bremia lactucae*; Ascomycetes, incluidas enfermedades por *Alternaria* tales como *Alternaria solani* y *Alternaria brassicae*, enfermedades por *Guignardia* tales como *Guignardia bidwell*, enfermedades por *Venturia* tales como *Venturia inaequalis*, enfermedades por *Septoria* tales como *Septoria nodorum* y *Septoria tritici*, enfermedades del mildiú pulverulento tales como *Erysiphe* spp. (incluidas *Erysiphe graminis* y *Erysiphe polygoni*), *Uncinula neaatur*, *Sphaerotheca fuliginea* y *Podosphaera leucotricha*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, enfermedades por *Botrytis* tales como *Botrytis cinerea*, *Monilinia fructicola*, enfermedades por *Sclerotinia* tales como *Sclerotinia sclerotiorum*, *Magnaporthe grisea*, *Phomopsis viticola*, enfermedades por *Helminthosporium* tales como *Helminthosporium tritici repentis*, *Pyrenophora teres*, enfermedades por antracnosis tales como *Glomerella* o *Colletotrichum* spp. (tales como *Colletotrichum graminicola* y *Colletotrichum orbiculare*), y *Gaeumannomyces graminis*; Basidiomicetos, incluidas enfermedades de la roña provocadas por *Puccinia* spp. (tales como *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia hordei*, *Puccinia graminis* y *Puccinia arachidis*), *Hemileia vastatrix* y *Phakopsora pachyrhizi*; otros patógenos, incluido *Rutstroemia floccosum* (también conocido como *Sclerotinia homoeocarpa*); *Rhizoctonia* spp. (tales como *Rhizoctonia solani*); enfermedades por *Fusarium* tales como *Fusarium roseum*, *Fusarium graminearum* y *Fusarium oxysporum*; *Verticillium dahliae*; *Sclerotium rolfsii*; *Rynchosporium secalis*; *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola* y *Cercospora beticola*; y otros géneros y especies estrechamente relacionados con estos patógenos. Además de su actividad fungicida, las composiciones o combinaciones también tienen actividad contra bacterias tales como *Erwinia amylovora*,

Xanthomonas campestris, *Pseudomonas syringae*, y otras especies relacionadas. Además, los compuestos de la presente invención son útiles en el tratamiento de enfermedades poscosecha de frutas y verduras provocadas por hongos y bacterias. Estas infecciones pueden producirse antes, durante y después de la cosecha. Por ejemplo, las infecciones pueden producirse antes de la cosecha y después permanecer latentes hasta algún momento durante la maduración (por ejemplo, el huésped comienza a realizar cambios en el tejido de tal manera que la infección puede progresar); también pueden surgir infecciones a partir de heridas superficiales creadas por lesiones mecánicas o por insectos. A este respecto, los compuestos de la presente invención pueden reducir las pérdidas (es decir, pérdidas resultantes de la cantidad y la calidad) debidas a enfermedades poscosecha que pueden producirse en cualquier momento desde la cosecha hasta el consumo. El tratamiento de enfermedades poscosecha con compuestos de la invención puede aumentar el periodo de tiempo durante el cual las partes comestibles perecederas de la planta (por ejemplo, frutos, semillas, follaje, tallos, bulbos, tubérculos) pueden almacenarse refrigeradas o sin refrigerar después de la cosecha, y permanecer comestibles y desprovistas de degradación o contaminación perceptible o dañina por hongos u otros microorganismos. El tratamiento de partes comestibles de plantas antes o después de la cosecha con compuestos de la invención también puede disminuir la formación de metabolitos tóxicos de hongos u otros microorganismos, por ejemplo micotoxinas tales como aflatoxinas.

El control de enfermedades de las plantas se realiza normalmente aplicando una cantidad eficaz de un compuesto de la presente invención, ya sea antes o después de la infección, a la parte de la planta que se ha de proteger, tal como raíces, tallos, follaje, frutos, semillas, tubérculos o bulbos, o al medio (tierra o arena) en el que crecen las plantas que se han de proteger. Los compuestos también se pueden aplicar a semillas para proteger las semillas y las plántulas que se desarrollan a partir de las semillas. Los compuestos también se pueden aplicar a través del agua de riego para tratar plantas. El control de los patógenos poscosecha que infectan el producto antes de la cosecha se realiza normalmente mediante la aplicación en el campo de un compuesto de la presente invención, y en los casos en que la infección se produce después de la cosecha, los compuestos se pueden aplicar al cultivo cosechado como baños, pulverizaciones, fumigantes, envolturas tratadas y revestimientos de cajas.

Las tasas de aplicación de estos compuestos (es decir, una cantidad eficaz como fungicida) pueden verse influidas por factores tales como las enfermedades de las plantas que se han de controlar, las especies de plantas que se han de proteger, la humedad y la temperatura ambiente, y deben determinarse en las condiciones de uso reales. Un experto en la técnica puede determinar fácilmente mediante una experimentación sencilla la cantidad eficaz como fungicida necesaria para el nivel deseado de control de enfermedades de las plantas. Normalmente, el follaje se puede proteger cuando se trata a una dosis de menos de aproximadamente 1 g/ha a aproximadamente 5.000 g/ha de principio activo. Las semillas y las plántulas normalmente pueden protegerse cuando las semillas se tratan a una tasa de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10 g por kilogramo de semilla.

Los compuestos de la presente invención también se pueden mezclar con uno o más compuestos o agentes biológicamente activos, que incluyen fungicidas, insecticidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, herbicidas, protectores de herbicidas, reguladores del crecimiento tales como inhibidores de la muda de insectos y estimulantes del enraizamiento, quimioesterilizantes, semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes de la alimentación, nutrientes de plantas, otros compuestos biológicamente activos, o bacterias, virus u hongos entomopatógenos para formar un plaguicida de múltiples componentes que proporciona un espectro aún más amplio de protección agrícola. Por lo tanto, la presente invención también se refiere a una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1 (en una cantidad eficaz como fungicida) y al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional (en una cantidad biológicamente eficaz) y puede comprender además al menos uno de un tensioactivo, un diluyente sólido o un diluyente líquido. Los otros compuestos o agentes con actividad biológica se pueden formular en composiciones que comprenden al menos uno de un tensioactivo y un diluyente sólido o líquido. Para las mezclas de la presente invención, se pueden formular uno o más compuestos o agentes biológicamente activos junto con un compuesto de Fórmula 1, para formar una premezcla, o se pueden formular uno o más compuestos o agentes biológicamente activos por separado del compuesto de Fórmula 1, y combinarse las formulaciones antes de la aplicación (por ejemplo, en un tanque de pulverización) o, alternativamente, aplicarse en sucesión.

Cabe destacar una composición que además del compuesto de Fórmula 1 incluye al menos un compuesto fungicida seleccionado del grupo que consiste en las clases (1) fungicidas de carbamato de metil-bencimidazol (MBC); (2) fungicidas de dicarboximida; (3) fungicidas inhibidores de la desmetilación (DMI); (4) fungicidas de fenilamida; (5) fungicidas de amina/morfolina; (6) fungicidas inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos; (7) fungicidas de carboxamida; (8) fungicidas de hidroxil(2-amino-)pirimidina; (9) fungicidas de anilino pirimidina; (10) fungicidas de carbamato de *N*-fenilo; (11) fungicidas inhibidores externos de quinona (QoI); (12) fungicidas de fenilpirrol; (13) fungicidas de quinolina; (14) fungicidas inhibidores de la peroxidación lipídica; (15) fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina-reductasa (MBI-R); (16) fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina-deshidratasa (MBI-D); (17) fungicidas de hidroxianilida; (18) fungicidas inhibidores de escualeno-epoxidasa; (19) fungicidas de polioxina; (20) fungicidas de fenilurea; (21) fungicidas inhibidores internos de quinona (Qil); (22) fungicidas de benzamida; (23) fungicidas antibióticos de ácido enopiranurónico; (24) fungicidas antibióticos de hexopiranosilo; (25) fungicidas de antibióticos de glucopiranosilo: síntesis de proteínas; (26) fungicidas de antibióticos de glucopiranosilo: biosíntesis de trehalasa e inositol; (27) fungicidas de cianoacetamidaoxima; (28) fungicidas de carbamato; (29) fungicidas de desacoplamiento de la fosforilación oxidativa; (30) fungicidas de organoestaño; (31) fungicidas de ácido carboxílico; (32) fungicidas heteroaromáticos; (33) fungicidas de fosfonato; (34) fungicidas de ácido ftalámico; (35)

fungicidas de benzotriazina; (36) fungicidas de bencenosulfonamida; (37) fungicidas de piridazinona; (38) fungicidas de tiofeno-carboxamida; (39) fungicidas de pirimidinamida; (40) fungicidas de amida de ácido carboxílico (CAA); (41) fungicidas antibióticos de tetraciclina; (42) fungicidas de tiocarbamato; (43) fungicidas de benzamida; (44) fungicidas de inducción de defensa de la planta huésped; (45) fungicidas con actividad de contacto en múltiples sitios; (46) fungicidas distintos de las clases (1) a (45); y sales de compuestos de las clases (1) a (46).

A continuación se proporcionan descripciones adicionales de estas clases de compuestos fungicidas.

- (1) Los "fungicidas de carbamato de metilbencimidazol (MBC)" (código 1 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la mitosis uniéndose a la β -tubulina durante el ensamblaje de los microtúbulos. La inhibición del ensamblaje de microtúbulos puede alterar la división celular, el transporte dentro de la célula y la estructura celular. Los fungicidas de carbamato de metilbencimidazol incluyen fungicidas de bencimidazol y tiofanato. Los bencimidazoles incluyen benomilo, carbendazim, fuberidazol y tiabendazol. Los tiofanatos incluyen tiofanato y tiofanato-metilo.
- (2) Los "fungicidas de dicarboximida" (código 2 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) se proponen para inhibir la peroxidación lipídica en hongos mediante interferencia con la NADH citocromo c reductasa. Los ejemplos incluyen clozolinato, iprodiona, procimidona y vinclozolina.
- (3) Los "fungicidas inhibidores de la desmetilación (DMI)" (código 3 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la C14-desmetilasa, que desempeña un papel en la producción de esteroides. Los esteroides, tales como el ergosterol, son necesarios para la estructura y función de las membranas, lo que los hace esenciales para el desarrollo de paredes celulares funcionales. Por lo tanto, la exposición a estos fungicidas produce un crecimiento anormal y eventualmente la muerte de hongos sensibles. Los fungicidas DMI se dividen en varias clases químicas: azoles (incluidos triazoles e imidazoles), pirimidinas, piperazinas y piridinas. Los triazoles incluyen azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol (incluido diniconazol-M), epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, triticonazol y uniconazol. Los imidazoles incluyen clotrimazol, imazalilo, oxpoconazol, procloraz, pefuraroato y triflumizol. Las pirimidinas incluyen fenarimol y nuarimol. Las piperazinas incluyen triforina. Las piridinas incluyen pirifenox. Las investigaciones bioquímicas han demostrado que todos los fungicidas mencionados anteriormente son fungicidas DMI tal como se describen por K.H. Kuck et al. en *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: Nueva York, 1995, 205-258.
- (4) Los "fungicidas de fenilamida" (código 4 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) son inhibidores específicos de la ARN polimerasa en los hongos oomicetos. Los hongos sensibles expuestos a estos fungicidas muestran una capacidad reducida para incorporar uridina al ARNr. El crecimiento y el desarrollo de hongos sensibles se previene mediante la exposición a esta clase de fungicida. Los fungicidas de fenilamida incluyen fungicidas de acilalanina, oxazolidinona y butirolactona. Las acilalaninas incluyen benalaxil, benalaxilo-M, furalaxilo, metalaxilo y metalaxilo-M/mefenoxam. Las oxazolidinonas incluyen oxadixilo. Las butirolactonas incluyen ofurace.
- (5) Los "fungicidas de amina/morfolina" (código 5 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben dos sitios diana dentro de la vía biosintética de esteroides, $\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$ isomerasa y Δ^{14} reductasa. Los esteroides, tales como el ergosterol, son necesarios para la estructura y función de las membranas, lo que los hace esenciales para el desarrollo de paredes celulares funcionales. Por lo tanto, la exposición a estos fungicidas produce un crecimiento anormal y eventualmente la muerte de hongos sensibles. Los fungicidas de amina/morfolina (también conocidos como inhibidores de la biosíntesis de esteroides no DMI) incluyen fungicidas de morfolina, piperidina y espirocetalamina. Las morfolinas incluyen aldiform, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf y trimorfamida. Las piperidinas incluyen fenpropidina y piperalina. Las espirocetalaminas incluyen espiroxamina.
- (6) Los "fungicidas inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos" (código 6 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben el crecimiento de hongos al afectar a la biosíntesis de fosfolípidos. Los fungicidas de la biosíntesis de fosfolípidos incluyen fungicidas de fosforotiolato y ditiolano. Los fosforotiolatos incluyen edifenfós, iprobenfós y pirazofós. Los ditiolanos incluyen isoprotiolano.
- (7) Los "fungicidas de carboxamida" (código 7 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la respiración fúngica del Complejo II (succinato deshidrogenasa) al alterar una enzima clave en el ciclo de Krebs (ciclo TCA) denominada succinato deshidrogenasa. La inhibición de la respiración evita que el hongo produzca ATP, y por lo tanto inhibe el crecimiento y la reproducción. Los fungicidas de carboxamida incluyen benzamidas, furano carboxamidas, oxatiina carboxamidas, tiazol carboxamidas, pirazol carboxamidas y piridina carboxamidas. Las benzamidas incluyen benodanilo, flutolanilo y mepronilo. Las furano carboxamidas incluyen fenfuram. Las oxatiina carboxamidas incluyen carboxina y oxicarboxina. Las tiazol carboxamidas incluyen tifluzamida. Las pirazol carboxamidas incluyen furametpir, pentiopirad, bixafeno,

isopirazam, *N*-[2-(1*S*,2*R*)-[1,1'-biciclopropil]-2-ilfenil]-3-(difluorometil)-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxamida y penflufeno (*N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil]-1*H*-pirazol-4-carboxamida). Las piridina carboxamidas incluyen boscalida.

- 5 8) Los "fungicidas de hidroxil(2-amino-)pirimidina" (código 8 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la síntesis de ácidos nucleicos al interferir con la adenosina desaminasa. Los ejemplos incluyen bupirimato, dimetirimol y etirimol.
- 10 9) Los "fungicidas de anilino pirimidina" (código 9 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) se proponen para inhibir la biosíntesis del aminoácido metionina y alterar la secreción de enzimas hidrolíticas que lisan las células vegetales durante la infección. Los ejemplos incluyen ciprodinilo, mepanipirim y pirimetanilo.
- 15 10. (10) Los "fungicidas de carbamato de *N*-fenilo" (código 10 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la mitosis al unirse a la β -tubulina e interrumpir el ensamblaje de los microtúbulos. La inhibición del ensamblaje de microtúbulos puede alterar la división celular, el transporte dentro de la célula y la estructura celular. Los ejemplos incluyen dietofencarb.
- 20 (11) Los "fungicidas inhibidores externos de quinona (QoI)" (código 11 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la respiración mitocondrial del Complejo III en hongos al afectar a la ubiquinol oxidasa. La oxidación de ubiquinol se bloquea en el sitio de "externo de quinona" (Q_o) del complejo citocromo bc₁, que se encuentra en la membrana mitocondrial interna de los hongos. La inhibición de la respiración mitocondrial previene el crecimiento y desarrollo normal de los hongos. Los fungicidas inhibidores externos de quinona (también conocidos como fungicidas de estrobilurina) incluyen fungicidas de metoxiacrilato, metoxicarbamato, oximinoacetato, oximinoacetamida, oxazolidinediona, dihidrodioxazina, imidazolinona y bencilcarbamato. Los metoxiacrilatos incluyen azoxiestrobina, enestroburina (SYP-Z071), picoxiestrobina y piraoxiestrobina (SYP-3343). Los metoxicarbamatos incluyen piraclóestrobina y pirametoestrobina (SYP-4155). Los oximinoacetatos incluyen kresoxim-metilo y trifloxiestrobina. Las oximinoacetamidas incluyen dimoxiestrobina, metominoestrobina, orisaestrobina, α -[metoxiimino]-*N*-metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]-metil]bencenoacetamida y 2-[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-ilideno]-amino]oxi]metil]- α -(metoxiimino)-*N*-metilbencenoacetamida. Las oxazolidinonas incluyen famoxadona. Las dihidrodioxazinas incluyen fluoxaestrobina. Las imidazolinonas incluyen fenamidona. Los bencilcarbamatos incluyen piribencarb. La clase (11) también incluye 2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]- α -metoxi-*N*-bencenoacetamida.
- 25 30 35 (12) Los "fungicidas de fenilpirrol" (código 12 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben una proteína quinasa MAP asociada con la transducción de señales osmóticas en hongos. Fenpiclonilo y fludioxonilo son ejemplos de esta clase de fungicidas.
- 40 (13) Los "fungicidas de azanaftaleno" (código 13 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) se proponen para inhibir la transducción de señales al afectar a las proteínas G en la señalización celular temprana. Se ha demostrado que interfieren con la germinación y/o la formación de apresorio en hongos que provocan enfermedades del mildiú pulverulento. Los fungicidas de azanaftaleno incluyen ariloxiquinolinas y quinazolinona. Las ariloxiquinolinas incluyen quinoxifeno y tebufloquina. Las quinazolinonas incluyen la proquinazida.
- 45 (14) Los "fungicidas inhibidores de la peroxidación lipídica" (código 14 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) se proponen para inhibir la peroxidación lipídica que afecta a la síntesis de membranas en los hongos. Los miembros de esta clase, tales como etridiazol, también pueden afectar a otros procesos biológicos tales como la respiración y la biosíntesis de melanina. Los fungicidas de peroxidación lipídica incluyen fungicidas de carbono aromático y 1,2,4-tiadiazol. Los fungicidas de carbono aromáticos incluyen bifenilo, cloroneb, diclorán, quintoceno, tecnazeno y tolclofés-metilo. Los fungicidas de 1,2,4-tiadiazol incluyen etridiazol.
- 50 (15) Los "fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina-reductasa (MBI-R)" (código 16.1 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben el etapa de reducción de naftal en la biosíntesis de melanina. Algunos hongos requieren melanina para la infección de la planta huésped. Los fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina-reductasa incluyen fungicidas de isobenzofuranona, pirroloquinolinona y triazolobenzotiazol. Las isobenzofuranonas incluyen flhialuro. Las pirroloquinolinonas incluyen piroquilona. Los triazolobenzotiazoles incluyen triciclazol.
- 55 (16) Los "fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina deshidratasa (MBI-D)" (código 16.2 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la escitalona deshidratasa en la biosíntesis de melanina. Algunos hongos requieren melanina para la infección de la planta huésped. Los fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina-deshidratasa incluyen fungicidas de ciclopropanocarboxamida, carboxamida y propionamida. Las ciclopropanocarboxamidas incluyen carpropamida. Las carboxamidas incluyen diclocimet. Las propionamidas incluyen fenoxanilo.
- 60 65

- 5
- (17) "Los fungicidas de hidroxianilida (código 17 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la C4-desmetilasa, que desempeña un papel en la producción de esteroides. Los ejemplos incluyen la fenhexamida.
- 10
- (18) Los "fungicidas inhibidores de escualeno-epoxidasa" (código 18 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la escualeno-epoxidasa en la vía de biosíntesis del ergosterol. Los esteroides, tales como ergosterol, son necesarios para la estructura y la función de las membranas, lo que los hace esenciales para el desarrollo de paredes celulares funcionales. Por lo tanto, la exposición a estos fungicidas produce un crecimiento anormal y eventualmente la muerte de hongos sensibles. Los fungicidas inhibidores de escualeno-epoxidasa incluyen fungicidas de tiocarbamato y alilamina. Los tiocarbamatos incluyen piributicarb. Las alilaminas incluyen naftifina y terbinafina.
- 15
- (19) Los "fungicidas de polioxina" (código 19 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la quitina sintasa. Los ejemplos incluyen polioxina. Los ejemplos incluyen polioxina.
- 20
- (20) Los "fungicidas de fenilurea" (código 20 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) se proponen para afectar a la división celular. Los ejemplos incluyen pencicurón.
- 25
- (21) Los "fungicidas inhibidores internos de quinona (Qi)" (código 21 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la respiración mitocondrial del complejo III en hongos al afectar a la ubiquinol reductasa. La reducción de ubiquinol se bloquea en el sitio "interno de la quinona" (Q_i) del complejo citocromo bc₁, que se encuentra en la membrana mitocondrial interna de los hongos. La inhibición de la respiración mitocondrial previene el crecimiento y desarrollo normal de los hongos. Los fungicidas inhibidores internos de quinona incluyen fungicidas de cianoimidazol y sulfamoiltriazol. Los cianoimidazoles incluyen ciazofamida. Los sulfamoiltriazoles incluyen el amisulbrom.
- 30
- (22) Los "fungicidas de benzamida" (código 22 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la mitosis al unirse a β-tubulina e alterar el ensamblaje de los microtúbulos. La inhibición del ensamblaje de microtúbulos puede alterar la división celular, el transporte dentro de la célula y la estructura celular. Los ejemplos incluyen zoxamida.
- 35
- (23) Los "fungicidas antibióticos del ácido enopiranurónico" (código 23 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben el crecimiento de hongos al afectar a la biosíntesis de proteínas. Los ejemplos incluyen blasticidina-S.
- 40
- (24) Los "fungicidas antibióticos de hexopiranosilo" (código 24 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben el crecimiento de hongos al afectar a la biosíntesis de proteínas. Los ejemplos incluyen kasugamicina.
- 45
- (25) Los "fungicidas antibióticos de glucopiranosilo: síntesis de proteínas" (código 25 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben el crecimiento de hongos al afectar a la biosíntesis de proteínas. Los ejemplos incluyen estreptomina.
- 50
- (26) Los "fungicidas antibióticos de glucopiranosilo: biosíntesis de trehalasa e inositol" (código 26 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la trehalasa en la vía de biosíntesis de inositol. Los ejemplos incluyen validamicina.
- 55
- (27) Los "fungicidas de cianoacetamidaoxima (código 27 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) incluyen cimoxanilo.
- (28) Los "fungicidas de carbamato" (código 28 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) se consideran inhibidores multisitio del crecimiento de hongos. Se propone que interfieren con la síntesis de ácidos grasos en las membranas celulares, lo que altera entonces la permeabilidad de las membranas celulares. El propamocarb, el clorhidrato de propamocarb, el yodocarb y el protiocarb son ejemplos de esta clase de fungicidas.
- 60
- (29) Los "fungicidas de desacoplamiento de la fosforilación oxidativa" (código 29 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la respiración de los hongos al desacoplar la fosforilación oxidativa. La inhibición de la respiración previene el crecimiento y desarrollo normal de los hongos. Esta clase incluye 2,6-dinitroanilinas tales como fluazinam, pirimidonahidrazonas tales como ferimzona y crotonatos de dinitrofenilo tales como dinocap, meptildinocap y binapacril.
- 65
- (30) Los "fungicidas orgánicos de estaño" (código 30 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) inhiben la adenosín trifosfato (ATP) sintasa en la vía de la fosforilación oxidativa. Los ejemplos incluyen acetato de fentina, cloruro de fentina, e hidróxido de fentina.

- 5 (31) Los "fungicidas de ácido carboxílico" (código 31 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC))
inhiben el crecimiento de hongos al afectar a la topoisomerasa tipo II (girasa) del ácido desoxirribonucleico
(ADN). Los ejemplos incluyen ácido oxolínico.
- 10 (32) Los "fungicidas heteroaromáticos" (código 32 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC))
se proponen para afectar a la síntesis de ADN/ácido ribonucleico (ARN). Los fungicidas heteroaromáticos
incluyen fungicidas de isoxazol e isotiazolona. Los isoxazoles incluyen himexazol, y las isotiazolonas incluyen
octilina.
- 15 (33) Los "fungicidas de fosfonato" (código 33 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC))
incluyen ácido fosforoso y sus diversas sales, incluido el fosetil-aluminio.
- (34) Los "fungicidas de ácido ftalámico" (código 34 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC))
incluyen tecloftalam.
- 20 (35) Los "fungicidas de benzotriazina" (código 35 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC))
incluyen triazóxido.
- (36) Los "fungicidas de bencenosulfonamida" (código 36 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas
(FRAC)) incluyen flusulfamida.
- 25 (37) Los "fungicidas de piridazinona" (código 37 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC))
incluyen diclomezina.
- (38) Los "fungicidas de tiofeno-carboxamida" (código 38 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas
(FRAC)) se proponen para afectar a la producción de ATP. Los ejemplos incluyen siltiofam.
- 30 (39) Los "fungicidas de pirimidinamida" (código 39 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC))
inhiben el crecimiento de hongos al afectar a la biosíntesis de fosfolípidos e incluyen dilumetorim.
- 35 40. (40) Los "fungicidas de amida de ácido carboxílico (CAA)" (código 40 del Comité de Acción de Resistencia a
los Fungicidas (FRAC)) se proponen para inhibir la biosíntesis de fosfolípidos y la deposición de la pared
celular. La inhibición de estos procesos previene el crecimiento y conduce a la muerte del hongo diana. Los
fungicidas de amidas de ácidos carboxílico incluyen fungicidas de amidas de ácido cinámico, carbamato de
valinamida y amidas de ácido mandélico. Las amidas del ácido cinámico incluyen dimetomorf y flumorf. Los
carbamatos de valinamida incluyen bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, iprovalicarb, valifenalato y
valifenal. Las amidas del ácido mandélico incluyen mandipropamid, N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-
40 3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida y N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-
metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida.
- 45 (41) Los "fungicidas antibióticos de tetraciclina" (código 41 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas
(FRAC)) inhiben el crecimiento de hongos al afectar al complejo 1 nicotinamida adenina dinucleótido (NADH)
oxidorreductasa. Los ejemplos incluyen oxitetraciclina.
- (42) Los "fungicidas de tiocarbamato" (código 42 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC))
incluyen metasulfocarb.
- 50 (43) Los "fungicidas de benzamida" (código 43 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC))
inhiben el crecimiento de hongos mediante la deslocalización de proteínas similares a la espectrina. Los
ejemplos incluyen fungicidas de acilpicolida tales como fluopicolida.
- 55 (44) Los "fungicidas de inducción de defensa de la planta huésped" (código P del Comité de Acción de Resistencia
a los Fungicidas (FRAC)) inducen mecanismos de defensa de la planta huésped. Los fungicidas de inducción
de defensa de las plantas huésped incluyen benzotiadiazoles, benzoisotiazoles y tiadiazolcarboxamidas. Los
benzotiadiazoles incluyen acibenzolar-S-metilo. Los bencisotiazoles incluyen probenazol. Las
tiadiazolcarboxamidas incluyen tiadinilo e isotianilo.
- 60 (45) Los "fungicidas de contacto en múltiples sitios" inhiben el crecimiento de hongos a través de múltiples sitios
de acción y tienen actividad de contacto/preventiva. Esta clase de fungicidas incluye: (45.1) "fungicidas de
cobre" (código M1 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)), (45.2) "fungicidas de
azufre" (código M2 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)), (45.3) "fungicidas de
ditiocarbamato" (código M3 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)), (45.4) "fungicidas
de ftalimida" (código M4 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)), (45.5) "fungicidas
de cloronitrilo" (código M5 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)), (45.6) "fungicidas
65 de sulfamida" (código M6 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)), (45.7) "fungicidas

de guanidina" (código M7 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)), (45.8) "fungicidas de triazina" (código M8 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) y (45.9) "fungicidas de quinona" (código M9 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)). Los "fungicidas de cobre" son compuestos inorgánicos que contienen cobre, generalmente en el estado de oxidación de cobre (II); los ejemplos incluyen oxiclورو de cobre, sulfato de cobre e hidróxido de cobre, incluidas composiciones tales como la mezcla de Burdeos (sulfato de cobre tribásico). Los "fungicidas de azufre" son sustancias químicas inorgánicas que contienen anillos o cadenas de átomos de azufre; los ejemplos incluyen azufre elemental. Los "fungicidas de ditiocarbamato" contienen un resto molecular de ditiocarbamato; los ejemplos incluyen mancozeb, metiram, propineb, ferbam, maneb, tiram, zineb y ziram. Los "fungicidas de ftalimida" contienen un resto molecular de ftalimida; los ejemplos incluyen folpet, captán y captafol. Los "fungicidas de cloronitrilo" contienen un anillo aromático sustituido con cloro y ciano; los ejemplos incluyen clortalonilo. Los "fungicidas de sulfamida" incluyen diclofluánida y tolifluánida. Los "fungicidas de guanidina" incluyen dodina, guazatina, albesilato de iminoctadina y triacetato de iminoctadina. Los "fungicidas de triazina" incluyen anilazina. Los "fungicidas de quinona" incluyen ditianona.

- (46) Los "fungicidas distintos de los fungicidas de las clases (1) a (45)" incluyen determinados fungicidas cuyo modo de acción puede ser desconocido. Estos incluyen: (46.1) "fungicidas de tiazol carboxamida" (código U5 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)), (46.2) "fungicidas de fenilacetamida" (código U6 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)), (46.3) "fungicidas de arilfenilcetona" (código U8 del Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC)) y (46.4) "fungicidas de triazolopirimidina". Las tiazol carboxamidas incluyen etaboxam. Las fenilacetamidas incluyen ciflufenamida y N-[[[ciclopropilmetoxi]-amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]-metilén]bencenoacetamida. Las arilfenilcetonas incluyen benzofenonas tales como metrafenona y benzoilpiridinas tales como pirofenona. Las triazolopirimidinas incluyen la ametocradina. La clase (46) (es decir, "fungicidas distintos de las clases (1) a (45)") también incluye betoxacina, fluxapiroxad, neoasozina (metanoarsonato férrico), pirrolnitrina, quinometionato, tebufloquina, isofetamida, N-2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida, N-2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida, 2-[[2-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]tio]-2-[3-(2-metoxifenil)-2-tiazolidiniliden]acetónitrilo, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]piridina, N-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil]metil]propil]carbamatato de 4-fluorofenilo, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metilbencenosulfonamida, N-[[[ciclopropilmetoxi]amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metilén]bencenoacetamida, N'-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)-fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilmetanimidamida, 1-[(2-propeniltio)-carbonil]-2-(1-metiletil)-4-(2-metilfenil)-5-amino-1H-pirazol-3-ona, N'-[4-[[3-(4-clorofenil)metil]-1,2,4-tiadiazol-5-il]oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metil-metanimidamida, N-[6-[[[[1-metil-1H-tetrazol-5-il]fenilmetilén]amino]oxi]metil]-2-piridinil]carbamatato de 1,1-dimetiletilo, N-[6-[[[[1-metil-1H-tetrazol-5-il]fenilmetilén]amino]oxi]metil]-2-piridinil]carbamatato de 3-butin-1-ilo, 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, 5-fluoro-2-[(4-metilfenil)-metoxi]-4-pirimidinamina, 5-fluoro-2-[(4-fluorofenil)metoxi]-4-pirimidinamina, α -[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)isoxazol-4-il]pirid-3-ilmetanol, (aS)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)isoxazol-4-il]pirid-3-ilmetanol y (α R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)isoxazol-4-il]pirid-3-ilmetanol.

Por lo tanto, cabe destacar una mezcla (es decir, una composición) que comprende un compuesto de Fórmula 1 y al menos un compuesto fungicida seleccionado del grupo que consiste en las clases (1) a (46) descritas anteriormente. También cabe destacar una composición que comprende dicha mezcla (en una cantidad eficaz como fungicida) y que comprende además al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Cabe destacar, en particular, una mezcla (es decir, una composición) que comprende un compuesto de fórmula 1 y al menos un compuesto fungicida seleccionado del grupo de compuestos específicos enumerados anteriormente en relación con las clases (1) a (46). También cabe destacar, en particular, una composición que comprende dicha mezcla (en una cantidad eficaz como fungicida) y que comprende además al menos un tensioactivo adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.

Ejemplos de otros compuestos o agentes biológicamente activos con los que se pueden formular compuestos de la presente invención son: insecticidas tales como abamectina, acefate, acetamiprid, acrinatrina, amidoflumet (S-1955), avermectina, azadiractina, azinfolos-metilo, bifentrina, bifenazato, buprofezina, carbofurano, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorfluazurón, clorpirifós, clorpirifós-metilo, cromafenorida, clotianidina, ciantraniliprol (3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-1H-pirazol-5-carboxamida), ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuurón, diazinón, dieldrina, diflubenzurón, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfán, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronilo, flonicamida, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim (UR-50701), flufenoxurón, fonofós, halofenozida, hexaflumurón, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, isofenofós, lufenurón, malatión, metaflumizona, metaldehído, metamidofós, metidatió, metomilo, metopreno, metoxicloro, metoflutrina, milbemicina oxima, monocrotofós, metoxifenozida, nicotina, nitenpiram, nitiazina, novalurón, noviflumurón (XDE-007), oxamilo, paratió, paratió-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosamidón, pirimicarb, profenofós, proflutrina, pimetozina, pirafuprol, piretrina, piridalilo, pirifluquinazón, piriprol, piriproxifeno,

rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclorfenol, espiromesifeno (BSN 2060), espirotetramato, sulprofós, tebufenozida, teflubenzurón, teflutrina, terbufós, tetraclorvinfós, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrína, triazamato, triclorfón y triflumurón; y agentes biológicos que incluyen bacterias entomopatógenas, tales como *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, las endotoxinas delta encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, Cellcap, MPV, MPVII); hongos entomopatógenos, tales como el hongo de la muscardina verde; y virus entomopatógenos que incluyen baculovirus, nucleopoliedrovirus (NPV) tales como HzNPV, AfNPV; y virus de la granulosis (GV) tales como CpGV.

Los compuestos de esta invención y sus composiciones se pueden aplicar a plantas transformadas genéticamente para expresar proteínas tóxicas para plagas de invertebrados (tales como endotoxinas delta de *Bacillus thuringiensis*). El efecto de los compuestos fungicidas aplicados exógenamente de esta invención puede ser sinérgico con las proteínas de las toxinas expresadas.

Las referencias generales para protectores agrícolas (es decir, insecticidas, fungicidas, nematocidas, acaricidas, herbicidas y agentes biológicos) incluyen The Pesticide Manual, 13ª edición, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2003 y The BioPesticide Manual, 2ª edición, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2001.

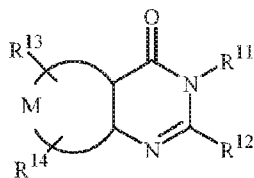
En determinados casos, las combinaciones de un compuesto de la presente invención con otros compuestos o agentes biológicamente activos (particularmente fungicidas) (es decir, principios activos) pueden dar como resultado un efecto superior al aditivo (es decir, sinérgico). Siempre es deseable reducir la cantidad de principios activos liberados en el medio ambiente y al mismo tiempo garantizar un control eficaz de las plagas. Cuando se produce sinergia de los principios activos fungicidas a tasas de aplicación que proporcionan niveles agrónomicamente satisfactorios de control fúngico, tales combinaciones pueden ser ventajosas para reducir el coste de producción de cultivos y disminuir la carga medioambiental.

Cabe destacar una combinación de un compuesto de fórmula 1 con al menos otro principio activo fungicida. Cabe destacar, en particular, una combinación en la que el otro principio activo fungicida tiene un sitio de acción diferente al del compuesto de Fórmula 1. En determinados casos, una combinación con al menos otro principio activo fungicida que tenga un espectro de control similar pero un sitio de acción diferente será particularmente ventajosa para la gestión de la resistencia. Por lo tanto, una composición de la presente invención puede comprender además una cantidad biológicamente eficaz de al menos un principio activo fungicida adicional que tenga un espectro de control similar pero un sitio de acción diferente.

Cabe destacar las composiciones que además del compuesto de Fórmula 1 incluyen al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en (1) fungicidas de alquilenbis(ditiocarbamato); (2) cimoxanilo; (3) fungicidas de fenilamida; (4) fungicidas de pirimidinona; (5) clorotalonilo; (6) carboxamidas que actúan en el complejo II del sitio de transferencia de electrones respiratorio mitocondrial fúngico; (7) quinoxifeno; (8) metrafenona; (9) ciflufenamida; (10) ciprodinilo; (11) compuestos de cobre; (12) fungicidas de ftalimida; (13) fosetil-aluminio; (14) fungicidas de bencimidazol; (15) ciazofamida; (16) fluazinam; (17) iprovalicarb; (18) propamocarb; (19) validomicina; (20) fungicidas de diclorofenildicarboximida; (21) zoxamida; (22) fluopicolida; (23) mandipropamida; (24) amidas de ácidos carboxílicos que actúan sobre la biosíntesis de fosfolípidos y la deposición de la pared celular; (25) dimetomorf; (26) inhibidores de la biosíntesis de esteroides distintos de DMI; (27) inhibidores de la desmetilasa en la biosíntesis de esteroides; (28) fungicidas del complejo *bc1*; y sales de los compuestos (1) a (28).

A continuación se proporcionan descripciones adicionales de clases de compuestos fungicidas.

Los fungicidas de pirimidinona (grupo (4)) incluyen compuestos de Fórmula A1



A1

en la que M forma un anillo de fenilo, tiofeno o piridina fusionado; R¹¹ es alquilo C₁-C₆; R¹² es alquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆; R¹³ es halógeno; y R¹⁴ es hidrógeno o halógeno.

Los fungicidas de pirimidinona se describen en la publicación de solicitud de patente PCT WO 94/26722 y las patentes de Estados Unidos 6.066.638, 6.245.770, 6.262.058 y 6.277.858. Cabe destacar los fungicidas de pirimidinona seleccionados del grupo: 6-bromo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona, 6,8-diyodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona, 6-yodo-3-propil-2-propiloxi-4(3H)-quinazolinona (proquinazida), 6-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, 6-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, 7-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-

d]pirimidin-4(3H)-ona, 6-bromo-2-propoxi-3-propilpirido[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, 6,7-dibromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-d]pirimidin-4(3H)-ona y 3-(ciclopropilmetil)-6-yodo-2-(propiltio)pirido[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona.

Los inhibidores de la biosíntesis de esteroides (grupo (27)) controlan los hongos al inhibir las enzimas en la vía de biosíntesis de esteroides. Los fungicidas inhibidores de la desmetilasa tienen un sitio de acción común dentro de la vía de biosíntesis de esteroides fúngicos, que implica la inhibición de la desmetilación en la posición 14 del lanosterol o 24-metilen dihidrolanosterol, que son precursores de los esteroides en los hongos. Los compuestos que actúan en este sitio a menudo se denominan inhibidores de la desmetilasa, fungicidas DMI o DMI. La enzima desmetilasa a veces recibe otros nombres en la literatura bioquímica, incluido citocromo P-450 (14DM). La enzima desmetilasa se describe, por ejemplo, en J. Biol. Chem. 1992, 267, 13175-79 y referencias citadas en el mismo. Los fungicidas DMI se dividen en varias clases químicas: azoles (incluidos triazoles e imidazoles), pirimidinas, piperazinas y piridinas. Los triazoles incluyen azaconazol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol (incluido diniconazol-M), epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, protioconazol, quinconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, triticonazol y uniconazol. Los imidazoles incluyen clotrimazol, econazol, imazalilo, isoconazol, miconazol, oxpoconazol, procloraz y triflumizol. Las pirimidinas incluyen fenarimol, nuarimol y triarimol. Las piperazinas incluyen triforina. Las piridinas incluyen butiobato y pirifenox. Las investigaciones bioquímicas han demostrado que todos los fungicidas mencionados anteriormente son fungicidas DMI tal como se describen por K.H. Kuck et al. en Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: Nueva York, 1995, 205-258.

Los fungicidas de complejo bc_1 (grupo 28) tienen un modo de acción fungicida que inhibe el complejo bc_1 en la cadena respiratoria mitocondrial. A veces se hace referencia al complejo bc_1 con otros nombres en la literatura bioquímica, incluido el complejo III de la cadena de transferencia de electrones y ubihidroquinona: citocromo *c* oxidorreductasa. Este complejo se identifica de forma única mediante el número de la Comisión Enzimática (*Enzyme Commission*) EC1.10.2.2. El complejo bc_1 se describe en, por ejemplo, J. Biol. Chem. 1989, 264, 14543-48; Methods Enzymol. 1986, 126, 253-71; y referencias citadas en el mismo. Se sabe que los fungicidas de estrobilurina tales como azoxiostrobrina, dimoxiostrobrina, enestroburina (SYP-Z071), fluoxaestrobrina, kresoxim-metilo, metominoestrobrina, orisaestrobrina, picoxiostrobrina, piracloestrobrina, pirametoestrobrina, piraoxiostrobrina y trifloxiostrobrina tienen este modo de acción (H. Sauter et al., Angew. Chem. Int. Ed 1999, 38, 1328-1349). Otros compuestos fungicidas que inhiben el complejo bc_1 de la cadena respiratoria mitocondrial incluyen famoxadona y fenamidona.

Los alquilenbis(ditiocarbamatos) (grupo (1)) incluyen compuestos tales como mancozeb, maneb, propineb y zineb. Las fenilamidas (grupo (3)) incluyen compuestos tales como metalaxilo, benalaxilo, furalaxilo y oxadixilo. Las carboxamidas (grupo (6)) incluyen compuestos tales como boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanilo, furametpir, mepronilo, oxicarboxina, tifulzamida, pentiopirad y N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (publicación de patente PCT WO 2003/010149), y se sabe que inhiben la función mitocondrial al alterar el complejo II (succinato deshidrogenasa) en la cadena respiratoria de transporte de electrones. Los compuestos de cobre (grupo (11)) incluyen compuestos tales como oxiclóruo de cobre, sulfato de cobre e hidróxido de cobre, incluyendo composiciones tales como mezcla de Burdeos (sulfato de cobre tribásico). Las ftalimidas (grupo (12)) incluyen compuestos tales como folpet y captán. Los fungicidas de bencimidazol (grupo (14)) incluyen benomilo y carbendazim. Los fungicidas de diclorofenildicarbóximida (grupo (20)) incluyen clozolinato, diclozolina, iprodiona, isovalediona, miclozolina, procimidona y vinclozolina.

Los inhibidores de la biosíntesis de esteroides distintos de DMI (grupo (26)) incluyen fungicidas de morfolina y piperidina. Las morfolininas y piperidinas son inhibidores de la biosíntesis de esteroides que se ha demostrado que inhiben etapas en la ruta de biosíntesis de esteroides en un punto posterior a las inhibiciones logradas por la biosíntesis de esteroides DMI (grupo (27)). Las morfolininas incluyen aldimorf, dodemorf, fenpropimorf, tridemorf y trimorfamida. Las piperidinas incluyen fenpropidina.

Cabe destacar además las combinaciones de compuestos de Fórmula 1 con azoxiostrobrina, kresoxim-metilo, trifloxiostrobrina, piracloestrobrina, picoxiostrobrina, dimoxiostrobrina, metominoestrobrina/fenominoestrobrina, carbendazim, clorotalonilo, quinoxifeno, metrafenona, ciflufenamida, fenpropidina, fenpropimorf, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, flusilazol, hexaconazol, ipconazol, metconazol, penconazol, propiconazol, proquinazida, protioconazol, tebuconazol, triticonazol, famoxadona, procloraz, pentiopirad y boscalid (nicobifeno).

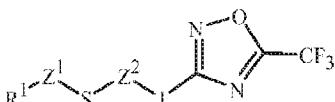
Para un mejor control de las enfermedades de las plantas provocadas por patógenos de plantas fúngicas (por ejemplo, una tasa de uso más baja o un espectro más amplio de patógenos de plantas controlados) o la gestión de la resistencia son preferidas mezclas de un compuesto de la presente invención con un fungicida seleccionado del grupo: azoxiostrobrina, kresoxim-metilo, trifloxiostrobrina, piracloestrobrina, picoxiostrobrina, dimoxiostrobrina, metominoestrobrina/fenominoestrobrina, quinoxifeno, metrafenona, ciflufenamida, fenpropidina, fenpropimorf, ciproconazol, epoxiconazol, flusilazol, metconazol, propiconazol, proquinazida, protioconazol, tebuconazol, triticonazol, famoxadona y pentiopirad.

Los siguientes ENSAYOS demuestran la eficacia de control de los compuestos de la presente invención sobre patógenos específicos. Sin embargo, la protección de control de patógenos proporcionada por los compuestos no se limita a estas especies. Véanse las Tablas de índices A-E para obtener descripciones de compuestos. En las Tablas de índices se usan las abreviaturas siguientes: Me significa metilo, Et significa etilo, *n*-Pr significa *n*-propilo, *i*-Pr significa *iso*-propilo, *c*-Pr significa ciclopropilo, *i*-Bu significa *iso*-butilo, Ph significa fenilo, MeO significa metoxi, EtO significa etoxi y Bn significa bencilo. La abreviatura "Comp." significa "Compuesto", y la abreviatura "Ej." significa "Ejemplo" y va seguida de un número que indica en qué ejemplo se prepara el compuesto. Los datos de los espectros de RMN de ¹⁹F se notifican en ppm con respecto a triclorofluorometano, en solución de CDCl₃ a menos que se indique lo contrario. Los experimentos de RMN de ¹⁹F se realizaron en un espectrómetro de RMN Bruker Avance III de 500 MHz, equipado con una sonda de 5 mm (1H/BBF). Los espectros de masas (EM) se notifican como el peso molecular del ion original cargado positivamente con mayor abundancia isotópica (M+1) formado por la adición de H⁺ (peso molecular de 1) a la molécula, o el ion cargado negativamente con mayor abundancia isotópica (M-1) formado por pérdida de H⁺ (peso molecular de 1), observado por espectrometría de masas mediante ionización por electropulverización (ESI).

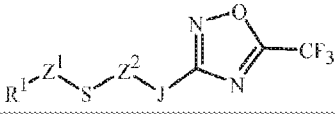
La definición de J en las Tablas de índices A-D se muestra en el Anexo B anterior, y el sustituyente R^{7a} unido al J es hidrógeno.

Los compuestos 25, 26, 32, 43, 46, 56, 60, 63, 66, 70-73, 75, 76, 78, 90, 93, 102, 103, 108, 111, 114, 115, 117 y 124 de la Tabla de índices B y los compuestos 118 y 130 de la Tabla de índices C son los compuestos de la invención. Todos los demás compuestos no lo son.

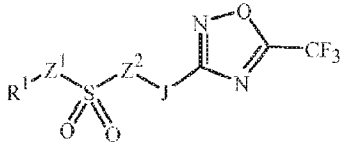
TABLA DE ÍNDICES A



Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	¹⁹ F RMN
1	Et	-	-	J-80	-65,23
2	Et	-	-	J-64	-65,69
5	CF ₃ CH ₂	-	-	J-80	-65,22, -66,19
6	Et	-	-	J-79	-65,56
19	Me	-	-	J-64	-65,32
33	MeOC(=O)CH ₂	-	-	J-64	-65,25
38	4-Cl-Ph	-	-	J-64	-65,28
49	CF ₃ CH ₂	-	-	J-64	-65,28, -66,48
52	Ph	-	-	J-64	-65,29
57	CH ₂ =CHCH ₂	-	-	J-64	-65,32
58	<i>n</i> -Pr	-	-	J-64	-65,25



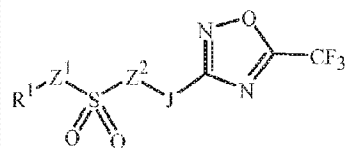
Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	¹⁹ F RMN
67	<i>i</i> -Pr	-	-	J- 64	- 65,33
69	<i>i</i> -Bu	-	-	J- 64	- 65,33
81	Bn	-	-	J- 64	- 65,31
89	Me	-	-	J- 66	- 65,21
116 (Ej. 3)	Me	-	-	J- 63	- 65,37
174	Me	-	-	J- 40	- 65,26
175	EtOC=OCH ₂	-	CH ₂	J- 63	- 65,36
178	MeOC=OCH ₂	-	CH ₂	J- 63	- 65,37
184	PhCH ₂	-	CH ₂	J- 63	- 65,36
225	Me	-	CH ₂	J- 63	- 65,37
227	Et	-	CH ₂	J- 63	- 65,37
229	<i>n</i> -Pr	-	CH ₂	J- 63	- 65,36
232	<i>i</i> -Pr	-	CH ₂	J- 63	- 65,42
235	<i>i</i> -Bu	-	CH ₂	J- 63	- 65,37
236	<i>n</i> -Bu	-	CH ₂	J- 63	- 65,43
243	CH=CCH ₂	-	CH ₂	J- 63	- 65,35
246	MeOC=OCH ₂ CH ₂	-	CH ₂	J- 63	- 65,36
249	EtOC=OCH ₂ CH ₂	-	CH ₂	J- 63	- 65,38

TABLA DE ÍNDICES B


Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	MS	¹⁹ F RMN
4	Et	-	-	J-64		-65,16
7	2-CF ₃ -Ph	NH	-	J-63		-60,12, -65,33
8	3-Cl-Ph	NH	-	J-63		-65,30
9	3-CF ₃ -Ph	NH	-	J-63		-62,84, -65,30
10	2,4-di-Cl-Ph	NH	-	J-63		-65,29
11	4-Me-Ph	NH	-	J-63		-65,31
12	4-F-Ph	NH	-	J-63		-65,30, - 114,78
13	4-Cl-Ph	NH	-	J-63		-65,30
14	2-Cl-Ph	NH	-	J-63		-65,30
15	4-CF ₃ -Ph	NH	-	J-63		-62,42, -65,32
16	4-Br-Ph	NH	-	J-63		-65,30
17	4-I-Ph	NH	-	J-63		-65,29
18	2,4-di-F-Ph	NH	-	J-63		-65,31, - 110,42, - 123,11
21	Me	-	-	J-64		-65,15
22	Ph	-	-	J-27		-65,34
23	Me	-	-	J-79		-65,17
24	Me	-	-	J-78		-65,14
25	(MeO) ₂ CHCH ₂	NH	-	J-63		-65,26
26 (Ej. 9)	Me	-	NH	J-63		-65,35
27	Et	-	NH	J-63		-65,35



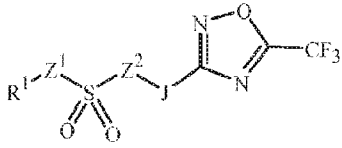
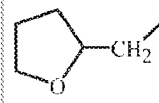
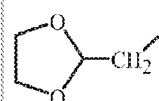
Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	MS	¹⁹ F RMN
28	Ph	N(Me)	-	J-63		-65,29
29	Ph	N(Et)	-	J-63		-65,29
30	Ph	N(CH ₂ CH=CH ₂)	-	J-63		-65,29
31	Ph	N(C(=O)OMe)	-	J-63		-65,25
32	Ph	-	N(Me)	J-63		-65,42
35	MeOC(=O)CH ₂	-	-	J-64		-65,15
36	3-Cl-Ph	-	-	J-64		-65,17
37	4-Cl-Ph	-	-	J-64		-65,17
39	2-F-4-CF ₃ -Ph	NH	-	J-63		-62,56, -65,30, - 127,83
40 (Ej. 2)	Me	NH	-	J-63		-65,30
41	Me	N(Me)	-	J-63		-65,29
42	2,6-di-Cl-Ph	NH	-	J-63		-65,27
43	Ph	-	NH	J-63		-65,34
44	2,4,6-tri-Cl-Ph	NH	-	J-63		-65,27
45	Ph	-	NH	J-77		-65,36
46	CH ₃ C(=O)	N(Me)	-	J-63		-65,24
47	2,6-di-F-Ph	NH	-	J-63		-65,30, - 117,90
48	3,4-di-Cl-Ph	NH	-	J-63		-65,30
50	CF ₃ CH ₂	-	-	J-64		-60,92, -65,14
54	Ph	-	-	J-64		-65,18

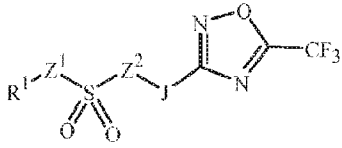
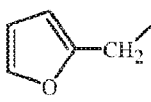
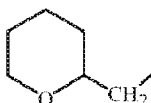
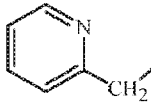
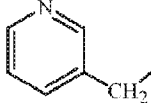
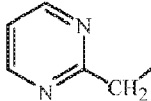
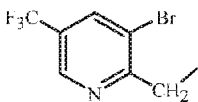


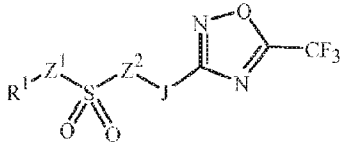
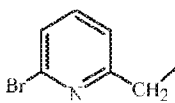
Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	MS	¹⁹ F RMN
55	2,5-di-Cl-Ph	NH	-	J-63		-65,30
56	3,5-di-Cl-Ph	NH	-	J-63		-65,31
59	n-Pr	-	-	J-64		-65,22
60	CH ₂ =CHCH ₂	-	-	J-64		-65,23
61	Ph	-	-	J-73		-65,37
62	Ph	NH	-	J-77		-65,38
63	Ph	-	NH	J-64		-65,28
64	Bn	-	-	J-73		-65,39
65	Et	-	-	J-27		-65,33
66	4-EtOC(=O)-Ph	NH	-	J-63		-65,29
68	<i>i</i> -Pr	-	-	J-64		-65,16
70	<i>i</i> -Bu	-	-	J-64		-65,17
71	4-F-Ph	-	NH	J-64		-65,17, - 103,46
72	4-Me-Ph	-	NH	J-64		-65,29
73	2-Cl-Ph	-	NH	J-64		-65,25
74	3-Cl-Ph	-	NH	J-64		-65,23
75	4-Cl-Ph	-	NH	J-64		-65,27
76	4-MeO-Ph	-	NH	J-64		-65,28
77	4-CF ₃ O-Ph	-	NH	J-64		-58,51, -66,50 ^a
78	Me	-	NHCH ₂	J-63		-65,35
79	CF ₃ CH ₂	-	NH	J-63		-63,32, -65,33



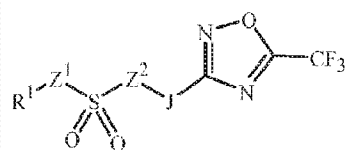
Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	MS	¹⁹ F RMN
82	Bn	-	-	J-64		-65,10
83	3-CF ₃ -Ph	-	NH	J-64		-63,40, -66,48 ^a
84	4-CF ₃ -Ph	-	NH	J-64		-63,67, -66,50 ^a
85	2-CF ₃ -Ph	-	NH	J-64		-57,87, -65,30
86	ClCH ₂	-	NH	J-63		-65,33
88	Et	NH	-	J-63		-65,29
90	Ph	-	NHCH ₂	J-63		-65,36
91	Et	N(Me)	-	J-63		-65,30
92	Et	N(Et)	-	J-63		-65,30
93	3-Cl-Ph	-	NH	J-63		-65,38
94	Me	N(OMe)	-	J-63		-65,25
95	Et	N(OMe)	-	J-63		-65,29
96	ClCH ₂	-	-	J-63		-65,35
99	n-Pr	NH	-	J-63		-65,30
100	Ph	NH	-	J-63		-65,31
101	Me	-	-	J-73		-65,34
102	2-Cl-Ph	-	NH	J-63		-65,27
103	2-CF ₃ -Ph	-	NH	J-63		-57,98, -65,41
104	4-Cl-Ph	-	NH	J-63		-65,40
105	3-CF ₃ -Ph	-	NH	J-63		-63,01, -65,43
106	4-CF ₃ -Ph	-	NH	J-63		-63,29, -65,40
107	Me	-	O	J-64		-65,24

						
Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	MS	¹⁹ F RMN
108 (Ej. 8)	Me	-	O	J-63		-65,33
109	i-Pr	NH	-	J-63		-65,32
110	Cl ₃ C	-	-	J-63		-65,30
111	CH ₃ C(=O)	N(OMe)	-	J-63		-65,24
112	Me	-	-	J-66		-65,03
113	CF ₃	-	-	J-63		-65,18, -77,92
114	CH ₃ C(=O)	N(Et)	-	J-63		-65,24
115	Et	-	CH ₂	J-63		-65,32
117 (Ej. 5)	Me	-	-	J-63		-65,26
119	Cl ₂ CH	-	-	J-63		-65,23
120	4-Me-Ph	-	NH	J-63		-65,41
121	4-F-Ph	-	NH	J-63		-65,42, -103,23
122	4-MeO-Ph	-	NH	J-63		-65,40
123	4-CF ₃ O-Ph	-	NH	J-63		-57,52, -65,40
124 (Ej. 1)	Me	-	CH ₂	J-63		-65,33
125	Ph	-	CH ₂	J-63		-65,28
126		NH	-	J-63		-65,28
127		NH	-	J-63		-65,28

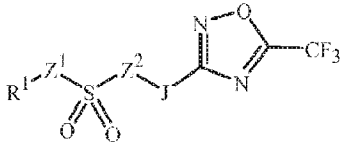
						
Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	MS	¹⁹ F RMN
128		N(Me)	-	J-63		-65,28
129	MeOCH ₂ CH ₂	NH	-	J-63		-65,30
131	4-MeO-Ph	NH	-	J-63		-65,31
132	MeOCH ₂ CH ₂ CH ₂	NH	-	J-63		-65,29
134	<i>c</i> -Pr	-	CH ₂	J-63		-65,33
138		NH	-	J-63		-65,28
139		NH	-	J-63		-65,28
140		NH	-	J-63		-65,26
142		NH	-	J-63		-65,26
144	<i>c</i> -Pr	-	NH	J-63		-65,35
145	Me	N(Me)	CH ₂	J-63		-65,34
146	Me	NH	CH ₂	J-63		-65,33
149		NH	-	J-63		-62,26, -65,29

						
Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	MS	¹⁹ F RMN
151		NH	-	J-63		-65,24
154	CH=CCH ₂	NH	CH ₂	J-63		-65,33
155	<i>c</i> -Pr	-	NH	J-64		-65,28
156	Me	-	NH	J-64		-65,29
158	<i>c</i> -Pr	-	N(Me)CH ₂	J-63		-65,35
159	CH ₂ =CHCH ₂	NH	CH ₂	J-63		-65,34
160	<i>n</i> -Pr	NH	CH ₂	J-63		-65,33
164	Me	-	N(Me)CH ₂	J-63		-65,38
165	Me	-	N(C=OMe)CH ₂	J-63		-65,41
166	Et	-	N(Me)CH ₂	J-63		-65,39
167	Et	-	N(C=OMe)CH ₂	J-63		-65,35
168	Me	-	NHCH ₂	J-40		-65,39
170	Et	-	-	J-60		-65,32
171	Ph	-	-	J-60		-65,30
172	Et	-	NHCH ₂	J-63		-65,33
173	<i>c</i> -Pr	-	NHCH ₂	J-63		-65,33
177	EtOC=OCH ₂	-	CH ₂	J-63		-65,30
180	MeOC=OCH ₂	-	CH ₂	J-63		-65,35

Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	MS	¹⁹ F RMN
181		-	-	J-63	418 (ES)	
182	Me	-	CH ₂ CH ₂	J-27		-65,40
183	Me	-	(CH ₂) ₃	J-27		-65,41
186	PhCH ₂	-	CH ₂	J-63		-65,30
187		NH	-	J-63		-65,26
188		NH	-	J-63		-65,26
189		NH	-	J-63		-65,27
190		NH	-	J-63		-65,27
191		NH	-	J-63		-65,23
192		NH	-	J-63		-65,27
196	Ph	NH	-	J-64	369 (ES)	
197	Me	-	N(Me)	J-63		-65,36

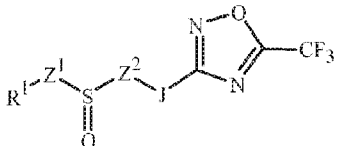


Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	MS	¹⁹ F RMN
198	<i>c</i> -Pr	-	N(Me)	J-63		-65,37
200	(MeO) ₂ CHCH ₂	NH	CH ₂	J-63		-65,34
201	<i>i</i> -Bu	NH	CH ₂	J-63		-65,33
203	Me	-	N(SO ₂ Me)	J-40	390 (ES)	
204	Et	N(Me)	CH ₂	J-63		-65,41
205	<i>c</i> -Pr	N(Me)	CH ₂	J-63		-65,34
207	Me	N(OMe)	-	J-63		-65,36
208	<i>c</i> -Pr	NH	CH ₂	J-63		-65,33
209	MeOCH ₂ CH ₂	NH	CH ₂	J-63		-65,34
210	<i>i</i> -Pr	NH	CH ₂	J-63		-65,41
211	Et	NH	CH ₂	J-63		-65,34
213	Me	-	NH	J-40	312 (ES)	
214	Me	-	CH ₂	J-40		-65,37
216	Me	-	(CH ₂) ₃	J-63		-65,40
217	Et	-	(CH ₂) ₃	J-63		-65,38
218	<i>c</i> -Pr	-	(CH ₂) ₃	J-63		-65,38
219	Me	-	CH ₂	J-74		-66,35
220	Et	-	CH(Ph)	J-63		-65,31
221	<i>n</i> -Pr	-	NHCH ₂	J-63		-65,36
222	Me	-	CH ₂ CH ₂	J-63		-65,36
223	Me	-	CH ₂ CH ₂	J-73		-65,42
224	Me	-	(CH ₂) ₃	J-73		-65,46

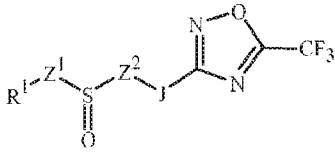


Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	MS	¹⁹ F RMN
231	<i>n</i> -Pr	-	CH ₂	J-63		-65,31
234	<i>i</i> -Pr	-	CH ₂	J-63		-65,37
237	Et	-	CH ₂ CH ₂	J-63		-65,36
238	<i>c</i> -Pr	-	CH ₂ CH ₂	J-63		-65,36
240	<i>i</i> -Bu	-	CH ₂	J-63		-65,33
242	<i>n</i> -Bu	-	CH ₂	J-63		-65,33
245	CH=CCH ₂	-	CH ₂	J-63		-65,35
248	MeOC(=O)CH ₂ CH ₂	-	CH ₂	J-63		-65,33
251	EtOC(=O)CH ₂ CH ₂	-	CH ₂	J-63		-65,30
a. Ejecución de RMN de ¹⁹ F en acetona- <i>d</i> ₆						

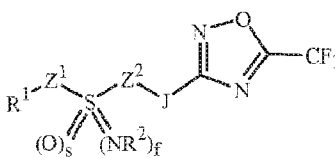
TABLA DE ÍNDICES C



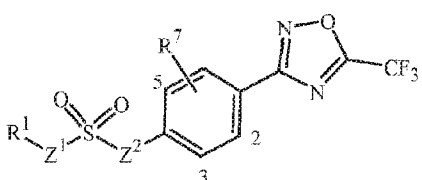
Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	RMN de ¹⁹ F
3	Et	-	-	J-64	-65,22
20	Me	-	-	J-64	-65,15
34	MeOC(=O)CH ₂	-	-	J-64	-65,21
51	CF ₃ CH ₂	-	-	J-64	-60,57, -65,18
53	Ph	-	-	J-64	-65,24
97	ClCH ₂	-	-	J-63	-65,29



Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	J	RMN de ¹⁹ F
118 (Ej. 4)	Me	-	-	J-63	-65,30
130	Cl ₂ CH	-	-	J-63	-65,26
176	EtOC=OCH ₂	-	CH ₂	J-63	-65,33
179	MeOC=OCH ₂	-	CH ₂	J-63	-65,40
185	PhCH ₂	-	CH ₂	J-63	-65,38
226	Me	-	CH ₂	J-63	-65,36
228	Et	-	CH ₂	J-63	-65,39
230	<i>n</i> -Pr	-	CH ₂	J-63	-65,34
233	<i>i</i> -Pr	-	CH ₂	J-63	-65,33
239	<i>i</i> -Bu	-	CH ₂	J-63	-65,38
241	<i>n</i> -Bu	-	CH ₂	J-63	-65,45
244	CH=CCH ₂	-	CH ₂	J-63	-65,37
247	MeOC(=O)CH ₂ CH ₂	-	CH ₂	J-63	-65,36
250	EtOC(=O)CH ₂ CH ₂	-	CH ₂	J-63	-65,38

TABLA DE ÍNDICES D


Comp.	R ¹	Z ¹	s	f	R ²	Z ²	J	RMN de ¹⁹ F
80 (Ej. 6)	Me	-	0	1	C≡N	-	J-63	-65,26
87 (Ej. 7)	Me	-	1	1	C≡N	-	J-63	-65,19

TABLA DE ÍNDICES E


Comp.	R ¹	Z ¹	Z ²	R ⁷	EM	RMN de ¹⁹ F
136	Me	-	-	3-NO ₂		-65,20
137	Me	-	-	3-CF ₃		-56,97, -65,22
147	Me	-	-	2-Cl	327 (ES ⁺)	
148	Me	-	NH	3-Cl	340 (ES ⁺)	
157	Me	-	-	3-Cl		-65,28
161	Me	-	-	3-F		-65,28
162	Me	-	-	3-MeO		-65,28
163	Me	-	-	3-Me		-65,32
169	Me	-	-	3-MeSO ₂	369 (ES ⁻)	
193	Me	NH	-	3-Cl	340 (ES ⁻)	
194	Me	-	NH	2-Cl	342 (ES ⁻)	
195	Me	-	-	2-Br	370 (ES ⁻)	
202	Me	-	-	2-Me	307 (ES ⁻)	
212	Me	-	-	2-MeO		-65,21
215	Me	-	-	2-NO ₂		-63,20

EJEMPLOS BIOLÓGICOS DE LA INVENCION

5 Protocolo general para preparar suspensiones de ensayo para los Ensayos A-E: los compuestos de ensayo se disolvieron en primer lugar en acetona en una cantidad igual al 3% del volumen final y después se suspendieron a la concentración deseada (en ppm) en acetona y agua purificada (mezcla 50/50 en volumen) que contenía 250 ppm del tensoactivo PEG400 (ésteres de alcohol polihidroxílico). Las suspensiones de ensayo resultantes se usaron después en los Ensayos A-E. La pulverización de una suspensión de ensayo de 200 ppm hasta el punto de escurrimiento de las plantas de ensayo fue equivalente a una dosis de 800 g/ha.

ENSAYO A

15 La solución de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre plántulas de soja. Al día siguiente, las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Phakopsora pachyrhizi* (el agente causal de la roya asiática de la soja), y se incubaron en una atmósfera saturada a 22 °C durante 24 h, y después se trasladaron a una cámara de crecimiento a 22 °C durante 8 días, tras lo cual se realizaron calificaciones visuales de la enfermedad.

ENSAYO B

20 La solución de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre plántulas de uva. Al día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Plasmopara viticola* (el agente causal del mildiú veloso de la uva) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 h, y después se trasladaron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 6 días, y se incubaron nuevamente en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 h, tras lo cual se realizaron calificaciones de la enfermedad.

ENSAYO C

30 La solución de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre plántulas de trigo. Al día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Zymoseptoria tritici* (el agente causal de la mancha foliar

del trigo) y se incubaron en una atmósfera saturada a 24 °C durante 48 h, y después se trasladaron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 17 días, tras lo cual se realizaron calificaciones de la enfermedad.

ENSAYO D

La solución de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre plántulas de trigo. Al día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (el agente causal de la roya de la hoja del trigo) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20 °C durante 24 h, y después se trasladaron a una cámara de crecimiento a 20 °C durante 6 días, tras lo cual se realizaron calificaciones de la enfermedad.

ENSAYO E

La solución de ensayo se pulverizó hasta el punto de escurrimiento sobre plántulas de trigo. Al día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*, (el agente causal del mildiú pulverulento del trigo) y se incubaron en una cámara de crecimiento en una atmósfera saturada a 20 °C durante 8 días, tras lo cual se realizaron las calificaciones de la enfermedad.

Los resultados de los Ensayos A-E se proporcionan en la Tabla A. En la tabla, una calificación de 100 indica el 100% de control de la enfermedad y una calificación de 0 indica ningún control de la enfermedad (con respecto a los controles). A menos que se indique lo contrario, la clasificación a la que se utilizó la suspensión de ensayo se muestra en la columna titulada "Tasa en ppm". Un asterisco "*" junto al valor de clasificación indica que se utilizó una suspensión de ensayo de 50 ppm (por ejemplo, Ensayo A para los compuestos números 7, 8, 10, 11, 12, 15, 43, 53, 54, 61 y 72). En la Tabla A, los compuestos 25, 26, 32, 43, 46, 56, 60, 63, 66, 70-73, 75, 76, 78 90, 93, 102, 103, 108, 111, 114, 115, 117, 118, 124 y 130 son los compuestos de la invención. Todos los demás compuestos no lo son.

TABLA A

Compuesto N°	Tasa en ppm	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E
1	200	-	15	0	38	0
2	120	-	3	0	0	0
3	50	-	0	4	80	0
4	250	99	8	0	100	0
5	200	-	0	0	0	0
6	200	-	0	0	0	0
7	250	100*	38	4	99	0
8	250	99*	19	20	99	0
9	250	95	52	25	86	0
10	250	99*	71	81	99	13
11	250	80*	0	7	95	0
12	250	92*	2	0	86	0
13	250	94	1	0	92	0
14	250	100	52	35	99	13
15	250	80*	45	35	92	0
16	250	96	-	33	95	0
17	250	94	-	0	89	0
18	250	100	-	62	91	0
19	250	0	-	0	55	0
20	250	100	-	0	100	48
21	250	100	-	0	100	0
22	250	100	-	0	55	0
23	50	0	-	-	9	-
24	250	19	-	0	0	0

ES 2 968 172 T3

Compuesto N°	Tasa en ppm	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E
25	50	100	-	-	100	-
26	250	100	-	97	100	0
27	25	92	-	-	-	-
28	250	100	0	0	0	0
29	250	-	52	10	0	0
30	250	0	9	2	28	0
31	250	-	5	2	0	0
32	250	100	-	86	98	0
33	250	86	-	0	0	0
34	250	96	-	0	94	0
35	250	99	-	0	98	0
36	250	100	-	58	99	0
37	250	100	-	0	99	0
38	250	100	-	0	99	0
39	250	95	-	72	95	0
40	250	100	-	85	100	0
41	250	100	-	0	100	0
42	250	100	-	8	68	0
43	250	100*	86	61	100	0
44	250	13	-	0	0	0
45	250	67	-	66	19	0
46	50	100	-	-	100	-
47	250	100	-	0	92	0
48	250	100	-	86	94	0
49	250	-	13	0	0	0
50	250	-	2	0	74	0
51	250	-	1	0	0	0
52	250	100	6	0	100	0
53	250	100*	33	51	100	0
54	250	100*	14	0	100	0
55	250	100	-	94	98	56
56	250	93	-	84	86	0
57	250	-	2	0	0	0
58	250	-	2	0	0	0
59	250	100	3	3	100	27
60	250	100	2	0	100	0
61	250	100*	27	83	100	0
62	250	99	16	98	74	0
63	250	99	4	78	99	0
64	250	-	0	28	0	0

ES 2 968 172 T3

Compuesto N°	Tasa en ppm	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E
65	250	-	12	0	0	0
66	250	99	-	71	94	0
67	250	-	11	0	0	0
68	250	100	10	98	100	0
69	250	-	0	0	0	0
70	250	100	15	93	100	0
71	250	97	7	0	98	0
72	250	94*	6	0	95	0
73	250	100*	13	0	99	0
74	250	98*	27	0	98	0
75	250	95*	3	0	95	0
76	250	98*	14	0	94	0
77	250	-	2	0	95	0
78	250	100	-	96	100	0
79	250	93	-	0	80	81
80	250	100	-	84	100	0
81	250	0	4	11	68	0
82	250	96	0	23	74	0
83	250	-	9	0	90	0
84	250	-	-	-	0	0
85	250	94*	9	0	97	0
86	250	100*	-	44	96	76
87	250	100	-	0	100	0
88	250	100	-	93	100	0
89	250	37	-	0	0	0
90	250	100	-	0	99	0
91	250	100	-	0	100	0
92	250	100	-	0	99	0
93	208	100*	52	90	99	0
94	250	100	-	0	80	0
95	250	100	-	0	98	0
96	250	100	-	0	100	0
97	250	-	-	0	100	0
99	250	100		0	100	0
100	250	100*	31	42	99	0
101	250	-	23	56	84	0
102	250	100	-	0	100	0
103	250	100	-	96	100	21
104	250	100	-	0	99	0
105	212	-	60	89	68	0

ES 2 968 172 T3

Compuesto Nº	Tasa en ppm	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E
106	250	100	-	0	95	0
107	250	100	-	0	91	0
108	210	100*	31	0	100	0
109	250	100	-	0	100	0
110	250	100	-	0	55	0
111	250	100	-	0	100	81
112	250	100	-	86	84	0
113	250	-	0	0	0	0
114	250	100	-	21	100	96
115	250	100	-	52	100	0
116	250	96	14	0	95	0
117	250	100*	5	57	100	0
118	250	100*	14	53	100	0
119	250	100	-	0	100	0
120	250	100	-	0	99	0
121	250	100	-	85	99	0
122	250	100	-	0	99	0
123	250	100	-	0	96	0
124	250	100	-	0	100	0
125	250	100	-	0	68	0
126	250	100	-	0	100	0
127	250	100	-	0	100	0
128	250	100	-	0	100	0
129	-	-	-	-	-	-
130	250	100*	3	4	100	0
131	250	99*	1	15	95	0
132	250	-	-	-	-	-
134	25	100	-	-	-	-
136	260	34	-	29	67	0
137	270	0	-	14	67	0
138	260	100	-	2	100	0
139	260	100	-	2	100	0
140	260	100	-	0	100	84
142	260	100	-	0	100	0
144	10	98	-	-	0	-
145	10	100	-	-	97	-
146	10	100	-	-	99	-
147	255	100	-	3	97	0
148	260	100	-	59	99	0
149	250	36	-	0	68	0

ES 2 968 172 T3

Compuesto N°	Tasa en ppm	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E
151	250	99	-	16	100	0
154	10	100	-	-	98	-
155	50	98	-	-	98	-
156	50	99	-	-	99	-
157	260	100	-	42	100	0
158	10	100	-	-	99	-
159	10	100	-	-	68	-
160	10	100	-	-	88	-
161	255	100	-	2	100	0
162	255	99	-	88	95	0
163	270	100	-	79	99	27
164	10	100	-	-	99	-
165	10	100	-	-	100	-
166	10	100	-	-	99	-
167	10	100	-	-	100	-
168	50	100	-	-	100	-
169	250	50	-	15	55	0
170	260	0	-	17	28	0
171	260	99	-	34	99	0
172	10	100	-	-	100	-
173	10	100	-	-	98	-
174	250	0	-	0	92	0
175	50	100	-	-	94	-
176	10	96	-	-	80	-
177	10	89	-	-	23	-
178	50	99	-	-	74	-
179	10	95	-	-	55	-
180	10	38	-	-	0	-
181	50	95	-	-	68	-
182	250	13	-	51	0	0
183	250	48	-	67	0	0
184	50	100	-	-	100	-
185	10	100	-	-	99	-
186	10	100	-	-	80	-
187	250	99	-	0	95	0
188	250	100	-	4	99	0
189	250	100	-	0	100	0
190	250	100	-	0	100	0
191	250	99	-	81	86	0
192	250	99	-	0	99	0

ES 2 968 172 T3

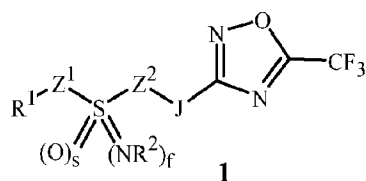
Compuesto N°	Tasa en ppm	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E
193	250	100	-	72	100	64
194	250	99	-	91	41	-
195	250	0	-	2	68	0
196	250	-	13	0	91	0
197	50	100	-	-	93	-
198	50	100	-	-	94	-
200	10	100	-	-	84	-
201	10	100	-	-	45	-
202	250	99	-	76	68	0
203	250	100	-	65	100	
204	10	100	-	-	83	-
205	10	100	-	-	92	-
207	10	100	-	-	95	-
208	10	100	-	-	95	-
209	10	100	-	-	84	-
210	10	100	-	-	86	-
211	10	100	-	-	55	-
212	265	11	-	0	67	0
213	270	59	-	30	55	0
214	265	100	-	96	100	0
215	255	13	-	0	0	0
216	10	100	-	-	100	-
217	10	100	-	-	100	-
218	10	100	-	-	99	-
219	10	0	-	-	0	-
220	250	100	-	97	100	0
221	10	100	-	-	83	-
222	10	100	-	-	99	-
223	50	0	-	-	0	-
224	50	0	-	-	0	-
225	10	94	-	-	68	-
226	10	99	-	-	99	-
227	50	100	-	-	91	-
228	10	100	-	-	99	-
229	50	100	-	-	95	-
230	10	100	-	-	99	-
231	50	100	-	-	100	-
232	50	100	-	-	94	-
233	10	100	-	-	100	-
234	10	100	-	-	99	-

ES 2 968 172 T3

Compuesto N°	Tasa en ppm	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E
235	50	100	-	-	86	-
236	50	100	-	-	94	-
237	10	100	-	-	99	-
238	10	100	-	-	100	-
239	10	100	-	-	91	-
240	10	100	-	-	68	-
241	10	100	-	-	96	-
242	10	100	-	-	86	-
243	50	100	-	-	98	-
244	10	100	-	-	97	-
245	250	100	-	100	100	0
246	10	100	-	-	55	-
247	10	100	-	-	74	-
248	10	100	-	-	55	-
249	10	98	-	-	41	-
250	10	99	-	-	68	-
251	10	92	-	-	68	-

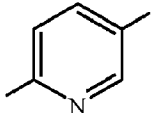
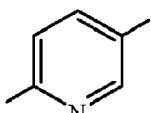
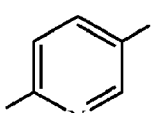
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de Fórmula 1:



en la que R¹, Z¹, s, f, Z² y J se definen de la forma siguiente, y en la que cuando J es un anillo de fenilo, el anillo está conectado a Z² y el anillo de oxadiazol en una orientación 1,4.

R ¹	Z ¹	s	f	Z ²	J
2-Cl-Ph	enlace directo	2	0	NH	fenilo
Cl ₂ CH	enlace directo	1	0	enlace directo	fenilo
Me	enlace directo	2	0	NH	fenilo
Ph	enlace directo	2	0	NH	fenilo
Et	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo
Me	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo
(MeO) ₂ CHCH ₂	NH	2	0	enlace directo	fenilo
Ph	enlace directo	2	0	N(Me)	fenilo
CH ₃ C(=O)	N(Me)	2	0	enlace directo	fenilo
3,5-di-Cl-Ph	NH	2	0	enlace directo	fenilo
CH ₂ =CHCH ₂	enlace directo	2	0	enlace directo	
Ph	enlace directo	2	0	NH	
4-EtOC(=O)-Ph	NH	2	0	enlace directo	fenilo
(Me) ₂ CHCH ₂	enlace directo	2	0	enlace directo	
4-F-Ph	enlace directo	2	0	NH	
4-Me-Ph	enlace directo	2	0	NH	

2-Cl-Ph	enlace directo	2	0	NH	
4-Cl-Ph	enlace directo	2	0	NH	
4-MeO-Ph	enlace directo	2	0	NH	
CH ₃	enlace directo	2	0	NHCH ₂	fenilo
Ph	enlace directo	2	0	NHCH ₂	fenilo
3-Cl-Ph	enlace directo	2	0	NH	fenilo
2-CF ₃ -Ph	enlace directo	2	0	NH	fenilo
Me	enlace directo	2	0	O	fenilo
CH ₃ C(=O)	N(OMe)	2	0	enlace directo	fenilo
CH ₃ C(=O)	N(Et)	2	0	enlace directo	fenilo
Me	enlace directo	2	0	enlace directo	fenilo
Me	enlace directo	1	0	enlace directo	fenilo

en el que el enlace de la piridina J que se proyecta hacia la izquierda está unido a Z², y el enlace que se proyecta hacia la derecha está unido al anillo de oxadiazol en la Fórmula 1.

- 5 2. Un compuesto de la reivindicación 1, en el que R¹, Z¹, s, f, Z² y J se definen de la forma siguiente, en el que J está conectado a Z² y el anillo de oxadiazol en una orientación 1,4.

R ¹	Z ¹	s	f	Z ²	J
Me	enlace directo	2	0	NH	fenilo
Ph	enlace directo	2	0	NH	fenilo
2-Cl-Ph	enlace directo	2	0	NH	fenilo
Et	enlace directo	2	0	CH ₂	fenilo
Me	enlace directo	2	0	CH ₂	Fenilo

- 10 3. Una composición fungicida que comprende (a) un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-2; y (b) al menos otro fungicida.

4. Una composición fungicida que comprende (a) un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-2; y (b) al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.

- 15 5. Un procedimiento para controlar enfermedades de las plantas provocadas por patógenos fúngicos de plantas que comprende aplicar a la planta o a una parte de la misma, o a la semilla de la planta, una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-2.

- 20 6. Un procedimiento para controlar enfermedades de las plantas provocadas por patógenos de plantas fúngicos oomicetos que comprende aplicar a la planta o a una parte de la misma, o a la semilla de la planta, una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1-2.