

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 383 308**

51 Int. Cl.:

A01N 43/80	(2006.01)	C07C 233/87	(2006.01)
A01N 43/78	(2006.01)	C07D 333/40	(2006.01)
A01N 43/76	(2006.01)	C07D 333/38	(2006.01)
A01N 43/56	(2006.01)	C07D 319/20	(2006.01)
A01N 43/36	(2006.01)	C07D 319/18	(2006.01)
A01N 43/32	(2006.01)		
A01N 43/30	(2006.01)		
A01N 43/10	(2006.01)		
A01N 43/08	(2006.01)		
A01N 37/20	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **05772560 .8**

96 Fecha de presentación: **10.08.2005**

97 Número de publicación de la solicitud: **1776011**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **25.04.2007**

54

Título: **Composición fungicida que contiene un derivado de amida de ácido**

30

Prioridad:
12.08.2004 JP 2004235634
17.06.2005 JP 2005178614

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:
20.06.2012

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:
20.06.2012

73

Titular/es:
ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.
3-15, EDOBORI 1-CHOME, NISHI-KU
OSAKA-SHI, OSAKA 550-0002, JP

72

Inventor/es:
NAKAMURA, Yuji,;
MITANI, Shigeru, y
YONEDA, Tetsuo,

74

Agente/Representante:
Ungría López, Javier

ES 2 383 308 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

Composición fungicida que contiene un derivado de amida de ácido

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a una composición fungicida que contiene un derivado de amida de ácido.

10 **Antecedentes de la técnica**

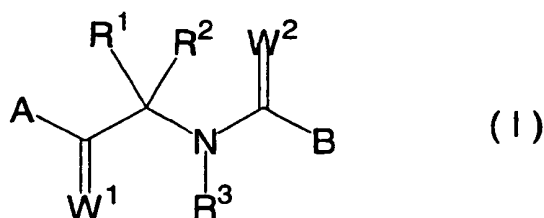
El documento W000/73290 revela isotiazolcarboxamidas y su uso como microbiocidas. Las benzotiazolonas 3,7-disustituidas se conocen por el documento EP-A 0 334134. Los documentos W02001/60783 y W02003/2705 revelan que los derivados de amida de ácido que tienen ciertas estructuras químicas son útiles como ingredientes activos para plaguicidas, pero no se menciona que los compuestos de fórmula (I) dados en lo sucesivo tengan actividades fungicidas. Por otro lado, la solicitud de patente japonesa n.º 2003-420864 de los presentes solicitantes revela una composición fungicida que contiene un derivado de amida de ácido como ingrediente activo, pero el compuesto ingrediente activo de dicha composición es diferente del compuesto de fórmula (I) dado en lo sucesivo en la presente memoria.

Muchas composiciones fungicidas convencionales han tenido problemas en la práctica, tales como la falta de idoneidad de un efecto preventivo o curativo, que el efecto residual tiende a ser inadecuado o que el efecto de control contra las enfermedades vegetales tiende a ser inadecuado en función de su zona de aplicación. Por consiguiente, se desea una composición fungicida que resuelva dichos problemas.

25 **Revelación de la invención**

Los presentes inventores han realizado una investigación para solventar los problemas anteriores y como resultado de ella han descubierto que una composición fungicida que contiene un derivado de amida de ácido de fórmula (I) dado en lo sucesivo en la presente memoria presenta excelentes efectos preventivos y curativos contra diversas enfermedades provocadas por diversos hongos nocivos tales como *Oomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* o *Deuteromycetes* y, que al mismo tiempo, tienen actividades residuales prácticamente satisfactorias. La presente invención se ha realizado en base a este descubrimiento.

Concretamente, la presente invención proporciona una composición fungicida que contiene un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales como ingrediente activo:



en la que:

- 40 A es fenilo que puede estar sustituido con X, benzodioxolanilo que puede estar sustituido con X o benzodioxanilo que puede estar sustituido con X;
- B es furilo que puede estar sustituido con Y o tienilo que puede estar sustituido con Y,
- Cada R^1 y R^2 es alquilo o
- 45 R^1 y R^2 pueden formar juntos un anillo de carbonos saturado de 3 a 6 miembros;
- X es flúor, cloro, yodo, alquilo, haloalquilo, alcoxilo o haloalcoxilo;
- Y es halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilo o haloalcoxilo;
- R^3 es hidrógeno; y
- 50 Cada W^1 y W^2 es oxígeno.

La presente invención también proporciona una composición fungicida mixta que comprende un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales y otro compuesto fungicidamente activo como ingredientes activos.

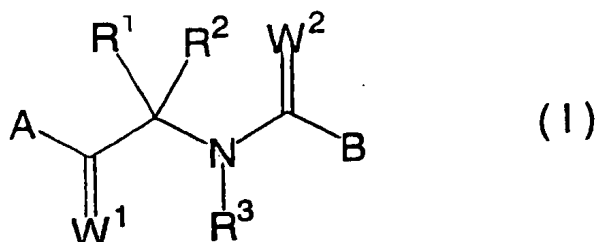
55 La presente invención también proporciona un procedimiento para el control de hongos nocivos que comprende aplicar una cantidad eficaz de un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales.

La presente invención también proporciona un procedimiento para el control de enfermedades vegetales que comprende aplicar una cantidad eficaz de un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales.

5 La presente invención también proporciona un procedimiento para proteger cultivos de plantas que comprende aplicar una cantidad eficaz de un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales.

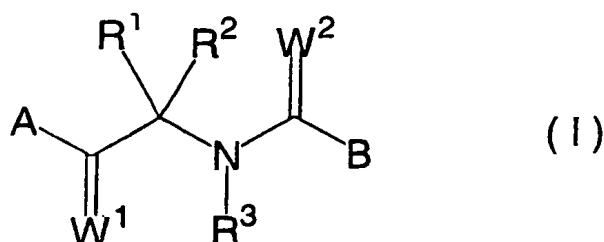
La presente invención también proporciona un procedimiento mejorar la producción de cultivos que comprende aplicar una cantidad eficaz de un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales.

10 La presente invención también proporciona un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales:



15 en la que A es fenilo que puede estar sustituido con X, benzodioxolanilo que puede estar sustituido con X o benzodioxanilo que puede estar sustituido con X; B es furilo que puede estar sustituido con Y o tienilo que puede estar sustituido con Y, cada uno de R¹ y R² es alquilo o R¹ y R² pueden formar juntos un anillo de carbonos saturado de 3 a 6 miembros; X es flúor, cloro, yodo, alquilo, haloalquilo, alcoxilo o haloalcoxilo; Y es halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilo o haloalcoxilo; R³ es hidrógeno; y cada uno de W¹ y W² es oxígeno.

20 La presente invención también proporciona un uso de un derivado de amida de ácido de la siguiente fórmula (I) o una de sus sales como fungicida agrícola u hortícola para controlar hongos nocivos seleccionados entre *Oomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* o *Deuteromycetes*:



25 en la que:

A es fenilo que puede estar sustituido con X, naftilo que puede estar sustituido con X, anillo heterocíclico que puede estar sustituido con X o anillo heterocíclico fusionado que puede estar sustituido con X; B es anillo heterocíclico de 5 miembros, que está sustituido con Y; X es halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, dialquilaminoalquilo, alquilo, trialkilsililalquilo, hidroxilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alcoxialcoxilo, cicloalquilo, nitro, fenilo, fenilalquilo, piridiloxilo que puede estar sustituido con haloalquilo, alquilcarboniloxilo, alquilsulfoniloxilo o anillo heterocíclico (el anillo heterocíclico puede estar sustituido con halógeno, alquilo o alquilcarbonilo); Y es halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, cicloalquilo o formilo; cada uno de R¹ y R², que son independientes entre sí, es hidrógeno o alquilo; R³ es hidrógeno, alquilo, alquilcarbonilo o alcoxycarbonilo; y cada uno de W¹ y W², que son independientes entre sí, es oxígeno o azufre.

En la fórmula anterior (I), el número de sustituyentes X contenido en A puede ser uno o más, y en el caso de que sea más de uno, dichos sustituyentes pueden ser iguales o diferentes. El número de sustituyentes Y contenidos en B puede ser uno o más, y en el caso de que sea de más de uno, dichos sustituyentes pueden ser iguales o diferentes. El número de halógeno, alquilo o alquilcarbonilo que sea/n sustituyente/s en el anillo heterocíclico contenido en X puede ser de uno o más de uno, y en el caso de que sea de más de uno, dichos sustituyentes pueden ser iguales o diferentes.

El anillo heterocíclico de A, B o X es, preferentemente, un anillo heterocíclico de 3, 5 ó 6 miembros que contiene de 1 a 4 átomos de al menos un tipo seleccionado del grupo que consiste en O, S y N, y puede ser, por ejemplo, un anillo heterocíclico de 3 miembros, tal como oxiranilo; anillo heterocíclico de 5 miembros, tal como furilo, tetrahydrofurilo, tienilo, pirrolilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, dioxolanilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, imidazolinilo, imidazolidinilo, pirazolilo, pirazolinilo, pirazolidinilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo o tetrazolilo; un anillo

heterocíclico de 6 miembros, tal como piranilo, piridilo, piperidinilo, dioxanilo, oxazinilo, morfolinilo, tiazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piperazinilo o triazinilo.

- 5 El anillo heterocíclico fusionado de A es, preferentemente, un anillo heterocíclico fusionado de 8 a 10 miembros que contiene de 1 a 4 átomos de al menos un tipo seleccionado del grupo que consiste en O, S y N, y puede ser, por ejemplo, benzofuranilo, isobenzofuranilo, dihidrobenzofuranilo, dihidroisobenzofuranilo, benzotienilo, isobenzotienilo, dihidrobenzotienilo, dihidroisobenzotienilo, tetrahidrobenzotienilo, indolilo, isoindolilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, indazolilo, bencimidazolilo, benzodioxolanilo, benzodioxanilo, cromenilo, cromanilo, isocromanilo, cromonilo, cromanonilo, quinolilo, isoquinolilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, indolizínilo, quinolizínilo, imidazopiridilo, naftiridinilo, pteridinilo, dihidrobenzoxazinilo, dihidrobenzoxazolinonilo, dihidrobenzoxazinonilo o benzotioxanilo.

- 15 El alquilo o resto alquilo de X, Y o R¹ a R³ puede ser lineal o ramificado y, como ejemplo específico del mismo, cabe mencionar alquilo C₁₋₇, tal como metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, *terc*-butilo, pentilo, hexilo o heptilo.

El cicloalquilo o el resto cicloalquilo de X o Y, puede ser uno que tenga de 3 a 6 átomos de carbono, tal como ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo. Además, un ejemplo específico del anillo carbocíclico saturado de 3 a 6 miembros que pueden formar juntos R¹ y R² puede ser ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

- 20 El alquinilo o resto alquinilo de X, puede ser uno lineal o ramificado que tenga de 2 a 7 átomos de carbono, tal como etinilo, 2-butinilo, 2-pentinilo, 3-hexinilo o 4-dimetil-2-pentinilo.

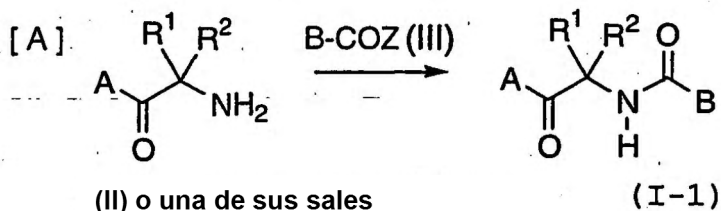
- 25 El halógeno o el halógeno como sustituyente de A, X o Y puede ser un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo. El número de sustituyentes de halógeno puede ser de uno o más, y en el caso de que sea de más de uno, dichos halógenos pueden ser iguales o diferentes. Además, dichos halógenos pueden estar sustituidos en cualquier posición.

- 30 La sal del derivado de amida de ácido de la fórmula (I) anterior puede ser cualquier sal siempre y cuando sea agrícolamente aceptable. Por ejemplo, puede ser una sal de metal alcalino, tal como una sal sodio o una sal potasio; una sal de metal alcalinotérreo, tal como una sal magnesio o una sal calcio; una sal de ácido inorgánico, tal como un clorhidrato, un perclorato, un sulfato o un nitrato; o una sal de ácido orgánico, tal como un acetato o un metanosulfonato.

- 35 El derivado de amida de ácido de la fórmula (I) anterior tiene diversos isómeros, tales como isómeros ópticos o isómeros geométricos, y la presente invención incluye ambos isómeros y las mezclas de dichos isómeros. Además, la presente invención también incluye diversos isómeros distintos de los anteriores isómeros que pertenezcan al conocimiento del campo técnico pertinente. Además, en función de los tipos de isómeros, pueden tener estructuras químicas diferentes de la fórmula (I) anterior, perteneciendo al ámbito de la presente invención, pues es evidente para los expertos en la técnica que se trata de isómeros.

- 40 El derivado de amida de ácido de la fórmula (I) anterior o una de sus sales se puede producir mediante cualquier reacción (A) a (K), (U) a (W) o mediante un procedimiento habitual de producción de sales.

REACCIÓN (A)



- 45 En la reacción (A), A, B, R¹ y R² son como se definen anteriormente. Z es hidroxilo, alcóxido o halógeno, y el halógeno puede ser un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo.

La reacción (A) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de una base y de un disolvente.

- 50 La base puede ser una o más seleccionadas adecuadamente entre, p. ej., un metal alcalino, tal como sodio o potasio; un alcóxido de metal alcalino, tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o *terc*-butoxido de potasio; un carbonato, tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio; un bicarbonato, tal como bicarbonato de sodio o bicarbonato de potasio; un hidróxido de metal, tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un hidruro de metal, tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio; una amina, tal como monometilamina, dimetilamina o trietilamina; una piridina, tal como piridina o 4-dimetilaminopiridina; y un litio orgánico, tal como metil-litio, *n*-butil-litio o diisopropilamida de litio. La base

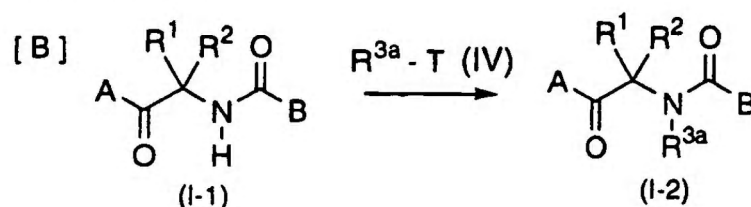
se puede usar en una cantidad de 1 a 3 moles, preferentemente, de 1 a 2 moles por mol de compuesto de fórmula (II).

El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloruro de metilo, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahidrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, *N*-metilpirrolidona, piridina, acetonitrilo o propionitrilo; y una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona.

La reacción (A) se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de un agente de condensación por deshidratación. El agente de condensación por deshidratación puede ser, por ejemplo, *N,N'*-diciclohexilcarbodiimida, clorosulfonil-isocianato, *N,N'*-carbonildiimidazol y anhídrido trifluoroacético.

La temperatura de reacción para la reacción (A) es habitualmente de 0 a 100°C, preferentemente, de 0 a 50°C, y la duración de la reacción es habitualmente de 0,5 a 48 horas, preferentemente, de 1 a 24 horas.

REACCIÓN (B)



En la reacción (B), A, B, R¹ y R² son como se definen anteriormente, y R^{3a} es alquilo, alquilcarbonilo o alcóxicarbonilo y T es halógeno, y el halógeno puede ser un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo.

La reacción (B) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de una base y de un disolvente.

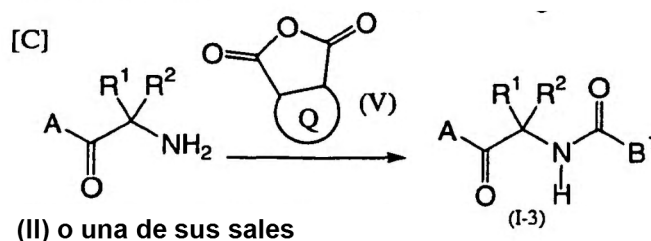
La base se puede seleccionar adecuadamente entre, p. ej., un metal alcalino, tal como sodio o potasio; un alcóxido de metal alcalino, tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o *tert*-butóxido de potasio; un carbonato, tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio; un bicarbonato, tal como bicarbonato de sodio o bicarbonato de potasio; un hidróxido de metal, tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un hidruro de metal, tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio; una amina, tal como monometilamina, dimetilamina o trietilamina; y una piridina, tal como piridina o 4-dimetilaminopiridina. La base se puede usar en una cantidad de 1 a 3 moles, preferentemente, de 1 a 1,5 moles por mol del compuesto de fórmula (I-1).

El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloruro de metilo, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahidrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, *N*-metilpirrolidona o piridina; un nitrilo tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo; y una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona.

La temperatura de reacción para la reacción (B) es habitualmente de 0 a 100°C, preferentemente, de 0 a 50°C, y la duración de la reacción es habitualmente de 1 a 300 horas, preferentemente, de 1 a 150 horas.

REACCIÓN (C)

(Referencia)

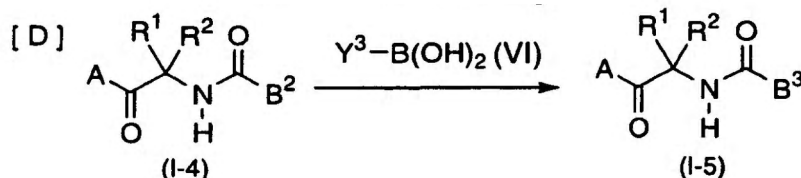


En la reacción (C), A, R¹ y R² son como se definen anteriormente, y B¹ es un anillo heterocíclico sustituido con -CO₂H o un anillo heterocíclico fusionado sustituido con -CO₂H. La fórmula (V) es ácido dicarboxílico anhidro de Q (fenilo, un heterociclo o un heterociclo fusionado).

- 5 La reacción (C) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloruro de metilo, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, *N*-metilpirrolidona o piridina; un nitrilo tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo; y una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona; y un alcohol, tal como metanol, etanol, propanol o *terc*-butanol.
- 10
- 15 La reacción (C) se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de una base. La base puede ser una o más adecuadamente seleccionadas entre, p. ej., un metal alcalino, tal como sodio o potasio; un alcóxido de metal alcalino, tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o *terc*-butóxido de potasio; un carbonato, tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio; un bicarbonato, tal como bicarbonato de sodio o bicarbonato de potasio; un hidróxido de metal, tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un hidruro de metal, tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio;
- 20 una amina, tal como monometilamina, dimetilamina o trietilamina; una piridina, tal como piridina o 4-dimetilaminopiridina. La base se puede usar en una cantidad de 1 a 3 moles, preferentemente, de 1 a 1,5 moles por mol del compuesto de fórmula (II).
- 25 La temperatura de reacción para la reacción (C) es habitualmente de 0 a 150°C, preferentemente, de 0 a 80°C. La duración de la reacción es habitualmente de 5 a 96 horas, preferentemente, de 1 a 48 horas.

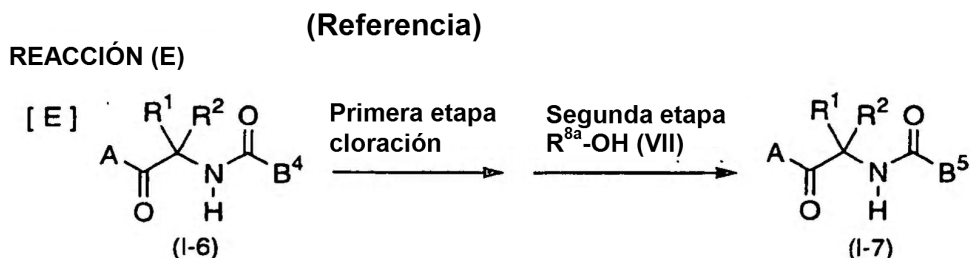
REACCIÓN (D)

(Referencia)



- 30 En la reacción (D), A, R¹ y R² son como se definen anteriormente. B² es un anillo heterocíclico sustituido con Y² o un anillo heterocíclico fusionado sustituido con Y², B³ es un anillo heterocíclico sustituido con Y³ o un anillo heterocíclico fusionado sustituido con Y³, Y² es un átomo de cloro, bromo o yodo, e Y³ es un anillo heterocíclico insaturado (el anillo heterocíclico insaturado puede estar sustituido con halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilo o haloalcoxilo).
- 35 La reacción (D) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de un catalizador, una base, un disolvente y un gas inerte.
- El catalizador puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre p. ej., complejos de paladio, tales como tetraquis(trifenilfosfin)paladio (0), bis(dibencilidenacetona)paladio (0) y tris(dibencilidenacetona)dipaladio (0).
- 40 La base puede ser una o más adecuadamente seleccionadas entre, p. ej., un carbonato, tal como carbonato de sodio, carbonato de potasio o carbonato de calcio; un bicarbonato, tal como bicarbonato de sodio o bicarbonato de potasio; y un hidróxido metálico, tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio. La base se puede usar en una cantidad de 1 a 20 moles, preferentemente, de 1 a 10 moles por mol del compuesto de fórmula (I-4).
- 45 El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloruro de metilo, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, *N*-metilpirrolidona o piridina;
- 50 un nitrilo tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo; y una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona; un alcohol tal como metanol, etanol, propanol o *terc*-butanol; y agua.
- 55 El gas inerte puede ser, por ejemplo, gas de nitrógeno o gas de argón.
- La temperatura de reacción para la reacción (D) es habitualmente de 0 a 150°C, preferentemente, de 15 a 100°C. La

duración de la reacción es habitualmente de 5 a 96 horas, preferentemente, de 1 a 48 horas.



- 5 En la reacción (E), A, R¹ y R² son como se definen anteriormente, y B⁴ es un anillo heterocíclico sustituido con -CO₂H o un anillo heterocíclico fusionado sustituido con -CO₂H, B⁵ es un anillo heterocíclico sustituido con -CO₂ R^{8a} o un anillo heterocíclico fusionado sustituido con -CO₂ R^{8a}, y R^{8a} es alquilo, haloalquilo; alcoxilquilo o haloalcoxilquilo.

- 10 La primera etapa de la reacción (E) se puede llevar a cabo en presencia de un agente de cloración. El agente de cloración puede ser uno o más adecuadamente seleccionado entre, p. ej., cloruro de tionilo, cloruro de oxalilo y pentacloruro de fósforo.

- 15 La primera etapa de la reacción (E) se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloruro de metilo, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano, dietiléter o dimetoxietano; y un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo.

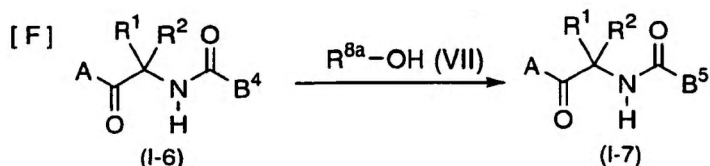
- 20 La temperatura de reacción para la primera etapa de la reacción (E) es habitualmente de 0 a 200°C, preferentemente, de 15 a 150°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,1 a 72 horas, preferentemente, de 0,5 a 3 horas.

- 25 La segunda etapa de la reacción (E) se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de una base. La base puede ser una o más adecuadamente seleccionadas entre, p. ej., un metal alcalino, tal como sodio o potasio; un alcóxido de metal alcalino, tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o *tert*-butóxido de potasio; un carbonato, tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio; un bicarbonato, tal como bicarbonato de sodio o bicarbonato de potasio; un hidróxido de metal, tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un hidruro de metal, tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio; una amina, tal como monometilamina, dimetilamina o trietilamina; una piridina, tal como piridina o 4-dimetilaminopiridina. La base se puede usar en una cantidad de 1 a 5 moles, preferentemente, de 1 a 2 moles por mol del compuesto de fórmula (I-6).

- 35 La segunda etapa de la reacción (E) se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloruro de metilo, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, *N*-metilpirrolidona o piridina; un nitrilo tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo; y una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona. Además, en esta reacción, el compuesto de fórmula (VII) también puede servir como disolvente si se usa en exceso.

La temperatura de reacción para la segunda etapa de la reacción (E) es habitualmente de 0 a 100°C, preferentemente, de 0 a 50°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,1 a 48 horas, preferentemente, de 0,5 a 6 horas.

REACCIÓN (F) (Referencia)



En la reacción (F), A, B⁴, B⁵, R¹, R² y R^{8a} son como se definen anteriormente.

La reacción (F) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de un catalizador o un agente de condensación por deshidratación.

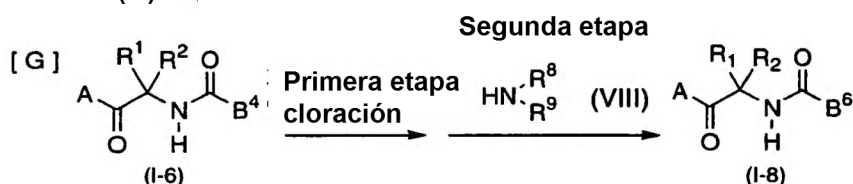
El catalizador puede ser uno o más adecuadamente seleccionado entre, p. ej., un ácido mineral, tal como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico; un ácido orgánico, tal como ácido paratolueno-sulfónico; y un ácido de Lewis, tal como eterato de trifluoruro de boro.

El agente de condensación por deshidratación puede ser uno o más adecuadamente seleccionados entre, p. ej., *N,N'*-diciclohexilcarbodiimida, clorosulfonil-isocianato, *N,N'*-carbonildiimidazol y anhídrido trifluoroacético.

La reacción (F) se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloruro de metilo, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetahidrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, *N*-metilpirrolidona o piridina; un nitrilo tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo; una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona; y un alcohol, tal como metanol, etanol, propanol o *terc*-butanol. Además, en esta reacción, el compuesto de fórmula (VII) también puede servir como disolvente si se usa en exceso.

La temperatura de reacción para la reacción (F) es habitualmente de 0 a 200°C, preferentemente de 0 a 100°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,1 a 96 horas, preferentemente, de 0,5 a 24 horas.

REACCIÓN (G) (Referencia)



En la reacción (G), A, B⁴, R¹, R², R⁸ y R⁹ son como se definen anteriormente, y B⁶ es un anillo heterocíclico sustituido con -CONR⁸R⁹ o un anillo heterocíclico fusionado sustituido con -CONR⁸R⁹ (en el que cada uno de R⁸ y R⁹, que son independientes entre sí, es hidrógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilalquilo o haloalcoxilalquilo, y los R⁸ y R⁹ adyacentes pueden formar juntos un anillo).

La primera etapa de la reacción (G) se puede llevar a cabo según la primera etapa de la reacción (E) anteriormente descrita.

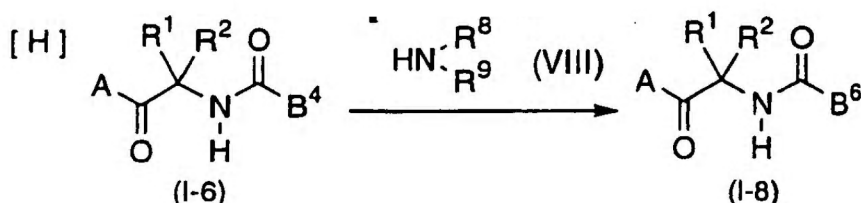
La segunda etapa de la reacción (G) se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de una base. La base puede ser una o más adecuadamente seleccionadas entre, p. ej., un metal alcalino, tal como sodio o potasio; un alcóxido de metal alcalino, tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o *terc*-butóxido de potasio; un carbonato, tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio; un bicarbonato, tal como bicarbonato de sodio o bicarbonato de potasio; un hidróxido de metal, tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un hidruro de metal, tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio; una amina, tal como monometilamina, dimetilamina o trietilamina; y una piridina, tal como piridina o 4-dimetilaminopiridina. La base se puede usar en una cantidad de 1 a 10 moles, preferentemente, de 1 a 2 moles por mol del compuesto de fórmula (I-6).

La segunda etapa de la reacción (G) se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloruro de metilo, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetahidrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, *N*-metilpirrolidona o piridina; un nitrilo tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo; y una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona; y agua.

La temperatura de reacción para la segunda etapa de la reacción (G) es habitualmente de 0 a 100°C, preferentemente, de 0 a 50°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,1 a 48 horas, preferentemente, de 0,5 a 6 horas.

REACCIÓN (H)

(Referencia)



En la reacción (H), A, B⁴, B⁶, R¹, R², R⁸ y R⁹ son como se definen anteriormente.

- 5 La reacción (H) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de un agente de condensación por deshidratación y un disolvente.

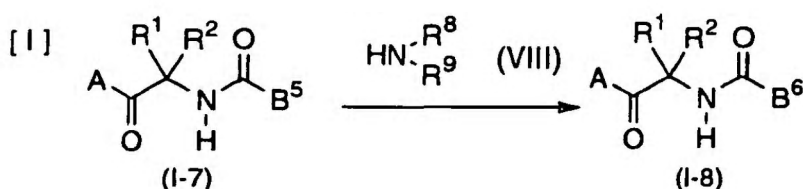
El agente de condensación por deshidratación puede ser uno o más adecuadamente seleccionados entre, p. ej., N,N'-diciclohexilcarbodiimida, clorosulfonil-isocianato, N,N'-carbonildiimidazol y anhídrido trifluoroacético.

- 10 El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloruro de metilo, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, N-metilpirrolidona o piridina; un nitrilo tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo; y una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona.

- 15 La temperatura de reacción para la reacción (H) es habitualmente de 0 a 200°C, preferentemente, de 0 a 100°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,1 a 96 horas, preferentemente, de 0,5 a 24 horas.

REACCIÓN (I)

(Referencia)

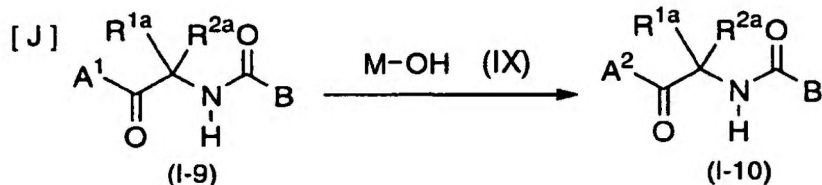


En la reacción (I), A, B⁵, B⁶, R¹, R², R⁸ y R⁹ son como se definen anteriormente.

- 25 La reacción (I) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloruro de metilo, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, N-metilpirrolidona o piridina; un nitrilo tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo; y una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona; un alcohol, tal como metanol, etanol, propanol o terc-butanol; y agua. Además, en esta reacción, el compuesto de fórmula (VIII) también puede servir como disolvente si se usa en exceso.

La temperatura de reacción para la reacción (I) es habitualmente de 0 a 150°C, preferentemente, de 0 a 80°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,1 a 48 horas, preferentemente, de 0,5 a 24 horas.

REACCIÓN (J)

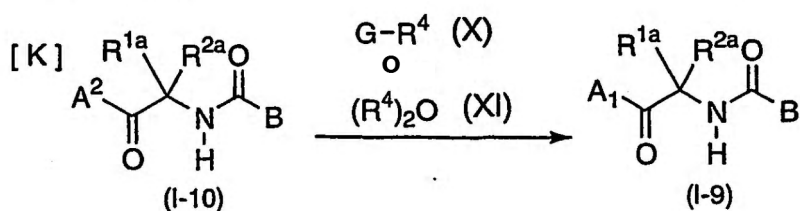


En la reacción (J), B es como se define anteriormente, A¹ es fenilo sustituido con -OR⁴, naftilo sustituido con -OR⁴, un anillo heterocíclico sustituido con -OR⁴ o un anillo heterocíclico fusionado sustituido con -OR⁴ (en el que R⁴ es -C(=W³)R¹², -C(HW³)OR¹², -C(=W³)SR¹², -C(=W³)NR¹²R¹³, S(O)_mR¹²-S(O)_nNR¹²R¹³ o anillo heterocíclico (el anillo heterocíclico puede estar sustituido con halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo o alquilcarbonilo); cada uno de R¹² y R¹³, que son independientes entre sí, es alquilo que puede estar sustituido con E³, alcoxilo, haloalcoxilo, cicloalquilo que puede estar sustituido con J o fenilo (el fenilo puede estar sustituido con halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo o alquilcarbonilo), o R¹² y R¹³ adyacentes pueden formar juntos un anillo; cada uno de W³ es oxígeno o azufre; cada uno de m y n, que son independientes entre sí, es un número entero de 0 a 2; E³ es halógeno/alcoxilo, alquiltio, amino, monoalquilamino, dialquilaraino, cicloalquilo, ciano, alcoxycarbonilo, haloalcoxilo, haloalquiltio o fenilo (el fenilo puede estar sustituido con halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo o alquilcarbonilo); y J es halógeno, alquilo, haloalquilo/alcoxilo o haloalcoxilo. A² es fenilo sustituido con -OH, naftilo sustituido con -OH, un anillo heterocíclico sustituido con -OH o un anillo heterocíclico fusionado sustituido con -OH, cada uno de R^{1a} y R^{2a} es alquilo, y R^{1a} y R^{2a} pueden formar juntos un carbociclo saturado de 3 a 6 miembros, y M es sodio o potasio.

La reacción (J) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloruro de metilo, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahidrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, N-metilpirrolidona o piridina; un nitrilo tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo; y una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona; un alcohol, tal como metanol, etanol, propanol o *tert*-butanol; y agua.

La temperatura de reacción para la reacción (J) es habitualmente de 0 a 100°C, preferentemente, de 20 a 80°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,1 a 24 horas, preferentemente, de 0,1 a 12 horas.

REACCIÓN (K)



En la reacción (K), A¹, A², B, R^{1a}, R^{2a} y R⁴ son como se definen anteriormente, G es un átomo de cloro, bromo o yodo.

La reacción (K) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de una base y de un disolvente.

La base puede ser una o más adecuadamente seleccionadas entre, p. ej., un alcóxido de metal alcalino, tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o *tert*-butoxido de potasio; un carbonato, tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio; un bicarbonato, tal como bicarbonato de sodio o bicarbonato de potasio; un hidróxido de metal, tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un hidruro de metal, tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio; una amina, tal como monometilamina, dimetilamina o trietilamina; una piridina, tal como piridina o 4-dimetilaminopiridina. La base se puede usar en una cantidad de 1 a 2 moles, preferentemente, de 1 a 1,5 moles por mol del compuesto de fórmula (I-10).

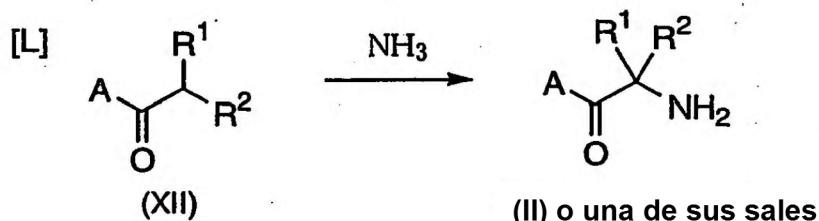
El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloruro de metilo,

cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, *N*-metilpirrolidona o piridina; un nitrilo tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo; y una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona.

La temperatura de reacción para la reacción (K) es habitualmente de -20 a 100°C, preferentemente, de 0 a 50°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,1 a 24 horas, preferentemente, de 0,1 a 12 horas.

El compuesto de fórmula (II) para usarse en la reacción anterior (A) o (C) se puede producir mediante las siguientes reacciones (L) a (N).

REACCIÓN (L)



En la reacción (L), A, R¹ y R² son como se definen anteriormente. En la reacción (L), se puede producir una sal del compuesto (II) mediante el tratamiento posterior de la reacción o según una reacción habitual de formación de sales.

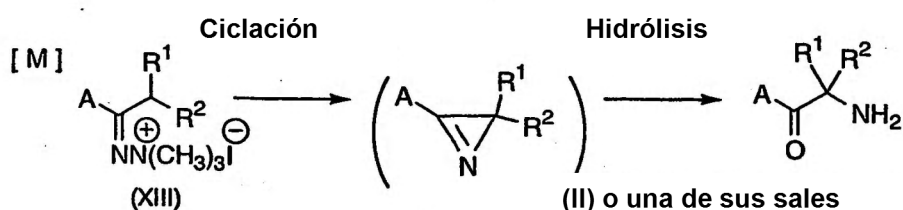
La reacción (L) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de un agente oxidante y un disolvente.

El agente oxidante puede ser, por ejemplo, ferricianuro de potasio. El agente oxidante se puede usar en una cantidad de 1 a 10 moles, preferentemente, de 1 a 5 moles por mol del compuesto de fórmula (XII).

El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más adecuadamente seleccionado entre, p. ej., un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster tal como metilacetato o etilacetato; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, *N*-metilpirrolidona, piridina, acetonitrilo o propionitrilo; y una cetona, tal como acetona o metiletilcetona.

La temperatura de reacción para la reacción (L) es habitualmente de 20 a 150°C, preferentemente, de 50 a 100°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,5 a 30 horas, preferentemente, de 1 a 20 horas.

REACCIÓN (M)



En la reacción (M), A, R¹ y R² son como se definen anteriormente. En la reacción (M), se puede producir una sal del compuesto (II) mediante el tratamiento posterior de la reacción o según una reacción habitual de formación de sales.

La reacción de ciclación de la reacción (M) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de una base y de un disolvente.

La base puede ser una o más adecuadamente seleccionadas entre, p. ej., un metal alcalino, tal como sodio o potasio; un alcóxido de metal alcalino, tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o *tert*-butóxido de potasio; y un hidruro de metal, tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio. La base se puede usar en una cantidad de 1 a 3 moles, preferentemente, de 1 a 1,5 moles por mol del compuesto de fórmula (XIII).

El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un alcohol, tal como metanol, etanol, propanol o *tert*-butanol; y un nitrilo, tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo.

La temperatura de reacción para la reacción de ciclación de la reacción (M) es habitualmente de 0 a 150°C,

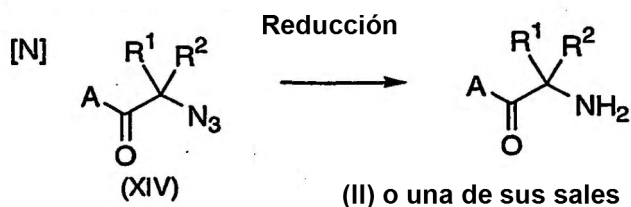
preferentemente, de 30 a 100°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,5 a 24 horas, preferentemente, de 1 a 12 horas.

- 5 La reacción hidrolítica de la reacción (M) se puede llevar a cabo según una reacción hidrolítica común y se puede llevar a cabo en presencia de un ácido o una base y un disolvente.

El ácido puede ser, por ejemplo, cloruro de hidrógeno o ácido sulfúrico. La base puede ser, por ejemplo, un hidróxido metálico, tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio.

- 10 El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, pueden ser uno o más adecuadamente seleccionado, p.ej., un alcohol, tal como metanol, etanol, propanol o *terc*-butanol; un nitrilo, tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo; una cetona, tal como acetona o metiletilcetona; y agua.
- 15 La temperatura de reacción para la reacción hidrolítica de la reacción (M) es habitualmente de 0 a 100°C, preferentemente de 20 a 80°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,1 a 12 horas, preferentemente, de 0,1 a 1 hora.

REACCIÓN (N)



- 20 En la reacción (N), A, R¹ y R² son como se definen anteriormente. En la reacción (N), se puede producir una sal del compuesto (II) mediante el tratamiento posterior de la reacción o según una reacción habitual de formación de sales.

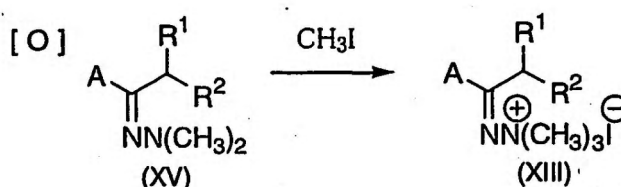
La reacción de reducción de la reacción (N) puede ser, por ejemplo, una reducción catalítica, una reducción mediante un hidruro metálico (tal como hidruro de boro del sodio o hidruro de litio y aluminio); reducción mediante, p. ej., trifenilfosfina, dimetilsulfuro o difenilsulfuro; o reducción en un sistema de reacción constituido por un metal tal como oro o cobre y un ácido carboxílico, tal como ácido fórmico o ácido acético. La reducción catalítica se lleva a cabo habitualmente en una atmósfera de hidrógeno usando un catalizador, tal como platino, óxido de platino, negro de platino, níquel Raney, paladio, paladio sobre carbono, rodio o rodio-alúmina.

- 30 La reacción (N) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, *N*-metilpirrolidona, piridina, acetonitrilo o propionitrilo; una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona; un alcohol, tal como metanol, etanol, propanol o *terc*-butanol; y agua.

La temperatura de reacción para la reacción (N) es habitualmente de 0 a 150°C, preferentemente, de 0 a 80°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,5 a 96 horas, preferentemente, de 1 a 48 horas.

- 40 El compuesto de fórmula (XIII) para usarse en la reacción anterior (M) se puede producir mediante la siguiente reacción (O).

REACCIÓN (O)



En la reacción (O), A, R¹ y R² son como se definen anteriormente.

- 45 La reacción (O) se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea inerte para la reacción y puede ser, por ejemplo, uno o más seleccionados

adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un alcohol, tal como metanol, etanol, propanol o *terc*-butanol; un disolvente aprótico polar, tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo; y una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona.

El metilioduro de la reacción (O) se puede usar en una cantidad de 1 a 10 moles, preferentemente, de 1 a 3 moles por mol del compuesto de fórmula (XV). Además, el metilioduro puede servir también como disolvente si se usa en exceso.

La temperatura de reacción para la reacción (O) es habitualmente de 0 a 100°C, preferentemente, de 10 a 50°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,5 a 48 horas, preferentemente, de 1 a 24 horas.

El compuesto de fórmula (XIV) para usarse en la reacción anterior (N) se puede producir mediante la siguiente reacción (P).

REACCIÓN (P)



En la reacción (P), A, R¹ y R² son como se definen anteriormente, U es un átomo de cloro o bromo.

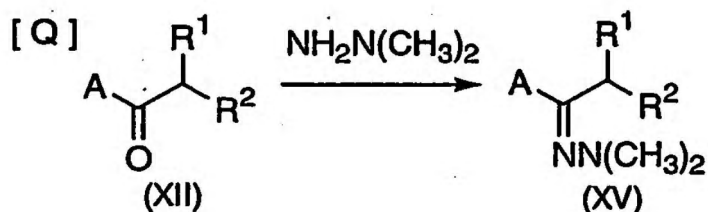
La reacción (P) se puede llevar a cabo en presencia de un agente de azidación. El agente de azidación puede ser uno o más adecuadamente seleccionado entre, p. ej., azida de sodio, azida de potasio y trimetilsililazida.

La reacción (P) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, *N*-metilpirrolidona, piridina, acetonitrilo o propionitrilo; una cetona, tal como acetona o metil-etil-cetona; un alcohol, tal como metanol, etanol, propanol o *terc*-butanol; y agua.

La temperatura de reacción para la reacción (P) es habitualmente de 0 a 150°C, preferentemente, de 20 a 90°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,1 a 96 horas, preferentemente, de 0,5 a 12 horas.

El compuesto de fórmula (XV) para usarse en la reacción anterior (O) se puede producir mediante la siguiente reacción (Q).

REACCIÓN (Q)



En la reacción (Q), A, R¹ y R² son como se definen anteriormente.

La reacción (Q) se puede llevar a cabo según una reacción de síntesis de hidrazonas común y, si es necesario, en presencia de un agente de deshidratación y/o un catalizador.

Como agente de deshidratación, cabe mencionar, por ejemplo, un tamiz molecular. El agente de deshidratación se puede usar habitualmente de 1 a 30 moles, preferentemente, de 5 a 10 moles con respecto al peso del compuesto de fórmula (XII).

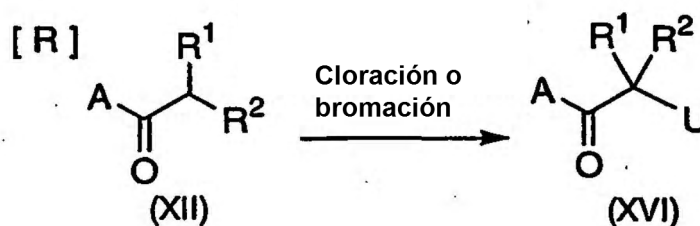
El catalizador puede ser, por ejemplo, tetracloruro de titanio.

5 La dimetilhidrazina de la reacción (Q) se puede usar habitualmente en una cantidad de 1 a 30 moles, preferentemente, de 5 a 10 moles por mol del compuesto de fórmula (XII).

La temperatura de reacción para la reacción (Q) es habitualmente de 20 a 150°C, preferentemente, de 50 a 120°C. La duración de la reacción es habitualmente de 5 a 200 horas, preferentemente, de 24 a 120 horas.

10 El compuesto de fórmula (XVI) para usarse en la reacción anterior (P) se puede producir mediante la siguiente reacción (R).

REACCIÓN (R)



En la reacción (R), A, R¹, R² y U son como se definen anteriormente.

15 La reacción (R) se puede llevar a cabo en presencia de un agente de cloración o un agente de bromación. El agente de cloración puede ser uno o más adecuadamente seleccionado entre, p. ej., cloro y *N*-clorosuccinimida. El agente de bromación puede ser uno o más adecuadamente seleccionado entre, p. ej., bromo, *N*-bromosuccinimida y tribromuro de feniltrimetilamonio.

20 La reacción (R) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloruro de metilo, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano; un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano, dietiléter o dimetoxietano; un éster, tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un disolvente aprótico polar, tal como dimetilsulfóxido, sulfolano, dimetilacetamida, dimetilformamida, *N*-metilpirrolidona o piridina; un ácido orgánico, tal como ácido acético o ácido propiónico; y agua.

30 La reacción (R) se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de una base o un ácido.

La base puede ser, por ejemplo, diisopropilamida de litio. La base se puede usar en una cantidad de 1 a 2 moles, preferentemente, de 1 a 1,2 moles por mol del compuesto de fórmula (XII).

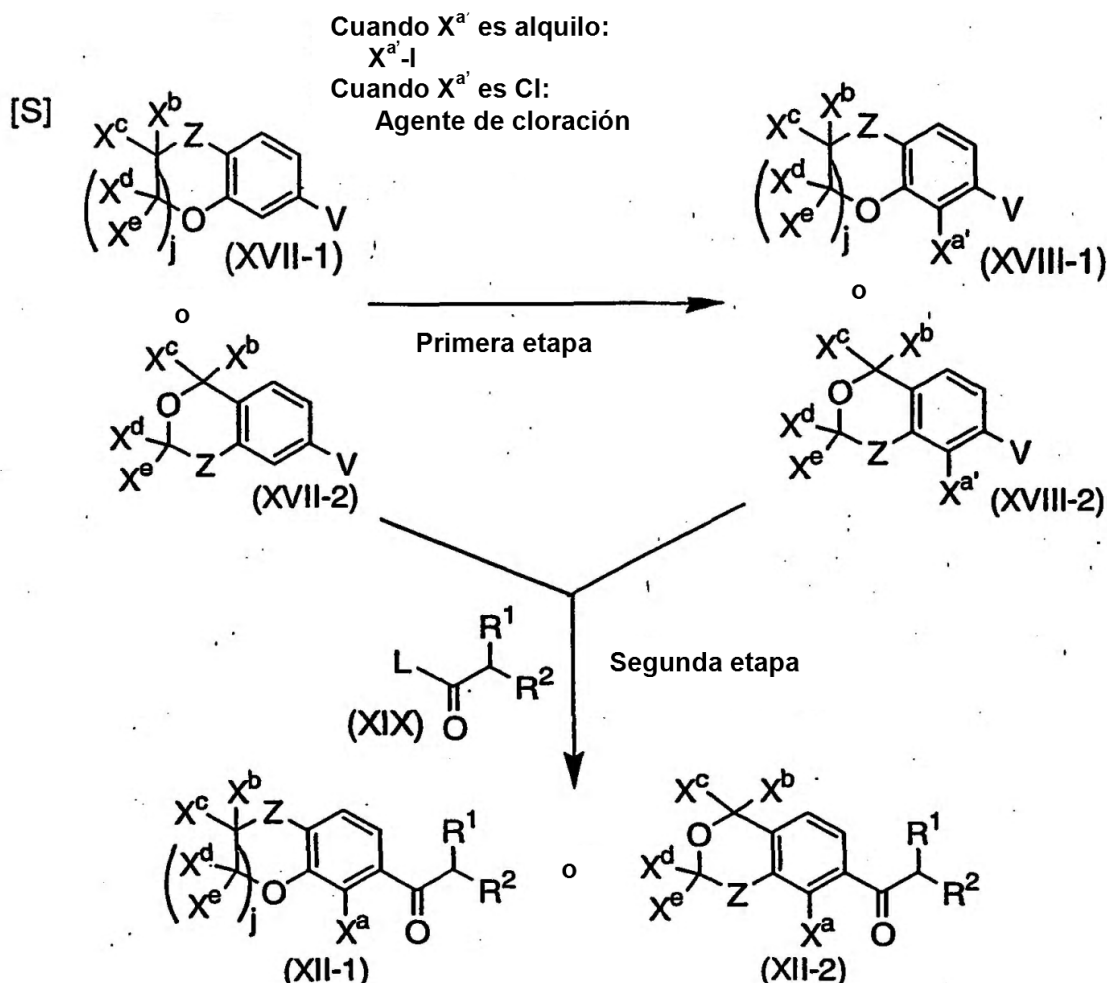
35 Cuando la reacción se lleva a cabo en presencia de una base, el disolvente puede ser habitualmente uno o más adecuadamente seleccionados entre éteres tales como tetrahydrofurano y dietiléter.

El ácido puede ser uno o más adecuadamente seleccionados entre, p. ej., un ácido orgánico, tal como ácido acético o ácido propiónico y cloruro de aluminio. El ácido se usa habitualmente en una cantidad catalítica. Además, el ácido orgánico como disolvente puede servir como disolvente y como ácido si se usa en exceso.

40 La temperatura de reacción para la reacción (R) es habitualmente de -100 a 150°C, preferentemente, de -78 a 110°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,1 a 48 horas, preferentemente, de 0,5 a 24 horas. Sin embargo, si se lleva a cabo en presencia de una base, la temperatura de reacción es habitualmente de -100 a 0°C, preferentemente, de -78 a -20°C, y la duración de la reacción es habitualmente de 1 a 12 horas, preferentemente, de 0,5 a 6 horas. Si se lleva a cabo en presencia de un ácido, la temperatura de reacción es habitualmente de 0 a 150°C, preferentemente, de 20 a 110°C, y la duración de reacción es habitualmente de 0,1 a 48 horas, preferentemente, de 1 a 24 horas.

45 El compuesto de fórmula (XII) para usarse en la reacción anterior (Q) es un compuesto conocido o se puede producir mediante las siguientes reacciones (S) o (T) o mediante procedimientos según los mismos.

REACCIÓN (S)



En la reacción (S), R^1 y R^2 son como se definen anteriormente, y Z es un átomo de oxígeno o $-\text{C}(\text{G}^1)\text{G}^2-$, X^a es un átomo de hidrógeno, un átomo de cloro o alquilo, $X^{a'}$ es un átomo de cloro o alquilo, cada uno de $X^b, X^c, X^d, X^e, \text{G}^1$ y G^2 es un átomo de hidrógeno, flúor o cloro, V es un átomo de bromo o yodo, y j es 0 ó 1.

La primera etapa de la reacción (S) se puede llevar a cabo en presencia de una base y de un disolvente.

La base se puede seleccionar adecuadamente entre un compuesto de litio orgánico, tal como diisopropilamida de litio. La base se puede usar en una cantidad de 1 a 2 moles, preferentemente, de 1 a 1,5 moles por mol del compuesto de fórmula (XVII-1) o (XVII-2).

El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un éter, tal como dioxano, tetahidrofurano y dietiléter.

El agente de cloración que se puede usar para la primera etapa de la reacción (S) puede ser, por ejemplo, N-clorosuccinimida.

La fórmula: $X^{a'}-I$ para usarse en la primera etapa de la reacción (S) se puede usar en una cantidad de 1 a 10 moles, preferentemente, de 1 a 5 moles por mol del compuesto de fórmula (XVII-1) o (XVII-2). Además, el agente de cloración para usarse en la primera etapa de la reacción (S) se puede usar en una cantidad de 1 a 5 moles, preferentemente, de 1 a 3 moles por mol del compuesto de fórmula (XVII-1) o (XVII-2).

La primera etapa de la reacción (S) se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de un gas inerte. El gas inerte se puede seleccionar adecuadamente entre, p. ej., gas de nitrógeno o gas de argón.

La temperatura de reacción para la primera etapa de la reacción (S) es habitualmente de -100 a 50°C , preferentemente, de -70 a 25°C . La duración de la reacción es habitualmente de 1 a 48 horas, preferentemente, de 1 a 20 horas.

La segunda etapa de la reacción (S) se puede llevar a cabo en presencia de una base y de un disolvente.

La base puede ser una o más seleccionadas adecuadamente entre, p. ej., compuestos de litio orgánicos, tales como metil-litio y *n*-butil-litio; y compuestos de Grignard, tales como cloruro de isopropil-magnesio. La base se puede usar en una cantidad de 1 a 2 moles, preferentemente, de 1 a 1,5 moles por mol del compuesto de fórmula (XVII-1), (XVII-2), (XVIII-1) o (XVIII-2).

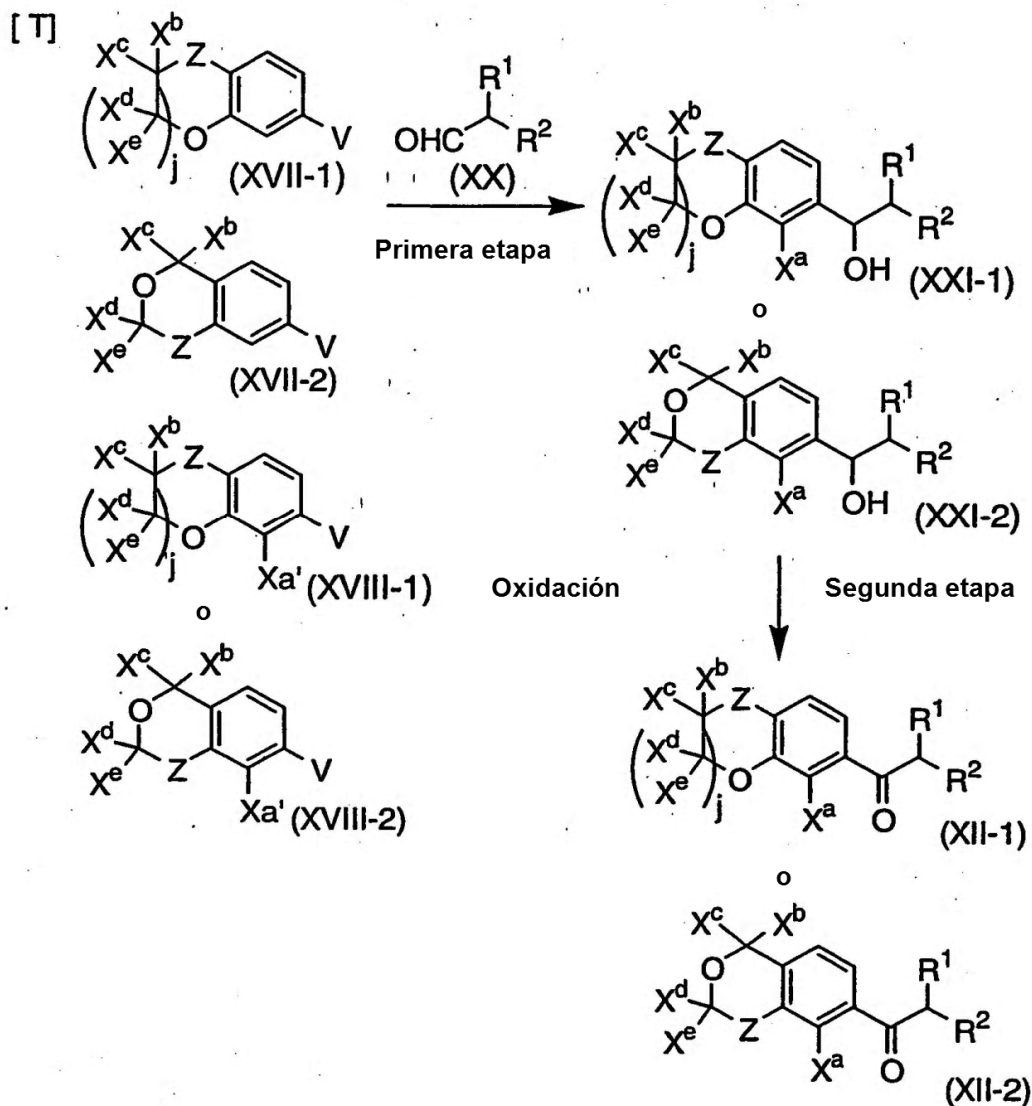
El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un éter, tal como dioxano, tetrahydrofurano y dietiléter.

El compuesto de fórmula (XIX) para usarse para la segunda etapa de la reacción (S) se usa en una cantidad de 1 a 3 moles, preferentemente, de 1 a 1,5 moles por mol del compuesto de fórmula (XVII-1), (XVII-2), (XVIII-1) o (XVIII-2).

La segunda etapa de la reacción (S) se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de un gas inerte. El gas inerte se puede seleccionar adecuadamente entre, p. ej., gas de nitrógeno o gas de argón.

La temperatura de reacción para la segunda etapa de la reacción (S) es habitualmente de -100 a 50°C, preferentemente, de -70 a 25°C. La duración de la reacción es habitualmente de 1 a 48 horas, preferentemente, de 1 a 20 horas.

REACCIÓN (T)



En la reacción (T), R^1 , R^2 , Z , X^a , X^b , X^c , X^d , X^e , V y j son como se definen anteriormente.

La primera etapa de la reacción (T) se puede llevar a cabo en presencia de una base y de un disolvente.

5 La base puede ser una o más seleccionadas adecuadamente entre, p. ej., compuestos de litio orgánicos, tales como metil-litio y *n*-butil-litio; y compuestos de Grignard, tales como cloruro de isopropil-magnesio.

La base se usa en una cantidad de 1 a 2 moles, preferentemente, de 1 a 1,5 moles por mol del compuesto de fórmula (XVII-1), (XVII-2), (XVIII-1) o (XVIII-2).

10 El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un éter, tal como dioxano, tetahidrofurano y dietiléter.

El compuesto de fórmula (XX) para usarse para la primera etapa de la reacción (T) se usa en una cantidad de 1 a 3 moles, preferentemente, de 1 a 1,5 moles por mol del compuesto de fórmula (XVII-1), (XVII-2), (XVIII-1) o (XVIII-2).

15 La primera etapa de la reacción (T) se puede llevar a cabo, si es necesario, en presencia de un gas inerte. El gas inerte se puede seleccionar adecuadamente entre, p. ej., gas de nitrógeno o gas de argón.

20 La temperatura de reacción para la primera etapa de la reacción (T) es habitualmente de -100 a 50°C, preferentemente, de -70 a 25°C. La duración de la reacción es habitualmente de 1 a 48 horas, preferentemente, de 1 a 20 horas.

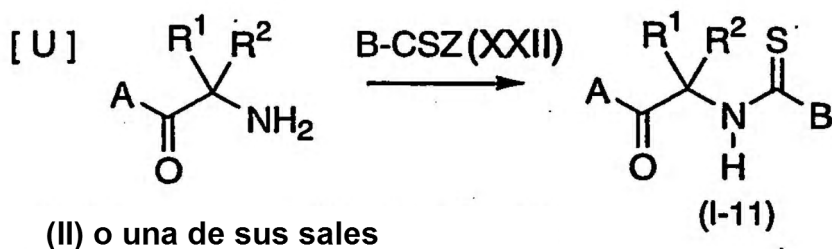
La segunda etapa de la reacción (T) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de un agente oxidante y un disolvente.

25 El agente de oxidación puede ser uno o más adecuadamente seleccionados entre, p. ej., clorocromato de piridinio y dióxido de manganeso. El agente oxidante se usa en una cantidad de 1 a 10 moles, preferentemente, de 1 a 3 moles por mol del compuesto de fórmula (XXI-1) o (XXI-2).

30 El disolvente puede ser cualquier disolvente, siempre y cuando sea un disolvente inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser uno o más seleccionados adecuadamente entre, p. ej., un hidrocarburo aromático, tal como benceno, tolueno, xileno o clorobenceno; un hidrocarburo alifático, tal como tetracloruro de carbono, cloroformo, diclorometano, dicloroetano, tricloroetano, hexano o ciclohexano.

35 La temperatura de reacción para la segunda etapa de la reacción (T) es habitualmente de 0 a 150°C, preferentemente, de 20 a 100°C. La duración de la reacción es habitualmente de 0,5 a 24 horas, preferentemente, de 1 a 12 horas.

REACCIÓN (U)



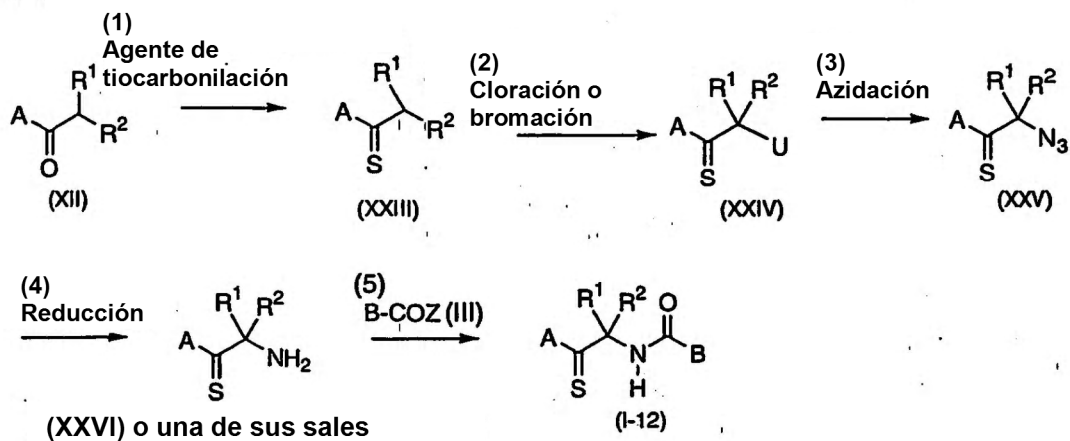
En la reacción (U), A, B, R¹, R² y Z, son como se definen anteriormente.

40

La reacción (U) se puede llevar a cabo según la reacción anterior (A).

REACCIÓN (V)

[M]



En la reacción (V), A, B, R¹, R², U y Z son como se definen anteriormente. Además, el agente de tiocarbonilación puede ser, por ejemplo, un reactivo de Lawesson o pentasulfuro de difósforo. La reacción (V) comprende las reacciones de cinco etapas (1) a (5) como se muestra en el diagrama de flujo anterior, siendo las condiciones de reacción de las respectivas reacciones descritas a continuación.

La reacción (1) se puede llevar a cabo habitualmente en presencia de un disolvente. El disolvente puede ser cualquier disolvente inerte a la reacción, y puede ser uno o más adecuadamente seleccionados entre hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, tolueno y xileno; hidrocarburos alifáticos, tales como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína, bencina de petróleo; éteres, tales como dietiléter, dipropiléter, dibutiléter, tetrahidrofurano y dioxano; y disulfuro de carbono.

La reacción (1) se puede llevar a cabo habitualmente de -20°C a 150°C, preferentemente, de 0 a 110°C, y la duración de la reacción es habitualmente de 0,1 a 48 horas.

En la reacción (1), el agente de tiocarbonilación se puede usar en una cantidad de 0,4 a 2 moles por mol del compuesto de fórmula (XII).

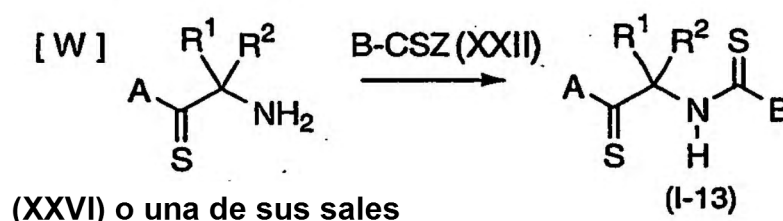
La reacción (2) se puede llevar a cabo según la reacción anterior (R).

La reacción (3) se puede llevar a cabo según la reacción anterior (P).

La reacción (4) se puede llevar a cabo según la reacción anterior (N).

La reacción (5) se puede llevar a cabo según la reacción anterior (A).

REACCIÓN (W)



En la reacción (W), A, B, R¹, R² y Z son como se definen anteriormente.

La reacción (W) se puede llevar a cabo según la reacción anterior (A).

Además, el derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales se puede producir con referencia al procedimiento revelado en los documentos W02001/60783 o W02003/27059, según lo requiera el caso.

Una composición fungicida que contiene un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales como ingrediente activo (denominada en lo sucesivo simplemente la composición de la presente invención) puede controlar hongos nocivos a una baja dosis y, por tanto, es útil, por ejemplo, como composición fungicida agrícola u hortícola.

Mejor modo de llevar a cabo la invención

A continuación, se describirán las realizaciones preferidas de la composición de la presente invención.

La composición de la presente invención es útil como composición fungicida capaz de controlar hongos nocivos a una baja dosis, siendo particularmente útil como composición fungicida agrícola u hortícola. Cuando se usa como composición fungicida agrícola u hortícola, la composición de la presente invención puede controlar hongos nocivos tales como *Oomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes*, *Deuteromycetes*, y son particularmente eficaz en el control de hongos nocivos pertenecientes a, p. ej., *Ascomycetes* o *Deuteromycetes*.

Cabe mencionar los siguientes como ejemplos específicos de los anteriores hongos nocivos.

Oomycetes puede ser, por ejemplo, el género *Phytophthora*, tal como el patógeno del tizón tardío de la patata y del tomate (*Phytophthora infestans*) o el patógeno haitiro-eki-byo del tomate (*Phytophthora capsici*); género *Pseudoperonospora*, tal como el patógeno del mildiú lanoso del pepino (*Pseudoperonospora cubensis*); género *Plasmopara*, tal como el patógeno del mildiú lanoso de la vid (*Plasmopara viticola*); y el género *Pythium*, tal como el patógeno del tizón de plántulas de arroz (*Pythium graminicola*) o el patógeno de podredumbre de la raíz del trigo (*Pythium iwayamai*).

Ascomycetes puede ser, por ejemplo, el género *Erysiphe*, tal como el patógeno del oídio del trigo (*Erysiphegraminis*); el género *Sphaerotheca*, tal como el patógeno del oídio del pepino (*Sphaerotheca fuliginea*) o el patógeno del oídio de la fresa (*Sphaerotheca humuli*); el género *Uncinula*, tal como el patógeno del oídio de la vid (*Uncinula necator*); el género *Podosphaera*, tal como el patógeno del oídio de la manzana (*Podosphaera leucotricha*); el género *Mycosphaerella*, tal como el patógeno del tizón *Mycosphaerella* del guisante de jardín (*Mycosphaerella pinodes*), patógeno de manchas en el fruto del manzano (*Mycosphaerella pomi*), patógeno de la sigatoka negra del plátano (*Mycosphaerella musicola*), patógeno de manchas circulares en hoja de caqui (*Mycosphaerella nawae*) o patógeno de manchas en hoja de fresa (*Mycosphaerella fragariae*); el género *Venturia*, tal como patógeno de la sarna de la manzana (*Venturia inaequalis*) o patógeno de la sarna de la pera (*Venturia nashicola*); el género *Pyrenophora*, tal

como patógeno de la helmintosporiosis de la cebada (*Pyrenophora teres*) o patógeno del rayado de la cebada (*Pyrenophora graminea*); el género *Sclerotinia*, tal como diversos patógenos de enfermedades provocadas por *Sclerotinia* (*Sclerotinia sclerotiorum*), tales como el patógeno de la podredumbre del tallo de la judía, patógeno *Sclerotinia* de podredumbre del pepino, patógeno *Sclerotinia* de podredumbre de la calabaza, patógeno *Sclerotinia* de podredumbre de la calabaza china, patógeno *Sclerotinia* de podredumbre de pimentón, patógeno *Sclerotinia* de podredumbre del pimiento dulce o patógeno de la podredumbre acuosa blanda de la cebolla, patógeno *Sclerotinia* de marchitamiento bajo la nieve del trigo (*Sclerotinia borealis*), patógeno *syoryu-kinkaku* del tomate (*Sclerotinia minor*) o patógeno *Sclerotinia* de podredumbre y patógeno de podredumbre de la corona de la alfalfa (*Sclerotinia trifoliorum*); el género *Botrylinia*, tal como pequeño patógeno *Sclerotinia* de podredumbre del cacahuete (*Botrylinia arachidis*); el género *Cochliobolus*, tal como patógeno de manchas marrones del arroz (*Cochliobolus miyabeanus*); el género *Didymella*, tal como patógeno del tizón del tallo pegajoso del pepino (*Didymella bryoniae*); el género *Gibberella*, tal como patógenos de la fusariosis de la espiga del trigo (*Gibberella zeae*); el género *Elsinoe*, tal como patógeno de la atracnosis de la vid (*Elsinoe ampelina*) o patógeno de la sarna de los cítricos (*Elsinoe fawcettii*); el género *Diaporthe*, tal como patógeno de la melanosis de los cítricos (*Diaporthe citri*) o patógeno de brazo de hinchazón de la vid (*Diaporthe* sp.); el género *Monilinia*, tal como patógeno del tizón de la floración de la manzana (*Monilinia mali*) o patógeno de podredumbre marrón del guisante (*Monilinia fructicola*); y el género *Glomerella*, tal como patógeno de podredumbre de la uva madura (*Glomerella cingulata*).

Basidiomycetes puede ser, por ejemplo, el género *Rhizoctonia*, tal como patógeno del tizón de la vaina del arroz (*Rhizoctonia solani*); el género *Ustilago*, tal como patógeno del carbón desnudo del trigo (*Ustilago nuda*); el género *Puccinia*, tal como el patógeno de la roya coronada de la avena (*Puccinia coronata*), patógeno de la roya parda del trigo (*Puccinia recondita*) o patógeno de la roya estriada del trigo (*Puccinia striiformis*); y el género *Typhula*, tal como patógeno *Typhula* de marchitamiento bajo la nieve del trigo o la cebada (*Typhula incarnata*, *Typhula ishikariensis*).

Deuteromycetes puede ser, por ejemplo, el género *Septoria*, tal como patógeno de la mancha de la pluma del trigo (*Septoria nodorum*), mancha de la hoja del trigo (*Septoria tritici*); el género *Botrytis*, tal como diversos patógenos de moho gris (*Botrytis cinerea*), tales como patógeno del moho gris de la vid, patógeno del moho gris de los cítricos, patógeno del moho gris del pepino, patógeno del moho gris del tomate, patógeno del moho gris de la fresa, patógeno del moho gris de la berenjena, patógeno del moho gris de la judía, patógeno del moho gris del la judía adzuki, patógeno del moho gris del guisante de jardín, patógeno del moho gris del cacahuete, patógeno del moho gris de la pimentón, patógeno del moho gris del pimiento dulce, patógeno del moho gris de la lechuga, patógeno del moho gris de la cebolla, patógeno del moho gris de estíctes, patógeno del moho gris del clavel, patógeno del tizón de la botritis de la rosa, patógeno del moho gris del pensamiento ornamental o patógeno del moho gris del girasol, patógeno de moho gris de podredumbre de la parte baja del tallo de la cebolla (*Botrytis allii*) o hagare-syo de botritis de la cebolla (*Botrytis squamosa*, *Botrytis byssoidea*, *Botrytis tulipae*); el género *Piricularia*, tal como patógeno del añublo del arroz (*Piricularia oryzae*); el género *Cercospora*, tal como patógeno *Cercospora* de las manchas en la hoja de la remolacha (*Cercospora beticola*) o patógeno *Cercospora* de manchas en las hojas del caqui (*Cercospora kakivola*); el género *Colletotrichum*, tal como patógeno de la antracnosis del pepino (*Colletotrichum orbiculare*); el género *Alternaria*, tal como patógeno *Alternaria* de manchas en las hojas de la manzana (patotipo de la manzana *Alternaria alternata*), patógeno de manchas negras de la pera (patotipo de la pera japonesa *Alternaria alternata*), patógeno del tizón temprano del tomate o la patata (*Alternaria solani*), patógeno de manchas en las hojas *Alternaria* de la calabaza o la calabaza china (*Alternaria brassicae*), patógeno *Alternaria* de manchas carbonosas de la calabaza (*Alternaria brassicola*), patógeno *Alternaria* de manchas en las hojas de la cebolla o la cebolla Welsh (*Alternaria porri*); el género *Pseudocercospora*, tal como patógeno de la cercosporiosis del trigo (*Pseudocercospora herpotrichoides*); el género *Pseudocercospora*, tal como patógeno de manchas en las hojas de la vid (*Pseudocercospora vitis*); el género *Rhynchosporium*, tal como patógeno del escaldado de la cebada (*Rhynchosporium secalis*); el género *Cladosporium*, tal como patógeno de la sarna del melocotón (*Cladosporium carpophilum*); el género *Phomopsis*, tal como patógeno *Phomopsis* de podredumbre del melocotón (*Phomopsis* sp.); el género *Gloeosporium*, tal como patógeno de antracnosis del caqui (*Gloeosporium kaki*); el género *Fulvia*, tal como patógeno del moho de las hojas del tomate (*Fulvia fulva*); y el género *Corynespora*, tal como patógeno *Corynespora* de machas en las hojas del pepino (*Corynespora cassiicola*).

La composición de la presente invención es capaz de controlar los diversos hongos nocivos anteriores y, por tanto, puede controlar preventiva o curativamente diversas enfermedades. Particularmente, la composición de la presente invención es eficaz para controlar diversas enfermedades que son problemáticas en el campo de la agricultura y la horticultura, tales como el quemado, las manchas marrones, tizón de la vaina o podredumbre del arroz (*Oryza sativa*, etc.); oídio, sarna, roya parda, roya estriada, helmintosporiosis, rayado, moho bajo la nieve, marchitamiento bajo la nieve, carbón desnudo, cercosporiosis, escaldado, manchas en las hojas o mancha de la pluma de los cereales (*Hordeum vulgare*, *Triticum aestivum*, etc.); melanosis o sarna de cítricos (*Citrus* spp., etc.); tizón de la floración, oídio, melanosis, manchas en las hojas o sarna de la manzana por *Alternaria* (*Malus pumila*); sarna o manchas negras de la pera (*Pyrus ussuriensis*, *Pyrus communis*); podredumbre marrón, sarna o podredumbre del melocotón por *Phomopsis* (*Prunus persica*, etc.); antracnosis, podredumbre blanca, machas en las hojas, brazo de hinchazón, oídio o mildiú de la vid (*Vitis vinifera* spp., etc.); antracnosis, manchas circulares en las hojas o manchas en las hojas por *Cercospora* del caqui japonés (*Diospyros kaki*, etc.); antracnosis, oídio, tizón del tallo pegajoso, manchas en las hojas por *Corynespora* o mildiú de cucurbitáceas (*Cucumis melo*, etc.); tizón temprano, haiiro-eki-byo, moho en las hojas o tizón tardío del tomate (*Lycopersicon esculentum*); sigatoka negra del plátano (*Musa sapientum*, etc.);

manchas en las hojas de la remolacha por *Cercospora* (*Beta vulgaris* var. *saccharifera*, etc.); tizón por *Mycosphaerella* del guisante de jardín (*Pisum sativum*); diversos patógenos de *Alternaria* de crucíferas (*Brassica* sp., *Raphanus* sp., etc.); tizón tardío y tizón temprano de la patata (*Solanum tuberosum*); oídio o manchas de las hojas de la fresa (*Fragaria*, etc.); y moho gris o enfermedad provocada por *Sclerotinia* de diversos cultivos como judías, verduras, frutas o flores. Entre ellas, es particularmente eficaz contra diversos mohos grises o enfermedades provocadas por *Sclerotinia* del pepino (*Cucumis sativus*), judía (*Phaseolus vulgaris*), adzuki beari (*Vigna angularis*), soja (*Glycine max*), guisante de jardín, cacahuete (*Arachis hypogaea*), tomate, fresa, berenjena (*Solanum melongena*), pimentón (*Capsicum annuum*), pimiento dulce (*Capsicum annuum*), lechuga (*Lactuca sativa*), cebolla (*Allium cepa*), vid, cítricos, estáticos (*Limonium* spp.), clavel, (*Dianthus* spp.), rosa (*Rosa* spp.), pensamiento de jardín (*Viola*, etc.) o girasol (*Helianthus annuus*).

Además, la composición de la presente invención es eficaz para el control preventivo o curativo de enfermedades del suelo provocadas por patógenos vegetales, tales como *Fusarium*, *Pythium*, *Rhizoctonia*, *Verticillium* y *Plasmodiophora*.

Es más, la composición de la presente invención es eficaz también para el control de diversos patógenos resistentes a fungicidas, tales como bencimidazoles, estrobilurinas, dicarboximidas, fenilamidas e inhibidores de la biosíntesis del ergosterol.

Además, la composición de la presente invención tiene una excelente propiedad de migración penetrante y cuando se aplica en el suelo un plaguicida que contiene la composición de la presente invención, es posible controlar hongos nocivos en tallos y hojas a la vez que se controlan estos hongos nocivos en el suelo.

La composición de la presente invención se formula habitualmente mezclando el derivado de amida de ácido representado por la fórmula (I) o una de sus sales con diversos adyuvantes agrícolas y se usa en forma de una formulación, tal como polvo, gránulos, gránulos hidrodispersables, polvo humectante, un concentrado de suspensión basada en agua, un concentrado de suspensión basado en aceite, gránulos hidrosolubles, un concentrado emulsionable, un concentrado soluble, una pasta, un aerosol o una formulación de volumen ultra-bajo. Sin embargo, siempre y cuando sea adecuado para el objeto de la presente invención, se puede formular en cualquier tipo de formulación comúnmente usada en el presente campo. Dichos adyuvantes agrícolas incluyen vehículos sólidos tales como tierra de diatomeas, cal apagada, carbonato cálcico, talco, carbón blanco, caolín, bentonita, una mezcla de caolinita y sericita, arcilla, carbonato sódico, bicarbonato sódico, mirabilita, zeolita y almidón; disolventes, tales como agua, tolueno, xileno, disolvente nafta, dioxano, acetona, isoforona, metilisobutilcetona, clorobenceno, ciclohexano, dimetilsulfóxido, *N,N*-dimetilformamida, dimetilacetamida, *N*-metil-2-pirrolidona y alcohol; tensioactivos aniónicos y extendedores tales como una sal de ácido graso, un benzoato, un alquilsulfosuccinato, un dialquilsulfosuccinato, un policarboxilato, una sal de éster de ácido alquilsulfúrico, un alquilsulfato, un alquilarilsulfato, un alquildiglicoléter sulfato, una sal de éster de ácido sulfúrico alcohólico, un alquilsulfonato, un alquilarilsulfonato, un arilsulfonato, un sulfonato de lignina, un alquildifeniléterdisulfonato, un sulfonato de poliestireno, una sal de éster de ácido alquilfosfórico, un alquilarilfosfato, un estirilaril-fosfato, una sal de éster de ácido sulfúrico de polioxietilentalquiléter, un polioxietilen-alquilaril-éter-sulfato, una sal de ácido sulfúrico de polioxietilen-alquilaril-éter, un polioxietilen-alquiléter-fosfato, una sal de éster de ácido fosfórico de polioxietilen-alquilarilo y una sal de un condensado de naftalenosulfonato con formalina; tensioactivos no iónicos y extendedores, tales como un éster de ácido graso de sorbitán, un éster de ácido graso de glicerina, un poliglicérido de ácido graso, un poliglicoléter de alcohol de ácido graso, acetilenglicol, alcohol acetilénico, un polímero de bloques de oxalquileno, un alquiléter de polioxietileno, un alquilariléter de polioxietileno, un estirilariléter de polioxietileno, un alquiléter de polioxietilenglicol, un polietilenglicol, un éster de ácido graso de polioxietileno, un éster de ácido graso de polioxietilen-sorbitán, un éster de ácido graso de polioxietilenglicerina, un aceite de ricino hidrogenado de polioxietileno y un éster de ácido graso de polioxipropileno; y aceites vegetales y minerales, tales como aceite de oliva, aceite de kapok, aceite de ricino, aceite de palma, aceite de camelia, aceite de coco, aceite de sésamo, aceite de maíz, aceite de fibra de arroz, aceite de cacahuete, aceite de semilla de algodón, aceite de semilla de soja, aceite de colza, aceite de lino, aceite de tung y parafinas líquidas. Cada uno de los componentes de dichos adyuvantes se puede seleccionar adecuadamente para su uso, siempre y cuando permita alcanzar el objeto de la presente invención. Además, también se pueden emplear diversos aditivos comúnmente usados, tales como una carga, un espesante, un agente antisedimentación, un agente anticongelante, un estabilizador de la dispersión, un agente reductor de la fitotoxicidad y un agente antimoho.

La proporción en peso del derivado de amida de ácido representado por la fórmula (I) o una de sus sales con los diversos adyuvantes agrícolas es habitualmente de 0,001:99,999 a 95:5, preferentemente, de 0,005:99,995 a 90:10.

En la aplicación real de dicha formulación, se puede usar como tal o se puede diluir hasta una concentración predeterminada con un diluyente, tal como agua, y se pueden añadir diversos extendedores, p. ej., tensioactivos, aceite vegetales o aceites minerales a la misma según lo requiera el caso.

La aplicación de la composición de la presente invención no se puede definir en términos generales, pues varía en función de las condiciones climatológicas, del tipo de formulación, de las plantas del cultivo que se vayan a tratar, de la estación del año en la que se realice la aplicación, de la zona de la aplicación, de los tipos o estados de germinación de los hongos nocivos y de los tipos o del grado de brote de las enfermedades. Sin embargo, habitualmente se aplica a

una concentración del ingrediente activo de 0,1 a 10.000 ppm, preferentemente, de 1 a 2.000 ppm en el caso del tratamiento del follaje, y su dosis puede ser tal que el derivado de amida de ácido de fórmula (1) o una de sus sales sea habitualmente de 0,1 a 50.000 g, preferentemente, de 1 a 30.000 g por hectárea. En el caso del tratamiento del suelo, se aplica habitualmente a una dosis del derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales de 10 a 100.000 g, preferentemente, de 200 a 20.000 g por hectárea.

La formulación que contiene la composición de la presente invención o un producto diluido de la misma se puede aplicar mediante un procedimiento de aplicación comúnmente usado, tal como mediante extendido (extendido, pulverizado, nebulizado, atomizado, difusión en grano o aplicación sobre la superficie de agua), aplicación en el suelo (tal como mediante mezclado o irrigación) o aplicación superficial (tal como mediante revestimiento, espolvoreado o tapado). Además, se puede aplicar también mediante el denominado volumen ultra-bajo. En este procedimiento, la formulación puede contener el 100% del ingrediente activo.

La composición de la presente invención se puede mezclar o se puede usar en combinación con otros compuestos químicos agrícolas, fertilizantes o agentes reductores de la fitotoxicidad, mediante lo que, a veces, se pueden obtener efectos o actividades sinérgicos. Dichos otros compuestos químicos pueden ser, por ejemplo, un herbicida, un insecticida, un miticida, un nematocida, un plaguicida para el suelo, un fungicida, un agente antiviral, un atrayente, un antibiótico, una hormona vegetal y un agente regulador del crecimiento vegetal. En especial, con una composición fungicida mixta que tenga el derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales mezclado con o usado en combinación con uno o más otros ingredientes fungicidamente activos, se pueden mejorar el intervalo de aplicación, el tiempo de aplicación, las actividades fungicidas, etc. en los sentidos preferidos. En la presente memoria, el derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales y el compuesto de ingrediente activo de otro fungicida se pueden formular por separado, de manera que se pueden mezclar para usarse en el mismo momento de la aplicación o se pueden formular juntos para su uso. La presente invención incluye dicha composición fungicida.

La proporción de mezcla del derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales con respecto a otro compuesto de ingrediente fungicidamente activo no se puede definir en general, pues varía en función de las condiciones climatológicas, de los tipos de formulaciones, de los cultivos que se vayan a tratar, del momento de la aplicación, de la zona de aplicación, de los tipos o del estado de germinación de los hongos nocivos, de los tipos o del estado de las enfermedades, etc., pero habitualmente está en el intervalo de 1:300 a 300:1, preferentemente, de 1:100 a 100:1 en peso. Además, la dosis de aplicación puede ser tal que la cantidad total de compuestos activos sea de 0,1 a 70.000 g, preferentemente, de 1 a 30.000 g por hectárea. La presente invención incluye un procedimiento para controlar hongos nocivos mediante una aplicación de dicha composición fungicida mixta.

El compuesto de ingrediente activo (nombre común; entre los que se incluye alguno que se encuentra en solicitud o código de prueba de la asociación japonesa de protección de especies vegetales) del fungicida de dicho otro compuesto químico agrícola puede ser, por ejemplo:

un compuesto de anilino pirimidina, tal como Mepanipyrim, Pirimethanil o Cyprodinil;
 un compuesto de piridinamina, tal como Fluzinam;
 un compuesto de azol, tal como Triadimefon, Bitertanol, Triflumizole, Etaconazole, Propiconazole, Penconazole, Flusilazole, Myclobutanilo, Cyproconazole, Tebuconazole, Hexaconazole, Furconazole, Prochloraz, Metconazole, Epoxiconazole, Tetraconazole, Oxpoconazole fumarate, Sipconazole, Prothioconazole, Triadimenol, Flutriafol, Difenconazole, Fluquinconazole, Fenbuconazole, Bromuconazole, Diniconazole, Tricyclazole, Probenazole o Simeconazole, Pefurazoate, Ipconazole o Imibenconazole;
 un compuesto de quinoxalina, tal como Quinomethionate;
 un compuesto de ditiocarbamato, tal como Maneb, Zineb, Mancozeb, Policarbamate, Metiram o Propineb;
 un compuesto de cloro orgánico, tal como Fthalide, Chlorothalonil o Quintozene;
 un compuesto de imidazol, tal como Benomyl, Thiophanate-Methyl, Carbendazim o Cyazofamid;
 un compuesto de cianoacetamida, tal como Cymoxanil;
 un compuesto de fenilamida, tal como Metalaxyl, Metalaxyl M, Oxadixyl, Ofurace, Benalaxyl, Benalaxyl M, Furalaxyl o Cyprofuram;
 un compuesto de ácido sulfénico, tal como Dichlofluanid;
 un compuesto de cobre, tal como hidróxido cúprico o cobre de oxina;
 un compuesto de isoxazol, tal como Hymexazol;
 un compuesto de fósforo orgánico, tal como Fosetyl-Al, Tolcofos-Metilo, O,O-diisopropilfosforotioato de S-bencilo, S,S-difenilfosforotioato de O-etilo o etilhidrógenofosfonato de aluminio;
 un compuesto de N-halogenotioalquilo, tal como Captan, Captafol o Folpet;
 un compuesto de dicarboxiimida, tal como Procymidone, Iprodione o Vinclozolin;
 un compuesto de benzanilida, tal como Flutolanilo, Mepronil, Zoxamid o Tiadinil;
 un compuesto de anilida, tal como Boscalid;
 un compuesto de piperazina tal como Triforine;
 un compuesto de piridina, tal como Pirifenox;
 un compuesto de carbinol, tal como Fenarimol o Flutriafol;
 un compuesto de piperidina, tal como Fenpropidine;
 un compuesto de morfolina, tal como Fenpropimorph o Tridemorph;

un compuesto de estaño orgánico, tal como hidróxido de fentina o acetato de fentina;
 un compuesto de urea, tal como Pencycuron;
 un compuesto de ácido cinnámico, tal como Dimethomorph o Flumorph;
 un compuesto de fenilcarbarnato, tal como Diethofencarb;
 5 un compuesto de cianopirrol, tal como Fludioxonil o Fenpiclonil;
 un compuesto de estrobilurina, tal como Azoxystrobin, Kresoxim-Methyl, Metominofen, Trifloxystrobin, Picoxystrobin Oryzastrobin, Dimoxystrobin, Pyraclostrobin, Fluoxastrobin o Flucacypirín;
 un compuesto de oxazolidinona, tal como Famoxadone;
 un compuesto de tiazolcarboxamida, tal como Ethaboxam;
 10 un compuesto de sililamida, tal como Silthiopham;
 un compuesto de carbarnato de amida de aminoácido, tal como lprovalicarb o Benthiavalicarb-isopropyl;
 un compuesto de imidazolidina, tal como Fenamidone;
 un compuesto de hidroxianilida, tal como Fenhexamid;
 un compuesto de bencenosulfonamida, tal como Flusulfamide;
 15 un compuesto de éter de oxima, tal como Cyflufenamid;
 un compuesto de fenoxiamida, tal como Fenoxanil;
 un antibiótico, tal como Polioxins;
 un compuesto de guanidina, tal como lminoctadine;
 otro compuesto, tal como Isoprothiolane, Pyroquilon, Diclomezine, Quinoxifen, Clorhidrato de Propamocarb, Spiroxamine Cloropicrin, Dazomet, Metam sódico, Nicobifen, Metrafenone, MTF-753 (Pentiopirad), UBF-307, Diclocymet, Proquinazid, NC-224 (Amibromdole, Amisulbrom), KIF-7767 (KUF-1204, Pyribencarb metilo, Mepyracarb) o Syngenta 446510 (Mandipropamid, Dipromandamid).

El compuesto de ingrediente activo (nombre común; entre los que se incluye alguno que se encuentra en solicitud) del insecticida, miticida, nematocida o plaguicida de suelo de dicho otro compuesto químico agrícola puede ser, por ejemplo:

un compuesto de fosfato orgánico, tal como Profenofos, Dichlorvos, Fenamiphos, Fenitrothion, EPN, Diazinon, Chlorpirifos-metilo, Acephate, Prothiofos, Fosthiazate, Phosphocarb, Cadusafos, Disulfoton, Chlorpyrifos, Demeton-S-metilo, Dimethoate o Methamidophos;
 30 un compuesto de carbarnato, tal como Carbaryl, Propoxur, Aldicarb, Carbofuran, Tiodicarb, Methomyl, Oxamyl, Ethiofencarb, Pirimicarb, Fenobucarb, Carbosulfan o Benfuracarb;
 un derivado de nelicetoxina, tal como Cartap, Thiocyclam o Bensultap;
 un compuesto de cloro orgánico, tal como Dicofol o Tetradifon;
 35 un compuesto de metal orgánico, tal como Óxido de fenbutatina;
 un compuesto piretroide, tal como Fenvalerate, Permethrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Cyhalothrin, Tefluthrin, Ethofenprox, Fenpropathrin o Bifenthrin;
 un compuesto de benzoil-urea, tal como Diflubenzuron, Chlorfluazuron, Teflubenzuron, Flufenoxuron, Lufenuron o Novaluron;
 40 un compuesto de tipo hormona juvenil, tal como Methoprene, Pyriproxyfen o Fenoxycarb;
 un compuesto de piridinona, tal como Pyridaben;
 un compuesto de pirazol, tal como Fenpyroximate, Fipronilo, Tebufenpyrad, Ethiprole, Tolfenpyrad, Acetoprole, Pirafluprole o Pyriprole;
 un compuesto neonicotinoide tal como lmidacloprid, Nitenpyram, Acetamiprid, Thiachloprid, Thiamethoxam, Clothianidin o Dinotefuran;
 45 un compuesto de hidrazina, tal como Tebufenozide, Methoxyfenozide o Chromafenozide;
 un compuesto dinitro, un compuesto de azufre orgánico, un compuesto de urea, un compuesto de triazina o un compuesto de hidrazona;
 otro compuesto, tal como Flonicamid, Buprofezin, Hexythiazox, Amitraz, Chlordimeform, Silafluofen, Triazamate, Pymetrozine, Pyrimidifen, Chlorfenapyr, Indoxacarb, Acequinocyl, Etoazole, Cyromazine, 1,3-dicloropropeno, Diafenthiuron, Benclothiaz, Flufenerim, Pyridalilo, Spirodiclofen, Bifenazate, Spiromesifen, spirotetramat, Propargite, Clofentezine, Fluacrypyrim, Metaflumizone, Flubendiamide o Cyflumetofen.

Además, un plaguicida microbiano, tal como un agente de BT, un agente de virus patógeno de insecto, hongos entomopatógeno u hongos nematófagos;
 55 un antibiótico, tal como Avermectin, Emamectin-Benzoate, Milbemectin, Spinosad, Ivermectin o Lepimectin;
 un producto natural, tal como Azadirachtin.

Las realizaciones preferidas de la presente invención son las siguientes. Sin embargo, se ha de entender que la presente invención no se limita en absoluto a dichas realizaciones específicas.

(1) Un uso de un derivado de amida de ácido de la formula (I) anterior o una de sus sales según lo definido por la reivindicación 13.
 (2) El uso según la reivindicación 13 de un derivado de amida de ácido o una de sus sales, en el que A es fenilo que puede estar sustituido con X, naftilo que puede estar sustituido con X, anillo heterocíclico que puede estar sustituido con X o anillo heterocíclico fusionado que puede estar sustituido con X; B es anillo heterocíclico de 5

miembros que puede estar sustituido con Y; X es halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxialquilo, dialquilaminoalquilo, alquinilo, trialquilsililalquinilo, hidroxilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alcoxialcoxilo, cicloalquilo, nitro, fenilo, fenilalquinilo, piridiloxilo que puede estar sustituido con haloalquilo, alquilcarboniloxilo, alquilsulfoniloxilo o anillo heterocíclico (el anillo heterocíclico puede estar sustituido con halógeno, alquilo o alquilcarbonilo); Y es halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, cicloalquilo o formilo; cada uno de R¹ y R², que son independientes entre sí, es hidrógeno o alquilo; R³ es hidrógeno, alquilo, alquilcarbonilo o alcoxicarbonilo; y cada uno de W¹ y W², que son independientes entre sí, es oxígeno o azufre.

(3) Un uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según (2) anterior, en el que cada uno de W¹ y W² es oxígeno.

(4) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según (2) anterior, en el que B es anillo heterocíclico de 5 miembros que puede estar sustituido con Y; X es halógeno, alquilo, haloalquilo, alquinilo, hidroxilo, alcoxilo, haloalcoxilo, alcoxialcoxilo, cicloalquilo, nitro, fenilalquinilo, piridiloxilo que puede estar sustituido con haloalquilo, alquilcarboniloxilo o anillo heterocíclico (el anillo heterocíclico puede estar sustituido con halógeno, alquilo o alquilcarbonilo); Y es halógeno, alquilo, haloalquilo o alcoxilo; R³ es hidrógeno, alquilcarbonilo o alcoxicarbonilo; y cada uno de W¹ y W² es oxígeno.

(5) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según (2) o (4) anterior, en el que B es furilo que puede estar sustituido con Y, tienilo que puede estar sustituido con Y, pirrolilo que puede estar sustituido con Y, oxazolilo que puede estar sustituido con Y, isoxazolilo que puede estar sustituido con Y, tiazolilo que puede estar sustituido con Y, isotiazolilo que puede estar sustituido con Y, pirazolilo que puede estar sustituido con Y o tiadiazolilo que puede estar sustituido con Y.

(6) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según (5) anterior, en el que B es furilo que puede estar sustituido con Y, tienilo que puede estar sustituido con Y, pirrolilo que puede estar sustituido con Y, oxazolilo que puede estar sustituido con Y, tiazolilo que puede estar sustituido con Y, isotiazolilo que puede estar sustituido con Y, pirazolilo que puede estar sustituido con Y o tiadiazolilo que puede estar sustituido con Y.

(7) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según (6) anterior, en el que B es furilo sustituido con Y.

(8) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según (6) anterior, en el que B es tienilo sustituido con Y.

(9) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según (6) anterior, en el que B es pirazolilo sustituido con Y.

(10) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según (2) anterior, en el que A es fenilo que puede estar sustituido con X, naftilo que puede estar sustituido con X, benzodioxolanilo que puede estar sustituido con X o benzodioxanilo que puede estar sustituido con X; B es furilo que puede estar sustituido con Y, tienilo que puede estar sustituido con Y o pirazolilo que puede estar sustituido con Y; X es halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilo o haloalcoxilo; Y es halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilo o haloalcoxilo; R³ es hidrógeno; y cada uno de W¹ y W² es oxígeno.

(11) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según (10) anterior, en el que B es furilo sustituido con Y, tienilo sustituido con Y o pirazolilo sustituido con Y.

(12) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según (10) anterior, en el que B es furilo sustituido con Y, tienilo sustituido con Y, pirazolilo sustituido con Y, e Y es halógeno, alquilo o haloalquilo.

(13) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según (10) anterior, en el que A es fenilo sustituido con X o benzodioxolanilo sustituido con X, y B es furilo sustituido con Y, tienilo sustituido con Y o pirazolilo sustituido con Y.

(14) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según (10) anterior, en el que A es fenilo sustituido con X o benzodioxolanilo sustituido con X; B es furilo sustituido con Y, tienilo sustituido con Y o pirazolilo sustituido con Y; X es halógeno, alquilo o alcoxilo; e Y es halógeno, alquilo o haloalquilo.

(15) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según (10) anterior, en el que A es fenilo sustituido con X o benzodioxolanilo sustituido con X; B es furilo sustituido con Y, tienilo sustituido con Y o pirazolilo sustituido con Y; cada uno de R¹ y R² es alquilo; X es halógeno, alquilo o alcoxilo; e Y es halógeno, alquilo o haloalquilo.

(16) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según uno cualquiera de los (10) a (15) anteriores, en el que B es furilo sustituido con Y.

(17) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según uno cualquiera de los (10) a (15) anteriores, en el que B es tienilo sustituido con Y.

(18) El uso de un derivado de amida de ácido o una de sus sales según uno cualquiera de los (10) a (15) anteriores, en el que B es pirazolilo sustituido con Y.

(19) Una composición fungicida que contiene un derivado de amida de ácido o una de sus sales según lo definido en la reivindicación 1 como ingrediente activo.

(20) Una composición fungicida mixta que contiene el derivado de amida de ácido o una de sus sales según lo definido en la reivindicación 1 y otro compuesto de ingrediente fungicidamente activo como ingredientes activos.

(21) La composición fungicida según (20) anterior, en la que dicho compuesto de ingrediente fungicidamente activo es al menos un miembro seleccionado del grupo que consiste en un compuesto de anilino pirimidina, un compuesto de piridinamina, un compuesto de azol, un compuesto de quinoxalina, un compuesto de ditiocarbamato, un compuesto de cloro orgánico, un compuesto de imidazol, un compuesto de cianoacetamida, un compuesto de fenilamida, un compuesto de ácido sulfénico, un compuesto de cobre, un compuesto de isoxazol, un compuesto de fósforo orgánico, un compuesto de N-halogenotioalquilo, un compuesto de dicarboxiimida, un

compuesto de benzanilida, un compuesto de anilida, un compuesto de piperazina, un compuesto de piridina, un compuesto de carbinol, un compuesto de piperidina, un compuesto de morfolina, un compuesto de estaño orgánico, un compuesto de urea, un compuesto de ácido cinámico, un compuesto de fenilcarbamato, un compuesto de cianopirrol, un compuesto de estrobilurina, un compuesto de oxazolidinona, un compuesto de tiazolcarboxamida, un compuesto de sililamida, un compuesto de carbamato de amida de aminoácido, un compuesto de imidazolidina, un compuesto de hidroxianilida, un compuesto de bencenosulfonamida, un compuesto de éter de oxima, un compuesto de fenoxiamida, un antibiótico, un compuesto de guanidina, isoprotilano, piroquilona, diclomezina, quinoxifeno, clorhidrato de propamocarb, espiroxamina, cloropicrina, dazomet, metam sódico, nicobifeno, metrafenona, MTF-753, UBF-307, diclocimet, proquinazid, NC-224, KIF-7767 y Syngenta 446510.

(21) La composición fungicida mixta según (20) anterior, en la que dicho otro ingrediente fungicidamente activo es al menos un miembro seleccionado del grupo que consiste en un compuesto de piridinamina, un compuesto de azol, un compuesto de ditiocarbamato, un compuesto de cloro orgánico, un compuesto de imidazol, un compuesto de cobre, un compuesto de dicarboxiimida, un compuesto de anilida, un compuesto de piperazina, un compuesto de piridina, un compuesto de carbinol, un compuesto de fenilcarbamato, un compuesto de cianopirrol, un compuesto de estrobilurina, un compuesto de hidroxianilida, MTF-753 y KIF-7767.

(22) La composición fungicida mixta según (21) anterior, en la que dicho otro ingrediente fungicidamente activo es al menos un miembro seleccionado del grupo que consiste en Fluazinam, Triadimefon, Bitertanol, Triflumizole, Eptaconazole, Propiconazole, Penconazole, Flusilazole, Myclobutanilo, Cyproconazole, Terbuconazole, Hexaconazole, Furconazole-cis, Prochloraz, Metconazole, Epoxiconazole, Tetraconazole, fumarato de Oxpoconazole, Sipconazole, Prothioconazole, Triadimenol, Flutriafol, Difenconazole, Fluquinconazole, Fenbuconazole, Bromuconazole, Diniconazole, tricyclazole, probenazole, Simeconazole, Pefurazoate, Ipconazole, Imibenconazole, Maneb, Zineb, Mancozeb, Policarbamate, Metiram, Propineb, Fthalide, Clorothalonilo, Quintozene, Benomyl, Tiophanate-Methyl, Carbendazim, Cyazofamid, hidróxido cúprico, Oxina de cobre, Procymidone, Iprodione, Vinclozolin, Boscalid, Diethofencarb, Fludioxonil, Fenpiclonil, Azoxystrobin, Kresoxim-Methyl, Metominofen, Trifloxystrobin, Picoxystrobin, Oryzastrobin, Dimoxystrobin, Pyraclostrobin, Fluoxastrobin, Fluacrypyrin, Fenhexamid, Polyoxins, Iminoctadine, MTF-753 y KIF-7767.

(23) Un procedimiento para controlar hongos nocivos seleccionados entre *Domyces*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* o *Deuteromycetes*, que comprende aplicar una cantidad eficaz del derivado de amida de ácido o una de sus sales según lo definido en uno cualquiera de los anteriores (1) a (17).

A continuación, se describirá la presente invención más detalladamente con referencia a los ejemplos. Sin embargo, se ha de entender que la presente invención no se limita en absoluto a los mismos. En primer lugar, se describirán los ejemplos preparativos del derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales.

Ejemplo preparativo 1

Preparación de *N*-[(3',4'-dicloro-1,1-dimetil)fenacil]-2-metil-3-furancarboxamida (Compuesto n.º 1-57 mencionado más adelante)

(1) Se añadió una mezcla en gotas que comprendía 10,0 g de cloruro de 3,4-diclorobenzoilo, 9,31 g de 2-bromoisobutirato de etilo y 90 ml de dietiléter anhidro a 3,12 g de cinc en una atmósfera de nitrógeno, que luego se hizo reaccionar durante 15 horas bajo reflujo. Se filtró la mezcla de reacción a través de Celite y se lavó el filtrado con ácido sulfúrico al 20% y luego con agua. Se secó la capa orgánica con sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo una presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/19), obteniéndose 8,7 g de 2-(3',4'-diclorobenzoil)isobutirato de etilo oleaginoso. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /400 MHz): 1,11 (t, 3H), 1,52 (s, 6H), 4,14 (c, 2H), 7,48 (d, 1H), 7,63 (dd, 1H), 7,96 (d, 1H).

(2) Se hizo reaccionar durante 15 horas a reflujo una mezcla que comprendía 8,7 g de 2-(3',4'-diclorobenzoil)isobutirato de etilo, 14,2 ml de ácido sulfúrico, 14,2 ml de agua y 40 ml de ácido acético. Se puso la mezcla de reacción en agua con hielo y se extrajo con acetato de etilo, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica con sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo una presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/19), obteniéndose 6,47 g de 3,4-dicloroisobutirofenona oleaginoso. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /400 MHz): 1,21 (d, 6H), 3,46 (m, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,79 (dd, 1H), 8,02 (d, 1H).

(3) Se añadieron 9,32 g de tribromuro de feniltrimetilamonio a una mezcla que comprendía 6,47 g de 3,4-dicloroisobutirofenona y 100 ml de tetrahidrofurano, seguidos de una reacción durante 4 horas a temperatura ambiente. Se filtró la mezcla de reacción, y se concentró el filtrado bajo presión reducida, obteniéndose 6,39 g de α -bromo-3,4-dicloroisobutirofenona oleaginoso. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /300 MHz): 2,01 (s, 6H), 7,50 (d, 1H), 8,0 (dd, 1H), 8,20 (d, 1H).

(4) Se añadieron 2,8 g de azida de sodio a una mezcla que comprendía 6,39 g de α -bromo-3,4-dicloroisobutirofenona y 60 ml dimetilsulfóxido, seguidos de una reacción durante una hora a 50°C.

Se puso la mezcla de reacción en agua con hielo y se extrajo con acetato de etilo, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/9), obteniéndose 6,34 g de α -azida-3,4-dicloroisobutirofenona oleaginoso. Los datos de los espectros de RMN

de este producto son los siguientes.
RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /300 MHz): 1,60 (s, 6H), 7,53 (d, 1H), 7,97 (dd, 1H), 8,20 (d, 1H).

(5) Se añadieron 7,74 g de trifenilfosfina a una mezcla que comprendía 6,34 g de α -azida-3,4-dicloroisobutirofenona, 90 ml de tetrahidrofurano y 3,2 ml de agua, seguidos de una reacción durante 23 horas a temperatura ambiente. Se concentró la mezcla de reacción bajo presión reducida. Se añadieron al residuo agua y luego ácido clorhídrico para convertirlo en débilmente ácido, tras lo que se lavó con dietiléter. Se neutralizó la capa acuosa con solución de hidróxido de sodio y se extrajo con dietiléter. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se añadió al residuo acetato de etilo y se introdujo gas de cloruro de hidrógeno bajo enfriamiento con hielo. Se recogió el sólido formado mediante filtración y se secó, obteniéndose 5,92 g de clorhidrato de α -amino-3,4-dicloroisobutirofenona.

(6) Se añadieron 0,31 g de trietilamina a una mezcla que comprendía 0,3 g de clorhidrato de α -amino-3,4-dicloroisobutirofenona y 10 ml de tetrahidrofurano, tras lo que se agitó durante 5 horas a temperatura ambiente. Se concentró la mezcla bajo presión reducida. A una mezcla que comprendía el residuo obtenido, 0,195 g de ácido 2-metil-3-furan-carboxílico y 20 ml de diclorometano, se añadió una mezcla en gotas que comprendía 0,29 g de *N,N'*-diciclohexilcarbodiimida y 10 ml de diclorometano bajo enfriamiento con hielo, seguida de una reacción durante 15 horas a temperatura ambiente. Se filtró la mezcla de reacción, y se diluyó el filtrado con diclorometano y se lavó con solución acuosa de carbonato potásico y luego con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/9), obteniéndose 0,08 g del producto deseado que tiene un punto de fusión de 175 a 178°C. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /400 MHz): 1,71 (s, 6H), 2,43 (s, 3H), 6,28 (s, 1H), 6,44 (d, 1H), 7,26 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,84 (dd, 1H), 8,11 (d, 1H).

Ejemplo preparativo 2

Preparación de *N*-[(3'-difluorometoxi-1,1-dimetil)fenacil]-5-cloro-1,3-dimetil-4-pirazol-carboxamida (Compuesto n.º 1-72 mencionado más adelante)

(1) Se añadió en gotas un reactivo de Grignard preparado con 0,75 g de magnesio, 4,46 g de 2-bromopropano y 24 ml de dietiléter anhidro a una mezcla que comprendía 4,09 g de 3-difluorometoxibenzonitrilo y 20 ml de dietiléter anhidro. Una vez completada la adición en gotas, se hizo reaccionar la mezcla a temperatura ambiente durante 27 horas. Se introdujo la mezcla de reacción en agua con hielo y se añadió ácido sulfúrico 6N para volver la mezcla débilmente ácida, tras lo que se agitó durante 0,5 horas. Se extrajo la mezcla con dietiléter y se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/19), obteniéndose 2,04 g de 3-difluorometoxiisobutirofenona. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /300 MHz): 1,23 (d, 6H), 3,52 (m, 1H), 6,56 (t, 1H), 7,32 (dd, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,80 (d, 1H).

(2) Se añadieron 3,58 g de tribromuro de feniltrimetilamonio a una mezcla que comprendía 2,04 g de 3-difluorometoxiisobutirofenona y 30 ml de tetrahidrofurano, seguidos de una reacción durante dos horas a temperatura ambiente. Se filtró la mezcla de reacción y se concentró el filtrado bajo presión reducida, obteniéndose 2,79 g de α -bromo-3-difluorometoxiisobutirofenona oleaginoso.

(3) Se añadieron 1,24 g de azida de sodio a una mezcla que comprendía 2,79 g de α -bromo-3-difluorometoxiisobutirofenona y 35 ml de dimetilsulfóxido, seguidos de una reacción durante una hora a 50°C. Se puso la mezcla de reacción en agua con hielo y se extrajo con acetato de etilo, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/9), obteniéndose 2,21 g de α -azida-3-difluorometoxiisobutirofenona oleaginoso. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /300 MHz): 1,61 (s, 6H), 6,56 (t, 1H), 7,34 (dd, 1H), 7,48 (t, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,98 (d, 1H).

(4) Se hizo reaccionar una mezcla que comprendía 2,18 g de α -azida-3-difluorometoxiisobutirofenona, 35 ml de metanol y 0,109 g de paladio sobre carbono al 5% durante 1,5 horas a temperatura ambiente en una atmósfera de hidrógeno. Se filtró la mezcla de reacción a través de Celite y se concentró el filtrado bajo presión reducida. Al residuo, se añadió acetato de etilo, y se introdujo gas de cloruro de hidrógeno bajo enfriamiento con hielo, tras lo que se concentró bajo presión reducida, obteniéndose 1,76 g de clorhidrato de α -amino-3-difluorometoxiisobutirofenona.

(5) Se añadieron 0,33 g de trietilamina a una mezcla que comprendía 0,3 g de clorhidrato de α -amino-3-difluorometoxiisobutirofenona y 10 ml de tetrahidrofurano, y se añadió en gotas una mezcla que comprendía 0,25 g de cloruro de 5-cloro-1,3-dimetil-4-pirazol-carbonilo y 5 ml de tetrahidrofurano bajo

enfriamiento con hielo. Una vez completada la adición en gotas, se hizo reaccionar la mezcla a temperatura ambiente durante 3 horas. Se extrajo la mezcla de reacción con acetato de etilo, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/4), obteniéndose 0,23 g del producto deseado que tenía un punto de fusión de 138 a 139°C. Los datos de los

espectros de RMN de este producto son los siguientes.
RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /400 MHz): 1,75 (s, 6H), 2,28 (s, 3H), 3,80 (s, 3H), 6,50 (t, 1H), 6,80 (s, 1H), 7,23 (dd, 1H), 7,38 (t, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,86 (d, 1H).

10 Ejemplo preparativo 3

Preparación de *N*-[2-(2'-naftilcarbonyl)-2-propil]-5-cloro-1,3-dimetil-4-pirazolcarboxamida (Compuesto n.º 2-1)

(1) Se añadió en gotas un reactivo de Grignard preparado con 0,61 g de magnesio, 3,6 g de 2-bromopropano y 18 ml de dietiléter anhidro a una mezcla que comprendía 3,0 g de 2-naftonitrilo y 20 ml de dietiléter anhidro. Tras finalizar la adición de las gotas, se hizo reaccionar la mezcla durante 12 horas a reflujo. Se introdujo la mezcla de reacción en agua con hielo y se añadió ácido sulfúrico 6N para volver la mezcla débilmente ácida, tras lo que se agitó durante 0,5 horas. Se extrajo la mezcla con acetato de etilo, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/50), obteniéndose 1,14 g de 2-naftil-isopropil-cetona. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /400 MHz): 1,27 (d, 6H), 3,73 (m, 1H), 7,53 a 7,65 (m, 2H), 7,86 to 7,92 (m, 2H), 7,97 (d, 1H), 8,03 (dd, 1H), 8,48 (d, 1H).

(2) Se añadieron 2,16 g de tribromuro de feniltrimetilamonio a una mezcla que comprendía 1,14 g de 2-naftilisopropilcetona y 25 ml de tetrahidrofurano, y se hizo reaccionar la mezcla durante 3 horas. Se filtró la mezcla de reacción, y se concentró el filtrado bajo presión reducida, obteniéndose 1,59 g de α -bromoiso-propil-2-naftil-cetona oleaginoso.

(3) Se añadieron 0,75 g de azida de sodio a una mezcla que comprendía 1,59 g de α -bromoisopropil-2-naftil-cetona y 40 ml de dimetilsulfóxido, y se hicieron reaccionar las mezclas a 50°C durante 1,5 horas. Se puso la mezcla de reacción en agua con hielo y se extrajo con acetato de etilo, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/9), obteniéndose 1,19 g de α -azidaisopropil-2-naftil-cetona oleaginoso.

Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.
RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /400 MHz): 1,68 (s, 1H), 7,54 a 7,66 (m, 2H), 7,86 a 7,90 (m, 2H), 7,98 (d, 1H), 8,10 (dd, 1H), 8,74 (d, 1H).

(4) Se hizo reaccionar una mezcla que comprendía 0,3 g de α -azidaisopropil-2-naftil-cetona, 10 ml de metanol y 15 g de paladio sobre carbono al 5% durante una hora a temperatura ambiente en una atmósfera de hidrógeno. Se filtró la mezcla de reacción a través de Celite y se concentró el filtrado bajo presión reducida, obteniéndose 0,26 g de α -aminoisopropil-2-naftil-cetona oleaginoso.

(5) Se añadieron 0,19 g de trietilamina a una mezcla que comprendía 0,26 g de α -aminoisopropil-2-naftil-cetona y 10 ml de tetrahidrofurano, y se añadió en gotas una mezcla que comprendía 0,24 g de cloruro de 5-cloro-1,3-dimetil-4-pirazol-carbonilo y 5 ml de tetrahidrofurano bajo enfriamiento con hielo. Tras finalizar la adición de las gotas, se hizo reaccionar la mezcla durante 15 horas a temperatura ambiente. Se extrajo la mezcla de reacción con acetato de etilo, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica con sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo una presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 2/3), obteniéndose 0,15 g del producto deseado que tenía un punto de fusión de 145 a 147°C. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /300 MHz): 1,87 (s, 6H), 2,28 (s, 3H), 3,79 (s, 3H), 7,05 (s, 1H), 7,48 a 7,58 (m, 2H), 7,80 a 7,90 (m, 3H), 8,05 (dd, 1H), 8,56 (d, 1H).

Ejemplo preparativo 4

Preparación de *N*-[2-[(2',2',3',3'-tetrafluoro-1',4'-benzodioxan-6'-il)carbonyl]isopropil]-3-metil-2-tiofen-carboxamida (Compuesto n.º 4-10 mencionado más adelante)

(1) Se añadieron 7,3 ml de *n*-butillitio (solución en *n*-hexano 1,57M) en gotas a -50°C en una atmósfera de nitrógeno a una mezcla que comprendía 3,0 g de 6-bromo-2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxano y 38 ml de dietiléter, tras lo que se agitó durante 30 minutos a la misma temperatura. Luego, se añadieron 0,83 g de isobutilaldehído en gotas a una temperatura de -70°C como máximo, y se calentó la mezcla hasta la temperatura ambiente y se hizo reaccionar durante 15 horas. Se puso la mezcla de reacción en agua con hielo y se ajustó para que fuera débilmente ácida con ácido clorhídrico y se extrajo con dietiléter. Se lavó la capa orgánica con agua, se secó sobre sulfato de magnesio y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/9), obteniéndose

1,8 g de 1-(2',2',3',3'-tetrafluoro-1',4'-benzodioxan-6'-il)-2-metilpropanol oleaginoso. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: $\text{CDCl}_3/400$ MHz): 0,83 (d, 3H), 0,96 (d, 3H), 1,92 (m, 1H), 4,40 (d, 1H), 6,90 (d, 1H), 7,10 (s, 2H), 7,14 (s, 1H).

(2) Se añadió una mezcla que comprendía 1,8 g de 1-(2',2',3',3'-tetrafluoro-1',4'-benzodioxan-6'-il)-2-metilpropanol y 7 ml de diclorometano, a una mezcla que comprendía 2,08 g de clorocromato de piridinio, 1,05 g de acetato de sodio y 20 ml de diclorometano, seguida de una reacción durante dos horas a temperatura ambiente. Se filtró la mezcla de reacción a través de Celite y se concentró el filtrado bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/19), obteniéndose 1,40 g de 2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-il-isopropil-cetona. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: $\text{CDCl}_3/400$ MHz): 1,23 (d, 6H), 3,48 (m, 1H), 7,24 (d, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,81 (dd, 1H).

(3) Se añadieron 1,89 g de tribromuro de feniltrimetilamonio a una mezcla que comprendía 1,40 g de 2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-il-isopropil-cetona y 1,4 ml de tetrahidrofurano, seguidos de una reacción durante dos horas a temperatura ambiente. Se filtró la mezcla de reacción, y se concentró el filtrado bajo presión reducida, obteniéndose 1,78 g de α -bromoisopropil 2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-il-cetona oleaginoso.

(4) Se añadieron 0,65 g de azida de sodio a una mezcla que comprendía 1,78 g de α -bromoisopropil-2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-il-cetona y 10 ml de dimetilsulfóxido, seguidos de una reacción durante dos horas a 50°C. Se puso la mezcla de reacción en agua y se extrajo con dietiléter, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/19), obteniéndose 1,5 g de α -azidaisopropil 2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-il-cetona oleaginoso. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: $\text{CDCl}_3/400$ MHz): 1,61 (s, 6H), 7,23 (d, 1H), 8,01 to 8,03 (m, 2H).

(5) Se hizo reaccionar una mezcla que comprendía 0,25 g de α -azidaisopropil-2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-il-cetona, 15 ml de metanol y 13 mg de paladio sobre carbono al 5% durante una hora a temperatura ambiente en una atmósfera de hidrógeno. Se filtró la mezcla de reacción a través de Celite y se concentró el filtrado bajo presión reducida, obteniéndose 0,23 g de α -aminoisopropil-2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-il-cetona oleaginoso.

(6) Se añadieron 0,16 g de trietilamina a una mezcla que comprendía 0,23 g de α -aminoisopropil-2,2,3,3-tetrafluoro-1,4-benzodioxan-6-il-cetona y 10 ml de tetrahidrofurano, y se añadió en gotas una mezcla que comprendía 0,13 g de cloruro de 3-metil-2-tiofen-carbonilo y 5 ml de tetrahidrofurano bajo enfriamiento con hielo, seguidos de una reacción durante 3 horas a temperatura ambiente. Se extrajo la mezcla de reacción con acetato de etilo, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/4), obteniéndose 0,23 g del producto deseado que tenía un punto de fusión de 120 a 122°C. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: $\text{CDCl}_3/300$ MHz): 1,76 (s, 6H), 2,39 (s, 3H), 6,54 (s, 1H), 6,84 (d, 1H), 7,24 (d, 1H), 7,42 (d, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,96 (s, 1H).

Ejemplo preparativo 5

Preparación de *N*-[(3',4'-dicloro-1,1-dimetil)fenacil]-3-metil-2-tiofenocarboxamida (Compuesto n.º1-20 mencionado más adelante)

Se añadieron 303 mg de trietilamina a una mezcla que comprendía 268 mg de clorhidrato de α -amino-3,4-dicloroisobutirofenona, obtenido según el procedimiento de (1) a (5) del Ejemplo preparativo 1 anterior, y 5 ml de tetrahidrofurano, y se añadió en gotas una mezcla que comprendía 265 mg de cloruro de 3-metil-2-tiofen-carbonilo y 2,5 ml de tetrahidrofurano bajo enfriamiento con hielo. Una vez completada la adición en gotas, se hizo reaccionar la mezcla a temperatura ambiente durante 3 horas. Se extrajo la mezcla de reacción con acetato de etilo, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/3), obteniéndose 180 g del producto deseado que tenía un punto de fusión de 141°C. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: $\text{CDCl}_3/400$ MHz): 1,72 (s, 6H), 2,37 (s, 3H), 6,53 (s, 1H), 6,85 (d, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,43 (d, 1H), 7,86 (dd, 1H), 8,13 (s, 1H).

Ejemplo preparativo 6

Preparación de *N*-[(4'-metoxi-2'-metil-1,1-dimetil)fenacil]-3-metil-2-tiofen-carboxamida (Compuesto n.º1-160 mencionado más adelante)

(1) Se añadió en gotas una mezcla que comprendía 5,7 g de cloruro de isobutililo y 5 ml de disulfuro de carbono como máximo a 10°C a una mezcla que comprendía 7,15 g de cloruro de aluminio y 20 ml de disulfuro de carbono, seguida de una reacción durante 0,5 horas. Luego, se añadió en gotas una mezcla que comprendía 5 g de *m*-cresol y 5 ml de disulfuro de carbono como máximo a 5°C, seguida de una reacción durante 4 horas a temperatura ambiente. Se puso la mezcla de reacción en una mezcla de agua con hielo y ácido clorhídrico, y se extrajo con cloruro de metileno, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Al residuo, se añadieron 60 ml de tetrahidrofurano, 30 ml de agua y 3,7 g de hidróxido de sodio, seguidos de una reacción durante 1,5 horas a temperatura ambiente. Se concentró la mezcla de reacción bajo presión reducida, luego se puso en agua con hielo y se ajustó para que fuera débilmente ácida con ácido sulfúrico diluido, y luego se extrajo con acetato de etilo. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/9), obteniéndose 2,45 g de 4-hidroxi-2-metil-isobutirofenona sólida. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ¹H δppm (Disolvente: CDCl₃/400 MHz): 1,15 (d, 6H), 2,43 (s, 3H), 3,40 (m, 1H), 6,70 (m, 2H), 7,57 (d, 1H).

(2) Se añadió una mezcla que comprendía 0,62 g de dimetilsulfato y 3 ml de dimetilformamida a una mezcla que comprendía 0,8 g de 4-hidroxi-2-metil-isobutirofenona, 0,68 g de carbonato de potasio y 15 ml de dimetilformamida, seguida de una reacción durante 3 horas a temperatura ambiente. Se puso la mezcla de reacción en agua con hielo y se extrajo con acetato de etilo, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/9), obteniéndose 0,59 g de 4-metoxi-2-metilisobutirofenona oleaginosa. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ¹H δppm (Disolvente: CDCl₃/400 MHz): 1,13 (d, 6H), 2,46 (s, 1H), 3,38 (m, 1H), 6,72 (m, 2H), 7,59 (d, 1H).

(3) Se añadieron 1,16 g de tribromuro de feniltrimetilamonio a una mezcla que comprendía 0,59 g de 4-metoxi-2-metilisobutirofenona y 15 ml de tetrahidrofurano, seguidos de una reacción durante 2,5 horas a temperatura ambiente. Se añadió dietiléter a la mezcla de reacción y se filtró la materia insoluble. Se concentró el filtrado bajo presión reducida, obteniéndose 0,7 g de α-bromo-4-metoxi-2-metilisobutirofenona oleaginosa.

(4) Se añadieron 0,4 g de azida de sodio a una mezcla que comprendía 0,7 g de α-bromo-4-metoxi-2-metilisobutirofenona y 8 ml de dimetilsulfóxido, seguidos de una reacción durante 1,5 horas a 50°C. Se puso la mezcla de reacción en agua con hielo y se extrajo con acetato de etilo, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/9), obteniéndose 0,67 g de α-azida-4-metoxi-2-metilisobutirofenona oleaginosa. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ¹H δppm (Disolvente: CDCl₃/300 MHz): 1,54 (s, 6H), 2,33 (s, 1H), 3,81 (s, 3H), 6,72 (dd, 1H), 6,75 (d, 1H), 7,61 (d, 1H).

(5) Se hizo reaccionar una mezcla que contenía 0,25 g de α-azida-4-metoxi-2-metilisobutirofenona, 10 ml de metanol y 13 mg de paladio sobre carbono al 5% durante 3 horas a temperatura ambiente en una atmósfera de hidrógeno. Se filtró la mezcla de reacción a través de Celite y se concentró el filtrado bajo presión reducida, obteniéndose 0,23 g de α-amino-4-metoxi-2-metilisobutirofenona oleaginosa.

(6) Se añadieron 0,13 g de trietilamina a una mezcla que comprendía 0,22 g de α-amino-4-metoxi-2-metilisobutirofenona y 12 ml de tetrahidrofurano, y a esto se añadió una mezcla en gotas que comprendía 0,17 g de cloruro de 3-metil-2-tiofen-carbonilo y 3 ml de tetrahidrofurano bajo enfriamiento con hielo. Una vez completada la adición en gotas, se hizo reaccionar la mezcla a temperatura ambiente durante dos horas. Se extrajo la mezcla de reacción con acetato de etilo, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/3), obteniéndose 0,35 g del producto deseado que tenía un punto de fusión de 99 a 101°C. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ¹H δppm (Disolvente: CDCl₃/300 MHz): 1,77 (s, 6H), 2,38 (s, 3H), 2,45 (s, 3H), 6,81 (dd, 1H), 6,71 (s, 1H), 6,85 (m, 2H), 7,26 (d, 1H), 7,49 (d, 1H).

Ejemplo preparativo 7

Preparación de *N*-[(3',4'-dimetoxi-1,1-dimetil)fenacil]-3-metil-2-tiofen-carboxamida (Compuesto n.º 1-535 mencionado más adelante)

(1) Se añadió en gotas una solución de isopropil-magnesio-bromuro-éter preparada con 5,6 g de 2-bromopropano, 0,94 g de magnesio y 30 ml de dietiléter a una mezcla que comprendía 5,0 g de 3,4-dimetoxibenzaldehído y 50 ml de dietiléter, seguida de una reacción durante 15 horas bajo reflujo. Se puso la mezcla de reacción en agua con

hielo y se añadió ácido sulfúrico diluido, tras lo que se agitó. Luego, se extrajo la mezcla con cloruro de metileno, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida, obteniéndose 6,3 g de 1-(3',4'-dimetoxifenil)-2-metilpropanol oleaginoso.

(2) Se añadió una mezcla que comprendía 6,28 g de 1-(3',4',5'-dimetoxifenil)-2-metilpropanol y 30 ml de diclorometano, a una mezcla que comprendía 6,5 g de clorocromato de piridinio, 4,9 g de acetato de sodio y 100 ml de diclorometano, seguida de una reacción durante 15 horas a temperatura ambiente. Se filtró la mezcla de reacción a través de Celite y se concentró el filtrado bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 3/7), obteniéndose 3,9 g de 3,4-dimetoxiisobutirofenona oleaginoso. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /400 MHz): 1,70 (d, 6H), 3,50 (m, 1H), 3,89 (s, 3H), 3,90 (s, 3H), 6,85 (d, 1H), 7,50 (d, 1H), 7,56 (dd, 1H).

(3) Se añadieron 1,81 g de tribromuro de feniltrimetilamonio a una mezcla que comprendía 1,0 g de 3,4-dimetoxiisobutirofenona y 20 ml de tetrahidrofuran, seguidos de una reacción durante dos horas a temperatura ambiente. Se añadió dietiléter a la mezcla de reacción y se filtró la materia insoluble. Se concentró el filtrado bajo presión reducida, obteniéndose α -bromo-3,4-dimetoxiisobutirofenona oleaginoso.

(4) Se añadieron 0,62 g de azida de sodio a una mezcla que comprendía α -bromo-3,4-dimetoxiisobutirofenona y 20 ml de dimetilsulfóxido, seguidos de una reacción durante 1,5 horas a 50°C. Se puso la mezcla de reacción en agua con hielo y se extrajo con acetato de etilo, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de magnesio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 1/4), obteniéndose 1,1 g de α -azida-3,4-dimetoxiisobutirofenona oleaginoso. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /400 MHz): 1,56 (s, 6H), 3,91 (s, 3H), 3,93 (s, 3H), 6,86 (d, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,94 (dd, 1H).

(5) Se hizo reaccionar una mezcla que comprendía 0,25 g de α -azida-3,4-dimetoxiisobutirofenona, 15 ml de metanol y 13 mg de paladio sobre carbono al 5% durante 3 horas a temperatura ambiente en una atmósfera de hidrógeno. Se filtró la mezcla de reacción a través de Celite y se concentró el filtrado bajo presión reducida, obteniéndose 0,2 g de α -amino-3,4-dimetoxiisobutirofenona oleaginoso.

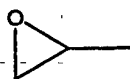
(6) Se añadieron 0,11 g de trietilamina a una mezcla que comprendía 0,2 g de α -amino-3,4-dimetoxiisobutirofenona y 12 ml de 1,2-dicloroetano, y se añadió una mezcla en gotas que comprendía 0,14 g de cloruro de 3-metil-2-tiofen-carbonilo y 2 ml de 1,2-dicloroetano bajo enfriamiento con hielo. Una vez completada la adición en gotas, se hizo reaccionar la mezcla a temperatura ambiente durante 1,5 horas. Se extrajo la mezcla de reacción con cloruro de metileno, tras lo que se lavó con agua. Se secó la capa orgánica sobre sulfato de sodio anhidro y luego se concentró bajo presión reducida. Se purificó el residuo mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (disolvente revelador: acetato de etilo/*n*-hexano = 3/2), obteniéndose 0,1 g del producto deseado que tenía un punto de fusión de 138 a 140°C. Los datos de los espectros de RMN de este producto son los siguientes.

RMN de ^1H δ ppm (Disolvente: CDCl_3 /300 MHz): 1,82 (s, 6H), 2,44 (s, 3H), 3,89 (s, 6H), 6,80 (d, 1H), 6,85 (d, 1H), 6,88 (s, 1H), 7,23 (d, 1H), 7,63 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H).

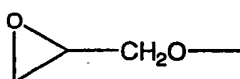
A continuación, en las Tablas 1 a 9, se ofrecen los ejemplos más comunes del derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales. Estos compuestos se pueden preparar según los ejemplos preparativos anteriores o mediante diversos procedimientos anteriormente descritos.

En las tablas, N.^o representa compuesto n.^o; Me, metilo; Et, etilo; Pr(i), isopropilo; P(n), *n*-propilo; Bu(t), *terc*-butilo; Bu(n), *n*-butilo; Bu(sec), *sec*-butilo; CO, carbonilo; CO₂, carboxilo; y Ph, fenilo. Además, en las tablas, Ph(4-Cl) representa fenilo que tiene un átomo de cloro sustituido en la posición 4 y Ph(3,4-Cl₂) representa fenilo que tiene átomos de cloro sustituidos en las posiciones 3 y 4. Esto se aplica igualmente a otras expresiones. Además, las abreviaturas D1 a D7 y B1 a B117 usadas en las tablas representan los siguientes sustituyentes, respectivamente:

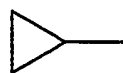
D1:



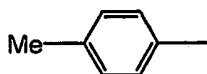
D2:



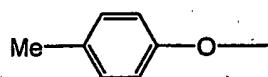
D3:



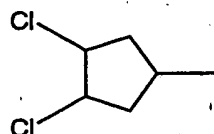
D4:



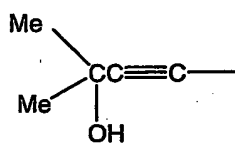
D5:



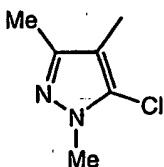
D6:



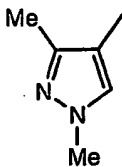
D7:



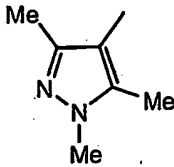
B1:



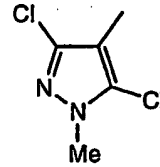
B2:



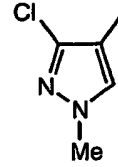
B3:



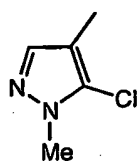
B4:



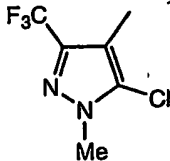
B5:



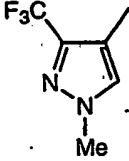
B6:



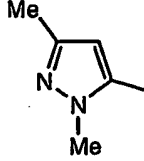
B7:



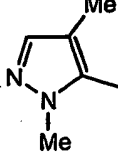
B8:

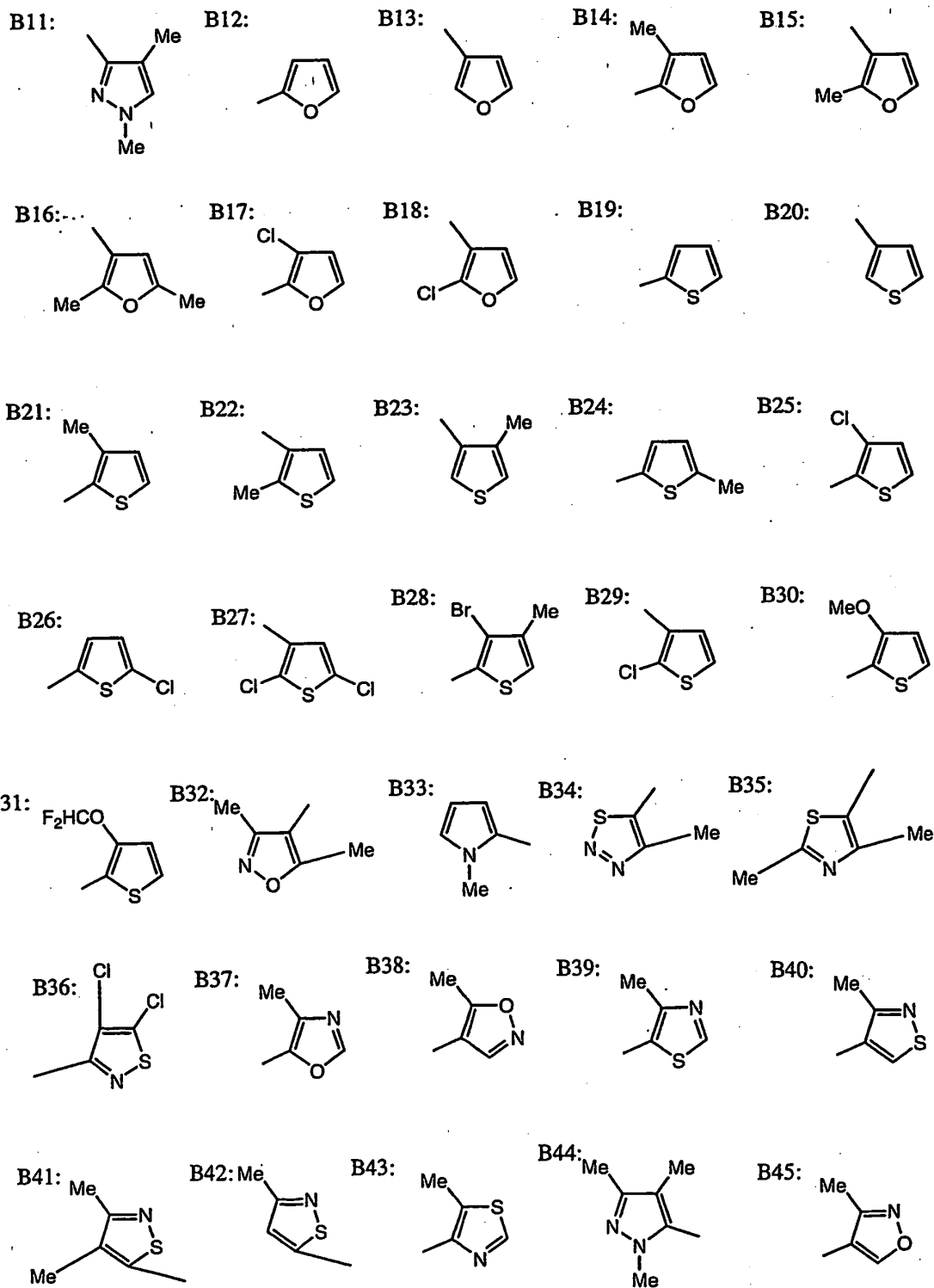


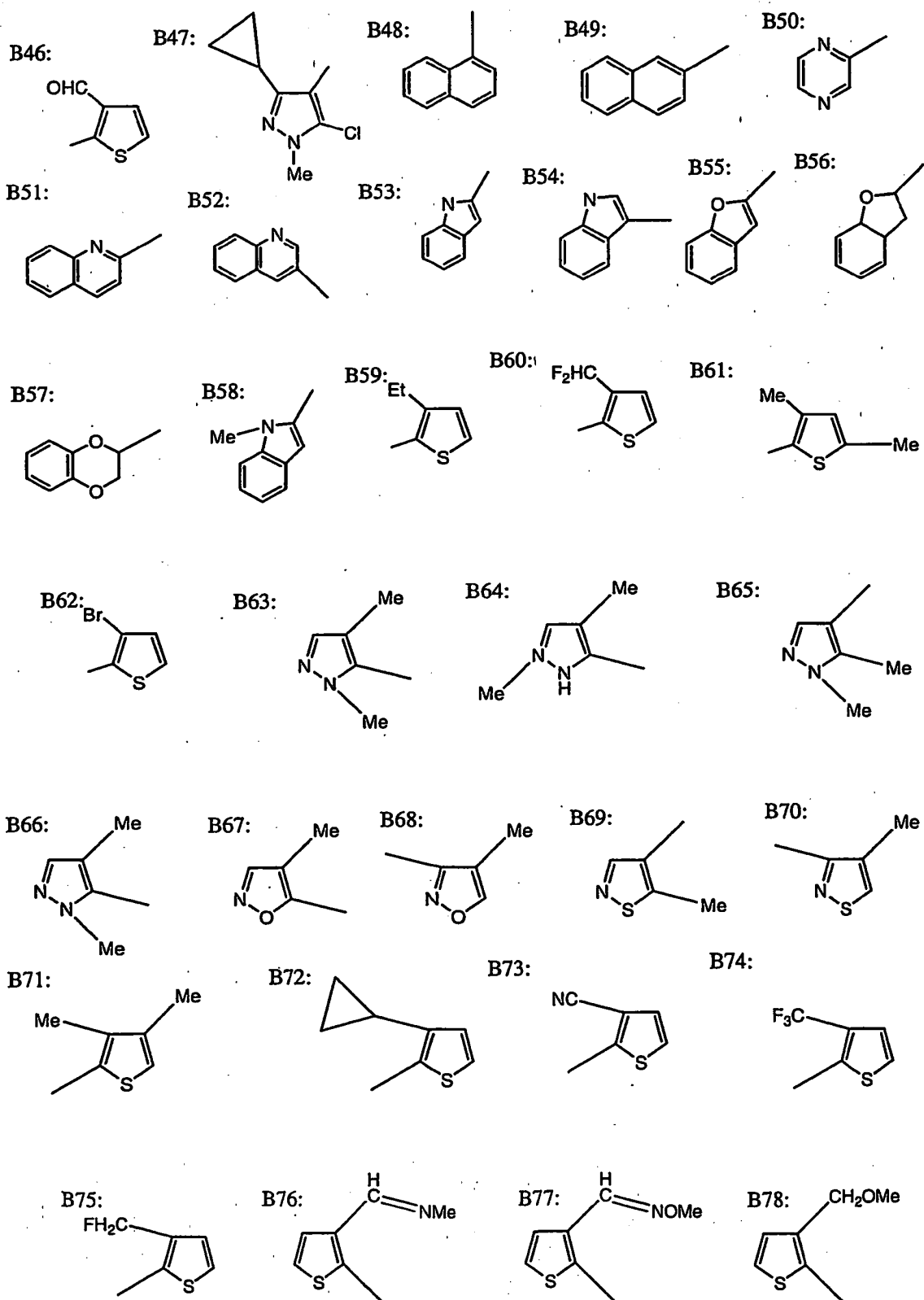
B9:

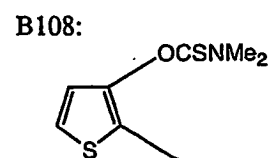
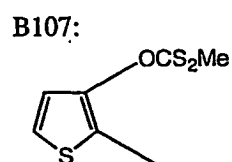
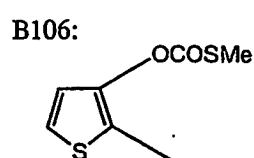
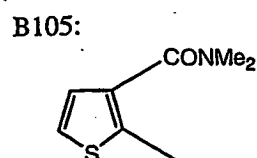
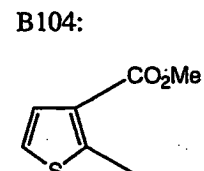
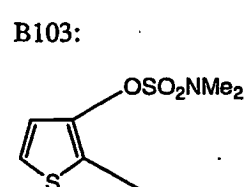
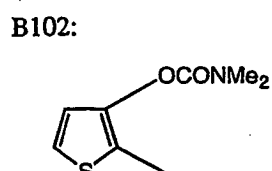
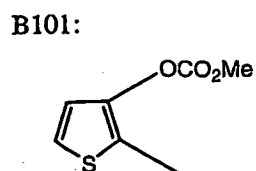
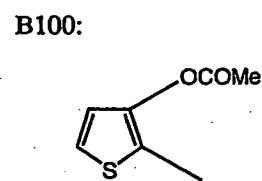
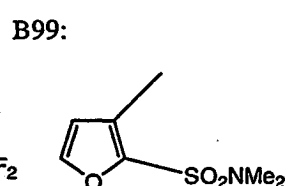
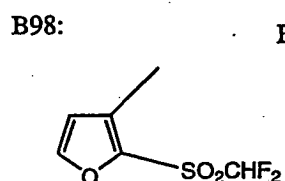
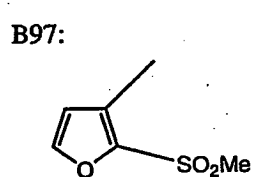
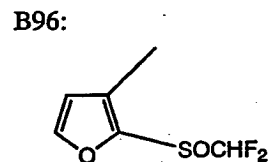
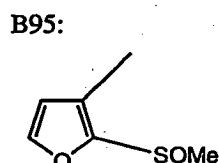
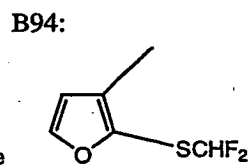
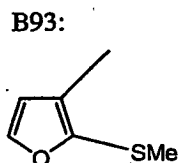
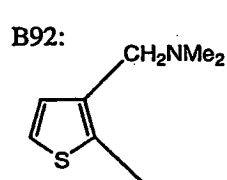
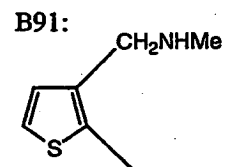
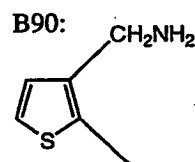
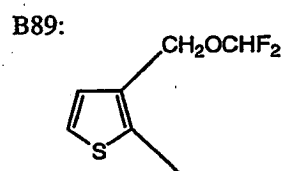
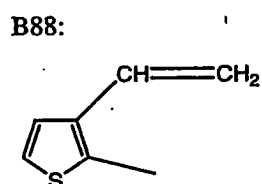
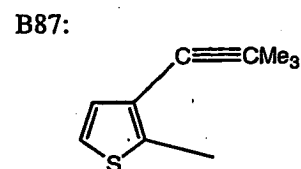
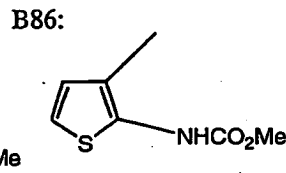
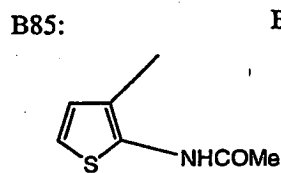
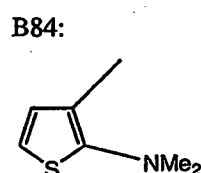
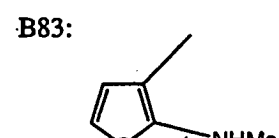
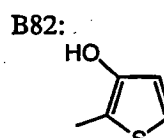
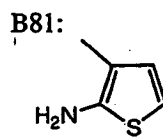
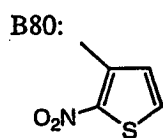
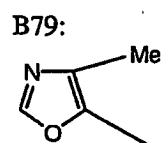


B10:

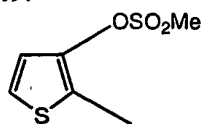




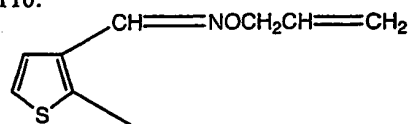




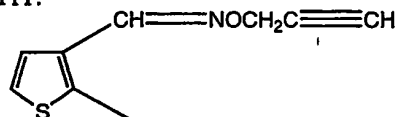
B109:



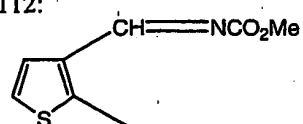
B110:



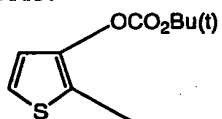
B111:



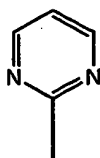
B112:



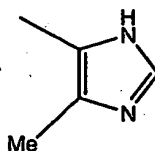
B113:



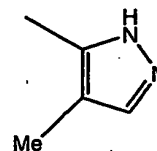
B114:



B115:



B116:



B117:

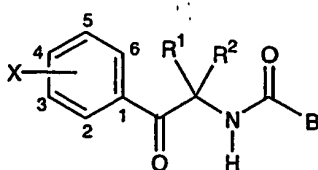
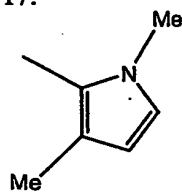


Tabla 1

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-1	Me	Me	2-Me-4-F	B1	132-134
1-2	Me	Me	2-Me-4-F	B5	
1-3	Me	Me	2-Me-4-F	B8	
1-4	Me	Me	2-Me-4-Cl	B1	141-143
1-5	Me	Me	2-Me-4-Cl	B5	
1-6	Me	Me	2-Me-4-Cl	B21	96-100

ES 2 383 308 T3

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-7	Me	Me	2-Me-4-Br	B16	138-140
1-8	Me	Me	2-Me-4-Br	B8	
1-9	Me	Me	2-Me-4-Br	B21	108-110
1-10	Me	Me	4-Cl	B1	186-188
1-11	Me	Me	4-Cl	B16	184-186
1-12	Me	Me	H	B7	168-170
1-13	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B1	188-189
1-14	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B16	170-173
1-15	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B7	182-183
1-16	Me	Me	3-Cl	B1	112-113
1-17	Me	Me	3-Cl	B16	150-151
1-18	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B2	200-201
1-19	Me	Me	4-Br	B21	174
1-20	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B21	141
1-21	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B25	Amorfo
1-22	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B14	137
1-23	Sal sodio del n.º 1-22				
1-24	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B24	Sólido
1-25	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B26	229
1-26	Me	Me	3-Br	B25	149
1-27	Me	Me	3-Br	B21	119
1-28	Me	Me	3-Me	B21	Aceite
1-29	Me	Me	3-CF ₃	B21	Amorfo
1-30	Me	Me	3-OMe	B21	128
1-31	Me	Me	3-OCHF ₂	B21	110
1-32	Me	Me	4-Cl	B21	175
1-33	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B9	126-130
1-34	Me	Me	H	B1	103-105
1-35	Me	Me	4-Br	B19	235-240
1-36	Me	Me	4-Br	B16	183-185
1-37	Me	Me	4-Br	B20	245-247
1-38	Me	Me	3-Cl	B2	141-142
1-39	Me	Me	4-Cl	B2	140-141
1-40	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B12	225-227
1-41	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B5	171-172
1-42	Me	Me	3-F-4-F	B1	134-136
1-43	Me	Me	3-F-4-F	B16	150-152
1-44	Me	Me	2-Cl	B1	144-145

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-45	Me	Me	2-Cl	B16	130-132
1-46	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B6	Sólido
1-47	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B4	150-152
1-48	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B27	140-141
1-49	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B3	141-146
1-50	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B10	
1-51	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B11	
1-52	Me	Me	4-Br	B1	183-185
1-53	Me	Me	3-Cl-5-Cl	B16	168-170
1-54	Me	Me	3-Cl-5-Cl	B1	152-153
1-55	Me	Me	3-Br	B16	143-145
1-56	Me	Me	3-Br	B1	151-152
1-57	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B15	175-178
1-58	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B17	
1-59	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B18	
1-60	Me	Me	2-Cl-4-Cl	B16	165-167
1-61	Me	Me	2-Cl-4-Cl	B1	170-171
1-62	Me	Me	3-Me	B16	133-135
1-63	Me	Me	3-Me	B1	145-146
1-64	Me	Me	3-CF ₃	B16	125-127
1-65	Me	Me	3-CF ₃	B1	120-121
1-66	Me	Me	3-Cl	B21	128-130
1-67	Me	Me	3-Cl	B25	161-162
1-68	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B29	
1-69	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B30	93-96
1-70	Me	Et	3-Cl-4-Cl	B21	
1-71	Me	Me	3-OCHF ₂	B16	121-123
1-72	Me	Me	3-OCHF ₂	B1	138-139
1-73	Me	Me	3-OMe	B16	116-118
1-74	Me	Me	3-OMe	B1	118-120
1-75	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B22	155-158
1-76	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B31	Aceite
1-77	Me	Me	3-Me-4-Me	B21	101-102
1-78	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B23	220-222
1-79	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B28	109-110
1-80	Me	Me	3-Cl-4-F	B21	124-126
1-81	Me	Me	3-Cl-4-F	B16	
1-82	Me	Me	3-Cl-4-F	B1	

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-83	- (CH ₂) ₅ -		4-Br	B7	
1-84	- (CH ₂) ₅ -		4-Br	B11	
1-85	Me	Me	3, 4- (OCHF ₂) ₂	B1	
1-86	Me	Me	3,4-(OCHF ₂) ₂	B21	147-150
1-87	Me	Me	4-OCF ₃	B1	
1-88	Me	Me	3-OCF ₃	B21	
1-89	Me	Me	4-CF ₃	B1	
1-90	Me	Me	4-CF ₃	B21	113-115
1-91	Me	Me	4-CF ₃	B15	
1-92	Me	Me	4-CF ₃	B11	
1-93	Me	Me	3-Me-4-Me	B16	133-135
1-94	Me	Me	4-NO ₂	B16	179-180
1-95	Me	Me	4-NO ₂	B1	168-170
1-96	Me	Me	4-NO ₂	B21	135-137
1-97	Me	Me	3-Me-4-Me	B1	130-132
1-98	Me	Me	2-Me-4-OCHF ₂	B21	112-114
1-99	Me	Me	3-Cl-5-Cl	B21	137-140
1-100	Me	Me	3-Cl-4-Br	B21	120-121
1-101	Me	Me	3-Me-4-Cl	B21	108-112
1-102	Me	Me	3-Br-4-Cl	B21	117-120
1-103	Me	Me	3-Cl-4-Me	B21	115-118
1-104	Me	Me	2-Me-4-F	B21	107-109
1-105	Me	Me	4-Me	B21	152-154
1-106	Me	Me	4-OCF ₃	B21	116-120
1-107	Me	Me	3-Br-4-OCF ₃	B21	107-111
1-108	Me	Me	3-CF ₃ -4-Cl	B21	133-135
1-109	Me	Me	3-Cl-4-Br	B1	105-109
1-110	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B19	192-195
1-111	Me	Me	4-OCH ₂ CF ₃	B21	134-138
1-112	Me	Me	4-OCHF ₂	B21	118-120
1-113	Me	Me	3-OMe-4-Cl	B21	154-159
1-114	Me	Me	3-Me-4-OCF ₃	B21	116-118
1-115	Me	Me	3-Cl-4-Me-5-Me	B21	107-114
1-116	Me	Me	2-Cl-3-Cl-4-Cl	B1	133-137
1-117	Me	Me	2-Me-3-Cl-4-Cl	B1	94-98
1-118	Me	Me	2-Cl-3-Cl-4-Cl	B21	112-115
1-119	Me	Me	2-Me-3-Cl-4-Cl	B21	90-95
1-120	Me	Me	2-Me-3-Me-4-Cl	B21	Aceite

ES 2 383 308 T3

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-121	Me	Me	2-Cl-3-Me-4-Me	B21	Aceite
1-122	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B8	200-202
1-123	Me	H	4-Cl	B16	Aceite
1-124	Me	Me	4-Br	B39	126-129
1-125	Me	Me	4-Bu(t)	B21	130-134
1-126	Me	Me	4-Bu(t)	B1	161-165
1-127	Me	Me	3-Me-4-Cl	B21	108-112
1-128	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B37	157-159
1-129	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B43	120-125
1-130	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B44	165-170
1-131	Me	Me	4-(2-tienilo)	B21	119,2
1-132	Me	Me	4-(5-Me-2-tienil)	B21	176,8
1-133	Me	Me	4-(2-furilo)	B21	>300
1-134	Me	Me	4-(3-tienilo)	B21	>300
1-135	Me	Me	4-(5-Cl-2-tienilo)	B21	153,5
1-136	Me	Me	4-(2-Me-3-tienilo)	B21	Viscoso
1-137	Me	Me	4-(5-COMe-2-tienilo)	B21	199,2
1-138	Me	Me	3-(2-tienilo)	B21	134,2
1-139	Me	Me	3-(3-tienilo)	B21	>300
1-140	Me	Me	3-(5-COMe-2-tienilo)	B21	Aceite
1-141	Me	Me	3-(5-Cl-2-tienilo)	B21	141,7
1-142	Me	Me	3-(5-Me-2-tienilo)	B21	137,8
1-143	Me	Me	3-(4-Me-3-tienilo)	B21	Amorfo
1-144	Me	Me	3-(2-furilo)	B21	Sólido
1-145	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B32	135-137
1-146	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B33	164
1-147	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B34	153-154
1-148	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B35	Sólido
1-149	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B36	Sólido
1-150	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B39	142-145
1-151	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B40	145-146
1-152	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B79	140-142
1-153	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B38	165-166
1-154	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B41	136-140
1-155	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B42	175-178
1-156	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B45	175-177
1-157	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B46	Aceite
1-158	Me	Me	4-(5-CF ₃ -piridin-2-iloxilo)	B1	127-128

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-159	Me	Me	4-(5-CF ₃ -piridin-2-iloxilo)	B21	138-140
1-160	Me	Me	2-Me-4-OMe	B21	99-101
1-161	Me	Me	2-Me-4-OEt	B21	85-88
1-162	Me	Me	2-Me-4-CF ₃	B21	110-113
1-163	Me	Me	2-Me-4-Me	B21	102-105
1-164	Me	Me	2-Me	B21	79-82
1-165	Me	Me	2-Me-3-Cl	B21	109-111
1-166	Me	Me	2-B1-4-CF ₃	B21	90-92
1-167	Me	Me	3-Br-4-Br	B21	127-130
1-168	Me	Me	3-Me-4-OCHF ₂	B21	100-106
1-169	Me	Me	4-[D3]	B21	107-109
1-170	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B59	139-145
1-171	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B60	139-141
1-172	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B61	140-142
1-173	H	H	4-Cl	B21	119-121
1-174	Me	Me	2-Me-4-OPr	B21	97-100
1-175	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B62	89-92
1-176	Me	Me	3-Me-4-OMe	B21	123-125
1-177	Me	Me	3-Cl-4-OMe	B21	161-164
1-178	Me	Me	2-Me-3-Me-4-OMe	B21	88-90
1-179	Me	Me	2-Me-3-Me-4-OCHF ₂	B21	Aceite
1-180	Me	Me	4-OMe	B21	139-141
1-181	Me	Me	2-Me-4-OCOPr(i)	B21	Amorfo
1-182	Me	Me	2-Me-4-OH	B21	204-208
1-183	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ Me	B21	81-84
1-184	Me	Me	2-OMe	B21	Aceite
1-185	Me	Me	2-Me-3-OMe	B21	128-129
1-186	Me	Me	2-Me-4-OBu(n)	B21	69-71
1-187	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CF ₃	B21	Aceite
1-188	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ OMe	B21	73-75
1-189	Me	H	4-Cl	B21	Aceite
1-190	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B21	96-98
1-191 *	Me	Me	4-Br	B48	
1-192 *	Me	Me	4-Br	B49	
1-193 *	Me	Me	4-Br	B50	122-125
1-194*	Me	Me	4-Br	B51	
1-195 *	Me	Me	4-Br	B52	192-195
1-196*	Me	Me	4-Br	B53	

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-197*	Me	Me	4-Br	B54	
1-198	Me	Me	4-Br	B13	
1-199	Me	Me	4-Br	B12	
1-200	Me	Me	4-Br	B63	132-134
1-201 *	Me	Me	4-Br	B55	164-166
1-202 *	Me	Me	4-Br	B56	145-147
1-203 *	Me	Me	4-Br	B57	45-47
1-204*	Me	Me	4-Br	B57	50-58
1-205	Me	Me	3-F-4-Cl	B21	119-122
1-206	Me	Me	2-Me-4-Et	B21	77-81
1-207	Et	H	4-Cl	B21	114-117
1-208	Me	Me	2-Cl-4-Cl	B21	103-104
1-209	Me	Me	3-OCHF ₂ -4-Cl	B21	106-110
1-210	Me	Me	3-Cl-4-OCHF ₂	B21	137-139
1-211	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B63	
1-212	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B64	
1-213	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B65	
1-214	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B66	
1-215	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B67	
1-216	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B68	
1-217	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B69	
1-218	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B70	
1-219	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B71	122-124
1-220	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B72	
1-221 *	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B73	
1-222	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B74	
1-223	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B75	
1-224*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B76	
1-225 *	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B77	
1-226*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B78	
1-227*	Me	Me	2-Me-4-O-[D3]	B21	
1-228	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ NMe ₂	B21	
1-229	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OMe	B21	
1-230 *	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ SMe	B21	
1-231	Me	Me	2-Me-5-OMe	B21	Aceite
1-232	Me	Me	2-Me-5-Cl	B21	
1-233	Me	Me	2-Me-6-OMe	B21	
1-234	Me	Me	2-Me-6-Me	B21	

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-235	Me	Me	2-Me-4-OMe-6-Me	B21	
1-236	Me	Me	2-Me-4-Br	B21	
1-237	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHF ₂	B21	
1-238	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CF ₂ CF ₃	B21	
1-239	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHFCF ₃	B21	
1-240	Me	Me	2-Et-4-OMe	B21	
1-241	Me	Me	2-CF ₃ -4-OMe	B21	
1-242	Me	Me	2-CF ₃ -4-Cl	B21	
1-243	Me	Me	3-Me-4-Br	B21	
1-244	Me	Me	3-Br-4-Me	B21	118-120
1-245*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CN	B21	
1-246*	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ CN	B21	
1-247*	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ CN	B21	
1-248 *	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ -[D3]	B21	
1-249 *	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ -[D3]	B21	
1-250 *	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ -[D3]	B21	
1-251 *	Me	Me	2-Me-4-SMe	B21	
1-252*	Me	Me	2-Me-4-SOMe	B21	
1-253 *	Me	Me	2-Me-4-SO ₂ Me	B21	
1-254*	Me	Me	2-Me-4-CHO	B21	
1-255	Me	Me	2-Me-4-OCF ₃	B21	
1-256	Me	Me	2-Me-4-CHF ₂	B21	
1-257*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ -[D3]	B21	
1-258	Me	Me	2-Me-4-[D3]	B21	
1-259	Me	Me	2-OCHF ₂ -4-Cl	B21	
1-260	Me	Me	2-F-4-Cl	B21	
1-261	Me	Me	2-OMe-4-Cl	B21	
1-262 *	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OCOMe	B21	
1-263 *	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OH	B21	
1-264	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ Br	B21	
1-265	Me	Me	2-Me-4-I	B21	
1-266	Me	Me	2-Me-3-OEt	B21	
1-267*	Me	Me	2-Me-4-ciclopentiloxilo	B21	
1-268	Me	Me	2-Me-4-Ph	B21	97-102
1-269 *	Me	Me	2-Me-4-OPh	B21	
1-270	Me	Me	2-Me-4-OCOMe	B21	Aceite * Referencia
1-271	Me	Me	2-Me-4-C≡CCMe ₃	B21	Amorfo
1-272*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ C≡CH	B21	

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-273	Me	Me	2-Me-4-OBu(sec)	B21	Viscoso
1-274*	Me	Me	2-Me-4-OCH([D3])Me	B21	
1-275 *	Me	Me	2-Me-4-NH([D3])Me	B21	
1-276	Me	Me	2-Me-4-C≡CPh	B21	Amorfo
1-277*	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHFOCF ₃	B21	
1-278 *	Me	Me	2-Me-4-CN	B21	
1-279	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CCMe ₃	B21	
1-280	Me	Me	2-Me-4-C≡CMe	B21	
1-281	Me	Me	2-Me-4-C≡CH	B21	
1-282	Me	Me	2-Me-4-C≡CSiMe ₃	B21	Viscoso
1-283	Me	Me	2-Me-4-[D1]	B21	
1-284*	Me	Me	2-Me-4-[D2]	B21	
1-285 *	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡Cl	B21	
1-286	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡CH	B21	
1-287*	Me	Me	2-Me-4-CH=CF ₂	B21	
1-288 *	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CH=CF ₂	B21	
1-289 *	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH=CCl ₂	B21	
1-290	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CH ₂ CH=CF ₂	B21	
1-291	Me	Me	2-Me-4-(CH ₂) ₅ CBrF ₂	B21	
1-292 *	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ C≡Cl	B1	
1-293	Me	Et	3-Cl-4-Cl	B1	
1-294	Me	Et	3-Me-4-Cl	B1	
1-295	Me	Et	2-Me-4-OMe	B1	
1-296	Me	Et	2-Me-4-OEt	B1	
1-297	Me	Et	2-Me-4-OPr(i)	B1	
1-298	Me	Et	3-Cl-4-Br	B1	
1-299	Me	Et	3-Br-4-Cl	B1	
1-300	Me	Et	3-F-4-Cl	B1	
1-301	Me	Et	3-Me-4-Br	B1	
1-302	Et	Et	3-Cl-4-Cl	B1	
1-303	Et	Et	3-Me-4-Cl	B1	
1-304	Et	Et	2-Me-4-OEt	B1	
1-305	Et	Et	2-Me-4-OPr(i)	B1	
1-306	Me	Et	3-Cl-4-Cl	B16	
1-307	Me	Et	3-Me-4-Cl	B16	
1-308	Me	Et	2-Me-4-OMe	B16	
1-309	Me	Et	2-Me-4-OEt	B16	
1-310	Me	Et	2-Me-4-OPr(i)	B16	

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-311	Me	Et	3-Cl-4-Br	B16	
1-312	Me	Et	3-Br-4-Cl	B16	
1-313	Me	Et	3-F-4-Cl	B16	
1-314	Me	Et	3-Me-4-Br	B16	
1-315	Et	Et	3-Cl-4-Cl	B16	
1-316	Et	Et	3-Me-4-Cl	B16	
1-317	Et	Et	2-Me-4-OEt	B16	
1-318	Et	Et	2-Me-4-OPr(i)	B16	
1-319	Me	Et	3-Me-4-Cl	B21	
1-320	Me	Et	2-Me-4-OMe	B21	
1-321	Me	Et	2-Me-4-OEt	B21	
1-322	Me	Et	2-Me-4-OPr(i)	B21	
1-323	Me	Et	3-Cl-4-Br	B21	
1-324	Me	Et	3-Br-4-Cl	B21	
1-325	Me	Et	3-F-4-Cl	B21	
1-326	Me	Et	3-Me-4-Br	B21	
1-327	Et	Et	3-Cl-4-Cl	B21	
1-328	Et	Et	3-Me-4-Cl	B21	
1-329	Et	Et	2-Me-4-OEt	B21	
1-330	Et	Et	2-Me-4-OPr(i)	B21	
1-331	Me	Me	3-Me-4-Cl	B71	
1-332	Me	Me	2-Me-4-OMe	B71	
1-333	Me	Me	2-Me-4-OEt	B71	
1-334	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B71	
1-335	Me	Me	3-Cl-4-Br	B71	
1-336	Me	Me	3-Br-4-Cl	B71	
1-337	Me	Me	3-F-4-Cl	B71	
1-338	Me	Me	3-Me-4-Br	B71	
1-339 *	Me	Me	2-Me-4-[D4]	B21	
1-340*	Me	Me	2-Me-4-[D5]	B21	
1-341 *	Me	D3	3-Cl-4-Cl	B16	
1-342*	Me	D3	3-Me-4-Cl	B16	
1-343 *	Me	D3	2-Me-4-OMe	B16	
1-344*	Me	D3	2-Me-4-OEt	B16	
1-345 *	Me	D3	2-Me-4-OPr(i)	B16	
1-346 *	Me	D3	3-Cl-4-Br	B16	
1-347*	Me	D3	3-Br-4-Cl	B16	
1-348*	Me	D3	3-F-4-Cl	B16	

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-349 *	Me	D3	3-Me-4-Br	B16	
1-350 *	H	D3	3-Cl-4-Cl	B16	
1-351 *	H	D3	3-Me-4-Cl	B16	
1-352*	H	D3	2-Me-4-OMe	B16	
1-353*	H	D3	2-Me-4-OEt	B16	
1-354*	H	D3	2-Me-4-OPr(i)	B16	
1-355 *	Me	D3	3-Cl-4-Cl	B21	
1-356 *	Me	D3	3-Me-4-Cl	B21	
1-357*	Me	D3	2-Me-4-OMe	B21	
1-358*	Me	D3	2-Me-4-OEt	B21	
1-359*	Me	D3	2-Me-4-OPr(i)	B21	
1-360 *	Me	D3	3-Cl-4-Br	B21	
1-361 *	Me	D3	3-Br-4-Cl	B21	
1-362 *	Me	D3	3-F-4-Cl	B21	
1-363 *	Me	D3	3-Me-4-Br	B21	
1-364*	H	D3	3-Cl-4-Cl	B21	
1-365*	H	D3	3-Me-4-Cl	B21	
1-366 *	H	D3	2-Me-4-OMe	B21	
1-367*	H	D3	2-Me-4-OEt	B21	
1-368 *	H	D3	2-Me-4-OPr(i)	B21	
1-369 *	Me	CH ₂ F	3-Cl-4-Cl	B21	
1-370 *	Me	CH ₂ F	3-Me-4-Cl	B21	
1-371 *	Me	CH ₂ Cl	2-Me-4-OMe	B21	
1-372*	Me	CH ₂ F	2-Me-4-OEt	B21	
1-373*	Me	CH ₂ F	2-Me-4-OPr(i)	B21	
1-374*	CH ₂ F	CH ₂ F	2-Me-4-OEt	B21	
1-375 *	CH ₂ F	CH ₂ F	2-Me-4-OPr(i)	B21	
1-376 *	Me	Me	4-SMe	B16	
1-377*	Me	Me	4-SOMe	B16	
1-378*	Me	Me	4-SO ₂ Me	B16	
1-379*	Me	Me	4-SO ₂ CF ₃	B16	
1-380 *	Me	Me	4-SO ₂ NMe ₂	B16	
1-381 *	Me	Me	4-CH ₂ CH=CH ₂	B16	
1-382 *	Me	Me	4-CH ₂ NHMe	B16	
1-383 *	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ NHMe	B21	
1-384*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CN	B21	
1-385*	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ CN	B21	
1-386 *	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ CN	B21	

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-387*	Me	Me	4-OCH ₂ CH=CH ₂	B16	
1-388 *	Me	Me	4-SCH ₂ CH=CH ₂	B16	
1-389 *	Me	Me	4-OCH ₂ C≡CH	B16	
1-390 *	Me	Me	4-SCH ₂ C≡CH	B16	
1-391 *	Me	Me	4-OCH ₂ C≡Cl	B16	
1-392 *	Me	Me	4-SCH ₂ C≡Cl	B16	
1-393 *	Me	Me	2-Me-4-OCF ₂ CHFOMe	B21	
1-394*	Me	Me	4-S-CH ₂ CH=CF ₂	B16	
1-395 *	Me	Me	4-SOCHF ₂	B16	
1-396 *	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ OCHF ₂	B21	
1-397*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ NH ₂	B21	
1-398 *	Me	Me	2-Me-4-SCHF ₂	B21	
1-399 *	Me	Me	2-Me-4-SOCHF ₂	B21	
1-400 *	Me	Me	2-Me-4-SO ₂ CHF ₂	B21	
1-401 *	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ SMe	B21	
1-402 *	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ NHMe	B21	
1-403*	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ NMe ₂	B21	
1-404*	Me	Me	2-Me-4-NH-[D3]	B21	
1-405 *	Me	Me	2-Me-4-S-[D3]	B21	
1-406 *	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ CH ₂ OCHF ₂	B71	
1-407*	Me	Me	4-CH=NOCH ₂ CH=CH ₂	B1	
1-408 *	Me	Me	4-CH=NOCH ₂ C≡CH	B1	
1-409 *	Me	Me	4-CH=NCO ₂ Me	B1	
1-410*	Me	Me	2-Me-4-CH=NMe	B21	
1-411 *	Me	Me	2-Me-4-CH=N-OMe	B21	
1-412 *	Me	Me	4-[D6]	B71	
1-413 *	Me	Me	2-Me-4-OCOCF ₃	B21	
1-414*	Me	Me	2-Me-4-OCO ₂ Me	B16	
1-415 *	Me	Me	2-Me-4-ONMe ₂	B16	
1-416*	Me	Me	2-Me-4-OCOSPh	B16	
1-417*	Me	Me	2-Me-4-OCSOMe	B14	
1-418*	Me	Me	2-Me-4-OCS ₂ Me	B14	
1-419 *	Me	Me	2-Me-4-OCSNMe ₂	B14	
1-420 *	Me	Me	2-Me-4-OSCCl ₃	B14	
1-421	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ Me	B14	
1-422 *	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ CF ₃	B14	
1-423*	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ Ph	B14	
1-424*	Me	Me	2-Me-4-OSNMe ₂	B14	

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-425 *	Me	Me	2-Me-4-OSO ₂ NMe ₂	B14	
1-426 *	Me	Me	2-Me-4-NH ₂	B14	
1-427*	Me	Me	2-Me-4-NH ₂ • HCl	B14	
1-428*	Me	Me	2-Me-4-NHMe	B14	
1-429*	Me	Me	2-Me-4-NMe ₂	B14	
1-430 *	Me	Me	2-Me-4-NHCOMe	B14	
1-431 *	Me	Me	2-Me-4-NHCOBu(t)	B14	
1-432 *	Me	Me	2-Me-4-NHCOCF ₃	B14	
1-433 *	Me	Me	2-Me-4-NHCO ₂ Me	B14	
1-434*	Me	Me	2-Me-4-N(Me)CO ₂ Me	B14	
1-435*	Me	Me	2-Me-4-NHCONMe ₂	B14	
1-436*	Me	Me	2-Me-4-NHCOSMe	B14	
1-437*	Me	Me	2-Me-4-NHCSOMe	B14	
1-438 *	Me	Me	2-Me-4-NHCS ₂ Me	B14	
1-439 *	Me	Me	2-Me-4-NHCSNMe ₂	B14	
1-440 *	Me	Me	2-Me-4-NHCS ₂ Ph	B14	
1-441 *	Me	Me	2-Me-4-NHSCCl ₃	B14	
1-442*	Me	Me	2-Me-4-NHSOMe	B14	
1-443 *	Me	Me	2-Me-4-NHSO ₂ Me	B14	
1-444*	Me	Me	2-Me-4-NHSO ₂ Ph	B14	
1-445 *	Me	Me	2-Me-4-NHCOPh	B14	
1-446 *	Me	Me	4-CO ₂ Me	B14	
1-447*	Me	Me	4-CO ₂ Et	B14	
1-448*	Me	Me	4-CO ₂ H	B14	
1-449*	Me	Me	4-CONH ₂	B14	
1-450 *	Me	Me	4-CONMe ₂	B14	
1-451 *	Me	Me	4-CONHMe	B14	
1-452 *	Me	Me	2-Me-4-SCH ₂ CF ₃	B21	
1-453 *	Me	Me	2-Me-4-NHCH ₂ CF ₃	B21	
1-454*	Me	Me	2-Me-4-SCHF ₂	B21	
1-455*	Me	Me	2-Me-4-SO ₂ CH ₂ CF ₃	B21	
1-456*	Me	Me	2-Me-4-OCN	B21	
1-457*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CO ₂ Me	B21	
1-458 *	Me	Me	2-Me-4-OPh	B21	
1-459	Me	Me	2-Me-4-Ph	B21	
1-460 *	Me	Me	2-Me-4-C≡CCO ₂ Me	B21	
1-461 *	Me	Me	2-Me-4-C≡CCO ₂ H	B21	
1-462*	Me	Me	2-Me-4-C≡CCCH ₂ ON	B21	

(Continuación)

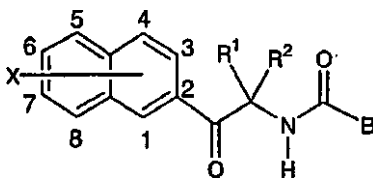
N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-463 *	Me	Me	2-Me-4-C $\equiv$ CCH ₂ Br	B21	
1-464*	Me	Me	2-Me-4-C $\equiv$ CCH ₂ NH ₂ • HCl	B21	
1-465 *	Me	Me	2-Me-4-[D7]	B21	
1-466*	Me	Me	2-Me-4-C $\equiv$ COEt	B21	
1-467*	Me	Me	2-Me-4-C $\equiv$ CCH ₂ OMe	B21	
1-468 *	Me	Me	2-Me-4-C $\equiv$ C- [D4]	B21	
1-469 *	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ -[D4]	B21	
1-470 *	Me	Me	2-Me-4-[D5]	B14	
1-471 *	Me	Me	2-Me-4-[D4]	B14	
1-472*	Me	Me	2-Me-4-CH=CH-[D4]	B21	
1-473*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ -[D4]	B21	
1-474*	Me	Me	2-Me-4-OC $\equiv$ C-[D4]	B21	
1-475 *	Me	Me	2-Me-4-OCH=CH-[D4]	B21	
1-476	Me	Me	4-Me	B62	
1-477	Me	Me	4-Me	B25	
1-478 *	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B80	
1-479*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B81	
1-480*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B82	
1-481 *	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B83	
1-482 *	Me	Me	3-Me-4-Cl	B84	
1-483 *	Me	Me	2-Me-4-OMe	B85	
1-484*	Me	Me	2-Me-4-OEt	B86	
1-485 *	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B87	
1-486*	Me	Me	3-Cl-4-Br	B88	
1-487*	Me	Me	3-Br-4-Cl	B89	
1-488 *	Me	Me	3-F-4-Cl	B90	
1-489 *	Me	Me	3-Me-4-Br	B91	
1-490 *	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B92	
1-491 *	Me	Me	3-Me-4-Cl	B93	
1-492*	Me	Me	2-Me-4-OMe	B94	
1-493*	Me	Me	2-Me-4-OEt	B95	
1-494*	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B96	
1-495 *	Me	Me	3-Cl-4-Br	B97	
1-496 *	Me	Me	3-Br-4-Cl	B98	
1-497*	Me	Me	3-F-4-Cl	B99	
1-498 *	Me	Me	3-Me-4-Br	B100	
1-499*	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B101	
1-500 *	Me	Me	3-Me-4-Cl	B102	

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-501 *	Me	Me	2-Me-4-OMe	B103	
1-502 *	Me	Me	2-Me-4-OEt	B104	
1-503 *	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B105	
1-504*	Me	Me	3-Cl-4-Br	B106	
1-505*	Me	Me	3-Br-4-Cl	B107	
1-506 *	Me	Me	3-F-4-Cl	B108	
1-507*	Me	Me	3-Me-4-Br	B109	
1-508 *	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B110	
1-509 *	Me	Me	3-Me-4-Cl	B111	
1-510*	Me	Me	2-Me-4-OMe	B112	
1-511 *	Me	Me	2-Me-4-OEt	B113	
1-512*	Me	Me	2-Me-4-OPr(i)	B114	
1-513	Me	Me	3-Cl-4-Br	B115	
1-514	Me	Me	3-Br-4-Cl	B116	
1-515	Me	Me	3-F-4-Cl	B117	
1-516	Me	Me	2-Br-5-OMe	B21	Aceite
1-517	Me	Me	2-Me-4-OCH(Me)OMe	B16	
1-518	Me	Me	4-CH ₂ Br	B25	Viscoso
1-519	Me	Me	4-CH ₂ Br	B62	108-111
1-520	Me	Me	4-CH ₂ OMe	B25	97-102
1-521	Me	Me	4-CH ₂ NMe ₂	B25	Viscoso
1-522 *	Me	Me	2-Me-4-OCH ₂ Ph	B14	
1-523 *	Me	CH ₂ Cl	3-F-4-Cl	B1	
1-524*	Me	CH ₂ Cl	3-Me-4-Br	B14	
1-525*	Me	CH ₂ Cl	3-Cl-4-Cl	B16	
1-526 *	Me	CH=CH ₂	3-Me-4-Cl	B21	
1-527*	Me	CH=CH ₂	2-Me-4-OMe	B1	
1-528 *	Me	CH=CH ₂	2-Me-4-OEt	B14	
1-529 *	Me	C=CH	2-Me-4-OPr(i)	B16	
1-530*	Me	C=CH	3-Cl-4-Br	B21	
1-531 *	Me	C=CH	3-Br-4-Cl	B1	
1-532*	Me	CH ₂ OMe	3-F-4-Cl	B14	
1-533 *	Me	CH ₂ OMe	3-Me-4-Br	B16	
1-534*	Me	CH ₂ OMe	3-Cl-4-Cl	B21	
1-535	Me	Me	3-OMe-4-OMe	B21	138-140
1-536	Me	Me	2-Br	B21	Viscoso
1-537*	Me	Me	4-SPh	B1	
1-538	Me	Me	4-CH ₂ OMe	B62	74-76

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
1-539	Me	Me	4-CH ₂ NMe ₂	B62	Viscoso
1-540	Me	Me	4-CH ₂ OMe	B21	117-119
1-541 *	Me	Me	4-CH ₂ SMe	B21	
1-542	Me	Me	4-CH ₂ NMe ₂	B21	
1-543*	Me	Me	2-Me-4-Ph(4-Cl)	B21	
1-544*	Me	Me	2-Me-4-Ph(4-OMe)	B21	
1-545 *	Me	Me	2-Me-4-CH=CHCMe ₃	B16	
1-546 *	Me	Me	2-Me-4-Ph(4-CF ₃)	B21	
1-547*	Me	Me	2-Me-4-CH=CHPh	B14	
1-548*	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ SO ₂ Me	B21	
1-549	Me	Me	4-Me	B25	96-98
1-550	Me	Me	4-Me	B62	98-102
1-551 *	Me	Me	4-SCO ₂ Me	B1	
1-552 *	Me	Me	2-Me-4-CH ₂ CN	B16	
1-553 *	Me	Me	4-NHPh	B1	
1-554	Me	Me	2-Me-4-OBu(t)	B21	
Referencia					



5

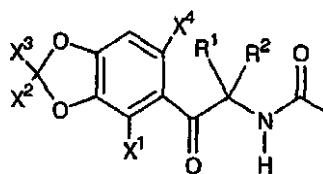
Tabla 2

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
2-1	Me	Me	H	B1	145-147
2-2	Me	Me	H	B16	159-161
2-3	Me	Me	H	B7	152-154
2-4	Me	Me	H	B2	Sólido
2-5	Me	Et	H	B1	
2-6	Me	Et	H	B16	
2-7	Me	Et	H	B21	
2-8	-(CH ₂) ₅ -		H	B16	
2-9	Me	Me	H	B12	225-226
2-10	Me	Me	H	B5	159-160
2-11	Me	Me	H	B8	196-198

10

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
2-12	Me	Me	H	B13	195-197
2-13	Me	Me	H	B15	158-160
2-14	Me	Me	H	B21	163-164
2-15	-(CH ₂) ₅ -		H	B21	
2-16	Me	Et	H	B1	
2-17	Me	Et	H	B5	
2-18	Me	Et	H	B8	
2-19	Me	Et	H	B11	
2-20	Me	Et	H	B14	
2-21	Me	Et	H	B15	
2-22	Me	Et	H	B16	
2-23	Me	Et	H	B21	
2-24	Me	Me	1-Me	B1	
2-25	Me	Me	3-Me	B5	
2-26	Me	Me	4-Me	B8	
2-27	Me	Me	5-Me	B14	
2-28	Me	Me	6-Me	B15	
2-29	Me	Me	7-Me	B16	
2-30	Me	Me	8-Me	B21	
2-31 *	Me	Me	H	B48	
2-32*	Me	Me	H	B49	
2-33	Me	Me	H	B19	
2-34	Me	Me	H	B20	
2-35*	Me	Me	H	B50	
2-36	Me	Me	1-Me	B21	
2-37	Me	Me	1-Me	B16	
Referencia					



5

Tabla 3

N.º	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
3-1	Me	Me	H	H	H	H	B1	127-128
3-2	Me	Me	H	H	H	H	B16	130-132

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
3-3	Me	Me	H	H	H	H	B21	155-158
3-4	Me	Me	H	F	F	H	B1	124-126
3-5	Me	Me	H	F	F	H	B16	
3-6	Me	Me	H	F	F	H	B21	116-118
3-7	Me	Me	Me	H	H	H	B1	
3-8	Me	Me	Me	H	H	H	B16	
3-9	Me	Me	Me	H	H	H	B21	98-102
3-10	Me	Me	Me	F	F	H	B1	99-107
3-11	Me	Me	Me	F	F	H	B16	
3-12	Me	Me	Me	F	F	H	B21	145-148
3-13	Me	Me	Cl	H	H	H	B1	
3-14	Me	Me	Cl	H	H	H	B16	
3-15	Me	Me	Cl	H	H	H	B21	
3-16	Me	Me	Cl	F	F	H	B1	
3-17	Me	Me	Cl	F	F	H	B16	
3-18	Me	Me	Cl	F	F	H	B21	
3-19	Me	Me	Me	F	F	H	B8	142-145
3-20	Me	Me	Me	F	F	H	B5	104-108
3-21	-(CH ₂) ₅ -		H	F	F	H	B21	
3-22	-(CH ₂) ₅ -		Me	F	F	H	B1	
3-23	Me	Me	H	F	F	H	B5	158-160
3-24	Me	Me	Me	F	F	H	B47	97-99
3-25	Me	Me	H	F	F	Me	B21	85-90
3-26	Me	Me	H	H	H	Me	B21	111-114
3-27	Me	Me	Me	Me	Me	H	B21	
3-28	Me	Me	Me	Me	H	H	B21	
3-29	Me	Me	Me	Et	H	H	B21	
3-30	Me	Me	Me	D3	H	H	B21	

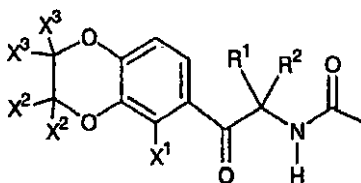


Tabla 4

N.º	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
4-1	Me	Me	H	H	H	B1	

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
4-2	Me	Me	H	H	H	B5	
4-3	Me	Me	H	H	H	B8	
4-4	Me	Me	H	H	H	B16	
4-5	Me	Me	H	H	H	B21	
4-6	Me	Me	H	F	F	B1	
4-7	Me	Me	H	F	F	B5	
4-8	Me	Me	H	F	F	B8	
4-9	Me	Me	H	F	F	B11	
4-10	Me	Me	H	F	F	B21	120-122
4-11	Me	Me	Me	H	H	B1	
4-12	Me	Me	Me	H	H	B4	
4-13	Me	Me	Me	H	H	B8	
4-14	Me	Me	Me	H	H	B16	
4-15	Me	Me	Me	H	H	B21	
4-16	Me	Me	Me	F	F	B1	
4-17	Me	Me	Me	F	F	B15	
4-18	Me	Me	Me	F	F	B10	
4-19	Me	Me	Me	F	F	B21	74-78
4-20	Me	Me	Me	F	F	B25	
4-21	Me	Me	Me	H	Me	B21	
4-22	Me	Me	Me	H	Me	B16	
4-23	Me	Me	Me	H	Me	B14	
4-24	Me	Me	Me	Me	H	B1	
4-25	Me	Me	Me	Me	H	B5	
4-26	Me	Me	Me	Me	H	B8	
4-27	Me	Me	Me	H	Me	B1	
4-28	Me	Me	Me	H	Me	B5	
4-29	Me	Me	Me	H	Me	B8	
4-30	Me	Me	Me	H	Me	B71	

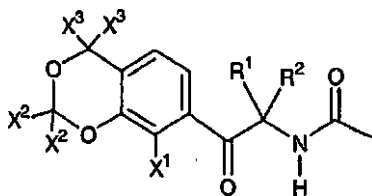


Tabla 5

N.º	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
5-1	Me	Me	H	H	H	B1	
5-2	Me	Me	H	H	H	B5	
5-3	Me	Me	H	H	H	B7	
5-4	Me	Me	H	H	H	B14	
5-5	Me	Me	H	H	H	B15	
5-6	Me	Me	Me	H	H	B1	
5-7	Me	Me	Me	H	H	B5	
5-8	Me	Me	Me	H	H	B8	
5-9	Me	Me	Me	H	H	B11	
5-10	Me	Me	Me	H	H	B21	
5-11	Me	Me	H	F	F	B1	
5-12	Me	Me	H	F	F	B4	
5-13	Me	Me	H	F	F	B8	
5-14	Me	Me	H	F	F	B16	
5-15	Me	Me	H	F	F	B21	
5-16	Me	Me	Me	F	F	B1	
5-17	Me	Me	Me	F	F	B15	
5-18	Me	Me	Me	F	F	B10	
5-19	Me	Me	Me	F	F	B21	
5-20	Me	Me	Me	F	F	B25	
5-21	Me	Me	Me	H	Me	B21	
5-22	Me	Me	Me	H	Me	B16	
5-23	Me	Me	Me	H	Me	B14	
5-24	Me	Me	Me	F	H	B1	
5-25	Me	Me	Me	F	H	B5	
5-26	Me	Me	Me	F	H	B8	
5-27	Me	Me	Me	Me	H	B14	
5-28	Me	Me	Me	Me	H	B16	
5-29	Me	Me	Me	Me	H	B21	
5-30	Me	Me	Me	Me	Me	B21	

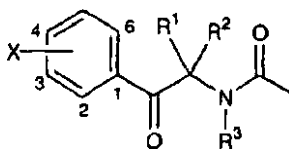


Tabla 6

N.º	R ¹	R ²	R ³	X	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
6-1	Me	Me	CO ₂ Bu(t)	4-Br	B21	Aceite
6-2	Me	Me	COMe	4-Br	B21	Aceite
6-3	Me	Me	COMe	3-Cl-4-Cl	B21	Aceite
6-4	Me	Me	Me	3-Cl-4-Cl	B1	147-150
6-5	Me	Me	CO ₂ Bu(t)	3-Cl-4-Cl	B21	66-68
6-6*	Me	Me	SCCl ₃	3-Br-4-Cl	B1	
6-7*	Me	Me	SPh	3-Cl-4-Br	B5	
6-8*	Me	Me	SOPh	3-Me-4-Br	B8	
6-9*	Me	Me	SO ₂ Ph	3-Me-4-Cl	B14	
6-10*	Me	Me	SO ₂ Me	3-Cl-4-Cl	B16	
6-11 *	Me	Me	SO ₂ CF ₃	3-F-4-Cl	B21	
6-12*	Me	Me	SO ₂ NMe ₂	2-Me-4-OMe	B71	
6-13*	Me	Me	CH ₂ OMe	2-Me-4-OEt	B1	
6-14*	Me	Me	CH ₂ SMe	2-Me-4-OPr(i)	B5	
6-15*	Me	Me	CN	3-Br-4-Br	B8	
6-16*	Me	Me	CHO	2-Me-4-Cl	B14	
6-17*	Me	Me	CH ₂ CF ₃	2-Me-4-Br	B16	
6-18*	Me	Me	OCH ₂ CF ₃	3-Br-4-Cl	B21	
6-19*	Me	Me	D3	3-Cl-4-Br	B71	
6-20*	Me	Me	OH	3-Me-4-Br	B1	
6-21 *	Me	Me	CO ₂ CH ₂ Ph	3-Me-4-Cl	B5	
6-22*	Me	Me	CO ₂ CH ₂ OMe	3-Cl-4-Cl	B8	
6-23*	Me	Me	COPh	3-Cl-4-Cl	B14	
6-24*	Me	Me	COCF ₃	3-Cl-4-Cl	B16	
6-25*	Me	Me	CH ₂ C≡CH	3-Cl-4-Cl	B21	
6-26*	Me	Me	CH ₂ CH=CH ₂	3-F-4-Cl	B71	
6-27*	Me	Me	CH ₂ CN	2-Me-4-OMe	B1	
6-28*	Me	Me	Ciclopentiloxilo	2-Me-4-OEt	B5	
6-29*	Me	Me	CH ₂ CH ₂ OCHF ₂	2-Me-4-OPr(i)	B8	
6-30*	Me	Me	CH ₂ CH ₂ NH ₂	3-Br-4-Br	B14	
6-31 *	Me	Me	CH ₂ CH ₂ NHMe	2-Me-4-Cl	B16	
6-32*	Me	Me	CH ₂ CH ₂ NMe ₂	2-Me-4-Br	B21	
Referencia						

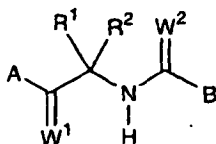


Tabla 7

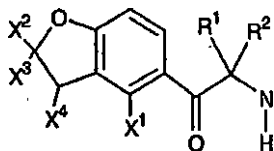
N.º	A	W ¹	R ¹	R ²	W ²	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
7-1	2-tienilo	0	Me	Me	0	B1	101-105
7-2	2-tienilo	0	Me	Me	0	B21	118-121
7-3	3-tienilo	0	Me	Me	0	B1	121-125
7-4	5-Cl-3-tienilo	0	Me	Me	0	B21	138-142
7-5	2-Cl-5-Cl-3-tienilo	0	Me	Me	0	B21	119-121
7-6	5-Cl-2-tienilo	0	Me	Me	0	B21	127-132
7-7	5-Cl-2-tienilo	0	Me	Me	0	B1	115-120
7-8	4-Cl-2-tienilo	0	Me	Me	0	B21	119-121
7-9	4-Cl-2-tienilo	0	Me	Me	0	B1	Aceite
7-10*	1-naftilo	0	Me	Me	0	B48	
7-11 *	1-naftilo	0	Me	Me	0	B49	
7-12	1-naftilo	0	Me	Me	0	B19	
7-13	1-naftilo	0	Me	Me	0	B20	
7-14*	1-naftilo	0	Me	Me	0	B50	
7-15	1-naftilo	0	Me	Me	0	B12	
7-16	1-naftilo	0	Me	Me	0	B13	
7-17*	2-tienilo	0	Me	Me	0	B48	
7-18*	2-tienilo	0	Me	Me	0	B49	
7-19	2-tienilo	0	Me	Me	0	B19	
7-20	2-tienilo	0	Me	Me	0	B20	
7-21 *	2-tienilo	0	Me	Me	0	B50	
7-22	2-tienilo	0	Me	Me	0	B12	
7-23	2-tienilo	0	Me	Me	0	B13	
7-24*	3-tienilo	0	Me	Me	0	B48	
7-25*	3-tienilo	0	Me	Me	0	B49	
7-26	3-tienilo	0	Me	Me	0	B19	
7-27	3-tienilo	0	Me	Me	0	B20	
7-28*	3-tienilo	0	Me	Me	0	B50	
7-29	3-tienilo	0	Me	Me	0	B12	
7-30	3-tienilo	0	Me	Me	0	B13	
7-31 *	2-piridilo	0	Me	Me	0	B48	
7-32*	2-piridilo	0	Me	Me	0	B49	
7-33	2-piridilo	0	Me	Me	0	B19	
7-34	2-piridilo	0	Me	Me	0	B20	
7-35*	2-piridilo	0	Me	Me	0	B50	
7-36	2-piridilo	0	Me	Me	0	B12	
7-37	2-piridilo	0	Me	Me	0	B13	

(Continuación)

N.º	A	W ¹	R ¹	R ²	W ²	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
7-38*	3-piridilo	0	Me	Me	0	B48	
7-39*	3-piridilo	0	Me	Me	0	B49	
7-40	3-piridilo	0	Me	Me	0	B19	
7-41	3-piridilo	0	Me	Me	0	B20	
7-42*	3-piridilo	0	Me	Me	0	B50	
7-43	3-piridilo	0	Me	Me	0	B12	
7-44	4-piridilo	0	Me	Me	0	B13	
7-45*	4-piridilo	0	Me	Me	0	B48	
7-46*	4-piridilo	0	Me	Me	0	B49	
7-47	4-piridilo	0	Me	Me	0	B19	
7-48	4-piridilo	0	Me	Me	0	B20	
7-49*	4-piridilo	0	Me	Me	0	B50	
7-50	4-piridilo	0	Me	Me	0	B12	
7-51	4-piridilo	0	Me	Me	0	B13	
7-52*	Indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B48	
7-53*	Indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B49	
7-54	Indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B19	
7-55	Indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B20	
7-56*	Indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B50	
7-57	Indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B12	
7-58	Indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B13	
7-59*	N-Me-indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B48	
7-60*	N-Me-indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B49	
7-61	N-Me-indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B19	
7-62	N-Me-indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B20	
7-63	N-Me-indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B50	
7-64	N-Me-indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B12	
7-65	N-Me-indol-3-ilo	0	Me	Me	0	B13	
7-66	3-tienilo	0	Me	Me	0	B21	131-133
7-67	Ph(3,4-Cl ₂)	s	Me	Me	0	B21	
7-68	Ph(3,4-Cl ₂)	0	Me	Me	s	B21	
7-69	2-Cl-5-piridilo	0	Me	Me	0	B21	
7-70	3-piridilo	0	Me	Me	0	B21	
7-71	2-OMe-5-piridilo	0	Me	Me	0	B21	
7-72	2-Cl-5-piridilo	0	Me	Me	0	B16	
7-73	2-OMe-5-piridilo	0	Me	Me	0	B16	
7-74	5-OMe-2-piridilo	0	Me	Me	0	B21	
7-75	5-OMe-2-piridilo	0	Me	Me	0	B16	

(Continuación)

N.º	A	W ¹	R ¹	R ²	W ²	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
7-76	5-Cl-2-piridilo	0	Me	Me	0	B21	
7-77	5-Cl-2-piridilo	0	Me	Me	0	B16	
Referencia							



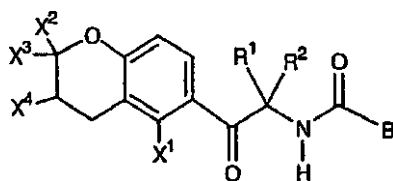
5

Tabla 8

N.º	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
8-1	Me	Me	Me	F	F	H	B1	
8-2	Me	Me	Me	F	F	H	B5	
8-3	Me	Me	Me	F	F	H	B8	
8-4	Me	Me	Me	F	F	H	B14	
8-5	Me	Me	Me	F	F	H	B16	
8-6	Me	Me	Me	F	F	H	B21	
8-7	Me	Me	Me	F	F	H	B71	
8-8	Me	Me	Me	H	H	H	B1	
8-9	Me	Me	Me	H	H	H	B14	
8-10	Me	Me	Me	H	H	H	B16	
8-11	Me	Me	Me	Me	H	H	B1	
8-12	Me	Me	Me	Me	H	H	B5	
8-13	Me	Me	Me	Me	H	H	B8	
8-14	Me	Me	Me	Me	H	H	B14	
8-15	Me	Me	Me	Me	H	H	B16	
8-16	Me	Me	Me	Me	H	H	B21	
8-17	Me	Me	Me	Me	H	H	B71	
8-18	Me	Me	Me	Me	Me	H	B1	
8-19	Me	Me	Me	Me	Me	H	B5	
8-20	Me	Me	Me	Me	Me	H	B8	
8-21	Me	Me	Me	Me	Me	H	B14	
8-22	Me	Me	Me	Me	Me	H	B16	
8-23	Me	Me	Me	Me	Me	H	B21	
8-24	Me	Me	Me	Me	Me	H	B71	
8-25	Me	Me	H	F	F	H	B5	
8-26	Me	Me	H	F	F	H	B8	
8-27	Me	Me	Me	F	F	Me	B14	

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
8-28	Me	Me	Me	F	F	Me	B16	
8-29	Me	Me	Me	Me	H	Me	B21	
8-30	Me	Me	Me	Me	Me	Me	B71	



5

Tabla 9

N.º	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
9-1	Me	Me	Me	F	F	H	B1	
9-2	Me	Me	Me	F	F	H	B5	
9-3	Me	Me	Me	F	F	H	B8	
9-4	Me	Me	Me	F	F	H	B14	
9-5	Me	Me	Me	F	F	H	B16	
9-6	Me	Me	Me	F	F	H	B21	
9-7	Me	Me	Me	F	F	H	B71	
9-8	Me	Me	Me	H	H	H	B1	
9-9	Me	Me	Me	H	H	H	B14	
9-10	Me	Me	Me	H	H	H	B16	
9-11	Me	Me	Me	Me	H	H	B1	
9-12	Me	Me	Me	Me	H	H	B5	
9-13	Me	Me	Me	Me	H	H	B8	
9-14	Me	Me	Me	Me	H	H	B14	
9-15	Me	Me	Me	Me	H	H	B16	
9-16	Me	Me	Me	Me	H	H	B21	
9-17	Me	Me	Me	Me	H	H	B71	
9-18	Me	Me	Me	Me	Me	H	B1	
9-19	Me	Me	Me	Me	Me	H	B5	
9-20	Me	Me	Me	Me	Me	H	B8	
9-21	Me	Me	Me	Me	Me	H	B14	
9-22	Me	Me	Me	Me	Me	H	B16	
9-23	Me	Me	Me	Me	Me	H	B21	
9-24	Me	Me	Me	Me	Me	H	B71	
9-25	Me	Me	H	F	F	H	B5	
9-26	Me	Me	H	F	F	H	B8	

(Continuación)

N.º	R ¹	R ²	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	B	Propiedades físicas (p.f. °C)
9-27	Me	Me	Me	F	F	Me	B14	
9-28	Me	Me	Me	F	F	Me	B16	
9-29	Me	Me	Me	Me	H	Me	B21	
9-30	Me	Me	Me	Me	Me	Me	B71	

Tabla 10

N.º	RMN de ¹ H δ ppm (Disolvente: CDCl ₃ / 400MHz)
1-21	1,73 (s, 6H), 6,97 (d, 1H), 7,42 (m, 2H), 7,59 (s, 1H), 7,84 (dd, 1H), 8,10 (d, 1H)
1-24	1,56 (s, 6H), 1,71 (s, 3H), 6,44 (s, 1H), 6,71 (dd, 1H), 7,30 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,82 (dd, 1H), 8,08 (d, 1H)
1-28	1,76 (s, 6H), 2,34 (s, 3H), 2,40 (s, 3H), 6,83 (m, 2H), 7,23 (m, 3H), 7,74 (m, 3H)
1-29	1,74 (s, 6H), 2,33 (s, 3H), 6,51 (s, 1H), 6,83 (d, 1H), 7,22 (d, 1H), 7,50 (t, 1H), 7,70 (d, 1H), 8,18 (d, 1H), 8,26 (s, 1H)
1-46	1,73 (s, 6H), 3,88 (s, 3H), 6,75 (s, 1H), 7,45 (d, 1H), 7,83 (m, 2H), 8,10 (d, 1H)
1-76	1,71 (s, 6H), 6,70 (t, 1H), 6,90 (d, 1H), 7,42 (m, 3H), 7,81 (dd, 1H), 8,06 (d, 1H)
1-120	1,72 (s, 6H), 2,24 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,47 (s, 3H), 6,80 (s, 1H), 6,86 (d, 1H), 7,20 (d, 2H), 7,25 (d, 1H)
1-121	1,76 (s, 6H), 2,34 (s, 3H), 2,53 (s, 3H), 6,88 (d, 1H), 6,94 (s, 1H), 7,09 (d, 1H), 7,24 (d, 1H), 7,28 (d, 1H)
1-123	1,50 (d, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,56 (s, 3H), 5,66 (m, 1H), 6,70 (da, 1H), 7,48 (da, 1H), 7,96 (d, 2H)
1-136	1,81 (s, 6H), 2,24 (s, 3H), 2,39 (s, 3H), 6,78 (d, 1H), 6,83 (d, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,22 (m, 2H), 7,40 (d, 2H), 8,03 (d, 2H)
1-140	1,73 (s, 6H), 2,24 (s, 3H), 2,47 (s, 3H), 6,58 (s, 1H), 6,75 (d, 1H), 7,15 (d, 1H), 7,22 (d, 1H), 7,22 (d, 1H), 7,54 (d, 1H), 7,63 (dd, 1H), 7,91 (dd, 1H), 8,21 (d, 1H)
1-143	1,76 (s, 3H), 2,17 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 6,71 (s, 1H), 6,83 (d, 1H), 7,00 (d, 1H), 7,10 (d, 1H), 7,20 (d, 1H), 7,41 (d, 1H), 7,47 (d, 1H), 7,93 (dd, 1H), 7,96 (d, 1H)
1-144	1,77 (s, 6H), 2,38 (s, 3H), 6,45 (d, 1H), 6,67 (d, 1H), 6,83 (d, 1H), 7,22 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,47 (d, 1H), 7,75 (dd, 1H), 7,83 (dd, 1H), 8,26 (d, 1H)
1-148	1,72 (s, 6H), 2,53 (s, 3H), 2,65 (s, 3H), 6,38 (s, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,89 (dd, 1H), 8,05 (d, 1H)
1-149	1,74 (s, 6H), 7,45 (d, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,82 (dd, 1H), 8,07 (d, 1H)
1-157	1,76 (s, 6H), 7,38 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,83 (dd, 1H), 8,09 (d, 1H), 9,98 (s, 1H)
1-179	1,72 (s, 6H), 2,21 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,45 (s, 3H), 6,50 (t, 1H), 6,78 (s, 1H), 6,85 (d, 1H), 6,91 (d, 1H), 7,25 (m, 2H)
1-181	1,32 (d, 6H), 1,72 (s, 6H), 2,36 (s, 3H), 2,46 (s, 3H), 2,80 (m, 1H), 6,74 (s, 1H), 6,84-6,92 (m, 2H), 6,98 (s, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,52 (d, 1H)
1-184	1,73 (s, 6H), 2,46 (s, 3H), 3,82 (s, 3H), 6,84 (d, 1H), 6,85-6,91 (m, 3H), 7,00 (t, 1H), 7,26 (d, 1H), 7,27-7,39 (m, 2H)
1-187	1,75 (s, 6H), 2,38 (s, 3H), 2,43 (s, 3H), 4,35 (c, 2H), 6,69 (s, 1H), 6,71 (dd, 1H), 6,82 (d, 1H), 6,86 (d, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,52 (d, 1H)
1-189	1,52 (d, 3H), 2,57 (s, 3H), 6,67 (m, 1H), 6,90 (d, 1H), 7,0 (da, 1H), 7,31 (d, 1H), 7,50 (d, 2H), 7,97 (d, 2H)
1-231	1,77 (s, 6H), 2,25 (s, 3H), 2,48 (s, 3H), 3,77 (s, 3H), 6,85 (dd, 1H), 6,87 (d, 1H), 6,89 (s, 1H), 6,97 (d, 1H), 7,15 (d, 1H), 7,26 (d, 1H)
1-270	1,75 (s, 6H), 2,29 (s, 3H), 2,36 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 6,73 (s, 1H), 6,86 (d, 1H), 6,91 (dd, 1H), 6,99 (d, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,51 (d, 1H)

(Continuación)

N.º	RMN de ¹ H δ ppm (Disolvente: CDCl ₃ / 400MHz)
1-271	1,31 (d, 9H), 1,73 (s, 6H), 2,31 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 6,75 (s, 1H), 6,85 (d, 2H), 7,17 (dd, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,28 (sa, 1H), 7,39 (d, 1H)
1-273	0,96 (t, 3H), 1,26-1,31 (m, 3H), 1,61 -1,75 (m, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 4,32 (m, 1H), 6,64 (dd, 1H), 6,75 (d, 1H), 6,85 (d, 1H), 6,88 (s, 1H), 7,24 (d, 1H), 7,47 (d, 1H)
1-276	1, 75 (s, 6H), 2, 38 (s, 3H), 2, 43 (s, 3H), 6, 71 (s, 1H), 6, 85 (d, 1H) 7,24 (d, 1H), 7,32 (dd, 1H), 7,34-7,36 (m, 3H), 7,43 (sa, 1H), 7,51-7,54 (m, 2H)
1-282	0,24 (s, 9H), 1,73 (s, 6H), 2,33 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 6,68 (s, 1H), 6,86 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 7,25 (d, 1H), 7,36 (sa, 1H), 7,42 (d, 1H)
1-516	1,78 (s, 6H), 2,53 (s, 3H), 3,79 (s, 3H), 6,76 (s, 1H), 6,83 (dd, 1H), 6,89 (d, 1H), 7,14 (d, 1H), 7,29 (d, 1H), 7,47 (d, 1H)
1-518	1,78 (s, 6H), 4,43 (s, 2H), 6,96 (d, 1H), 7,38 (d, 2H), 7,41 (d, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,96 (d, 2H)
1-521	1, 74 (s, 6H), 2,13 (s, 6H), 3, 34 (s, 2H), 6, 87 (d, 1H), 7, 25 (d, 2H), 7,32 (d, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,88 (d, 2H)
1-536	1,73 (s, 6H), 2,48 (s, 3H), 6,75 (s, 1H), 6,85 (d, 1H), 7,22-7,26 (m, 2H), 7,32 (dt, 1H), 7,55-7,58 (m, 2H)
1-539	1,80 (s, 6H), 2,30 (s, 6H), 3,56 (s, 2H), 7,01 (d, 1H), 7,39 (m, 3H), 7,93 (s, 1H), 7,98 (d, 2H)
2-4	1,87 (s, 6H), 2,45 (s, 3H), 3,80 (s, 3H), 7,54 (m, 2H), 7,69 (s, 1H), 7,90 (m, 3H), 8,00 (d, 1H), 8,50 (s, 1H)
6-1	0,75 (s, 3H), 1,34 (s, 9H), 1,59 (s, 3H), 2,57 (s, 3H), 6,93 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,39 (d, 2H), 7,54 (d, 2H),
6-2	0,74 (s, 3H), 1,62 (s, 3H), 2,04 (s, 3H), 2,56 (s, 3H), 6,92 (d, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,37 (d, 2H), 7,53 (d, 2H),
6-3	1,60 (s, 6H), 2,04 (s, 3H), 2,54 (s, 3H), 6,91 (d, 1H), 7,29 (m, 1H), 7,36 (m, 1H), 7,45 (d, 1H), 7,54 (s, 1H)
7-9	1,60 (s, 6H), 2,30 (s, 3H), 3,76 (s, 3H), 6,67 (s, 1H), 6,91 (d, 1H), 7,25 (d, 1H)

A continuación, se describirán los ejemplos de prueba para la composición de la presente invención. En cada prueba, se determinó el índice de control en base a los siguientes parámetros:

5

[índice de control] : [Grado de brote de la enfermedad:observación visual]

5: Sin lesiones ni esporulación reconocibles.

10

4: La superficie de las lesiones, la longitud de las lesiones, el número de lesiones o la superficie de la esporulación es menor del 10% del terreno sin tratar.

3: La superficie de las lesiones, la longitud de las lesiones, el número de lesiones o la superficie de la esporulación es menor del 40% del terreno sin tratar.

2: La superficie de las lesiones, la longitud de las lesiones, el número de lesiones o la superficie de la esporulación es menor del 70% del terreno sin tratar.

15

1: La superficie de las lesiones, la longitud de las lesiones, el número de lesiones o la superficie de la esporulación es al menos del 70% del terreno sin tratar.

Ejemplo de prueba 1: Prueba sobre el efecto preventivo contra el oídio del trigo

20

Se cultivó trigo (cultivar: Noria-61-go) en una maceta de plástico que tenía un diámetro de 7,5 cm y cuando alcanzó la fase de 1,5 hojas, se aplicaron 10 ml de una solución química que tenía el derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales ajustada hasta la concentración prescrita con una pistola pulverizadora. Una vez seca la solución química (el mismo día de la aplicación), se espolvorearon conidias de *Erysiphe graminis*, y se inoculó y mantuvo en una cámara a temperatura constante a 20°C. De 6 a 7 días después de la inoculación, se examinó la superficie de la esporulación y se determinó el índice de control según los patrones de evaluación anteriores. La prueba se llevó a cabo con respecto a los compuestos N.º 1-13, 1-29, 1-39, 1-54, 1-90, 1-96, 1-100, 1-101, 1-106, 1-107, 1-109, 1-124, 1-125, 1-127, 1-148, 1-152, 1-156, 1-174, 1-175, 1-190, 1-205, 1-516, 3-4, 3-9, 3-10, 3-12, 3-19, 3-20, 4-19, 6-1 y 7-2 anteriores, y todos los compuestos mostraron efectos con un índice de control de 4 ó 5 a una concentración de 500 ppm.

30

Ejemplo de prueba 2: Prueba sobre el efecto preventivo contra el oídio del pepino

Se cultivó pepino (cultivar: *Sagamihanpaku*) en una maceta de plástico que tenía un diámetro de 7,5 cm y cuando

alcanzó la fase de 1,5 hojas, se aplicaron 10 ml de una solución química que tenía el derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales ajustada hasta la concentración prescrita con una pistola pulverizadora. Una vez seca la solución química (el mismo día de la aplicación o el día siguiente), se pulverizó una suspensión de conidias de *Sphaerotheca fuliginea*, y se inoculó y mantuvo en una cámara a temperatura constante a 20°C. De 6 a 7 días después de la inoculación, se examinó la superficie de la esporulación y se determinó el índice de control según los patrones de evaluación anteriores. La prueba se llevó a cabo con respecto a los compuestos N.º 1-6, 1-9, 1-11, 1-14, 1-15, 1-17 a 1-22, 1-27 a 1-29, 1-32, 1-33, 1-36, 1-39, 1-41 a 1-43, 1-47, 1-53 a 1-56, 1-62 a 1-64, 1-66, 1-73, 1-77, 1-79, 1-90, 1-93, 1-97 a 1-104, 1-106 a 1-108, 1-111, 1-115, 1-119, 1-120, 1-124, 1-127, 1-129, 1-131, 1-148, 1-150, 1-152, 1-156, 1-160, 1-161, 1-164, 1-165, 1-167, 1-170, 1-172, 1-174, 1-175, 1-190, 1-205, 1-516, 2-1, 2-14, 3-2, 3-4, 3-6, 3-9, 3-10, 3-12, 3-19, 3-20, 3-23, 4-10 y 6-1 a 6-3 anteriores, y todos los compuestos mostraron efectos con un índice de control de 4 ó 5 a una concentración de 500 ppm. La prueba se llevó a cabo con respecto al compuesto N.º 1-34 anterior, y mostró un efecto con un índice de control de 4 a una concentración de 200 ppm.

Ejemplo de prueba 3: Prueba sobre el efecto preventivo contra el añublo del arroz

Se cultivó arroz (cultivar: *Nihonbare*) en una maceta de plástico que tenía un diámetro de 7,5 cm y cuando alcanzó la fase de 1,5 hojas, se aplicaron 10 ml de una solución química que tenía el derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales ajustada hasta la concentración prescrita con una pistola pulverizadora. Una vez seca la solución química (el mismo día de la aplicación o el día siguiente), se pulverizó una suspensión de conidias de *Pyricularia oryzae*, y se inoculó y mantuvo en una caja de inoculación a 20°C durante 24 horas, tras lo que se mantuvo en una cámara de temperatura constante a 20°C. De 5 a 7 días después de la inoculación, se examinó el número de lesiones y se determinó el índice de control según los patrones de evaluación anteriores. La prueba se llevó a cabo con respecto a los compuestos N.º 1-6, 1-9, 1-13, 1-14, 1-28, 1-45, 1-47, 1-52, 1-53, 1-55, 1-56, 1-62; 1-63, 1-66, 1-75, 1-77, 1-79, 1-109, 1-119, 1-164, 2-1, 2-2, 3-25 y 4-19 anteriores, y todos los compuestos mostraron efectos con un índice de control de 4 ó 5 a una concentración de 500 ppm.

Ejemplo de prueba 4: Prueba sobre el efecto preventivo contra el moho gris de la judía

Se cultivó judía (cultivar: *Taisyō Kintoki*) en una maceta de plástico que tenía un diámetro de 15 cm y cuando la hoja principal se desarrolló lo suficiente, se aplicaron 10 ml de una solución química que tenía el derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales ajustada hasta la concentración prescrita con una pistola pulverizadora. Una vez seca la solución química (el mismo día de la aplicación o el día siguiente), se inoculó una suspensión de esporas de *Botrytis cinerea* (extracto de glucosa de patata diluido al 50% con agua) y se mantuvo en una cámara a temperatura constante a 20°C. Tres días después de la inoculación, se examinaron las longitudes de las lesiones (mm) y se determinó el índice de control según los patrones de evaluación anteriores. La prueba se llevó a cabo con respecto a los compuestos N.º 1-11, 1-15, 1-17, 1-20, 1-22, 1-27, 1-41, 1-43, 1-52, 1-80, 1-99, 1-102, 1-112 a 1-115, 1-117, 1-118, 1-120, 1-125, 1-131, 1-136, 1-160, 1-162, 1-169, 1-172, 1-176, 1-180, 1-182, 1-186 a 1-189, 1-273, 2-2, 2-9, 2-13, 2-14 y 7-6 anteriores, y todos los compuestos mostraron efectos con un índice de control de 4 ó 5 a una concentración de 500 ppm.

Ejemplo de prueba 5: Prueba sobre el efecto preventivo contra la podredumbre del tallo de la judía

Se cultivó judía (cultivar: *Taisyō Kintoki*) en una maceta de plástico que tenía un diámetro de 15 cm y cuando la hoja principal se hubo desarrollado lo suficiente, se aplicaron 10 ml de una solución química que tenía el derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales ajustada hasta la concentración prescrita con una pistola pulverizadora. Una vez seca la solución química (el mismo día de la aplicación o el día siguiente), se inoculó disco micelial de *Sclerotinia sclerotiorum* y se mantuvo en una cámara a temperatura constante a 20°C. Tres días después de la inoculación, se examinaron las longitudes de las lesiones (mm) y se determinó el índice de control según los patrones de evaluación anteriores. La prueba se llevó a cabo con respecto a los compuestos N.º 1-1, 1-4, 1-7, 1-10, 1-16, 1-18, 1-19, 1-21, 1-26, 1-30 a 1-33, 1-36, 1-38, 1-42, 1-44, 1-46, 1-57, 1-60, 1-64, 1-69, 1-71, 1-73, 1-75, 1-80, 1-86, 1-93, 1-96 a 1-98, 1-103 a 1-105, 1-108, 1-111 a 1-114, 1-117, 1-118, 1-123, 1-126, 1-128, 1-129, 1-133 a 1-136, 1-141 a 1-144, 1-146, 1-149, 1-150, 1-159, 1-161 a 1-163, 1-165 a 1-171, 1-176, 1-180, 1-181, 1-186, 1-188, 1-208, 1-209, 1-271, 1-273, 1-276, 1-535, 2-1, 2-3, 2-4, 2-10, 2-11, 2-13, 3-2, 3-3, 3-6, 3-23, 3-26, 4-10, 6-2, 6-3, 7-2, 7-4, 7-6 a 7-8, y 7-66, y todos los compuestos mostraron efectos con un índice de control de 4 ó 5 a una concentración de 500 ppm.

Ejemplo de prueba 6: Prueba sobre el efecto preventivo contra la mancha de la pluma del trigo

Se cultivó trigo (cultivar: *Noria-61-go*) en una maceta de plástico que tenía un diámetro de 7,5 cm y cuando alcanzó la fase de 5 hojas, se aplicaron 10 ml de una solución química que tenía el derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales ajustada hasta la concentración prescrita con una pistola pulverizadora. Una vez seca la solución química (el mismo día de la aplicación), se pulverizó una suspensión de conidias de *Septoria nodorum*, y se inoculó y mantuvo en una caja de inoculación a 20°C durante 72 horas, tras lo que se mantuvo en una cámara de temperatura constante a 20°C. De 5 a 10 días después de la inoculación, se examinó el número de lesiones y se determinó el índice de control según los patrones de evaluación anteriores. La prueba se llevó a cabo con respecto a los compuestos N.º 1-179 y 1-189 anteriores, y todos los compuestos mostraron efectos con un índice de control de 4 ó 5 a una concentración de 500 ppm.

Ejemplo de prueba 7: Prueba sobre el efecto preventivo contra el tizón de la vaina del arroz

Se cultivó arroz (cultivar: *Nihonbare*) en una maceta de plástico que tenía un diámetro de 5 cm y cuando alcanzó la fase de 5 hojas, se aplicaron 10 ml de una solución química que tenía el derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales ajustada hasta la concentración prescrita con una pistola pulverizadora. Una vez seca la solución química (el mismo día de la aplicación o el día siguiente), se insertó disco micelial de *Rhizoctonia solani* cultivado preliminarmente en una vaina foliar y se fijó con una cuerda, y se mantuvo en una caja de inoculación a 25°C. De 5 a 7 días después de la inoculación, se examinó la longitud de lesiones y se determinó el índice de control según los patrones de evaluación anteriores. La prueba se llevó a cabo con respecto a los compuestos N.º 1-130 y 1-137 y 3-3 anteriores, y todos los compuestos mostraron efectos con un índice de control de 4 ó 5 a una concentración de 500 ppm.

A continuación, se describirán los ejemplos de formulaciones de la composición de la presente invención. Sin embargo, la proporción de peso, el tipo de formulación o similar no se limita en absoluto a los siguientes ejemplos.

Ejemplo de formulación 1:

(1) Compuesto de fórmula (I)	20 partes en peso
(2) Arcilla	72 partes en peso
(3) Sulfonato de lignina de sodio	8 partes en peso

Los compuestos anteriores se mezclan uniformemente, obteniéndose un polvo humectante.

Ejemplo de formulación 2

(1) Compuesto de fórmula (I)	5 partes en peso
(2) Talco	95 partes en peso

Los compuestos anteriores se mezclan uniformemente, obteniéndose un polvo.

Ejemplo de formulación 3

(1) Compuesto de fórmula (I)	20 partes en peso
(2) <i>N,N</i> -dimetilacetamida	20 partes en peso
(3) Polioxietilenaquilfeniléter	10 partes en peso
(4) Xileno	50 partes en peso

Los compuestos anteriores se mezclan uniformemente y se disuelven, obteniéndose un concentrado emulsionable.

Ejemplo de formulación 4

(1) Arcilla	68 partes en peso
(2) Sulfonato de lignina de sodio	2 partes en peso
(3) Polioxietilenaquilarsulfato	5 partes en peso
(4) Sílice fino	25 partes en peso

Se mezcla una mezcla de los componentes anteriores y el compuesto de fórmula (I) en una proporción en peso de 4:1, obteniéndose un polvo humectante.

Ejemplo de formulación 5

(1) Compuesto de fórmula (I)	50 partes en peso
(2) Trietanolamina de polialquilfenilfosfato oxilado	2 partes en peso
(3) Silicona	0,2 partes en peso
(4) Agua	47,8 partes en peso

Los compuestos anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan, obteniéndose una solución madre, y se añaden además

(5) policarboxilato sódico	5 partes en peso
(6) Sulfato sódico anhidro	42,8 partes en peso

tras lo que se mezcla uniformemente, se granula y se seca, obteniéndose gránulos hidrodispersables.

5 Ejemplo de formulación 6

(1) Compuesto de fórmula (I)	5 partes en peso
(2) Polioxietilenoctilfeniléter	1 partes en peso
(3) Fosfato de polioxietileno	0,1 partes en peso
(4) Carbonato cálcico particulado	93,9 partes en peso

10 Los componentes (1) a (3) anteriores se mezclan preliminarmente de manera uniforme y se diluyen con una cantidad apropiada de acetona, se pulveriza la mezcla diluida sobre el componente (4) y se retira la acetona, obteniéndose gránulos.

Ejemplo de formulación 7

(1) Compuesto de fórmula (I)	2,5 partes en peso
(2) <i>N</i> -metil-2-pirrolidona	2,5 partes en peso
(3) Aceite de semilla de soja	95,0 partes en peso

15 Los compuestos anteriores se mezclan uniformemente y se disuelven, obteniéndose una formulación de volumen ultra-bajo.

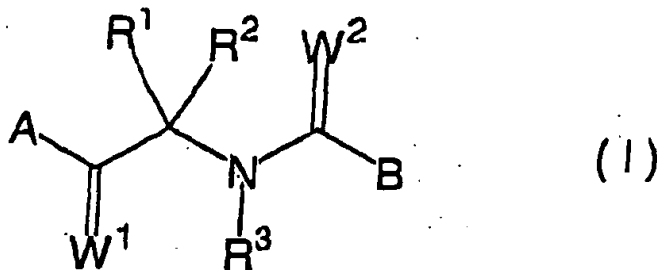
Ejemplo de formulación 8

(1) Compuesto de fórmula (I)	20 partes en peso
(2) Trietanolamina de polialquilfenilfosfato oxilado	2 partes en peso
(3) Silicona	0,2 partes en peso
(4) Goma xantana	0,1 partes en peso
(5) Etilenglicol	5 partes en peso
(6) Agua	72,7 partes en peso

20 Los compuestos anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan, obteniéndose un concentrado de suspensión basado en agua.

REIVINDICACIONES

1. Una composición fungicida que contiene un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales como ingrediente activo:



en la que:

A es fenilo que puede estar sustituido con X, benzodioxolanilo que puede estar sustituido con X o benzodioxanilo que puede estar sustituido con X;

B es furilo que puede estar sustituido con Y o tienilo que puede estar sustituido con Y, cada uno de R¹ y R² es alquilo o

R¹ y R² pueden formar juntos un anillo carbocíclico saturado de 3 a 6 miembros;

X es flúor, cloro, yodo, alquilo, haloalquilo, alcoxilo o haloalcoxilo;

Y es halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilo o haloalcoxilo;

R³ es hidrógeno; y

cada uno de W¹ y W² es oxígeno.

2. La composición fungicida según la reivindicación 1, en la que B es furilo sustituido con Y.

3. La composición fungicida según la reivindicación 1, en la que B es tienilo sustituido con Y.

4. Una composición fungicida mixta que comprende un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales según lo definido en la reivindicación 1 y otro compuesto de ingrediente fungicidamente activo como ingredientes activos.

5. La composición fungicida según la reivindicación 4, en la que dicho otro compuesto de ingrediente fungicidamente activo es al menos un miembro seleccionado del grupo que consiste en un compuesto de anilino, un compuesto de piridinamina, un compuesto de azol, un compuesto de quinoxalina, un compuesto de ditiocarbamato, un compuesto de cloro orgánico, un compuesto de imidazol, un compuesto de cianoacetamida, un compuesto de fenilamida, un compuesto de ácido sulfénico, un compuesto de cobre, un compuesto de isoxazol, un compuesto de fósforo orgánico, un compuesto de *N*-halogenotioalquilo, un compuesto de dicarboxiimida, un compuesto de benzanilida, un compuesto de anilida, un compuesto de piperazina, un compuesto de piridina, un compuesto de carbinol, un compuesto de piperidina, un compuesto de morfina, un compuesto de estaño orgánico, un compuesto de urea, un compuesto de ácido cinámico, un compuesto de fenilcarbamato, un compuesto de cianopirrol, un compuesto de estrobilurina, un compuesto de oxazolidinona, un compuesto de tiazolcarboxamida, un compuesto de sililamida, un compuesto de carbamato de amida de aminoácido, un compuesto de imidazolidina, un compuesto de hidroxianilida, un compuesto de bencenosulfonamida, un compuesto de éter de oxima, un compuesto de fenoxiamida, un antibiótico, un compuesto de guanidina, isoprotilano, piroquilona, diclomezina, quinoxifeno, clorhidrato de propamocarb, espiroxamina, cloropicrina, dazomet, metam sódico, nicobifeno, metrafenona, MTF-753, UBF-307, diclocimet, proquinazid, NC-224, KIF-7767 y Syngenta 446510.

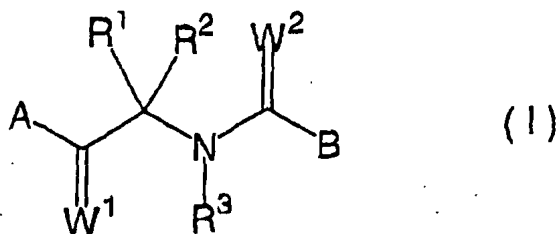
6. Un procedimiento para controlar hongos nocivos que comprende aplicar una cantidad eficaz de un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales según lo definido en la reivindicación 1.

7. Un procedimiento para controlar enfermedades vegetales que comprende aplicar una cantidad eficaz de un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales según lo definido en la reivindicación 1.

8. Un procedimiento para proteger cultivos de plantas que comprende aplicar una cantidad eficaz de un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales según lo definido en la reivindicación 1.

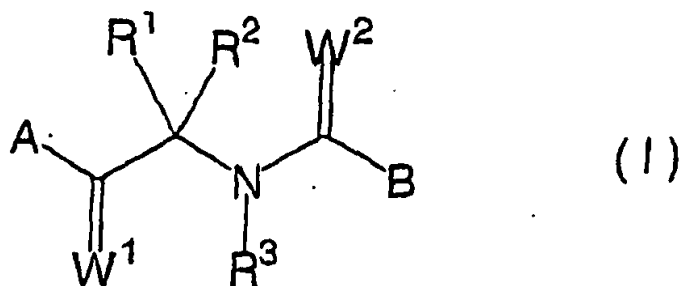
9. Un procedimiento para mejorar las producciones de cultivos que comprende aplicar una cantidad eficaz de un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales según lo definido en la reivindicación 1.

10. Un derivado de amida de ácido de fórmula (I) o una de sus sales:



en la que:

- 5 A es fenilo que puede estar sustituido con X, benzodioxolanilo que puede estar sustituido con X o benzodioxanilo que puede estar sustituido con X;
 B es furilo que puede estar sustituido con Y o tienilo que puede estar sustituido con Y,
 cada uno de R¹ y R² es alquilo o
 R¹ y R² pueden formar juntos un anillo carbocíclico saturado de 3 a 6 miembros;
 10 X es flúor, cloro, yodo, alquilo, haloalquilo, alcóxido o haloalcoxilo;
 Y es halógeno, alquilo, haloalquilo, alcóxido o haloalcoxilo;
 R³ es hidrógeno; y
 cada uno de W¹ y W² es oxígeno.
- 15 11. El derivado de amida de ácido según la reivindicación 10, en el que B es furilo sustituido con Y.
 12. El derivado de amida de ácido según la reivindicación 10, en el que B es tienilo sustituido con Y.
- 20 13. Uso de un derivado de amida de ácido de la siguiente fórmula (I) o una de sus sales como fungicida agrícola u hortícola para controlar hongos nocivos seleccionados entre *Oomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* o *Deuteromycetes*:



en la que:

- 25 A es fenilo que puede estar sustituido con X, naftilo que puede estar sustituido con X, anillo heterocíclico que puede estar sustituido con X o anillo heterocíclico fusionado que puede estar sustituido con X;
 B es anillo heterocíclico de 5 miembros que está sustituido con Y;
 X es halógeno,
 30 alquilo,
 haloalquilo,
 alcóxidoalquilo,
 dialquilaminoalquilo,
 alquinilo,
 35 trialquilsililalquinilo,
 hidroxilo,
 alcóxido,
 haloalcoxilo,
 alcóxidoalcoxilo,
 40 cicloalquilo,
 nitro,
 fenilo,
 fenilalquinilo,
 piridiloxilo que puede estar sustituido con haloalquilo,
 45 alquilcarboniloxilo,

- 5 alquilsulfoniloxilo,
o anillo heterocíclico (el anillo heterocíclico puede estar sustituido con halógeno, alquilo o alquilcarbonilo);
Y es halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxilo, haloalcoxilo, cicloalquilo o formilo;
cada uno de R^1 y R^2 , que son independientes entre sí, es hidrógeno o alquilo;
 R^3 es hidrógeno, alquilo, alquilcarbonilo o alcoxycarbonilo; y
cada uno de W^1 y W^2 , que son independientes entre sí, es oxígeno o azufre.

14. El uso de un derivado de amida de ácido según la reivindicación 13, en el que los hongos nocivos son *Ascomycetes* o *Deuteromycetes*.