

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 450 424**

51 Int. Cl.:

C07D 413/12 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **25.11.2010 E 10782291 (8)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **18.12.2013 EP 2516424**

54 Título: **Derivados de pirazol**

30 Prioridad:

22.12.2009 EP 09180466

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

24.03.2014

73 Titular/es:

**SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (100.0%)
Schwarzwaldallee 215
4058 Basel, CH**

72 Inventor/es:

**SULZER, SARAH y
LAMBERTH, CLEMENS**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 450 424 T3

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

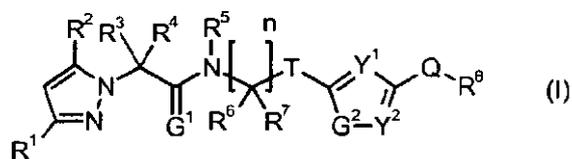
DESCRIPCIÓN

Derivados de pirazol.

La presente invención se refiere a heterociclos, por ejemplo como ingredientes activos, que tienen actividad microbiocida, en particular actividad fungicida. La invención también se refiere a la preparación de estos heterociclos, a derivados heterocíclicos usados como intermedios en la preparación de estos heterociclos, a la preparación de estos intermedios, a composiciones agroquímicas que comprenden al menos uno de los heterociclos, a la preparación de estas composiciones, y al uso de los heterociclos o composiciones en agricultura u horticultura para controlar o prevenir la infestación de plantas, cosechas alimentarias recolectadas, semillas o materiales no vivos por microorganismos fitopatógenos, preferiblemente hongos.

En los documentos WO 2007/014290, WO 2008/013622, WO 2008/013925, WO 2008/091580, WO 2008/091594 y WO 2009/055514 se describen ciertos heterociclos para uso como fungicidas.

La presente invención proporciona compuestos de fórmula I



en la que

G^1 y G^2 son, independientemente, O o S;

T es $-C(R^9R^{10})-$, $-C(R^{11})=C(R^{12})-$, $-C\equiv C-$, NR^{13} u O;

Y^1 e Y^2 son, independientemente, CR^{14} o N;

Q es $-C(=O)-N(R^{15})-z$, $-C(=S)-N(R^{16})-z$, $-C(=O)-O-z$, $-N(R^{17})-C(=O)-z$, $-N(R^{18})-C(=S)-z$, $-N(R^{19})-C(=O)-O-z$ o $-N(R^{20})-C(=O)-N(R^{21})-z$, en cada caso z indica el enlace que está conectado a R^8 ;

n es 1, 2, 3 ó 4 cuando T es $-C(R^9R^{10})-$, NR^{13} u O;

n es 1, 2, 3 cuando T es $-C(R^{11})=C(R^{12})-$ o $-C\equiv C-$;

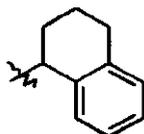
R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{11} , R^{12} y R^{14} son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C_1-C_4 , o haloalquilo de C_1-C_4 ;

R^5 , R^{13} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^{20} y R^{21} son, cada uno independientemente, hidrógeno, alquilo de C_1-C_4 o alcoxi de C_1-C_4 ;

R^6 y R^7 son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_4 , alquilo de C_1-C_4 -tio, haloalquilo de C_1-C_4 , haloalcoxi de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 -tio, o juntos forman un grupo carbonilo ($=O$);

R^9 y R^{10} son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_4 , alquilo de C_1-C_4 -tio, haloalquilo de C_1-C_4 , haloalcoxi de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 -tio, o juntos forman un grupo carbonilo ($=O$); y

R^8 es fenilo, bencilo o un grupo (a):



(a)

en el que el fenilo, el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , halógeno, ciano, hidroxilo y amino;

o una sal o un N-óxido de los mismos.

Cuando los sustituyentes se indican como sustituidos opcionalmente, esto significa que pueden tener o no uno o más sustituyentes idénticos o diferentes. Normalmente no están presentes al mismo tiempo más de tres de tales sustituyentes opcionales.

El término "halógeno" representa flúor, cloro, bromo o yodo.

5 El término "amino" representa -NH_2 .

Los sustituyentes alquílicos, alquenílicos o alquinílicos pueden ser de cadena lineal o ramificados. Alquilo, por sí mismo o como parte de otro sustituyente, es, dependiendo del número de átomos de carbono mencionado, por ejemplo, por ejemplo, metilo, etilo, n-propilo, n-butilo, n-pentilo, n-hexilo y sus isómeros, por ejemplo, iso-propilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, iso-amilo o pivaloilo.

10 Un grupo haloalquilo puede contener uno o más átomos de halógeno idénticos o diferentes y, por ejemplo, se puede representar por CH_2Cl , CHCl_2 , CCl_3 , CH_2F , CHF_2 , CF_3 , CF_3CH_2 , CH_3CF_2 , CF_3CF_2 o CCl_3CCl_2 .

La presencia de uno o más átomos de carbono asimétricos posibles en un compuesto de fórmula I significa que el compuesto puede aparecer en formas ópticamente isómeras, es decir, formas enantiómeras o diastereómeras. Como resultado de la presencia de un posible doble enlace $\text{C}=\text{C}$ alifático, se puede producir isomería geométrica, es decir, isomería cis-trans o (E)-(Z). También se pueden producir atropisómeros como resultado de rotación restringida alrededor de un enlace sencillo. La fórmula I está destinada a incluir todas aquellas posibles formas isómeras y sus mezclas. La presente invención incluye todas aquellas formas isómeras posibles y sus mezclas para un compuesto de fórmula I. Igualmente, la fórmula I pretende incluir todos los tautómeros posibles. La presente invención también incluye todas las formas tautómeras posibles para un compuesto de fórmula I.

20 En cada caso, los compuestos de fórmula I según la invención están en forma libre, en forma oxidada como un N-óxido, o en forma salina, por ejemplo una forma salina agronómicamente utilizable.

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

25 Las sales adecuadas de los compuestos de fórmula I incluyen aquellas que resultan tras la adición de ácido, tales como aquellas con un ácido mineral inorgánico, por ejemplo ácido clorhídrico, bromhídrico, sulfúrico, nítrico o fosfórico, o un ácido carboxílico orgánico, por ejemplo ácido oxálico, tartárico, láctico, butírico, toluico, hexanoico, o ftálico, o un ácido sulfónico, por ejemplo ácido metano-, benceno- o toluenosulfónico.

Preferiblemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto en el que:

30 G^1 y G^2 son, independientemente, O o S;

T es $-\text{C}(\text{R}^9\text{R}^{10})-$, $-\text{C}(\text{R}^{11})=\text{C}(\text{R}^{12})-$, $-\text{C}\equiv\text{C}-$, NR^{13} u O;

Y^1 e Y^2 son, independientemente, CR^{14} o N;

Q es $-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{R}^{15})-\text{z}$, $-\text{C}(=\text{S})-\text{N}(\text{R}^{16})-\text{z}$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{z}$, $-\text{N}(\text{R}^{17})-\text{C}(=\text{O})-\text{z}$, $-\text{N}(\text{R}^{19})-\text{C}(=\text{O})-\text{O}-\text{z}$ o $-\text{N}(\text{R}^{20})-\text{C}(=\text{O})-\text{N}(\text{R}^{21})-\text{z}$, en cada caso z indica el enlace que está conectado a R^8 ;

35 n es 1, 2 ó 3 cuando T es $-\text{C}(\text{R}^9\text{R}^{10})-$, NR^{13} u O;

n es 1 ó 2 cuando T es $-\text{C}(\text{R}^{11})=\text{C}(\text{R}^{12})-$ o $-\text{C}\equiv\text{C}-$;

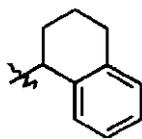
R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{11} , R^{12} y R^{14} son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$, o haloalquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$;

R^5 , R^{13} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{19} , R^{20} y R^{21} son, cada uno independientemente, hidrógeno o alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$;

40 R^6 y R^7 son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi de $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcoxi de $\text{C}_1\text{-C}_4$, o juntos forman un grupo carbonilo ($=\text{O}$);

R^9 y R^{10} son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi de $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquilo de $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcoxi de $\text{C}_1\text{-C}_4$, o juntos forman un grupo carbonilo ($=\text{O}$); y

R^8 es fenilo, bencilo o un grupo (a):

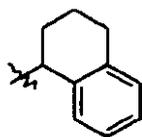


(a)

en el que el fenilo, el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, halógeno, hidroxilo y amino.

Preferiblemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto en el que:

- 5 G¹ y G² son, independientemente, O o S;
 T es -C(R⁹R¹⁰)-, -C(R¹¹)=C(R¹²)-, -C≡C-, NR¹³ u O;
 Y¹ es N;
 Y² es CR¹⁴ o N;
- 10 Q es -C(=O)-N(R¹⁵)-z, -C(=S)-N(R¹⁶)-z, -C(=O)-O-z, o -N(R¹⁷)-C(=O)-z, en cada caso z indica el enlace que está conectado a R⁸;
 n es 1, 2 ó 3 cuando T es -C(R⁹R¹⁰)-, NR¹³ u O;
 n es 1 ó 2 cuando T es -C(R¹¹)=C(R¹²)-o -C≡C-;
- R¹, R², R³, R⁴, R¹¹, R¹² y R¹⁴ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₄, o haloalquilo de C₁-C₄;
- 15 R⁵, R¹³, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷ son, cada uno independientemente, hidrógeno o alquilo de C₁-C₄;
 R⁶ y R⁷ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, o juntos forman un grupo carbonilo (=O);
 R⁹ y R¹⁰ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, o juntos forman un grupo carbonilo (=O); y
- 20 R⁸ es fenilo, bencilo o un grupo (a):



(a)

en el que el fenilo, el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, halógeno, hidroxilo y amino.

Preferiblemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto en el que:

- 25 G¹ es O;
 G² es O o S;
 T es -C(R⁹R¹⁰)-, -C(R¹¹)=C(R¹²)-, -C≡C-, NR¹³ u O;
 Y¹ es N;
 Y² es CR¹⁴ o N;
- 30 Q es -C(=O)-N(R¹⁵)-z, -C(=O)-O-z, o -N(R¹⁷)-C(=O)-z, en cada caso z indica el enlace que está conectado a R⁸;
 n es 1, 2 ó 3 cuando T es -C(R⁹R¹⁰)-, NR¹³ u O;

ES 2 450 424 T3

n es 1 ó 2 cuando T es $-C(R^{11})=C(R^{12})-o -C\equiv C-$;

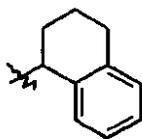
$R^1, R^2, R^3, R^4, R^{11}, R^{12}$ y R^{14} son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_4 , o haloalquilo de C_1-C_4 ;

$R^5, R^{13}, R^{15}, R^{17}$ son, cada uno independientemente, hidrógeno o alquilo de C_1-C_4 ;

5 R^6 y R^7 son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, hidroxilo, alquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , haloalcoxi de C_1-C_4 , o juntos forman un grupo carbonilo ($=O$);

R^9 y R^{10} son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, hidroxilo, alquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , haloalcoxi de C_1-C_4 , o juntos forman un grupo carbonilo ($=O$); y

R^8 es bencilo o un grupo (a):



(a)

10 en el que el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , halógeno e hidroxilo.

Preferiblemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto en el que:

G^1 es O;

15 G^2 es S;

T es $-C(R^9R^{10})-$, NR^{13} u O;

Y^1 es N;

Y^2 es CR^{14} ;

Q es $-C(=O)-N(R^{15})-z$ o $-C(=O)-O-z$, en cada caso z indica el enlace que está conectado a R^8 ;

20 n es 2;

R^1 y R^2 son, independientemente, halógeno, metilo o halometilo;

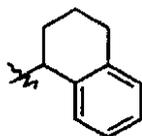
R^3, R^4 y R^{14} son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, metilo, o halometilo;

R^5, R^{13} y R^{15} son, cada uno independientemente, hidrógeno o metilo;

R^6 y R^7 son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, metoxi o metilo;

25 R^9 y R^{10} son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, metoxi o metilo; y

R^8 es bencilo o un grupo (a):



(a)

en el que el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de metilo, halometilo, y halógeno.

30 Preferiblemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto en el que:

G^1 es O;

G² es S;

T es -C(R⁹R¹⁰)-;

Y¹ es N;

Y² es CR¹⁴;

5 Q es -C(=O)-N(R¹⁵)-z, en el que z indica el enlace que se conecta a R⁸;

n es 2;

R¹ y R² son, independientemente, metilo o trifluorometilo;

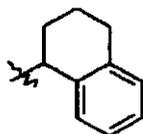
R³, R⁴ y R¹⁴ son, cada uno independientemente, hidrógeno, fluoro o metilo;

R⁵ y R¹⁵ son, cada uno independientemente, hidrógeno o metilo;

10 R⁶ y R⁷ son, cada uno independientemente, hidrógeno, fluoro o metilo;

R⁹, y R¹⁰ son, cada uno independientemente, hidrógeno, fluoro o metilo; y

R⁸ es el grupo (a):



(a)

15 en el que grupo (a) está opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de metilo, trifluorometilo y fluoro.

La invención también se refiere a compuestos de fórmula I en la que

G¹ es O;

G² es O, S;

T es -C(R⁹R¹⁰)-, -C(R¹¹)=C(R¹²)-, -C≡C-, NR¹³ u O;

20 Y¹ es N;

Y² es CR¹⁴ o N;

Q es -C(=O)-N(R¹⁵)-z, -C(=O)-O-z o -N(R¹⁷)-C(=O)-z, en cada caso z indica el enlace que está conectado a R⁸;

n es 1, 2 ó 3 cuando T es -C(R⁹R¹⁰)-, NR¹³ u O;

25 n es 1, o 2 cuando T es -C(R¹¹)=C(R¹²)-o -C≡C-;

R¹ y R² son, cada uno independientemente, metilo o halometilo;

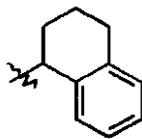
R³, R⁴, R¹¹, R¹² y R¹⁴ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno o metilo;

R⁵, R¹³, R¹⁵ y R¹⁷ son, cada uno independientemente, hidrógeno o metilo;

30 R⁶ y R⁷ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi, o juntos forman un grupo carbonilo (=O);

R⁹ y R¹⁰ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi, o juntos forman un grupo carbonilo (=O); y

R⁸ es bencilo o un grupo (a):



(a)

en el que el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de metilo, halometilo y halógeno.

5 La siguiente lista proporciona definiciones, incluyendo definiciones preferidas, para los sustituyentes G^1 , G^2 , T, Y^1 , Y^2 , Q, n, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^{20} y R^{21} con referencia a los compuestos de fórmula I. Para uno cualquiera de estos sustituyentes, cualquiera de las definiciones dadas más abajo se puede combinar con cualquier definición de cualquier otro sustituyente dado más abajo. La invención incluye compuestos de fórmula que tienen todas las combinaciones posibles de definiciones de sustituyente dadas a continuación o en otra parte en este documento. Generalmente, en este documento cualquier definición de sustituyente se puede combinar con cualquier otra definición de sustituyente.

G^1 y G^2 son, independientemente, O o S.

Preferiblemente, G^1 es O.

Preferiblemente, G^2 es S.

T es $-C(R^9R^{10})-$, $-C(R^{11})=C(R^{12})-$, $-C\equiv C-$, NR^{13} u O.

15 Preferiblemente, T es $-C(R^9R^{10})-$, NR^{13} u O.

Preferiblemente, T es $-C(R^9R^{10})-$.

Y^1 e Y^2 son, independientemente, CR^{14} o N.

Preferiblemente, Y^1 es N.

Preferiblemente, Y^2 es CR^{14} .

20 Q es $-C(=O)-N(R^{15})-z$, $-C(=S)-N(R^{16})-z$, $-c(=O)-z$, $-N(R^{17})-C(=O)-z$, $-N(R^{18})-C(=s)-z$, $-N(R^{19})-C(=O)-O-z$ o $-N(R^{20})C(=O)-N(R^{21})-z$, en cada caso z indica el enlace que está conectado a R^8 .

Preferiblemente, Q es $-C(=O)-N(R^{15})-z$, $-C(=S)-N(R^{16})-z$, $-C(=O)-O-z$, $-N(R^{17})-C(=O)-z$, $-N(R^{19})-C(=O)-O-z$ o $-N(R^{20})-C(=O)-N(R^{21})-z$, en cada caso z indica el enlace que está conectado a R^8 .

25 Preferiblemente, Q es $-C(=O)-N(R^{15})-z$, $-C(=S)-N(R^{16})-z$, $-C(=O)-O-z$, o $-N(R^{17})-C(=O)-z$, en cada caso z indica el enlace que está conectado a R^8 .

Preferiblemente, Q es $-C(=O)-N(R^{15})-z$, $-C(=O)-O-z$, o $-N(R^{17})-C(=O)-z$, en cada caso z indica el enlace que está conectado a R^8 .

Preferiblemente, Q es $-C(=O)-N(R^{15})-z$ o $-C(=O)-O-z$, en cada caso z indica el enlace que está conectado a R^8 .

Preferiblemente, Q es $-C(=O)-N(R^{15})-z$, en el que z indica el enlace que se conecta a R^8 .

30 n es 1, 2, 3 ó 4 cuando T es $-C(R^9R^{10})-$, NR^{13} u O; y n es 1, 2, 3 cuando T es $-C(R^{11})=C(R^{12})-$ o $-C\equiv C-$.

Preferiblemente, n es 1, 2 ó 3 cuando T es $-C(R^9R^{10})-$, NR^{13} u O; y n es 1 ó 2 cuando T es $-C(R^{11})=C(R^{12})-$ o $-C\equiv C-$.

Preferiblemente, n es 2 cuando T es $-C(R^9R^{10})-$, NR^{13} u O; y n es 1 cuando T es $-C(R^{11})=C(R^{12})-$ o $-C\equiv C-$.

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{11} , R^{12} y R^{14} son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C_1-C_4 , o haloalquilo de C_1-C_4 .

35 Preferiblemente, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{11} , R^{12} y R^{14} son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_4 , o haloalquilo de C_1-C_4 .

Preferiblemente, R^1 y R^2 son, cada uno independientemente, halógeno, metilo, o halometilo.

Preferiblemente, R^1 y R^2 son, cada uno independientemente, metilo o halometilo.

Preferiblemente, R¹ y R² son, cada uno independientemente, metilo o trifluorometilo;

Preferiblemente, R³, R⁴, R¹¹, R¹² y R¹⁴ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, metilo, o halometilo.

Preferiblemente, R³, R⁴, R¹¹, R¹² y R¹⁴ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno o metilo.

5 Preferiblemente, R³, R⁴, R¹¹, R¹² y R¹⁴ son, cada uno independientemente, hidrógeno, fluoro o metilo.

R⁵, R¹³, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰ y R²¹ son, cada uno independientemente, hidrógeno, alquilo de C₁-C₄ o alcoxi de C₁-C₄.

Preferiblemente, R⁵, R¹³, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰ y R²¹ son, cada uno independientemente, hidrógeno o alquilo de C₁-C₄.

10 Preferiblemente, R⁵, R¹³, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰ y R²¹ son, cada uno independientemente, hidrógeno o metilo.

R⁶ y R⁷ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, alquilo de C₁-C₄-tio, haloalquilo de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄-tio, o juntos forman un grupo carbonilo (=O).

15 Preferiblemente, R⁶ y R⁷ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, o juntos forman un grupo carbonilo (=O).

Preferiblemente, R⁶ y R⁷ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, o juntos forman un grupo carbonilo (=O).

Preferiblemente, R⁶ y R⁷ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi, o juntos forman un grupo carbonilo (=O).

20 Preferiblemente, R⁶ y R⁷ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, metoxi o metilo.

Preferiblemente, R⁶ y R⁷ son, cada uno independientemente, hidrógeno, fluoro o metilo.

R⁹ y R¹⁰ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, alquilo de C₁-C₄-tio, haloalquilo de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄-tio, o juntos forman un grupo carbonilo (=O).

25 Preferiblemente, R⁹ y R¹⁰ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, o juntos forman un grupo carbonilo (=O).

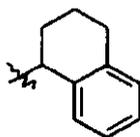
Preferiblemente, R⁹ y R¹⁰ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, o juntos forman un grupo carbonilo (=O).

30 Preferiblemente, R⁹ y R¹⁰ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi, o juntos forman un grupo carbonilo (=O).

Preferiblemente, R⁹ y R¹⁰ son, cada uno independientemente, hidrógeno, halógeno, metoxi o metilo.

Preferiblemente, R⁹ y R¹⁰ son, cada uno independientemente, hidrógeno, fluoro o metilo.

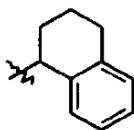
R⁸ es fenilo, bencilo o un grupo (a):



(a)

35 en el que el fenilo, el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, halógeno, ciano, hidroxilo y amino.

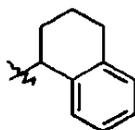
Preferiblemente, R⁸ es fenilo, bencilo o un grupo (a):



(a)

en el que el fenilo, el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, halógeno, hidroxilo y amino.

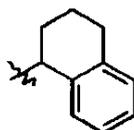
Preferiblemente, R⁸ es bencilo o un grupo (a):



(a)

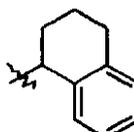
- 5 en el que el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, halógeno e hidroxilo.

Preferiblemente, R⁸ es bencilo o un grupo (a):



(a)

- 10 en el que el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de metilo, halometilo, y halógeno. Preferiblemente, R⁸ es un grupo (a):



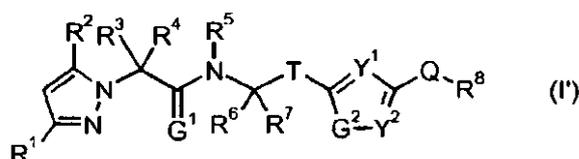
(a)

en el que grupo (a) está opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de metilo, trifluorometilo y fluoro.

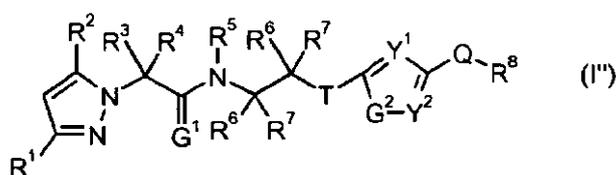
- 15 En un grupo de compuestos de la invención, T no es -C(R⁹R¹⁰)-, por ejemplo T es -C(R¹¹)=C(R¹²)-, -C≡C-, NR¹³ u O, preferiblemente NR¹³ u O.

En otro grupo de compuestos de la invención, Q no es -C(=O)-N(R¹⁵)-z, -C(=S)-N(R¹⁶)-z, o -C(=O)-O-z, por ejemplo Q es -N(R¹⁷)-C(=O)-z, -N(R¹⁸)-C(=S)-z, -N(R¹⁹)-C(=O)-O-z o -N(R²⁰)-C(=O)-N(R²¹)-z, preferiblemente es -N(R¹⁷)-C(=O)-z, en cada caso z indica el enlace que está conectado a R⁸.

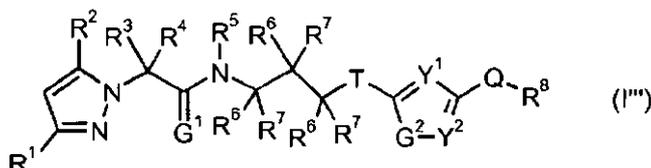
- 20 Para evitar dudas, cuando n es 1, los compuestos de fórmula I tienen la fórmula según la fórmula I':



en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, G¹, G², Q, Y¹, Y² y T son como se definen para la fórmula I. Igualmente, cuando n es 2, los compuestos de fórmula I tienen la fórmula según la fórmula I'':



en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , G^1 , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y T son como se definen para la fórmula I. Igualmente, cuando n es 3, compuestos de fórmula I tienen la fórmula según la fórmula I''':



- 5 en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , G^1 , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y T son como se definen para la fórmula I, y así sucesivamente.

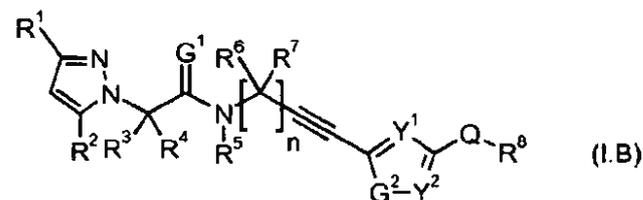
Los compuestos individuales preferidos son:

- metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(3-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-propil)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.d.55);
- 10 metil-((R)-1-fenil-etil)-amida del ácido 2-(3-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-propil)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.d.57);
- metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(3-{[2-(3-difluorometil-5-metil-pirazol-1-il)-acetil]-metil-amino}propil)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.d.19);
- 15 éster 1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ílico del ácido 2-(3-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-propil)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.d.62);
- metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(2-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-etoxi)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.g.55);
- metil-((R)-1-fenil-etil)-amida del ácido 2-(2-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-etoxi)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.g.57);
- 20 metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(2-{[2-(3-difluorometil-5-metil-pirazol-1-il)-acetil]-metil-amino}-etoxi)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.g.19);
- éster 1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ílico del ácido 2-(2-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-etoxi)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.g.62);
- 25 metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-[metil-(2-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-etil)-amino]-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.q.55);
- metil-((R)-1-fenil-etil)-amida del ácido 2-[metil-(2-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-etil)-amino]-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.q.57);
- metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-[(2-{[2-(3-difluorometil-5-metil-pirazol-1-il)-acetil]-metil-amino}-etil)-metil-amino]-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.q.19); y
- 30 éster 1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ílico del ácido 2-[metil-(2-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-etil)-amino]-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.q.62).

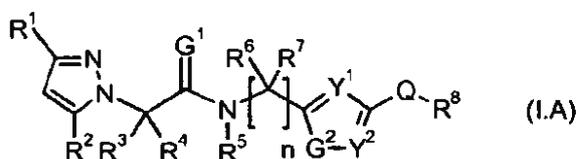
Los compuestos de fórmula (I) se pueden obtener como se muestra en los siguientes esquemas.

- Los compuestos de fórmula I.A, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , G^1 , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula I.B, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , G^1 , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I. Esto se muestra en el Esquema 1.
- 35

Esquema 1

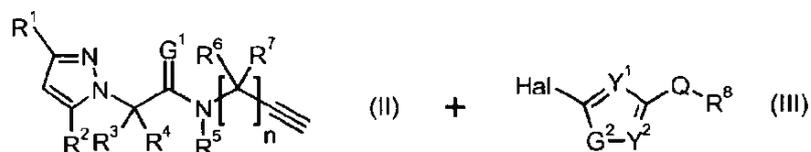


↓
reducción, por ejemplo H₂,
catalizador (tal como Pd/C, Ni Raney, etc.)

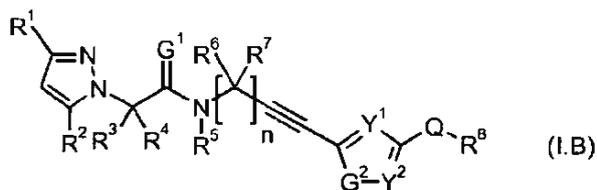


5 Los compuestos de fórmula I.B, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, G¹, G², Q, Y¹, Y² y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula II, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, G¹ y n son como se definen para la fórmula I, con un compuesto de fórmula III, en la que R⁸, G², Q, Y¹ e Y² son como se definen para la fórmula I y Hal es halógeno, preferiblemente cloro o bromo. Esto se muestra en el Esquema 2.

Esquema 2

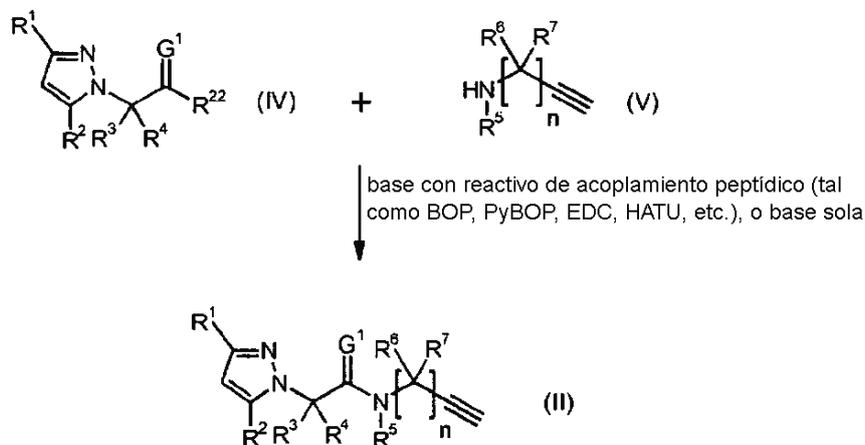


↓
condiciones de acoplamiento de
Sonogashira, por ejemplo
CuI, Pd(PPh₃)₂Cl₂



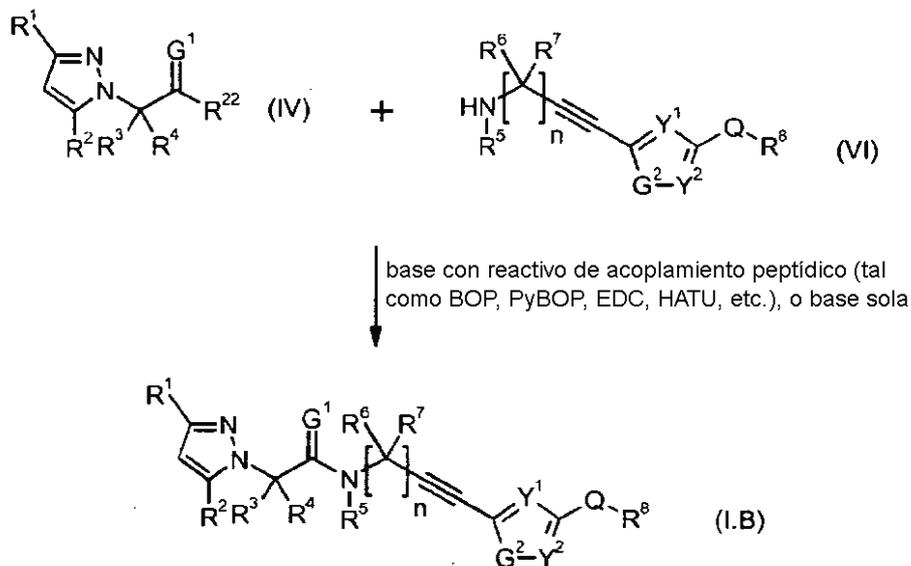
10 Los compuestos de fórmula II, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, G¹ y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula IV, en la que R¹, R², R³, R⁴ y G¹ son como se definen para la fórmula I y R²² es hidroxilo o cloro, con un compuesto de fórmula V, en la que R⁵, R⁶, R⁷ y n son como se definen para la fórmula I. Esto se muestra en el Esquema 3.

Esquema 3



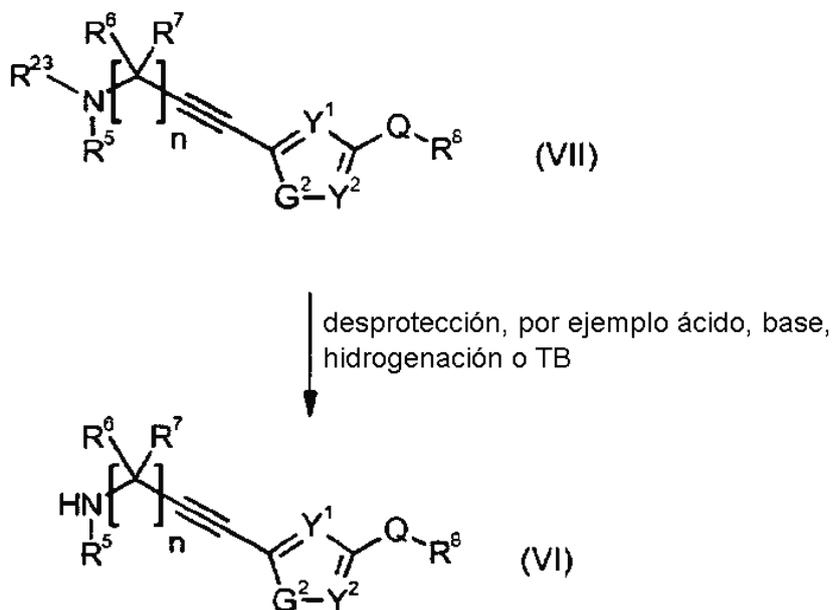
5 Como alternativa, los compuestos de fórmula I.B, en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, G^1, G^2, Q, Y^1, Y^2$ y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula IV, en la que R^1, R^2, R^3, R^4 y G^1 son como se definen para la fórmula I y R^{22} es hidroxilo o cloro, con un compuesto de fórmula VI, en la que $R^5, R^6, R^7, R^8, G^2, Q, Y^1, Y^2$ y n son como se definen para la fórmula I. Esto se muestra en el Esquema 4.

Esquema 4



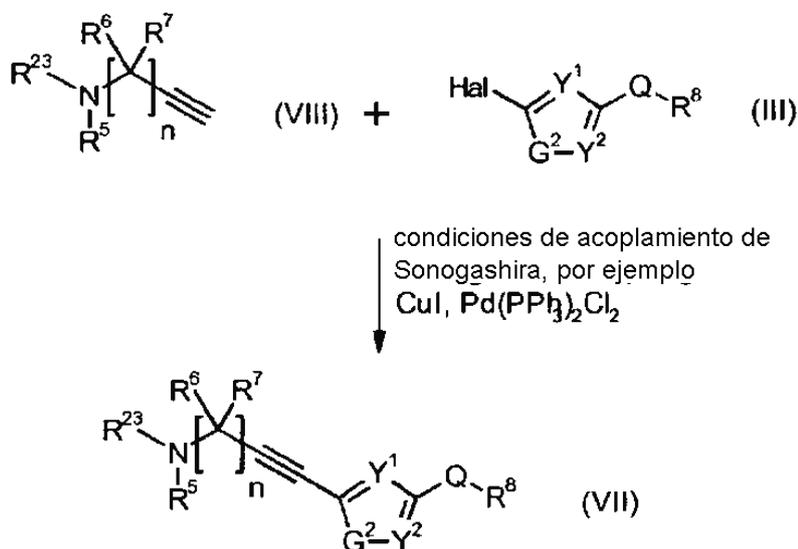
10 Los compuestos de fórmula VI, en la que $R^5, R^6, R^7, R^8, G^2, Q, Y^1$ e Y^2 y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula VII, en la que $R^5, R^6, R^7, R^8, G^2, Q, Y^1$ e Y^2 y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc. Esto se muestra en el Esquema 5.

Esquema 5



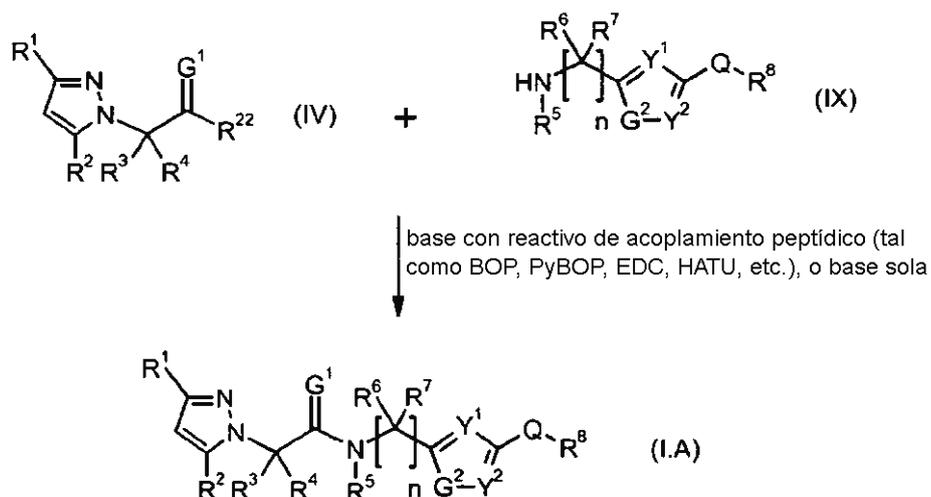
- 5 Los compuestos de fórmula VII, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , G^2 , Q , Y^1 e Y^2 y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula VIII, en la que R^5 , R^6 , R^7 y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc, con un compuesto de fórmula III, en la que R^8 , G^2 , Q , Y^1 e Y^2 son como se definen para la fórmula I y Hal es halógeno, preferiblemente cloro o bromo. Esto se muestra en el Esquema 6.

Esquema 6



- 10 Como alternativa, los compuestos de fórmula I.A, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , G^1 , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula IV, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y G^1 son como se definen para la fórmula I y R^{22} es hidroxilo o cloro, con un compuesto de fórmula IX, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I. Esto se muestra en el Esquema 7.

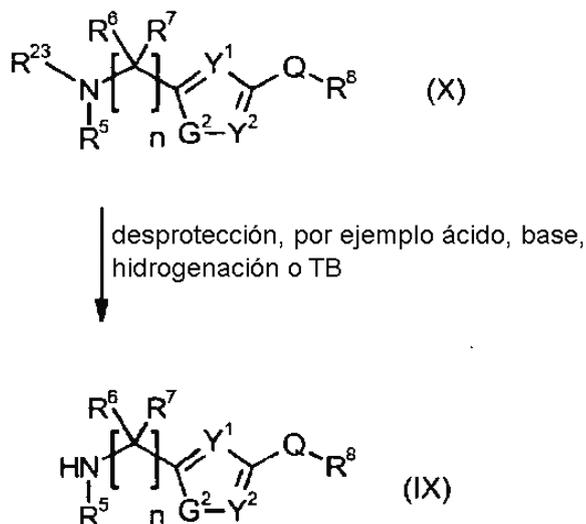
Esquema 7



Los compuestos de fórmula IX, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula X, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc. Esto se muestra en el Esquema 8.

5

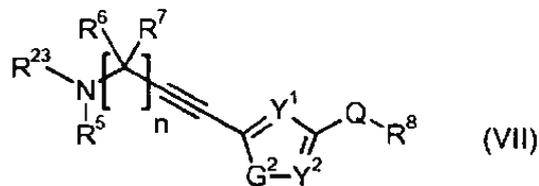
Esquema 8



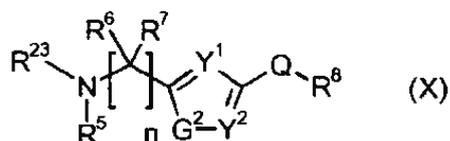
Los compuestos de fórmula X, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula VII, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc. Esto se muestra en el Esquema 9.

10

Esquema 9

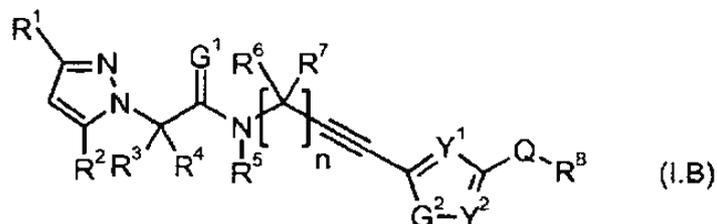


↓ reducción, por ejemplo H₂,
catalizador (tal como Pd/C, Ni Raney, etc.)

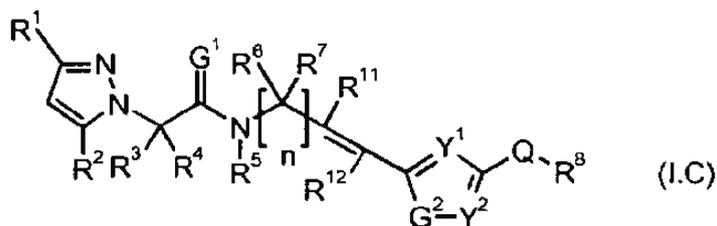


5 Los compuestos de fórmula I.C, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R¹¹, R¹², G¹, G², Q, Y¹, Y² y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula I.B, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, G¹, G², Q, Y¹, Y² y n son como se definen para la fórmula I. Esto se muestra en el Esquema 10.

Esquema 10

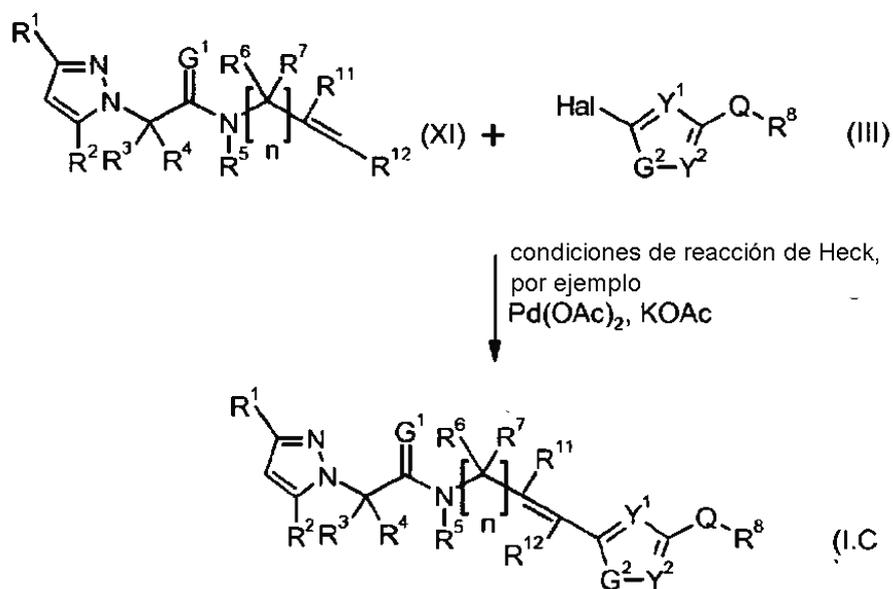


↓ reducción selectiva, por ejemplo H₂,
catalizador de Lindlar o Li, NH₃



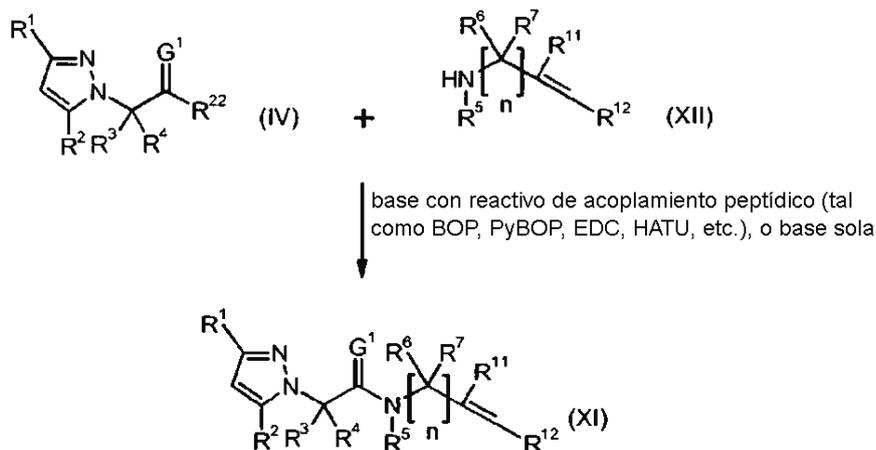
10 Como alternativa, los compuestos de fórmula I.C, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R¹¹, R¹², G¹, G², Q, Y¹, Y² y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula XI, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹¹, R¹², G¹ y n son como se definen para la fórmula I, con un compuesto de fórmula III, en la que R⁸, G², Q, Y¹ e Y² son como se definen para la fórmula I y Hal es halógeno, preferiblemente cloro o bromo. Esto se muestra en el Esquema 11.

Esquema 11



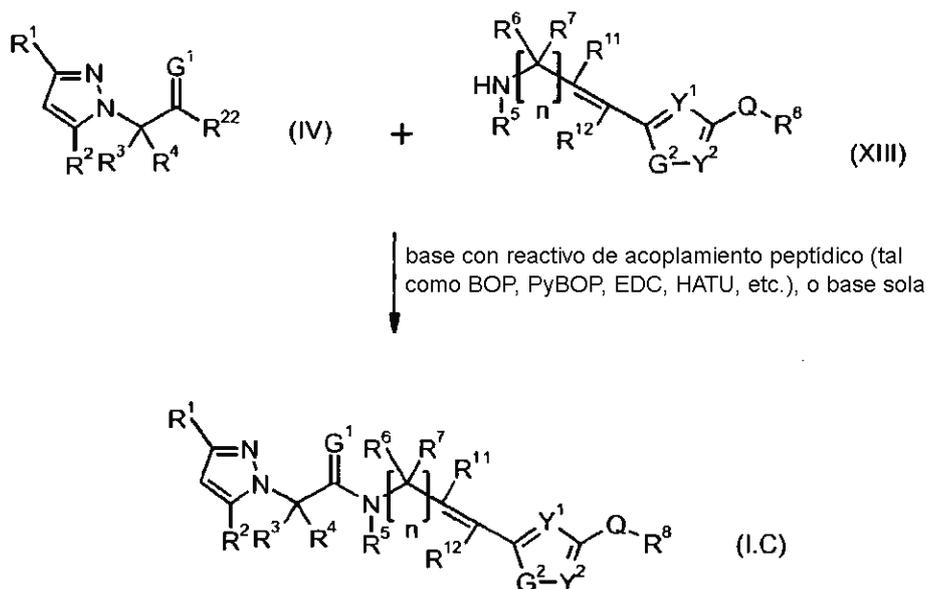
Los compuestos de fórmula XI, en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{11}, R^{12}, G^1$ y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula IV, en la que R^1, R^2, R^3, R^4 y G^1 son como se definen para la fórmula I y R^{22} es hidroxilo o cloro, con un compuesto de fórmula XII en la que $R^5, R^6, R^7, R^{11}, R^{12}$ y n son como se definen para la fórmula I. Esto se muestra en el Esquema 12.

Esquema 12



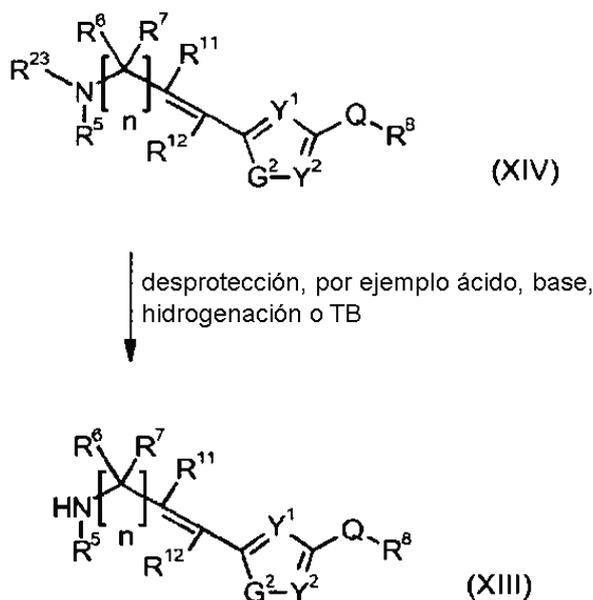
Como alternativa, los compuestos de fórmula I.C, en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^{11}, R^{12}, G^1, G^2, Q, Y^1, Y^2$ y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula IV, en la que R^1, R^2, R^3, R^4 y G^1 son como se definen para la fórmula I y R^{22} es hidroxilo o cloro, con un compuesto de fórmula XIII, en la que $R^5, R^6, R^7, R^8, R^{11}, R^{12}, G^2, Q, Y^1, Y^2$ y n son como se definen para la fórmula I. Esto se muestra en el Esquema 13.

Esquema 13



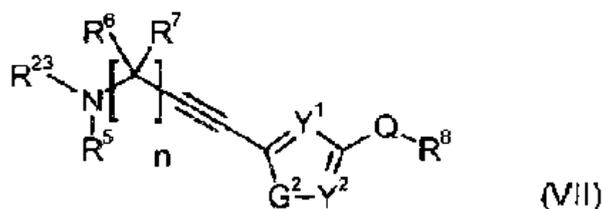
5 Los compuestos de fórmula XIII en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^{11} , R^{12} , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula XIV, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^{11} , R^{12} , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc. Esto se muestra en el Esquema 14.

Esquema 14

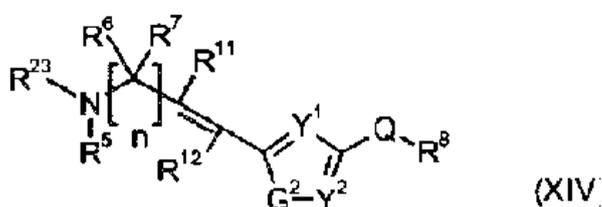


10 Los compuestos de fórmula XIV, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^{11} , R^{12} , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC o Cbz, Teoc, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula VII, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc. Esto se muestra en el Esquema 15.

Esquema 15

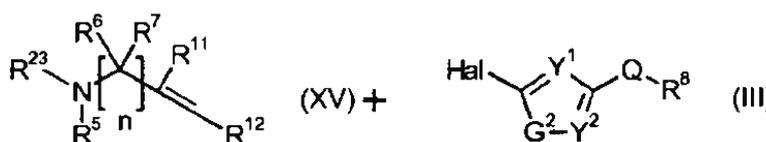


↓
reducción selectiva, por ejemplo H₂,
catalizador de Lindlar o Li, N₃H

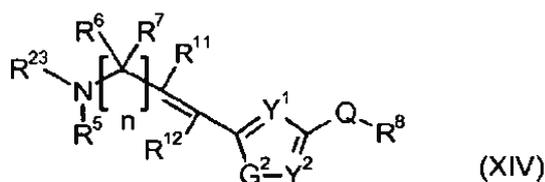


- 5 Como alternativa, los compuestos de fórmula XIV, en la que R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R¹¹, R¹², G², Q, Y¹, Y² y n son como se definen para la fórmula I y R²³ es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula XV, en la que R⁵, R⁶, R⁷, R¹¹, R¹² y n son como se definen para la fórmula I y R²³ es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc, con un compuesto de fórmula III, en la que R⁸, G², Q, Y¹ e Y² son como se definen para la fórmula I y Hal es halógeno, preferiblemente cloro o bromo. Esto se muestra en el Esquema 16.

Esquema 16

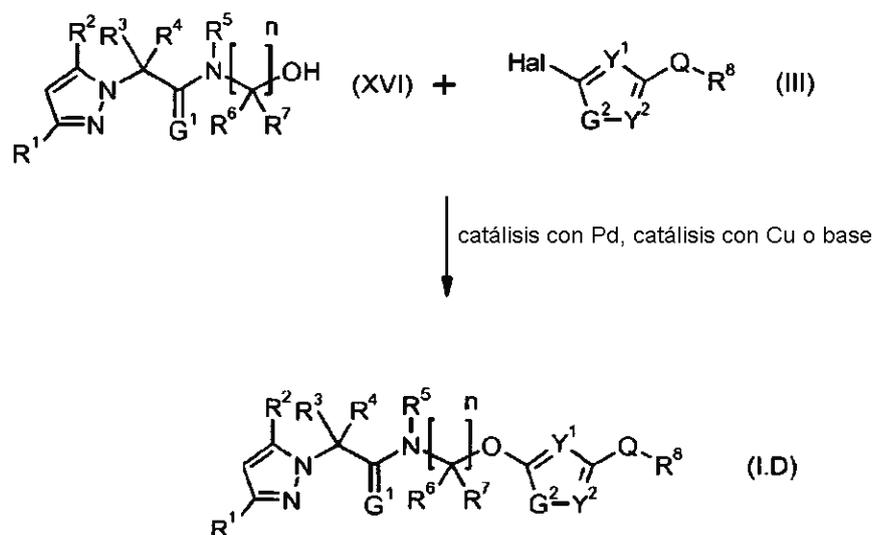


↓
condiciones de reacción de Heck,
por ejemplo
Pd(OAc)₂, KOAc



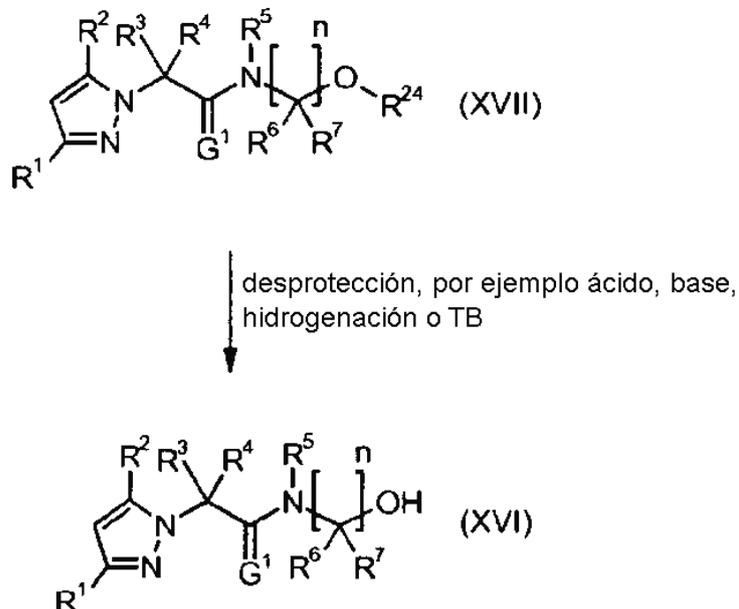
- 10 Los compuestos de fórmula I.D, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, G¹, G², Q, Y¹, Y² y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula XVI, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, G¹ y n son como se definen para la fórmula I, con un compuesto de fórmula III, en la que R⁸, G², Q, Y¹ e Y² son como se definen para la fórmula I y Hal es halógeno, preferiblemente cloro o bromo. Esto se muestra en el Esquema 17.

Esquema 17



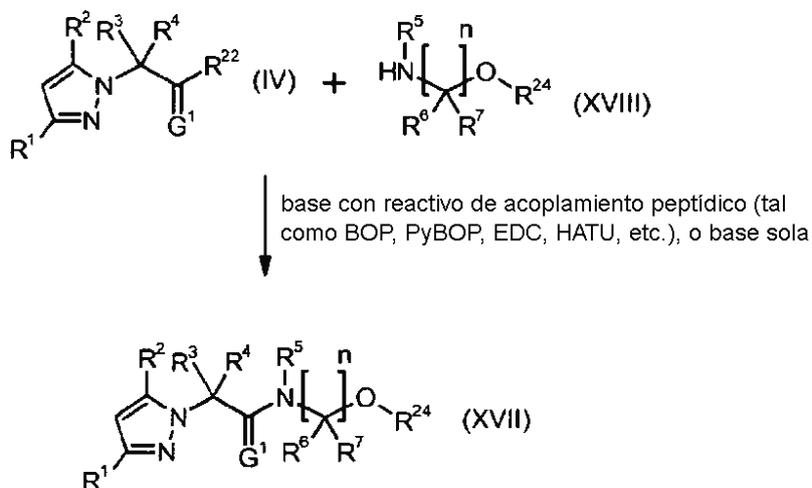
5 Los compuestos de fórmula XVI, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , G^1 y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula XVII, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , G^1 y n son como se definen para la fórmula I y R^{24} es un grupo protector, tal como acetilo o 4-metoxibencilo. Esto se muestra en el Esquema 18.

Esquema 18



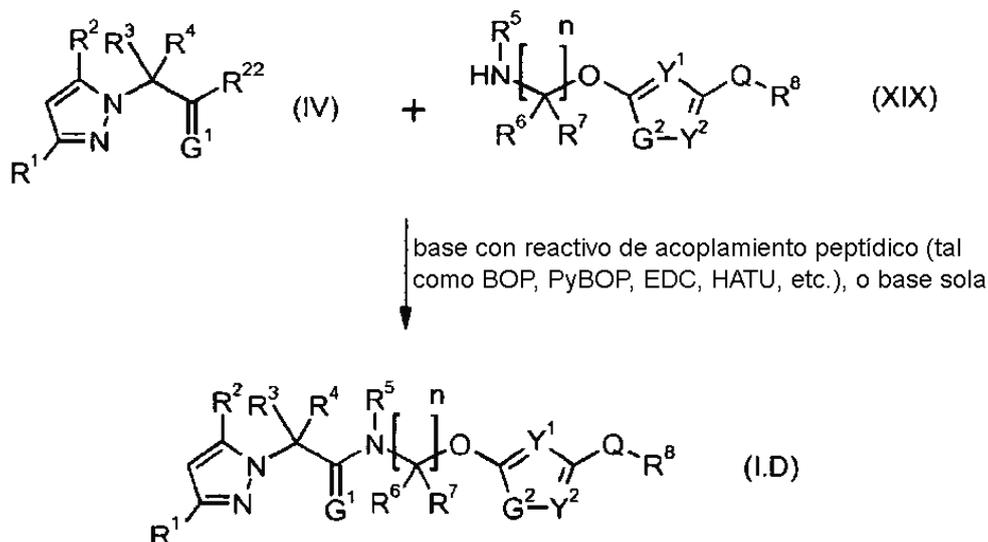
10 Los compuestos de fórmula XVII, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , G^1 y n son como se definen para la fórmula I y R^{24} es un grupo protector, tal como acetilo o 4-metoxibencilo, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula IV, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y G^1 son como se definen para la fórmula I y R^{22} es hidroxilo o cloro, con un compuesto de fórmula XVIII, en la que R^5 , R^6 , R^7 y n son como se definen para la fórmula I y R^{24} es un grupo protector, tal como acetilo o 4-metoxibencilo. Esto se muestra en el Esquema 19.

Esquema 19



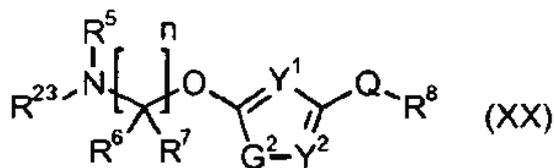
5 Como alternativa, los compuestos de fórmula I.D, en la que $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, G^1, G^2, Q, Y^1, Y^2$ y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula IV, en la que R^1, R^2, R^3, R^4 y G^1 son como se definen para la fórmula I y R^{22} es hidroxilo o cloro, con un compuesto de fórmula XIX, en la que $R^5, R^6, R^7, R^8, G^2, Q, Y^1, Y^2$ y n son como se definen para la fórmula I. Esto se muestra en el Esquema 20.

Esquema 20

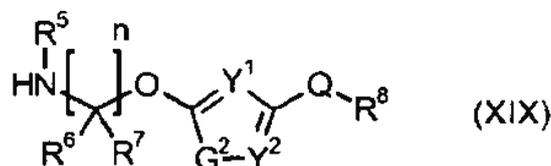


10 Los compuestos de fórmula XIX, en la que $R^5, R^6, R^7, R^8, G^2, Q, Y^1, Y^2$ y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula XX, en la que $R^5, R^6, R^7, R^8, G^2, Q, Y^1, Y^2$ y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc. Esto se muestra en el Esquema 21.

Esquema 21

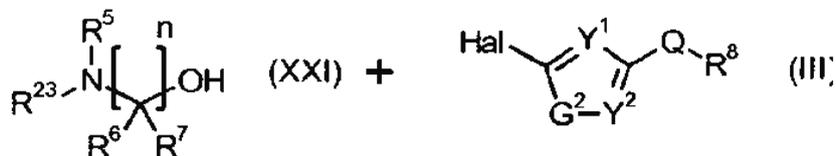


↓ desprotección, por ejemplo ácido, base,
hidrogenación o TB

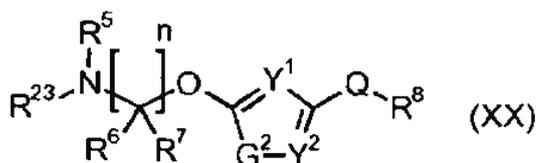


5 Los compuestos de fórmula XX, en la que R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, G², Q, Y¹, Y² y n son como se definen para la fórmula I y R²³ es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula XXI, en la que R⁵, R⁶, R⁷ y n son como se definen para la fórmula I y R²³ es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc, con un compuesto de fórmula III, en la que R⁸, G², Q, Y¹ e Y² son como se definen para la fórmula I y Hal es halógeno, preferiblemente cloro o bromo. Esto se muestra en el Esquema 22.

Esquema 22



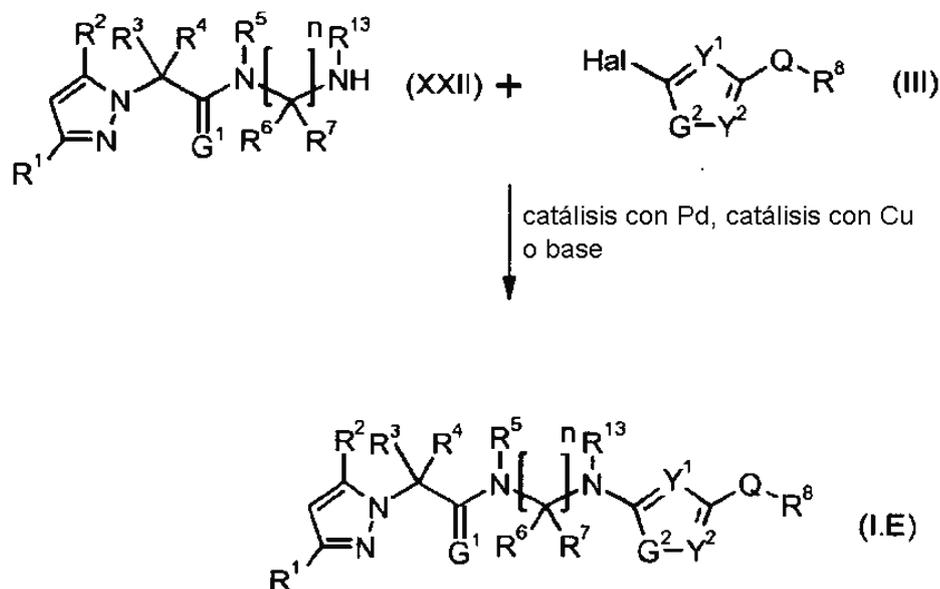
↓ catálisis con Pd, catálisis con Cu
o base



10 Los compuestos de fórmula I.E, en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R¹³, G¹, G², Q, Y¹, Y² y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula XXII en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹³, G¹ y n son como se definen para la fórmula I, con un compuesto de fórmula III, en la que R⁸, G², Q, Y¹ e Y² son como se definen para la fórmula I y Hal es halógeno, preferiblemente cloro o bromo. Esto se muestra en el Esquema 23.

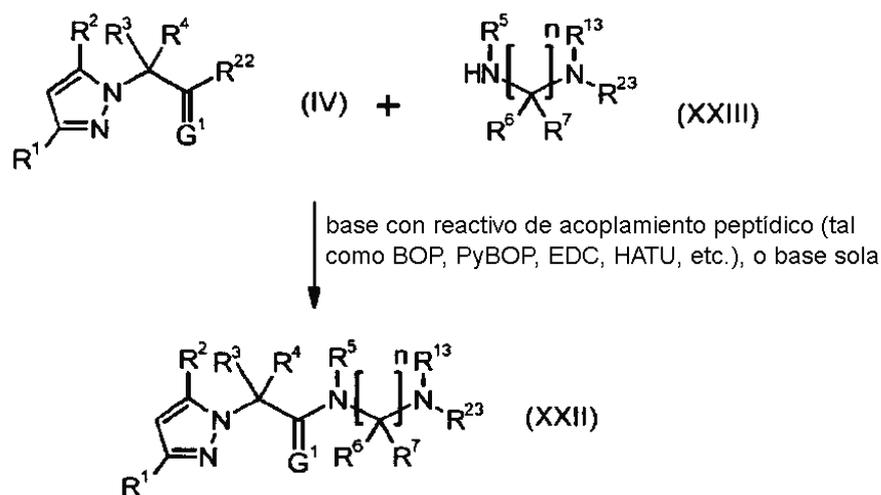
15

Esquema 23



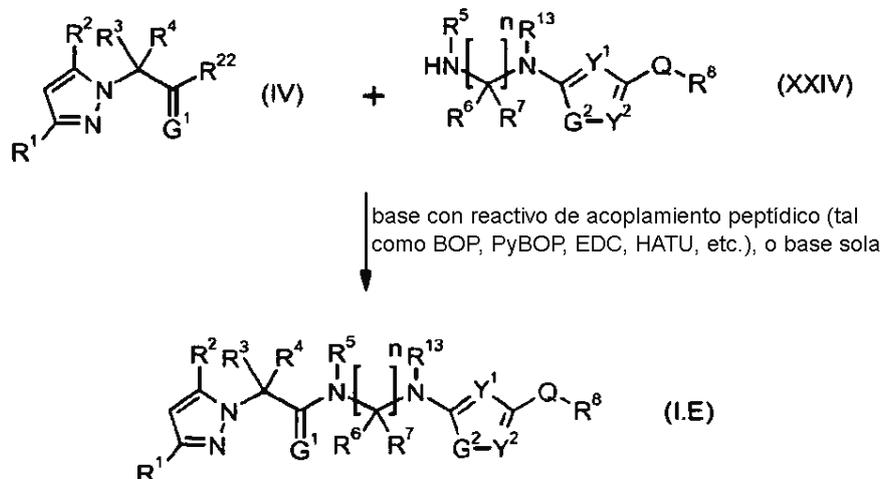
- 5 Los compuestos de fórmula XXII, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^{13} , G^1 y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula IV, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y G^1 son como se definen para la fórmula I y R^{22} es hidroxilo o cloro, con un compuesto de fórmula XXIII en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^{13} y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc. Esto se muestra en el Esquema 24.

Esquema 24



- 10 Como alternativa, los compuestos de fórmula I.E, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^{13} , G^1 , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula IV, en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y G^1 son como se definen para la fórmula I y R^{22} es hidroxilo o cloro, con un compuesto de fórmula XXIV, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^{13} , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I. Esto se muestra en el Esquema 25.

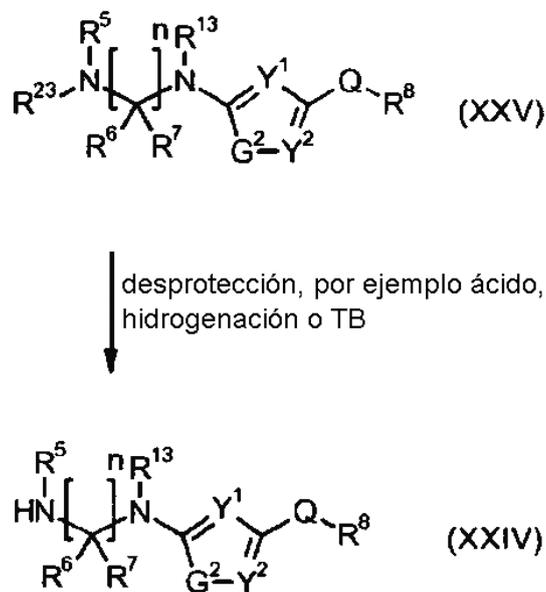
Esquema 25



Los compuestos de fórmula XXIV, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^{13} , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula XXV, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^{13} , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc. Esto se muestra en el Esquema 26.

5

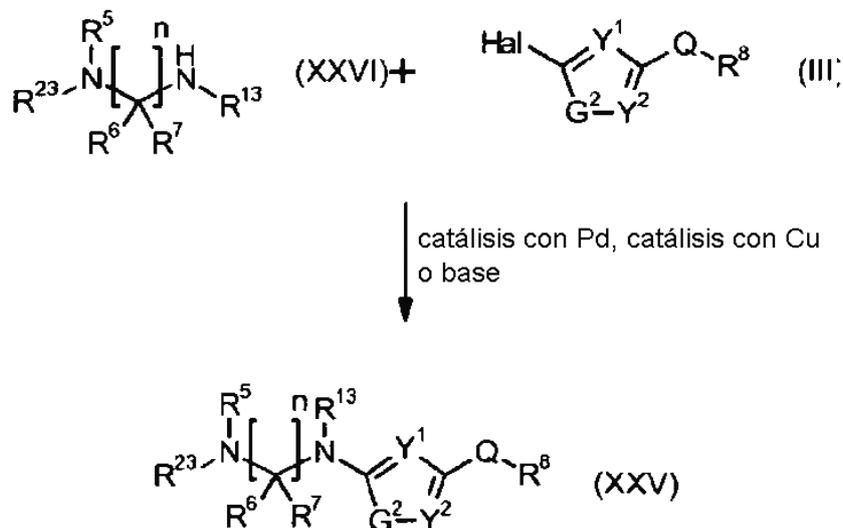
Esquema 26



Los compuestos de fórmula XXV, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^{13} , G^2 , Q , Y^1 , Y^2 y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc, se pueden obtener mediante transformación de un compuesto de fórmula XXVI, en la que R^5 , R^6 , R^7 , R^{13} y n son como se definen para la fórmula I y R^{23} es un grupo protector, tal como acetilo, bencilo, BOC, Cbz o Teoc, con un compuesto de fórmula III, en la que R^8 , G^2 , Q , Y^1 e Y^2 son como se definen para la fórmula I y Hal es halógeno, preferiblemente cloro o bromo. Esto se muestra en el Esquema 27.

10

Esquema 27



Sorprendentemente, ahora se ha encontrado que los nuevos compuestos de fórmula I tienen, para fines prácticos, un nivel muy ventajoso de actividad biológica para proteger plantas frente a enfermedades que están causadas por hongos.

5

Los compuestos de fórmula I se pueden usar en el sector agrícola y en campos relacionados de uso por ejemplo como ingredientes activos para controlar plagas de plantas o en materiales no vivos para el control de microorganismos responsables de la descomposición u organismos potencialmente dañinos para el hombre. Los nuevos compuestos se distinguen por una excelente actividad a tasas bajas de aplicación, siendo bien tolerados por las plantas y siendo medioambientalmente seguros. Tienen propiedades curativas, preventivas y sistémicas muy útiles, y se pueden usar para proteger numerosas plantas cultivadas. Los compuestos de fórmula I se pueden usar para inhibir o destruir las plagas que aparecen en plantas o partes de plantas (fruta, florecencias, hojas, tallos, tubérculos, raíces) de diferentes cosechas de plantas útiles, mientras que al mismo tiempo protegen también aquellas partes de las plantas que crecen más tarde, por ejemplo, de microorganismos fitopatógenos.

10

También es posible usar compuestos de fórmula I como agentes de tratamiento para el tratamiento de material de propagación vegetal, por ejemplo semillas, tales como frutas, tubérculos o granos, o esquejes de plantas (por ejemplo arroz), para la protección frente a infecciones fúngicas así como frente a hongos fitopatógenos que aparecen en el suelo. El material de propagación se puede tratar con una composición, que comprende un compuesto de fórmula I, antes de la plantación: por ejemplo, la semilla se puede tratar antes de sembrarla. Los ingredientes activos según la invención también se pueden aplicar a pepitas de semillas (revestimiento), ya sea empapando las pepitas en una composición líquida, o revistiéndolas con una formulación sólida. También es posible aplicar la composición al sitio de aplicación cuando se esté plantando el material de propagación, por ejemplo al surco de siembra durante el enterramiento. La invención se refiere también a tales métodos para tratar el material de propagación vegetal, y al material de propagación vegetal así tratado.

15

20

Además, los compuestos según la presente invención se pueden usar para controlar hongos en áreas relacionadas, por ejemplo en la protección de materiales técnicos, incluyendo madera y productos técnicos relacionados con la madera, en almacenamiento de alimentos o en la manipulación higiénica.

Además, la invención se podría usar para proteger materiales no vivos del ataque fúngico, por ejemplo madera elaborada, tableros para paredes, y pintura.

25

Los compuestos de fórmula I son, por ejemplo, eficaces frente a los hongos fitopatógenos de las siguientes clases: Hongos imperfectos (por ejemplo *Alternaria* spp.) y Basidiomicetos (por ejemplo *Corticium* spp., *Ceratobasidium* spp., *Waitea* spp., *Thanatephorus* spp., *Rhizoctonia* spp., *Hemileia* spp., *Puccinia* spp., *Phakopsora* spp., *Ustilago* spp., *Tilletia* spp.), Ascomicetos (por ejemplo *Venturia* spp., *Blumeria* spp., *Erysiphe* spp., *Podosphaera* spp., *Uncinula* spp., *Monilinia* spp., *Sclerotinia* spp., *Colletotrichum* spp., *Glomerella* spp., *Fusarium* spp., *Gibberella* spp., *Monographella* spp., *Phaeosphaeria* spp., *Mycosphaerella* spp., *Cercospora* spp., *Pyrenophora* spp., *Rhynchosporium* spp., *Magnaporthe* spp., *Gaeumannomyces* spp., *Oculimacula* spp., *Ramularia* spp., *Botryotinia* spp.) y Oomicetos (por ejemplo *Phytophthora* spp., *Pythium* spp., *Plasmopara* spp., *Peronospora* spp., *Pseudoperonospora* spp. *Bremia* spp.). Se ha observado una actividad sobresaliente frente al mildiu de la uva (por ejemplo *Plasmopara viticola*) y tizón tardío (por ejemplo *Phytophthora infestans*). Además, los nuevos compuestos de fórmula I son eficaces frente a bacterias grampositivas y gramnegativas (por ejemplo *Xanthomonas* spp., *Pseudomonas* spp., *Erwinia amylovora*, *Ralstonia* spp.) y virus (por ejemplo, virus del mosaico del tabaco).

30

35

Dentro del alcance de la invención, las cosechas objetivo y/o las plantas útiles a proteger comprenden típicamente las siguientes especies de plantas: cereal (trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz, sorgo y especies relacionadas); remolacha (remolacha azucarera y remolacha forrajera); frutas de pepita, drupas y fruta blanda (manzanas, peras, ciruelas, melocotones, almendras, cerezas, fresas, frambuesa y zarzamoras); plantas leguminosas (habas, lentejas, guisantes, sojas); oleaginosas (colza, mostaza, amapola, aceitunas, girasoles, coco, plantas de aceite de ricino, habas de cacao, cacahuetes); plantas cucurbitáceas (calabazas, pepinos, melones); plantas fibrosas (algodón, lino, cáñamo, yute); frutos cítricos (naranjas, limones, pomelo, mandarinas); vegetales (espinaca, lechuga, espárrago, coles, zanahorias, cebollas, tomates, patatas, pimentón); lauráceas (aguacate, canela, alcanfor), o plantas tales como tabaco, nueces, café, berenjena, caña de azúcar, té, pimiento, vides, lúpulos, plátanos y plantas de caucho natural, así como hierba artificial y ornamentales.

Las plantas útiles y/o cosechas objetivo según la invención incluyen variedades convencionales así como variedades genéticamente mejoradas o manipuladas tales como, por ejemplo, variedades resistentes a insectos (por ejemplo variedades Bt. y VIP) así como resistentes a enfermedades, tolerantes a herbicidas (por ejemplo variedades de maíz resistentes a glifosato y a glufosinato, comercialmente disponibles con los nombres comerciales RoundupReady® y LibertyLink®), y variedades tolerantes a nematodos. A título de ejemplo, las variedades de cosechas adecuadas genéticamente mejoradas o manipuladas incluyen las variedades de algodón Stoneville 5599BR y algodón Stoneville 4892BR.

La expresión “plantas útiles” y/o “cosechas objetivo” se entiende que incluye también plantas útiles que se han hecho tolerantes a herbicidas como bromoxinilo o clases de herbicidas (tales como, por ejemplo, inhibidores de HPPD, inhibidores de ALS, por ejemplo primisulfurón, prosulfurón y trifloxisulfurón, inhibidores de EPSPS (5-enolpiruvil-shikimato-3-fosfato-sintasa), inhibidores de GS (glutamina sintetasa) o inhibidores de PPO (protoporfirinógeno oxidasa)) como resultado de métodos convencionales de reproducción o ingeniería genética. Un ejemplo de una cosecha que se ha hecho tolerante a imidazolinonas, por ejemplo imazamox, por métodos convencionales de reproducción (mutagénesis) es la colza de verano Clearfield® (cánola). Los ejemplos de cosechas que se han hecho tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas mediante métodos de ingeniería genética incluyen variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato, comercialmente disponibles con los nombres comerciales RoundupReady®, Herculex I® y LibertyLink®.

La expresión “plantas útiles” y/o “cosechas objetivo” se entiende que incluye también plantas útiles que se han transformado así mediante el uso de técnicas de ADN recombinante, que son capaces de sintetizar una o más toxinas que actúan selectivamente, tales como se conocen, por ejemplo, de bacterias productoras de toxinas, especialmente aquellas del género Bacillus.

La expresión “plantas útiles” y/o “cosechas objetivo” se entiende que incluye también plantas útiles que se han transformado así mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que son capaces de sintetizar sustancias antipatógenas que tienen una acción selectiva, tal como, por ejemplo, las denominadas “proteínas relacionadas con la patogénesis” (PRPs; véase, por ejemplo, el documento EP-A-0392225). Los ejemplos de tales sustancias antipatógenas y plantas transgénicas capaces de sintetizar tales sustancias patógenas son conocidos, por ejemplo, de los documentos EP-A-0392225, WO 95/33818, y EP-A-0353191. Los métodos para producir tales plantas transgénicas son generalmente conocidos por la persona experta en la técnica, y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas anteriormente.

El término “locus” de una planta, como se usa aquí, pretende abarcar el lugar en el que están creciendo las plantas, donde se siembran los materiales de propagación vegetal de las plantas, o donde se colocarán en el suelo los materiales de propagación vegetal de las plantas. Un ejemplo para tal locus es un campo, sobre el cual crecen plantas de cosechas.

La expresión “material de propagación vegetal” se entiende que representa partes generativas de la planta, tales como semillas, que se pueden usar para la multiplicación de estas últimas, y material vegetativo, tales como esquejes o tubérculos, por ejemplo patatas. Se pueden mencionar, por ejemplo, semillas (en el sentido estricto), raíces, frutas, tubérculos, bulbos, rizomas y partes de plantas. También se pueden mencionar plantas germinadas y plantas jóvenes que se van a transplantar tras la germinación o tras la emergencia desde el suelo. Estas plantas jóvenes se pueden proteger antes del trasplante mediante un tratamiento total o parcial por inmersión. Preferiblemente, “material de propagación vegetal” se entiende que representa semillas.

Los compuestos de fórmula I se pueden usar en forma no modificada o, preferiblemente, junto los con adyuvantes empleados convencionalmente en la técnica de formulación. Para este fin, se pueden formular convenientemente de manera conocida en concentrados emulsionables, pastas revestibles, disoluciones pulverizables o diluibles directamente, emulsiones diluidas, polvos humectables, polvos solubles, polvos finos, granulados, y también encapsulamientos, por ejemplo en sustancias poliméricas. Con respecto al tipo de las composiciones, los métodos de aplicación, tal como pulverización, atomización, rociado, dispersión, revestimiento o vertido, se escogen según los objetivos pretendidos y las circunstancias que prevalezcan. Las composiciones pueden contener también otros adyuvantes, tales como estabilizantes, antiespumantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes o agentes de pegajosidad, así como fertilizantes, dadores de micronutrientes u otras formulaciones para obtener efectos especiales.

Los vehículos y adyuvantes adecuados, por ejemplo para uso industrial, pueden ser sólidos o líquidos, y son sustancias útiles en tecnología de formulación, por ejemplo sustancias minerales naturales o regeneradas, disolventes, dispersantes, agentes humectantes, agentes de pegajosidad, espesantes, aglutinantes o fertilizantes. Tales vehículos se describen, por ejemplo, en el documento WO 97/33890.

5 Los compuestos de fórmula I se pueden usar en forma de composiciones, y se pueden aplicar al área de la cosecha o planta a tratar, simultáneamente o en sucesión con otros compuestos. Estos otros compuestos pueden ser, por ejemplo, fertilizantes o dadores de micronutrientes, u otras preparaciones, que influyen en el crecimiento de las plantas. También pueden ser herbicidas selectivos o herbicidas no selectivos, así como insecticidas, fungicidas, bactericidas, nematocidas, moluscocidas, o mezclas de varias de estas preparaciones, si se desea junto con otros
10 vehículos, tensioactivos o adyuvantes promotores de la aplicación empleados habitualmente en la técnica de formulación.

Los compuestos de fórmula I se usan normalmente en forma de composiciones fungicidas para controlar o proteger frente a microorganismos fitopatógenos, que comprenden como ingrediente activo al menos un compuesto de fórmula I o de al menos un compuesto individual preferido como se define anteriormente, en forma libre o en forma
15 de sal agroquímicamente utilizable, y al menos uno de los adyuvantes mencionados anteriormente.

La invención proporciona una composición fúngica que comprende al menos un compuesto de fórmula I, un vehículo agrícolamente aceptable, y opcionalmente un adyuvante. Un vehículo agrícolamente aceptable es, por ejemplo, un vehículo que es adecuado para uso agrícola. Los vehículos agrícolas son bien conocidos en la técnica.

Dichas composiciones fungicidas pueden comprender un ingrediente activo fungicida adicional, además del
20 compuesto de fórmula I.

El compuesto de fórmula (I) puede ser el único ingrediente activo de una composición, o se puede mezclar con uno o más ingredientes activos adicionales, tales como un insecticida, fungicida, un sinérgico, un herbicida o un regulador del crecimiento vegetal, cuando sea apropiado. En algunos casos, un ingrediente activo adicional puede dar como resultado actividades sinérgicas inesperadas. Los ejemplos de ingredientes activos adicionales adecuados
25 incluyen los siguientes: Azoxistrobina (131860-33-8), Dimoxistrobina (149961-52-4), Enestrobina (238410-11-2), Fluoxastrobina (193740-76-0), Kresoxim-metilo (143390-89-0), Metominostrobin (133408-50-1), Orisastrobina (248593-16-0), Picoxistrobina (117428-22-5), Piraclostrobina (175013-18-0), Azaconazol (60207-31-0), Bromuconazol (116255-48-2), Ciproconazol (94361-06-5), Difenconazol (119446-68-3), Diniconazol (83657-24-3), Diniconazol-M (83657-18-5), Epoxiconazol (13385-98-8), Fenbuconazol (114369-43-6), Fluquinconazol (136426-54-5), Flusilazol (85509-19-9), Flutriafol (76674-21-0), Hexaconazol (79983-71-4), Imazalilo (58594-72-2), Imibenconazol (86598-92-7), Ipconazol (125225-28-7), Metconazol (125116-23-6), Miclobutanilo (88671-89-0), Oxpoconazol (174212-12-5), Pefurazoato (58011-68-0), Penconazol (66246-88-6), Procloraz (67747-09-5), Propiconazol (60207-90-1), Protiocconazol (178928-70-6), Simeconazol (149508-90-7), Tebuconazol (107534-96-3), Tetraconazol (112281-77-3), Triadimefón (43121-43-3), Triadimenol (55219-65-3), Triflumizol (99387-89-0),
35 Triticonazol (131983-72-7), Diclobutrazol (76738-62-0), Etaconazol (60207-93-4), Fluconazol (86386-73-4), Fluconazol-cis (112839-32-4), Tiabendazol (148-79-8), Quinconazol (103970-75-8), Fenpiclonilo (74738-17-3), Fludioxonilo (131341-86-1), Ciprodinilo (121552-61-2), Mepanipirim (110235-47-7), Pirimetanilo (53112-28-0), Aldimorph (91315-15-0), Dodemorph (1593-77-7), Fenpropimorph (67564-91-4), Tridemorph (81412-43-3), Fenpropidina (67306-00-7), Espiroxamina (118134-30-8), Isopirazam (881685-58-1), Sedaxano (874967-67-6), Bixafeno (581809-46-3), Pentiopirad (183675-82-3), Fluxapiraxad (907204-31-3), Boscalid (188425-85-6), Penflufeno (494793-67-8), Fluopiram (658066-35-4), Mandipropamida (374726-62-2), Bentiavalicarb (413615-35-7), Dimetomorph (110488-70-5), Clorotalonilo (1897-45-6), Fluazinam (79622-59-6), Ditianón (3347-22-6), Metrafenona (220899-03-6), Triciclazol (41814-78-2), Mefenoxam (70630-17-0), Metalaxilo (57837-19-1), Acibenzolar (126448-41-7) (Acibenzolar-S-metilo (126448-41-7)), Mancozeb (8018-01-7), Ametoctradina (865318-97-4) Ciflufenamida (180409-60-3), Ipconazol (125225-28-7), Amisulbrom (348635-87-0), Etaboxam (16650-77-3), Fluopicolida (239110-15-7), Flutianilo (304900-25-2), Isotianilo (224049-04-1), Proquinazida (189278-12-4), Valifenal (283159-90-0), 1-metil-ciclopropeno (3100-04-7), Trifloxistrobina (141517-21-7), Azufre (7704-34-9), carbonato de amonio y cobre (CAS 33113-08-5); oleato de cobre (CAS 1120-44-1); Folpet (133-07-3), Quinoxifeno (124495-18-7), Captano (133-06-2), Fenhexamida (126833-17-8), Glufosinato y sus sales (51276-47-2, 35597-44-5 (isómero S)), Glifosato (1071-83-6) y sus sales (69254-40-6 (Diamonio), 34494-04-7 (Dimetilamonio), 38641-94-0 (Isopropilamonio), 40465-66-5 (Monoamonio), 70901-20-1 (Potasio), 70393-85-0 (Sesquisodio), 81591-81-3 (Trimesio)), (2-diclorometilen-3-etil-1-metil-indan-4-il)-amida del ácido 1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxílico, (4'-metilsulfani-bifenil-2-il)-amida del ácido 1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxílico, [2-(2,4-dicloro-fenil)-2-metoxi-1-metil-etil]-amida del ácido 1,3-dimetil-4H-pirazol-4-carboxílico, (5-Cloro-2,4-dimetil-piridin-3-il)-(2,3,4-trimetoxi-6-metil-fenil)-metanona, (5-Bromo-4-cloro-2-metoxi-piridin-3-il)-(2,3,4-trimetoxi-6-metil-fenil)-metanona, 2-{2-[(E)-3-(2,6-Dicloro-fenil)-1-metil-prop-2-en-(E)-ilidenaminoximetil]-fenil}-2-[(Z)-metoxiimino]-N-metil-acetamida, 3-[5-(4-Clorofenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina.

Otro aspecto de la invención se refiere al uso de un compuesto de fórmula I, por ejemplo de un compuesto individual preferido como se define anteriormente, de una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula I, por ejemplo al menos un compuesto individual preferido como se define anteriormente, o de una mezcla fungicida que comprende al menos un compuesto de fórmula I, por ejemplo al menos un compuesto individual preferido como
60

se describe anteriormente, en mezcla con otros fungicidas, como se describe anteriormente, para controlar o prevenir infestación de plantas, por ejemplo plantas útiles tales como plantas de cosechas, su material de propagación, por ejemplo semillas, cosechas recolectadas, por ejemplo cosechas alimentarias recolectadas, o materiales no vivos por microorganismos fitopatógenos o responsables del deterioro, o microorganismos potencialmente dañinos al hombre. Preferiblemente, dichos microorganismos son microorganismos fúngicos. En particular, la invención se refiere al uso de un compuesto de fórmula I, por ejemplo un compuesto individual preferido como se define anteriormente, de una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula I, por ejemplo al menos un compuesto individual preferido como se define anteriormente, en mezcla con otros fungicidas, como se describe anteriormente, para controlar o prevenir la infestación de plantas, por ejemplo plantas útiles tales como plantas de cosechas, su material de propagación, por ejemplo semillas, por microorganismos fitopatógenos. Preferiblemente, dichos microorganismos son organismos fúngicos.

Un aspecto adicional de la invención se refiere a un método para controlar o prevenir una infestación de plantas, por ejemplo plantas útiles tales como plantas de cosechas, su material de propagación, por ejemplo semillas, cosechas recolectadas, por ejemplo cosechas alimentarias recolectadas, o de materiales no vivos por microorganismos fitopatógenos o responsables del deterioro, o microorganismos potencialmente dañinos al hombre, especialmente organismos fúngicos, que comprende aplicar un compuesto de fórmula I, por ejemplo un compuesto individual preferido como se define anteriormente, como ingrediente activo a las plantas, a partes de las plantas o al locus de las mismas, al material de propagación de las mismas, a la cosecha recolectada, o a cualquier parte de los materiales no vivos. En particular, la invención se refiere a un método para controlar o prevenir una infestación de plantas, por ejemplo plantas útiles tales como plantas de cosechas, su material de propagación, por ejemplo semillas, por microorganismos fitopatógenos, que comprende aplicar un compuesto de fórmula I, por ejemplo un compuesto individual preferido como se define anteriormente, como ingrediente activo a las plantas, a partes de las plantas o al locus de las mismas, o al material de propagación de las mismas. Preferiblemente, dichos microorganismos son microorganismos fúngicos.

Controlar o prevenir significa reducir la infestación por microorganismos fitopatógenos o responsables del deterioro, u organismos potencialmente dañinos al hombre, especialmente organismos fúngicos, hasta un nivel tal que se demuestre una mejora.

Un método preferido para controlar o prevenir una infestación de plantas de cosechas por microorganismos fitopatógenos, especialmente organismos fúngicos, que comprende la aplicación de un compuesto de fórmula I, o una composición agroquímica que contiene al menos uno de dichos compuestos, es la aplicación foliar. La frecuencia de aplicación y la tasa de aplicación dependerán del riesgo de infestación por el patógeno correspondiente. Sin embargo, los compuestos de fórmula I también pueden penetrar la planta a través de las raíces vía el suelo (acción sistémica) empapando el locus de la planta con una formulación líquida, o aplicando los compuestos en forma sólida al suelo, por ejemplo en forma granular (aplicación de suelo). En cosechas de arroz en agua, tales granulados se pueden aplicar al campo de arroz inundado. Los compuestos de fórmula I también se pueden aplicar a semillas (revestimiento) impregnando las semillas o tubérculos con una formulación líquida del fungicida, o revistiéndolas con una formulación sólida.

Una formulación, por ejemplo una composición que contiene el compuesto de fórmula I, y, si se desea, un adyuvante sólido o líquido, o monómeros para encapsular el compuesto de fórmula I, se puede preparar de manera conocida, típicamente mezclando y/o moliendo íntimamente el compuesto con agentes que promueven la extensión, por ejemplo disolventes, vehículos sólidos, y, opcionalmente, compuestos tensioactivos (tensioactivos).

Las formulaciones agroquímicas y/o composiciones contendrán habitualmente de 0,1 a 99% en peso, preferiblemente de 0,1 a 95% en peso, del compuesto de fórmula I, 99,9 a 1% en peso, preferiblemente 99,8 a 5% en peso, de un adyuvante sólido o líquido, y de 0 a 25% en peso, preferiblemente de 0,1 a 25% en peso, de un tensioactivo.

Las tasas de aplicación ventajosas son normalmente de 5 g a 2 kg de ingrediente activo (i.a.) por hectárea (ha), preferiblemente de 10 g a 1 kg i.a./ha, lo más preferible de 20 g a 600 g i.a./ha. Cuando se usa como un agente de empapamiento de semillas, las dosis convenientes son de 10 mg a 1 g de sustancia activa por kg de semillas.

Mientras que se prefiere formular productos comerciales como concentrados, el usuario final usará normalmente formulaciones diluidas.

El siguiente ejemplo no limitante ilustra la invención descrita anteriormente con más detalle.

Ejemplo 1: Este ejemplo ilustra la preparación de metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(3-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-propil)-tiazol-4-carboxílico (**Compuesto nº 1.d.55**)

a) Preparación de éster etílico del ácido 2-[3-(terc-butoxicarbonil-metil-amino)-prop-1-inil]-tiazol-4-carboxílico¹

- 5 A una disolución de 2-bromotiazol-4-carboxilato de etilo (3,54 g, 15 mmoles) en THF desgasificado seco (10 ml) se añadió diisopropilamina (2,27 g, 22,5 mmoles), seguido de CuI (0,14 g, 0,75 mmoles) y Pd(PPh₃)₂Cl₂ (0,52 g, 0,75 mmoles). Después de agitar 5 min. a RT, se añadió gota a gota a la mezcla de reacción durante 5 min. éster terc-butílico del ácido metil-prop-2-inil-carbámico² (2,54 g, 15 mmoles). Después de agitar toda la noche a TA, la mezcla de reacción se diluyó con THF (20 ml) y se filtró a través de celita. El disolvente se evaporó entonces, y la mezcla bruta resultante se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano 3:7) para dar éster etílico del ácido 2-[3-(terc-butoxicarbonil-metil-amino)-prop-1-inil]-tiazol-4-carboxílico (2,32 g, 47%). RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ = 8,15 (s, 1 H), 4,49-4,42 (q, 2H), 4,38-4,26 (m, 2H), 2,95 (s, 3H), 1,49 (s, 9H), 1,43-1,393 (t, 3H). MS: m/z = 347 (M+23).
- 10 b) Preparación de ácido 2-[3-(terc-butoxicarbonil-metil-amino)-prop-1-inil]-tiazol-4-carboxílico
- A una disolución de éster etílico del ácido 2-[3-(terc-butoxicarbonil-metil-amino)-prop-1-inil]-tiazol-4-carboxílico (1,22 g, 3,76 mmoles) en THF (10 ml) se añadió una disolución acuosa de hidróxido de sodio (2 M, 2,82 ml, 5,64 mmoles) a TA. Después de agitar 3 h a TA, la mezcla de reacción se acidificó con disolución acuosa 2M de HCl hasta pH 2, y la disolución se extrajo con acetato de etilo (20 ml). La capa acuosa se volvió a extraer con acetato de etilo (20 ml), y las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (10 ml), se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron, y se evaporaron a presión reducida hasta ácido 2-[3-(terc-butoxicarbonil-metil-amino)-prop-1-inil]-tiazol-4-carboxílico (1,11 g, cuant.), que se puede usar en la etapa siguiente sin purificación adicional. RMN ¹H (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 13,2 (br, 1 H), 8,55 (s, 1 H), 4,37 (s, 2H), 2,89 (s, 3H), 1,45 (s, 9H). MS: m/z = 297 (M+1).
- 15 c) Preparación de éster terc-butílico del ácido metil-{3-[4-((R)-metil-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-carbamoil)-tiazol-2-il]-prop-2-inil}-carbámico
- A una disolución de ácido 2-[3-(terc-butoxicarbonil-metil-amino)-prop-1-inil]-tiazol-4-carboxílico (1,11 g, 3,75 mmoles) en DMF (20 ml) se añadió diisopropilamina (1,93 ml, 11,3 mmoles), seguido de metanaminio de hexafluorofosfato de y 2-(1H-7-azabenzotriazol-1-il)-1,1,3,3-tetrametiluronio (1,57 g, 4,13 mmoles). Después de agitar 15 min. a TA, se añadió a la mezcla de reacción (1R)-1,2,3,4-tetrahidro-N-metil-1-naftalenamina (0,60 g, 3,75 mmoles). Después de agitar toda la noche a TA, el disolvente se evaporó, y el aceite marrón resultante se disolvió en acetato de etilo (30 ml), se lavó con disolución de bicarbonato de sodio acuoso saturado (50 ml), con disolución 1 M de HCl (50 ml), y con salmuera (50 ml). La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio, se filtró, y se evaporó a presión reducida. La mezcla bruta se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano 2:8 hasta 3:7) para dar éster terc-butílico del ácido metil-{3-[4-((R)-metil-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il-carbamoil)-tiazol-2-il]-prop-2-inil}-carbámico (1,01 g, 61%). RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ = 7,75 (s, 1H (confórmeros)), 7,03-6,92 (m, 4H), 5,58-5,46 (m, 1 H (confórmeros)), 4,18-4,09 (br, 2H), 2,75 (s, 3H (confórmeros)), 2,61 (s, 3H), 2,11-1,63 (m, 6H), 1,33 (s, 9H (confórmeros)). MS: m/z = 462 (M+23).
- 20 d) Preparación de éster terc-butílico del ácido metil-{3-[4-((R)-metil-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-carbamoil)-tiazol-2-il]-propil}-carbámico
- 35 Una disolución de éster terc-butílico del ácido metil-{3-[4-((R)-metil-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-carbamoil)-tiazol-2-il]-prop-2-inil}-carbámico (0,176 g, 0,4 mmoles) en metanol (3 ml) se bombeó a través de un cartucho de Pd/C usando un aparato H-Cube (50°C, 80 bares, 1 ml/min.). El disolvente se evaporó entonces a presión reducida para dar éster terc-butílico del ácido metil-{3-[4-((R)-metil-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-carbamoil)-tiazol-2-il]-propil}-carbámico (0,133 g, 75%), que se puede usar en la etapa siguiente sin purificación adicional. RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ = 7,54 (s, 1H (confórmeros)), 7,03-6,87 (m, 4H), 5,54-5,46 (m, 1 H (confórmeros)), 3,12-2,98 (m, 2H), 2,83-2,71 (m, 2H (confórmeros)), 2,63 (s, 3H (confórmeros)), 2,61-2,51 (m, 5H), 2,04-1,56 (m, 6H), 1,20 (s, 9H (confórmeros)). MS: m/z = 444 (M+1).
- 40 e) Preparación de sal de hidrocloreto de la metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(3-metilamino-propil)-tiazol-4-carboxílico
- 45 A una disolución de éster terc-butílico del ácido metil-{3-[4-((R)-metil-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-carbamoil)-tiazol-2-il]-propil}-carbámico (0,133 g, 0,3 mmoles) se añadió una disolución de HCl 1 M en dioxano (0,65 ml) a TA. Después de agitar toda la noche a TA, el disolvente se evaporó a presión reducida. El sólido resultante se trituró con éter dietílico, y se filtró para dar sal de hidrocloreto de la metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(3-metilamino-propil)-tiazol-4-carboxílico (0,097 g, 94%). RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ = 9,82-9,58 (br, 2H), 7,79 (s, 1 H (confórmeros)), 7,12-7,03 (m, 4H), 5,43-5,54 (m, 1 H (confórmeros)), 3,45-3,22 (m, 2H), 3,21-3,02 (m, 2H), 2,98-2,64 (m, 5H), 2,61-2,24 (m, 5H), 2,22-1,66 (m, 4H). MS: m/z = 330 (M+1). MS: m/z = 344 (M+1).
- 50

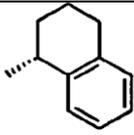
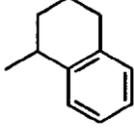
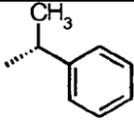
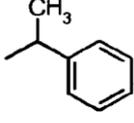
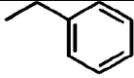
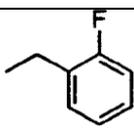
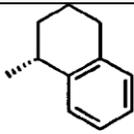
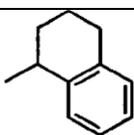
¹ Para una reacción de Sonogashira similar, véase Wipf, P., Wang, Z. documento WO 2008/106080.

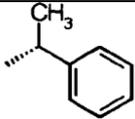
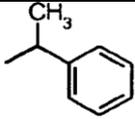
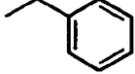
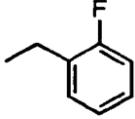
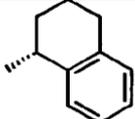
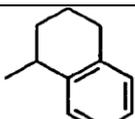
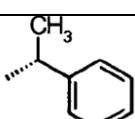
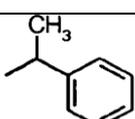
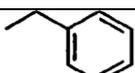
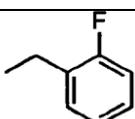
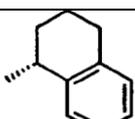
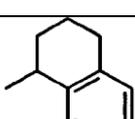
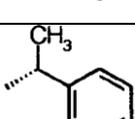
55 ² Para la síntesis de éster terc-butílico del ácido metil-prop-2-inil-carbámico, véase Bradbury, B. J.; Baumgold, J.; Jacobson, K. A J. Med. Chem. 1990, 33, 741-8.

f) Preparación de metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(3-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-propil)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.d.55)

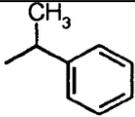
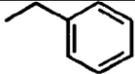
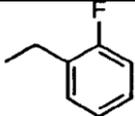
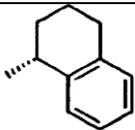
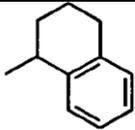
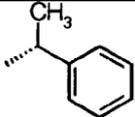
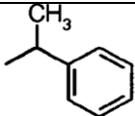
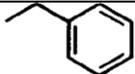
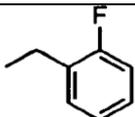
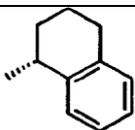
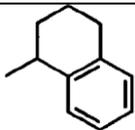
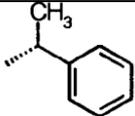
5 A una disolución de ácido (5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acético (0,053 g, 0,25 mmoles) en acetonitrilo (3 ml) se añadió diisopropiletilamina (0,17 ml, 1,01 mmoles), seguido de metanaminio de hexafluorofosfato de 2-(1H-7-azabenzotriazol-1-il)-1,1,3,3-tetrametiluronio (0,11 g, 0,3 mmoles). Después de agitar 15 min. a TA, se añadió sal de hidrocloreuro de la metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(3-metilamino-propil)-tiazol-4-carboxílico (0,096 g, 0,25 mmoles) a la mezcla de reacción. Después de agitar toda la noche a TA, el disolvente se evaporó, y el aceite amarillo resultante se disolvió en acetato de etilo (20 ml), se lavó con disolución de bicarbonato de sodio acuoso saturado (30 ml), con disolución 1M de HCl (10 ml), y salmuera (10 ml). La capa orgánica se secó sobre sulfato de sodio, se filtró, y se evaporó a presión reducida. La mezcla bruta se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano 7:3) para dar metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(3-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-propil)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.d.55, 83 mg, 61%). RMN ¹H (400 MHz, CDCl₃): δ = 7,75-7,80 (s, 1 H (confórmers)), 7,31-7,29 (m, 1 H), 7,20-7,06 (m, 3H), 6,35-6,25 (s, 1 H (confórmers)), 6,05-5,55 (m, 1 H (confórmers)), 5,05-4,75 (s, 2H (confórmers)), 3,55-3,46 (m, 2H), 3,10-2,90 (s, 3H (confórmers)), 3,08-3,05 (m, 1 H), 2,90-2,75 (s, 3H (confórmers) + m, 3H), 2,30-2,20 (s, 3H (confórmers)), 2,15-1,61 (m, 6H). MS: m/z = 534 (M+1). La Tabla 1 a continuación ilustra ejemplos de compuestos individuales de fórmula I según la invención.

Tabla 1: compuestos individuales de fórmula I según la invención

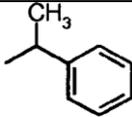
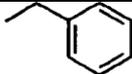
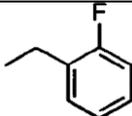
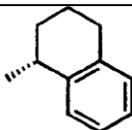
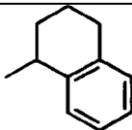
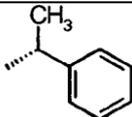
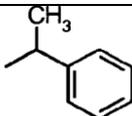
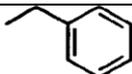
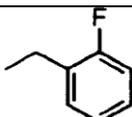
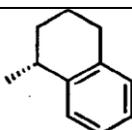
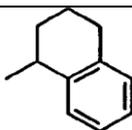
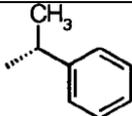
Compuesto nº	R ¹	R ⁵	Q	R ⁸
01	CF ₂ H	H	-C(=O)N(CH ₃)-	
02	CF ₂ H	H	-C(=O)N(CH ₃)-	
03	CF ₂ H	H	-C(=O)N(CH ₃)-	
04	CF ₂ H	H	-C(=O)N(CH ₃)-	
05	CF ₂ H	H	-C(=O)N(CH ₃)-	
06	CF ₂ H	H	-C(=O)N(CH ₃)-	
07	CF ₂ H	H	-C(=O)O-	
08	CF ₂ H	H	-C(=O)O-	

Compuesto n°	R ¹	R ⁵	Q	R ⁸
09	CF ₂ H	H	-C(=O)O-	
10	CF ₂ H	H	-C(=O)O-	
11	CF ₂ H	H	-C(=O)O-	
12	CF ₂ H	H	-C(=O)O-	
13	CF ₂ H	H	-NH-C(=O)-	
14	CF ₂ H	H	-NH-C(=O)-	
15	CF ₂ H	H	-NH-C(=O)-	
16	CF ₂ H	H	-NH-C(=O)-	
17	CF ₂ H	H	-NH-C(=O)-	
18	CF ₂ H	H	-NH-C(=O)-	
19	CF ₂ H	CH ₃	-C(=O)N(CH ₃)-	
20	CF ₂ H	CH ₃	-C(=O)N(CH ₃)-	
21	CF ₂ H	CH ₃	-C(=O)N(CH ₃)-	

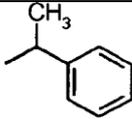
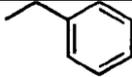
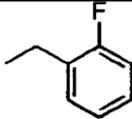
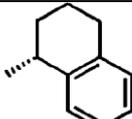
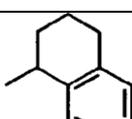
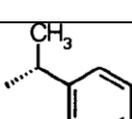
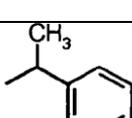
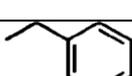
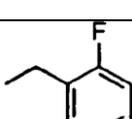
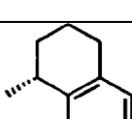
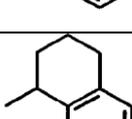
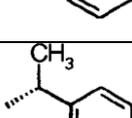
ES 2 450 424 T3

Compuesto n°	R ¹	R ⁵	Q	R ⁸
22	CF ₂ H	CH ₃	-C(=O)N(CH ₃)-	
23	CF ₂ H	CH ₃	-C(=O)N(CH ₃)-	
24	CF ₂ H	CH ₃	-C(=O)N(CH ₃)-	
25	CF ₂ H	CH ₃	-C(=O)O-	
26	CF ₂ H	CH ₃	-C(=O)O-	
27	CF ₂ H	CH ₃	-C(=O)O-	
28	CF ₂ H	CH ₃	-C(=O)O-	
29	CF ₂ H	CH ₃	-C(=O)O-	
30	CF ₂ H	CH ₃	-C(=O)O-	
31	CF ₂ H	CH ₃	-NH-C(=O)-	
32	CF ₂ H	CH ₃	-NH-C(=O)-	
33	CF ₂ H	CH ₃	-NH-C(=O)-	

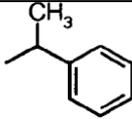
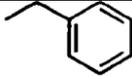
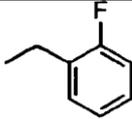
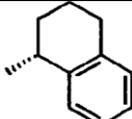
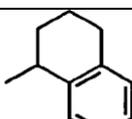
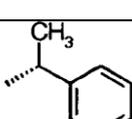
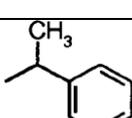
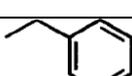
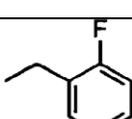
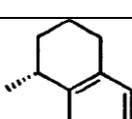
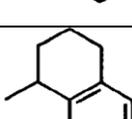
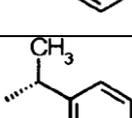
ES 2 450 424 T3

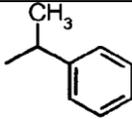
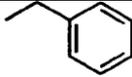
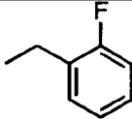
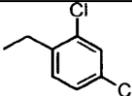
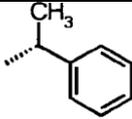
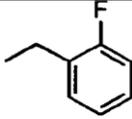
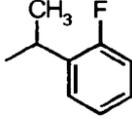
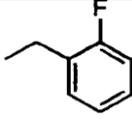
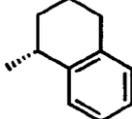
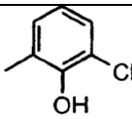
Compuesto n°	R ¹	R ⁵	Q	R ⁸
34	CF ₂ H	CH ₃	-NH-C(=O)-	
35	CF ₂ H	CH ₃	-NH-C(=O)-	
36	CF ₂ H	CH ₃	-NH-C(=O)-	
37	CF ₃	H	-C(=O)N(CH ₃)-	
38	CF ₃	H	-C(=O)N(CH ₃)-	
39	CF ₃	H	-C(=O)N(CH ₃)-	
40	CF ₃	H	-C(=O)N(CH ₃)-	
41	CF ₃	H	-C(=O)N(CH ₃)-	
42	CF ₃	H	-C(=O)N(CH ₃)-	
43	CF ₃	H	-C(=O)O-	
44	CF ₃	H	-C(=O)O-	
45	CF ₃	H	-C(=O)O-	

ES 2 450 424 T3

Compuesto n°	R ¹	R ⁵	Q	R ⁸
46	CF ₃	H	-C(=O)O-	
47	CF ₃	H	-C(=O)O-	
48	CF ₃	H	-C(=O)O-	
49	CF ₃	H	-NH-C(=O)-	
50	CF ₃	H	-NH-C(=O)-	
51	CF ₃	H	-NH-C(=O)-	
52	CF ₃	H	-NH-C(=O)-	
53	CF ₃	H	-NH-C(=O)-	
54	CF ₃	H	-NH-C(=O)-	
55	CF ₃	CH ₃	-C(=O)N(CH ₃)-	
56	CF ₃	CH ₃	-C(=O)N(CH ₃)-	
57	CF ₃	CH ₃	-C(=O)N(CH ₃)-	

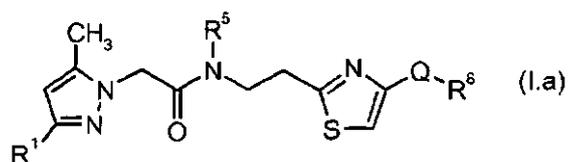
ES 2 450 424 T3

Compuesto n°	R ¹	R ⁵	Q	R ⁸
58	CF ₃	CH ₃	-C(=O)N(CH ₃)-	
59	CF ₃	CH ₃	-C(=O)N(CH ₃)-	
60	CF ₃	CH ₃	-C(=O)N(CH ₃)-	
61	CF ₃	CH ₃	-C(=O)O-	
62	CF ₃	CH ₃	-C(=O)O-	
63	CF ₃	CH ₃	-C(=O)O-	
64	CF ₃	CH ₃	-C(=O)O-	
65	CF ₃	CH ₃	-C(=O)O-	
66	CF ₃	CH ₃	-C(=O)O-	
67	CF ₃	CH ₃	-NH-C(=O)-	
68	CF ₃	CH ₃	-NH-C(=O)-	
69	CF ₃	CH ₃	-NH-C(=O)-	

Compuesto n°	R ¹	R ⁵	Q	R ⁸
70	CF ₃	CH ₃	-NH-C(=O)-	
71	CF ₃	CH ₃	-NH-C(=O)-	
72	CF ₃	CH ₃	-NH-C(=O)-	
73	CF ₃	CH ₃	-C(=O)N(CH ₃)-	
74	CF ₃	CH ₃	-C(=O)NH-	
75	CF ₃	CH ₃	-C(=O)NH-	
76	CF ₃	CH ₃	-C(=O)NH-	
77	CF ₃	CH ₃	-C(=O)N(CH ₂ CH ₃)-	
78	CF ₃	CH ₃	-C(=O)NH-	
79	CF ₃	CH ₃	-NH-C(=O)-	

en los que

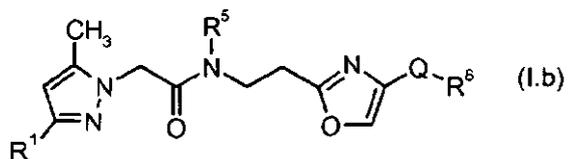
a) 77 compuestos de fórmula (I.a):



5

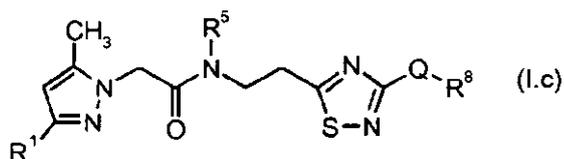
en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

b) 77 compuestos de fórmula (I.b):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

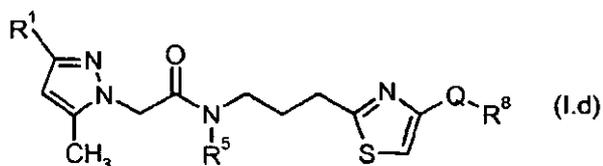
c) 77 compuestos de fórmula (I.c):



5

en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

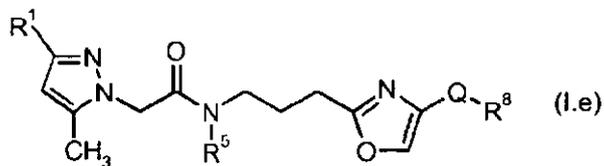
d) 77 compuestos de fórmula (I.d):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

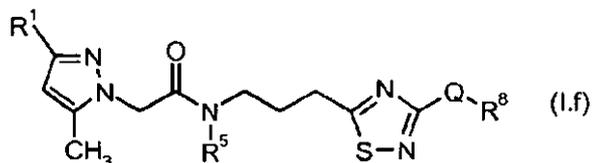
10

e) 77 compuestos de fórmula (I.e):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

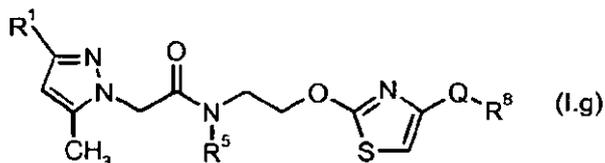
f) 77 compuestos de fórmula (I.f):



15

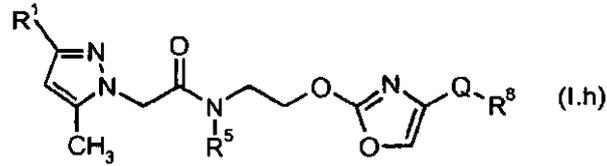
en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

g) 77 compuestos de fórmula (I.g):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

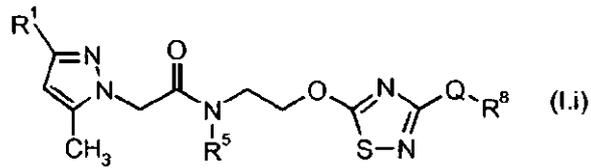
h) 77 compuestos de fórmula (I.h):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

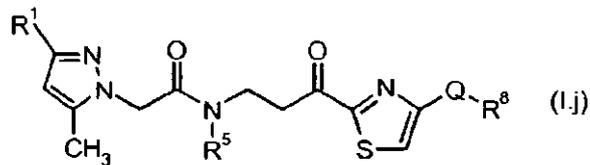
5

i) 77 compuestos de fórmula (I.i):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

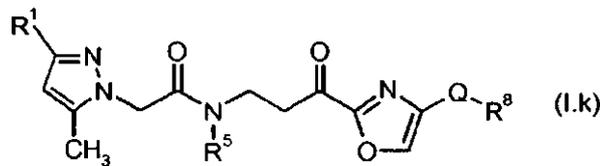
j) 77 compuestos de fórmula (I.j):



10

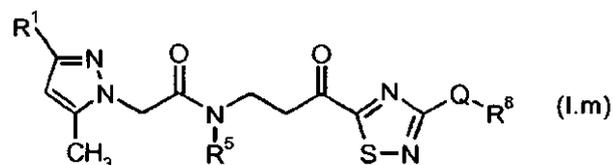
en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

k) 77 compuestos de fórmula (I.k):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

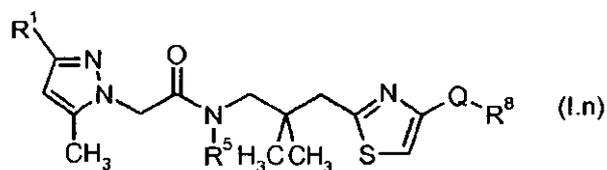
m) 77 compuestos de fórmula (I.m):



15

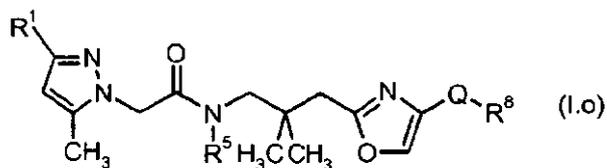
en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

n) 77 compuestos de fórmula (I.n):



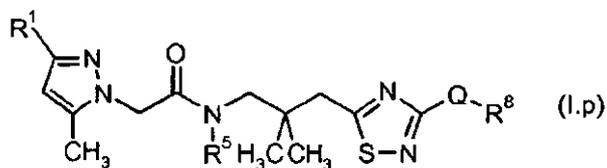
en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

o) 77 compuestos de fórmula (I.o):



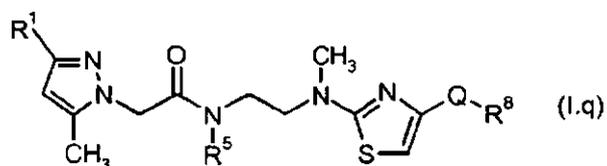
5 en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

p) 77 compuestos de fórmula (I.p):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

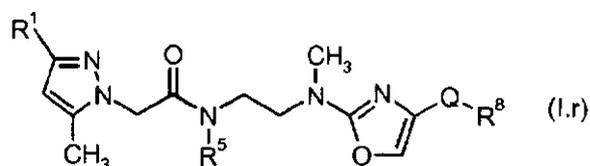
q) 77 compuestos de fórmula (I.q):



10

en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

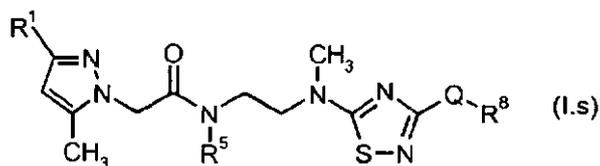
r) 77 compuestos de fórmula (I.r):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

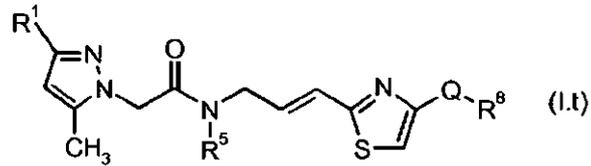
15

s) 77 compuestos de fórmula (I.s):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

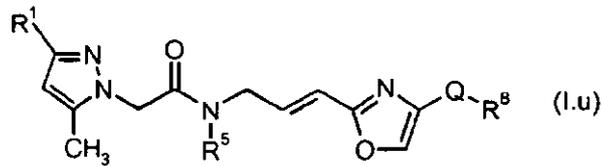
t) 77 compuestos de fórmula (I.t):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

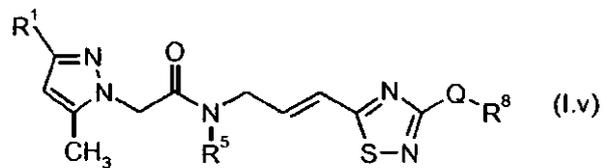
5

u) 77 compuestos de fórmula (I.u):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

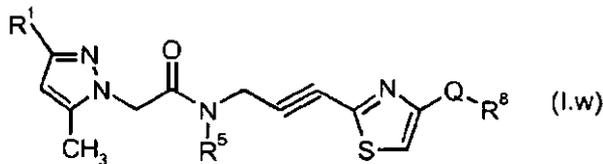
v) 77 compuestos de fórmula (I.v):



10

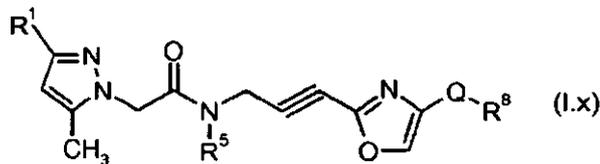
en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

w) 77 compuestos de fórmula (I.w):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

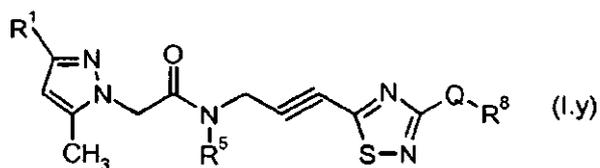
x) 77 compuestos de fórmula (I.x):



15

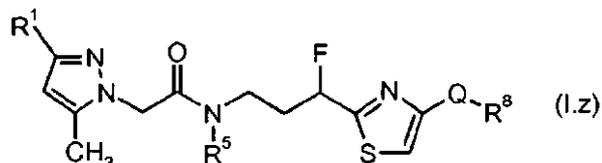
en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

y) 77 compuestos de fórmula (I.y):



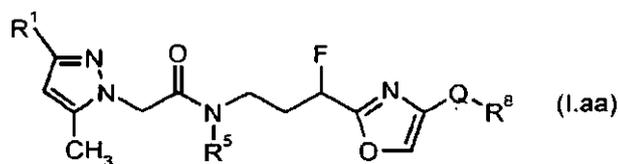
en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

z) 77 compuestos de fórmula (I.z):



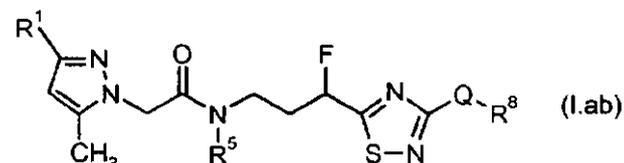
5 en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

aa) 77 compuestos de fórmula (I.aa):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

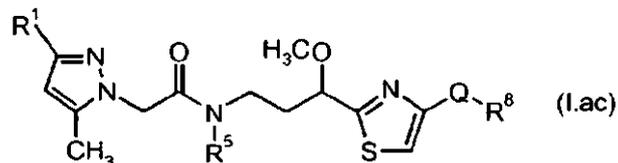
ab) 77 compuestos de fórmula (I.ab):



10

en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

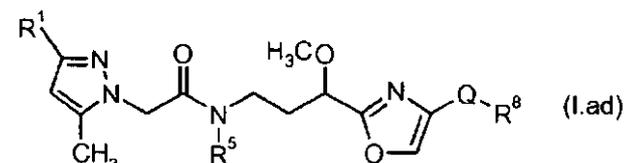
ac) 77 compuestos de fórmula (I.ac):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

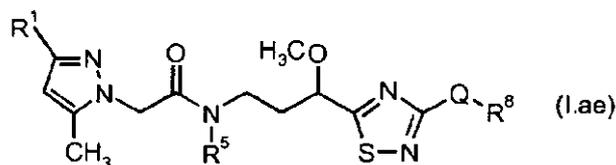
15

ad) 77 compuestos de fórmula (I.ad):



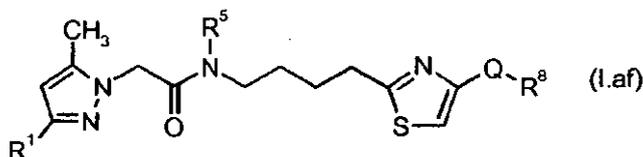
en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

ae) 77 compuestos de fórmula (I.ae):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

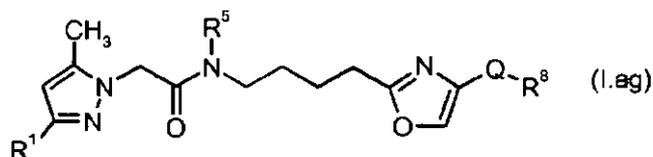
af) 77 compuestos de fórmula (I.af):



5

en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

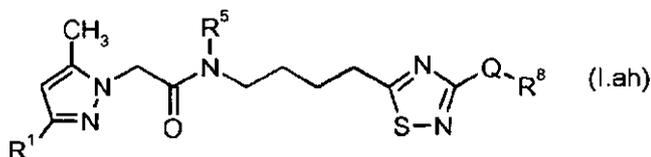
ag) 77 compuestos de fórmula (I.ag):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

10

ah) 77 compuestos de fórmula (I.ah):



en la que R¹, R⁵, Q y R⁸ son como se definen en la Tabla 1.

A lo largo de esta descripción, las temperaturas se dan en grados Celsius, y "p.f." significa punto de fusión. LC/MS significa cromatografía de líquidos-espectroscopía de masas, y la descripción del aparato y el método es: (HP 1100 HPLC de Agilent, Phenomenex Gemini C18, tamaño de partículas 3 μm, 110 Angström, columna 30 x 3 mm, 1,7 ml/min., 60 °C, H₂O + 0,05% HCOOH (95%) / CH₃CN/MeOH 4:1 + 0,04% HCOOH (5%) - 2 min. - CH₃CN/MeOH 4:1 + 0,04% HCOOH (5%) - 0,8 min., Espectrómetro de Masas ZQ de Waters, método de ionización: electropulverización (ESI), Polaridad: iones positivos, Capilar (kV) 3,00, Cono (V) 30,00, Extractor (V) 2,00, Temperatura de la fuente (°C) 100, Temperatura de desolvatación (°C) 250, caudal del gas del cono (l/h) 50, Caudal del gas de desolvatación (l/h) 400).

15

20

La Tabla 2 muestra los datos seleccionados de p.f. y los datos seleccionados de LC/MS para los compuestos de la Tabla 1.

Tabla 2: Datos de punto de fusión y de LC/MS para los compuestos de la Tabla 1

Compuesto nº	Punto de fusión (°C)	LC/MS
I.a.55		Rt = 1,89 min; MS: m/z = 542 (M+23)
I.a.57		Rt = 1,83 min; MS: m/z = 516 (M+23)
I.a.60		Rt = 1,76 min; MS: m/z = 520 (M+23)

Compuesto nº	Punto de fusión (°C)	LC/MS
l.d.37		Rt = 1,89 min; MS: m/z = 542 (M+23)
l.d.55		Rt = 1,91 min; MS: m/z = 534 (M+1)
l.d.78	127-130	
l.q.55		Rt = 1,96 min; MS: m/z = 549 (M+1)
l.q.57		Rt = 1,89 min; MS: m/z = 523 (M+1)
l.q.73		Rt = 2,01 min; MS: m/z = 579 (M+2)
l.q.74		Rt = 1,86 min; MS: m/z = 509 (M+1)
l.q.75		Rt = 1,81 min; MS: m/z = 513 (M+1)
l.q.76		Rt = 1,87 min; MS: m/z = 527 (M+1)
l.q.77		Rt = 1,91 min; MS: m/z = 541 (M+1)
l.t.55		Rt = 1,92 min; MS: m/z = 554 (M+23)

Los compuestos según la presente invención se pueden preparar según los esquemas de reacción mencionados anteriormente, en los que, excepto que se establezca de otro modo, la definición de cada variable es como se define anteriormente para un compuesto de fórmula (I).

5 Ejemplos biológicos

Phytophthora infestans/tomate/preventivo del disco de la hoja (tizón tardío del tomate)

Se colocaron discos de hojas de tomate sobre agar con agua en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizan con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Los discos de hojas se inoculan con una suspensión de esporas del hongo 1 día después de la aplicación. Los discos de hojas inoculados se incuban a 16°C y 75% de rh en un régimen de luz de 24 h de oscuridad seguido de 12 h de luz/12 h de oscuridad en una cabina climatizada, y la actividad de un compuesto se evalúa como porcentaje de control de la enfermedad en comparación con la falta de tratamiento cuando aparece un nivel apropiado de daño por enfermedad en discos de hojas comprobados no tratados (5-7 días tras la aplicación).

Los compuestos l.d.55, l.d.37 y l.t.55 a 200 ppm dan al menos 80% de control de la enfermedad en este ensayo cuando se comparan con discos de hojas de control sin tratar en las mismas condiciones, que muestran un desarrollo amplio de la enfermedad.

Phytophthora infestans/patata/preventivo (tizón tardío de la patata)

Se pulverizan plantas de patata cv. Bintje de 2 semanas en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo se inoculan pulverizándolas con una suspensión de esporangios 2 días tras la aplicación. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 18°C con 14 h de luz/día y 100% de rh en una cámara de crecimiento, y se evalúa el porcentaje de área de hoja cubierta por la enfermedad cuando aparece un nivel apropiado de enfermedad sobre plantas de comprobación no tratadas (5-7 días tras la aplicación).

El compuesto l.d.55 y l.t.55 a 200 ppm da al menos 80% de control de la enfermedad en este ensayo cuando se compara con discos de hojas de control sin tratar en las mismas condiciones, que muestran un desarrollo amplio de la enfermedad.

Phytophthora infestans/patata/duradero (tizón tardío de la patata)

Se pulverizan plantas de patata cv. Bintje de 2 semanas en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo se inoculan pulverizándolas con una suspensión de esporangios 6 días tras la aplicación. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 18°C con 14 h de luz/día y 100% de rh en una cámara de crecimiento, y se evalúa el porcentaje de área de hoja cubierta por la enfermedad cuando aparece un nivel apropiado de enfermedad sobre plantas de comprobación no tratadas (9-11 días tras la aplicación).

El compuesto l.d.55 y l.t.55 a 200 ppm da al menos 60% de control de la enfermedad en este ensayo cuando se compara con discos de hojas de control sin tratar en las mismas condiciones, que muestran un desarrollo amplio de la enfermedad.

Phytophthora infestans/patata/curativo (tizón tardío de la patata)

- 5 Se pulverizan plantas de patata cv. Bintje de 2 semanas se inoculan pulverizándolas con una suspensión de esporangios un día antes de la aplicación. Las plantas inoculadas se pulverizan en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 18°C con 14 h de luz/día y 100% de rh en una cámara de crecimiento, y se evalúa el porcentaje de área de hoja cubierta por la enfermedad cuando aparece un nivel apropiado de enfermedad sobre plantas de comprobación no tratadas (3-4 días tras la aplicación).

10

El compuesto l.d.55 y l.t.55 a 200 ppm da al menos 80% de control de la enfermedad en este ensayo cuando se compara con discos de hojas de control sin tratar en las mismas condiciones, que muestran un desarrollo amplio de la enfermedad.

Plasmopara viticola/uva/preventivo del disco de la hoja (mildiu de la uva)

- 15 Se colocan discos de hojas de vid en agar con agua en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizan con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Los discos de hoja se inoculan con una suspensión de esporas del hongo 1 día tras la aplicación. Los discos de hojas inoculados se incuban a 19°C y 80% de rh en un régimen de luz de 12 h de luz/12 h de oscuridad en una cabina climatizada, y la actividad de un compuesto se evalúa como porcentaje de control de la enfermedad en comparación a sin tratar cuando aparece un nivel apropiado de daño por enfermedad en discos de hojas de comprobación sin tratar (6-8 días tras la aplicación).

20

El compuesto l.d.55, l.d.37 y l.t.55 a 200 ppm da al menos 70% de control de la enfermedad en este ensayo cuando se compara con discos de hojas de control sin tratar en las mismas condiciones, que muestran desarrollo amplio de la enfermedad.

Plasmopara viticola/uva/preventivo (mildiu de la uva)

- 25 Se pulverizan plántulas de uva cv. Gutedel de 5 semanas en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo se inoculan pulverizando una suspensión de esporangios sobre su superficie inferior de la hoja un día tras la aplicación. Las plantas de ensayo inoculadas se incubaron a 22°C y 100% de rh en un invernadero, y se evalúa el porcentaje de área de hoja cubierto por la enfermedad cuando aparece un nivel apropiado de enfermedad en plantas de comprobación sin tratar (6-8 días tras la aplicación).

- 30 El compuesto l.d.55 y l.t.55 a 200 ppm da al menos 80% de control de la enfermedad en este ensayo cuando se compara con discos de hojas de control sin tratar en las mismas condiciones, que muestran un desarrollo amplio de la enfermedad.

Plasmopara viticola/uva/duradero (mildiu de la uva)

- 35 Se pulverizan plántulas de uva cv. Gutedel de 5 semanas en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo se inoculan pulverizando una suspensión de esporangios sobre su superficie inferior de la hoja 6 días tras la aplicación. Las plantas de ensayo inoculadas se incubaron a 22°C y 100% de rh en un invernadero, y se evalúa el porcentaje de área de hoja cubierto por la enfermedad cuando aparece un nivel apropiado de enfermedad en plantas de comprobación sin tratar (11-13 días tras la aplicación).

- 40 El compuesto l.d.55 y l.t.55 a 200 ppm da al menos 80% de control de la enfermedad en este ensayo cuando se compara con discos de hojas de control sin tratar en las mismas condiciones, que muestran un desarrollo amplio de la enfermedad.

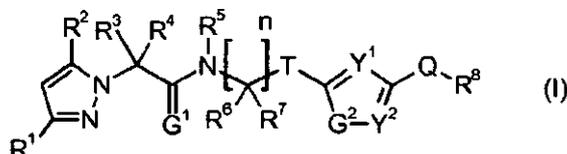
Plasmopara viticola/uva/curativo (mildiu de la uva)

- 45 Se inoculan plántulas de uva cv. Gutedel de 5 semanas pulverizando una suspensión de esporangios sobre su superficie inferior de la hoja un día antes de la aplicación. Las plantas de uva inoculadas se pulverizan en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 22°C y 100% de rh en un invernadero, y se evalúa el porcentaje de área de hoja cubierto por la enfermedad cuando aparece un nivel apropiado de enfermedad en plantas de comprobación no tratadas (4-6 días tras la aplicación).

- 50 El compuesto l.d.55 a 200 ppm da al menos 80% de control de la enfermedad en este ensayo cuando se compara con discos de hojas de control sin tratar en las mismas condiciones, que muestran un desarrollo amplio de la enfermedad.

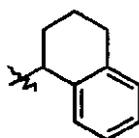
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula I:



en la que

- 5 G¹ y G² son, independientemente, O o S;
 T es -C(R⁹R¹⁰)-, -C(R¹¹)=C(R¹²)-, -C≡C-, NR¹³ u O;
 Y¹ e Y² son, independientemente, CR¹⁴ o N;
 Q es -C(=O)-N(R¹⁵)-z, -C(=S)-N(R¹⁶)-z, -C(=O)-O-z, -N(R¹⁷)-C(=O)-z, -N(R¹⁸)-C(=S)-z, -N(R¹⁹)-C(=O)-O-z o -N(R²⁰)-C(=O)-N(R²¹)-z, en cada caso z indica el enlace que está conectado R⁸;
- 10 n es 1, 2, 3 ó 4 cuando T es -C(R⁹R¹⁰)-, NR¹³ u O;
 n es 1, 2 ó 3 cuando T es -C(R¹¹)=C(R¹²)-o -C≡C-;
- R¹, R², R³, R⁴, R¹¹, R¹² y R¹⁴ son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo de C₁-C₄, o haloalquilo de C₁-C₄;
- 15 R⁵, R¹³, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²⁰ y R²¹ son cada uno, independientemente, hidrógeno, alquilo de C₁-C₄ o alcoxi de C₁-C₄;
- R⁶ y R⁷ son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, alquilo de C₁-C₄-tio, de haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄-tio, o juntos forman un grupo carbonilo (=O);
- 20 R⁹ y R¹⁰ son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo de C₁-C₄, alcoxi de C₁-C₄, alquilo de C₁-C₄-tio, haloalquilo de C₁-C₄, haloalcoxi de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄-tio, o juntos forman un grupo carbonilo (=O); y
- R⁸ es fenilo, bencilo o un grupo (a):



(a)

- 25 en el que el fenilo, el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo de C₁-C₄, haloalquilo de C₁-C₄, halógeno, ciano, hidroxilo y amino;
- o una sal o un N-óxido de los mismos.

2. El compuesto según la reivindicación 1, en el que

- 30 G¹ y G² son, independientemente, O o S;
 T es -C(R⁹R¹⁰)-, -C(R¹¹)=C(R¹²)-, -C≡C-, NR¹³ u O;
 Y¹ e Y² son, independientemente, CR¹⁴ o N;
 Q es -C(=O)-N(R¹⁵)-z, -C(=S)-N(R¹⁶)-z, -C(=O)-O-z, -N(R¹⁷)-C(=O)-z, -N(R¹⁹)-C(=O)-O-z o -N(R²⁰)-C(=O)-N(R²¹)-z, en cada caso z indica el enlace que está conectado R⁸;
- n es 1, 2 ó 3 cuando T es -C(R⁹R¹⁰)-, NR¹³ u O;

n es 1 ó 2 cuando T es $-C(R^{11})=C(R^{12})-o -C\equiv C-$;

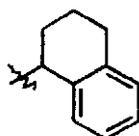
$R^1, R^2, R^3, R^4, R^{11}, R^{12}$ y R^{14} son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_4 , o haloalquilo de C_1-C_4 ;

$R^5, R^{13}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, R^{19}, R^{20}$ y R^{21} son cada uno, independientemente, hidrógeno o alquilo de C_1-C_4 ;

5 R^6 y R^7 son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , haloalcoxi de C_1-C_4 , o juntos forman un grupo carbonilo ($=O$);

R^9 y R^{10} son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , haloalcoxi de C_1-C_4 , o juntos forman un grupo carbonilo ($=O$); y

R^8 es fenilo, bencilo o un grupo (a):



(a)

10 en el que el fenilo, el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , halógeno, hidroxilo y amino.

3. El compuesto según la reivindicación 1, en el que

G^1 y G^2 son, independientemente, O o S;

15 T es $-C(R^9R^{10})-$, $-C(R^{11})=C(R^{12})-$, $-C\equiv C-$, NR^{13} u O;

Y^1 es N;

Y^2 es CR^{14} o N;

Q es $-C(=O)-N(R^{15})-z$, $-C(=S)-N(R^{16})-z$, $-C(=O)-O-z$, o $-N(R^{17})-C(=O)-z$, en cada caso z indica el enlace que está conectado R^8 ;

20 n es 1, 2 ó 3 cuando T es $-C(R^9R^{10})-$, NR^{13} u O;

n es 1 ó 2 cuando T es $-C(R^{11})=C(R^{12})-o -C\equiv C-$;

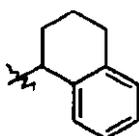
$R^1, R^2, R^3, R^4, R^{11}, R^{12}$ y R^{14} son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_4 , o haloalquilo de C_1-C_4 ;

$R^5, R^{13}, R^{15}, R^{16}, R^{17}$ son cada uno, independientemente, hidrógeno o alquilo de C_1-C_4 ;

25 R^6 y R^7 son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , haloalcoxi de C_1-C_4 , o juntos forman un grupo carbonilo ($=O$);

R^9 y R^{10} son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , haloalcoxi de C_1-C_4 , o juntos forman un grupo carbonilo ($=O$); y

R^8 es fenilo, bencilo o un grupo (a):



(a)

30 en la que el fenilo, el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , halógeno, hidroxilo y amino.

4. El compuesto según la reivindicación 1, en el que

G^1 es O;

G^2 es O o S;

T es $-C(R^9R^{10})-$, $-C(R^{11})=C(R^{12})-$, $-C=C-$, NR^{13} u O;

5 Y^1 es N;

Y^2 es CR^{14} o N;

Q es $-C(=O)-N(R^{15})-z$, $-C(=O)-O-z$, o $-N(R^{17})-C(=O)-z$, en cada caso z indica el enlace que está conectado R^8 ;

n es 1, 2 ó 3 cuando T es $-C(R^9R^{10})-$, NR^{13} u O;

n es 1 ó 2 cuando T es $-C(R^{11})=C(R^{12})-$ o $-C\equiv C-$;

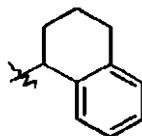
10 R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{11} , R^{12} y R^{14} son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, alquilo de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 ;

R^5 , R^{13} , R^{15} , R^{17} son cada uno, independientemente, hidrógeno o alquilo de C_1-C_4 ;

R^6 y R^7 son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, hidroxilo, alquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , haloalcoxi de C_1-C_4 , o juntos forman un grupo carbonilo ($=O$);

15 R^9 y R^{10} son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, hidroxilo, alquilo de C_1-C_4 , alcoxi de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , haloalcoxi de C_1-C_4 , o juntos forman un grupo carbonilo ($=O$); y

R^8 es bencilo o un grupo (a):



(a)

20 en el que el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo de C_1-C_4 , haloalquilo de C_1-C_4 , halógeno e hidroxilo.

5. El compuesto según la reivindicación 1, en el que

G^1 es O;

G^2 es S;

T es $-C(R^9R^{10})-$, NR^{13} u O;

25 Y^1 es N;

Y^2 es CR^{14} ;

Q es $-C(=O)-N(R^{15})-z$ o $-C(=O)-O-z$, en cada caso z indica el enlace que está conectado R^8 ;

n es 2;

R^1 y R^2 son, independientemente, halógeno, metilo o halometilo;

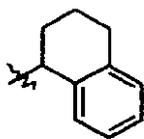
30 R^3 , R^4 y R^{14} son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, metilo, o halometilo;

R^5 , R^{13} y R^{15} son cada uno, independientemente, hidrógeno o metilo;

R^6 y R^7 son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, metoxi o metilo;

R^9 y R^{10} son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, metoxi o metilo; y

R^8 es bencilo o un grupo (a):

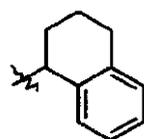


(a)

en el que el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de metilo, halometilo, y halógeno.

6. El compuesto según la reivindicación 1, en el que

- 5 G^1 es O;
 G^2 es S;
T es $-C(R^9R^{10})-$;
 Y^1 es N;
 Y^2 es CR^{14} ;
- 10 Q es $-C(=O)-N(R^{15})-z$, en el que z indica el enlace que se conecta a R^8 ;
n es 2;
 R^1 y R^2 son, independientemente, metilo o trifluorometilo;
 R^3 , R^4 y R^{14} son cada uno, independientemente, hidrógeno, fluoro o metilo;
 R^5 y R^{15} son cada uno, independientemente, hidrógeno o metilo; R^6 y R^7 son cada uno, independientemente, hidrógeno, fluoro o metilo;
- 15 R^9 , y R^{10} son cada uno, independientemente, hidrógeno, fluoro o metilo; y
 R^8 es un grupo (a):



(a)

- 20 en el que el grupo (a) está opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de metilo, trifluorometilo y fluoro.

7. El compuesto según la reivindicación 1, en el que

- G^1 es O;
 G^2 es O, S;
T es $-C(R^9R^{10})-$, $-C(R^{11})=C(R^{12})-$, $-C\equiv C-$, NR^{13} u O;
- 25 Y^1 es N;
 Y^2 es CR^{14} o N;
Q es $-C(=O)-N(R^{15})-z$, $-C(=O)-O-z$ o $-N(R^{17})-C(=O)-z$, en cada caso z indica el enlace que está conectado a R^8 ;
n es 1, 2 ó 3 cuando T es $-C(R^9R^{10})-$, NR^{13} u O;
n es 1, o 2 cuando T es $-C(R^{11})=C(R^{12})-$ o $-C\equiv C-$;
- 30 R^1 y R^2 son cada uno, independientemente, metilo o halometilo;

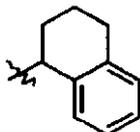
R³, R⁴, R¹¹, R¹² y R¹⁴ son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno o metilo;

R⁵, R¹³, R¹⁵ y R¹⁷ son cada uno, independientemente, hidrógeno o metilo;

R⁶ y R⁷ son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi, o juntos forman un grupo carbonilo (=O);

5 R⁹ y R¹⁰ son cada uno, independientemente, hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi, o juntos forman un grupo carbonilo (=O); y

R⁸ es bencilo o un grupo (a):



(a)

10 en el que el bencilo y el grupo (a) están cada uno opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de metilo, halometilo y halógeno.

8. El compuesto según la reivindicación 1, en el que el compuesto es:

metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(3-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-propil)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.d.55);

15 metil-((R)-1-fenil-etil)-amida del ácido 2-(3-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-propil)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.d.57);

metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(3-{[2-(3-difluorometil-5-metil-pirazol-1-il)-acetil]-metil-amino}-propil)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.d.19);

éster 1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ílico del ácido 2-(3-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-propil)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.d.62);

20 metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(2-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-etoxi)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.g.55);

metil-((R)-1-fenil-etil)-amida del ácido 2-(2-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-etoxi)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.g.57);

25 metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-(2-{[2-(3-difluorometil-5-metil-pirazol-1-il)-acetil]-metil-amino}-etoxi)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.g.19);

éster 1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ílico del ácido 2-(2-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-etoxi)-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.g.62);

metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-[metil-(2-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-etil)-amino]-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.q.55);

30 metil-((R)-1-fenil-etil)-amida del ácido 2-[metil-(2-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-etil)-amino]-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.q.57);

metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-amida del ácido 2-[(2-{[2-(3-difluorometil-5-metil-pirazol-1-il)-acetil]-metil-amino}-etil)-metil-amino]-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.q.19); o

35 éster 1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-ílico del ácido 2-[metil-(2-{metil-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)-acetil]-amino}-etil)-amino]-tiazol-4-carboxílico (Compuesto nº 1.q.62).

9. El compuesto según la reivindicación 1, en el que T es -C(R¹¹)=C(R¹²)-, -C≡C-, NR¹³ u O.

10. El compuesto según la reivindicación 1, en el que Q es -N(R¹⁷)-C(=O)-z, -N(R¹⁸)-C(=S)-z, -N(R¹⁹)-C(=O)-O-z o -N(R²⁰)-C(=O)-N(R²¹)-z, en cada caso z indica el enlace que está conectado R⁸.

40 11. Una composición fungicida que comprende al menos un compuesto como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 y un vehículo agrícolamente aceptable.

12. La composición fungicida según la reivindicación 11, que comprende un adyuvante.
13. La composición fungicida según la reivindicación 11 o reivindicación 12, que comprende al menos un compuesto fungicidamente activo adicional.
- 5 14. Un método para controlar o prevenir una infestación de plantas, su material de propagación, cosechas recolectadas o materiales no vivos por microorganismos fitopatógenos o responsables del deterioro, o microorganismos potencialmente dañinos al hombre, que comprende aplicar un compuesto como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 a las plantas, a partes de las plantas, al locus de las mismas, o al material de propagación de las mismas, a la cosecha recolectada, o a cualquier parte de los materiales no vivos.
15. El método según la reivindicación 14, en el que los microorganismos son microorganismos fúngicos.