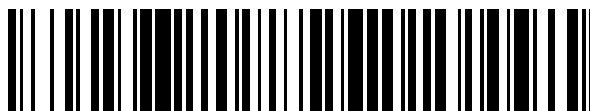


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 506 169**

51 Int. Cl.:

C07D 239/47 (2006.01)

A01N 47/16 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.08.2010** **E 10807174 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **24.09.2014** **EP 2462133**

54 Título: **Derivados de 5-fluoro-2-oxopirimidina-1(2H)-carboxilato como fungicidas**

30 Prioridad:

07.08.2009 US 232232 P

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
13.10.2014

73 Titular/es:

DOW AGROSCIENCES LLC (100.0%)
9330 Zionsville Road
Indianapolis, IN 46268-1054, US

72 Inventor/es:

BOEBEL, TIMOTHY;
BRYAN, KRISTY;
LORSBACH, BETH;
MARTIN, TIMOTHY;
OWEN, W.;
POBANZ, MARK;
THORNBURGH, SCOTT;
WEBSTER, JEFFERY y
YAO, CHENGLIN

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 506 169 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

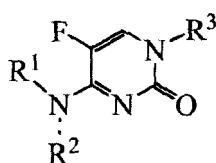
Derivados de 5-fluoro-2-oxopirimidina-1(2*H*)-carboxilato como fungicidas

Antecedentes y compendio de la invención

5 Los fungicidas son compuestos de origen natural o sintético, que actúan para proteger y/o curar a las plantas frente al daño causado por hongos agrícolamente relevantes. De manera general, ningún único fungicida es útil en todas las situaciones. Por consiguiente, está en curso una investigación para producir fungicidas que puedan tener mejor rendimiento, sean más fáciles de usar y cuesten menos.

10 La presente descripción se refiere a compuestos de 5-fluoro-2-oxopirimidina-1(2*H*)-carboxilato y a su uso como fungicidas. Los compuestos de la presente descripción pueden ofrecer protección contra ascomicetos, basidiomicetos, deuteromicetos y oomicetos.

Una realización de la presente descripción puede incluir compuestos de la Fórmula I:



Fórmula I

en donde R¹ es:

H;

15 alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con 1-3 R⁴;

alquenilo C₂-C₆ opcionalmente sustituido con 1-3 R⁴;

alquinilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con 1-3 R⁴;

20 fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵; o con un sistema anular saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema anular condensado 5-6, o con un sistema anular condensado 6-6, que contiene cada uno 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

-(CHR⁶)_mOR⁷;

-C(=O)R⁸;

-C(=S)R⁸;

25 -S(O)₂R⁸;

-C(=O)OR⁸;

-C(=S)OR⁸;

-(CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;

-C(=O)N(R⁹)R¹⁰; o

30 -C(=S)N(R⁹)R¹⁰;

en donde m es un número entero 1-3;

R² es H o alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con R⁴;

alternativamente R¹ y R² pueden unirse para formar =CR¹¹N(R¹²)R¹³;

R³ es -C(=O)OR⁸ o -C(=S)OR⁸;

35 R⁴ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil-C₁-C₆-tio, haloalquil-C₁-C₆-tio, amino, halotio, alquil-C₁-C₃-amino, alcoxi-C₂-C₆-carbonilo, alquil-C₂-C₆-carbonilo, alquil-C₂-C₆-aminocarbonilo, hidroxilo, o trialquil-C₃-C₆-sililo;

R⁵ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil-C₁-C₆-tio, haloalquil-C₁-C₆-tio, amino, alquil-C₁-C₆-amino, dialquil-C₂-C₆-amino, alcoxi-C₂-C₆-carbonilo, o alquil-C₂-C₆-carbonilo, nitro, hidroxilo, o ciano, halotio;

5 R⁶ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

10 R⁷ es H, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo, alquil-C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema anular saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema anular condensado 5-6, o con un sistema anular condensado 6-6, que contienen cada uno 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

15 R⁸ es H, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo, -(CH₂)₂OCH₂(C₆H₅), fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema anular saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema anular condensado 5-6, o con un sistema anular condensado 6-6, que contienen cada uno 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

20 R⁹ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo, alquil-C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema anular saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema anular condensado 5-6, o con un sistema anular condensado 6-6, que contienen cada uno 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

R¹⁰ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo, alquil-C₂-C₆-carbonilo, bencilo, en donde el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

alternativamente R⁹ y R¹⁰ pueden unirse para formar un anillo saturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

25 R¹¹ es H o alquilo C₁-C₄;

30 R¹² es H, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquil-C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema anular saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema anular condensado 5-6, o con un sistema anular condensado 6-6, que contienen cada uno 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

alternativamente R¹¹ y R¹² pueden unirse para formar un anillo saturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

35 R¹³ es H, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquil-C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema anular saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema anular condensado 5-6, o con un sistema anular condensado 6-6, que contienen cada uno 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵; y

alternativamente R¹² y R¹³ pueden unirse para formar un anillo saturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵.

40 Otra realización de la presente descripción puede incluir una composición fungicida para el control o prevención del ataque fúngico que comprende los compuestos descritos más adelante y un material como vehículo fitológicamente aceptable.

45 Aún otra realización de la presente descripción puede incluir un método para el control o prevención del ataque fúngico sobre una planta, incluyendo el método las etapas de aplicar una cantidad fungicidamente eficaz de uno o más de los compuestos descritos más adelante al menos a uno del hongo, la planta, un área adyacente a la planta, y la semilla adaptada para producir la planta.

El término "alquilo" se refiere a una cadena carbonada ramificada, no ramificada o cíclica, que incluye metilo, etilo, propilo, butilo, isopropilo, isobutilo, butilo terciario, pentilo, hexilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo y similares.

50 El término "alqueno" se refiere a una cadena carbonada ramificada, no ramificada o cíclica que contiene uno o más enlaces dobles, que incluye etenilo, propenilo, butenilo, isopropenilo, isobutenilo, ciclohexenilo, y similares.

El término "alquino" se refiere a una cadena carbonada ramificada, no ramificada o cíclica que contiene uno o más enlaces triples, que incluye propinilo, butinilo y similares.

Como se emplea en toda esta memoria descriptiva, el término "R" se refiere al grupo que consiste en alquilo C_{2-8} , alquenilo C_{3-8} o alquinilo C_{3-8} , a menos que se indique lo contrario.

El término "alcoxi" se refiere a un sustituyente -OR.

El término "alcoxycarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-OR.

5 El término "alquilcarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-R.

El término "alquilsulfonilo" se refiere a un sustituyente -SO₂-R.

El término "haloalquilsulfonilo" se refiere a un sustituyente -SO₂-R donde R está totalmente o parcialmente sustituido con Cl, F, I o Br o cualquier combinación de los mismos.

El término "alquiltio" se refiere a un sustituyente -S-R.

10 El término "haloalquiltio" se refiere a un alquiltio que está sustituido con Cl, F, I, o Br o cualquier combinación de los mismos.

El término "halotio" se refiere a un azufre sustituido con tres o cinco sustituyentes F.

El término "alquilaminocarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-N(H)-R.

El término "dialquilaminocarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-NR₂.

15 El término "alquilcicloalquilamino" se refiere a un sustituyente cicloalquilamino que está sustituido con un grupo alquilo.

El término "trialquilsililo" se refiere a un sustituyente -SiR₃.

El término "ciano" se refiere a un sustituyente -C≡N.

El término "hidroxilo" se refiere a un sustituyente -OH.

20 El término "amino" se refiere a un sustituyente -NH₂.

El término "alquilamino" se refiere a un sustituyente -N(H)-R.

El término "dialquilamino" se refiere a un sustituyente -NR₂.

El término "alcoxialquilo" se refiere a una sustitución alcoxi sobre un alquilo.

25 El término "haloalcoxialquilo" se refiere a una sustitución alcoxi sobre un alquilo que está totalmente o parcialmente sustituido con Cl, F, Br o I, o cualquier combinación de los mismos.

El término "hidroxialquilo" se refiere a un alquilo que está sustituido con un grupo hidroxilo.

El término "haloalcoxi" se refiere a un sustituyente -OR-X, en donde X es Cl, F, Br, o I, o cualquier combinación de los mismos.

30 El término "haloalquilo" se refiere a un alquilo que está sustituido con Cl, F, I o Br, o cualquier combinación de los mismos.

El término "haloalquenilo" se refiere a un alquenilo que está sustituido con Cl, F, I o Br, o cualquier combinación de los mismos.

El término "haloalquinilo" se refiere a un alquinilo que está sustituido con Cl, F, I o Br, o cualquier combinación de los mismos.

35 El término "halógeno" o "halo" se refiere a uno o más átomos de halógeno, definidos como F, Cl, Br y I.

El término "hidroxicarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-OH.

El término "nitro" se refiere a un sustituyente -NO₂.

40 En toda la descripción, la referencia a los compuestos de Fórmula I se interpreta como que incluye también isómeros ópticos y sales de Fórmula I, e hidratos de los mismos. Específicamente, cuando la Fórmula I contiene un grupo alquilo de cadena ramificada, se entiende que tales compuestos incluyen isómeros ópticos y racematos de los mismos. Las sales ilustrativas incluyen: hidrocioruro, hidrobromuro, hidroyoduro y similares. Adicionalmente, los compuestos de Fórmula I pueden incluir formas tautoméricas.

Ciertos compuestos descritos en este documento pueden existir como uno o más isómeros. Los expertos en la técnica apreciarán que un isómero puede ser más activo que los otros. Las estructuras descritas en la presente descripción están dibujadas sólo en una forma geométrica por claridad, pero se pretende que representen todas las formas geométricas y tautoméricas de la molécula.

- 5 Otra realización de la presente descripción es un uso de un compuesto de Fórmula I, para la protección de una planta contra el ataque de un organismo fitopatogénico o el tratamiento de una planta infestada por un organismo fitopatogénico, que comprende la aplicación de un compuesto de Fórmula I, o una composición que comprende el compuesto, al suelo, una planta, una parte de una planta, las hojas y/o las semillas.

- 10 Adicionalmente, otra realización de la presente descripción es una composición útil para proteger una planta contra el ataque de un organismo fitopatogénico y/o el tratamiento de una planta infestada por un organismo fitopatogénico, que comprende un compuesto de Fórmula I y un material como vehículo fitológicamente aceptable.

Los rasgos y ventajas adicionales de la presente invención se harán evidentes para los expertos en la técnica tras la consideración de la siguiente descripción detallada de las realizaciones ilustrativas que ejemplifican el mejor modo de llevar a cabo la invención ahora percibida.

15 Descripción detallada de la presente descripción

- Los compuestos de la presente descripción pueden ser aplicados mediante cualquiera de diversas técnicas conocidas, bien como los compuestos o bien como formulaciones que comprenden los compuestos. Por ejemplo, los compuestos pueden ser aplicados a las raíces, semillas u hojas de las plantas para el control de diversos hongos, sin dañar el valor comercial de las plantas. Los materiales pueden ser aplicados en la forma de cualquiera de los tipos de formulación usados generalmente, por ejemplo, como soluciones, polvos, polvos humedecibles, concentrados capaces de fluir, o concentrados emulsionables.

- Preferiblemente, los compuestos de la presente descripción se aplican en la forma de una formulación, que comprende uno o más de los compuestos de Fórmula I con un vehículo fitológicamente aceptable. Las formulaciones concentradas pueden ser dispersadas en agua, u otros líquidos, para la aplicación, o las formulaciones pueden ser similares a polvo o granulares, que pueden ser aplicadas entonces sin tratamiento adicional. Las formulaciones pueden ser preparadas según procedimientos que son convencionales en la técnica química agrícola.

- La presente descripción contempla todos los vehículos mediante los que uno o más de los compuestos pueden ser formulados para administración y uso como fungicida. Por regla general, las formulaciones se aplican como suspensiones acuosas o emulsiones. Tales suspensiones o emulsiones se pueden producir a partir de formulaciones solubles en agua, suspendibles en agua o emulsionables, que son sólidos, conocidos usualmente como polvos humedecibles; o líquidos, conocidos usualmente como concentrados emulsionables, suspensiones acuosas, o concentrados en suspensión. Como se apreciará fácilmente, se puede usar cualquier material al que se puedan añadir estos compuestos, a condición de que produzca la utilidad deseada sin interferencia significativa con la actividad de estos compuestos como agentes antifúngicos.

- Los polvos humedecibles, que pueden ser compactados para formar gránulos dispersables en agua, comprenden una mezcla íntima de uno o más de los compuestos de Fórmula I, un vehículo inerte y tensioactivos. La concentración del compuesto en el polvo humedecible puede ser de aproximadamente 10 por ciento a aproximadamente 90 por ciento en peso, en base al peso total del polvo humedecible, más preferiblemente aproximadamente 25 por ciento en peso a aproximadamente 75 por ciento en peso. En la preparación de formulaciones de polvos humedecibles, los compuestos pueden ser mezclados con cualquier sólido finamente dividido, tal como profilita, talco, tiza, yeso, tierra de Fuller, bentonita, atapulgita, almidón, caseína, gluten, arcillas de montmorillonita, tierras de diatomeas, silicatos purificados o similares. En tales operaciones, el vehículo finamente dividido y los tensioactivos se mezclan típicamente con el (los) compuesto(s) y se muelen.

- Los concentrados emulsionables de los compuestos de Fórmula I pueden comprender una concentración conveniente, tal como de aproximadamente 10 por ciento en peso a aproximadamente 50 por ciento en peso del compuesto, en un líquido adecuado, en base al peso total del concentrado. Los compuestos pueden ser disueltos en un vehículo inerte, que es un disolvente miscible con el agua o bien una mezcla de disolventes orgánicos inmiscibles con el agua, y emulsionantes. Los concentrados pueden ser diluidos con agua y aceite para formar mezclas para pulverización en la forma de emulsiones aceite en agua. Los disolventes orgánicos útiles incluyen aromáticos, especialmente las partes naftalénicas y olefinicas de alto punto de ebullición del petróleo, tales como nafta aromática pesada. También se pueden usar otros disolventes orgánicos, por ejemplo, disolventes terpénicos, que incluyen derivados de rosinas, cetonas alifáticas, tales como ciclohexanona, y alcoholes complejos, tales como 2-etoxietanol.

- Los emulsionantes que se pueden emplear ventajosamente en la presente memoria pueden ser determinados fácilmente por los expertos en la técnica, e incluyen diversos emulsionantes no iónicos, aniónicos, catiónicos y anfóteros, o una mezcla de dos o más emulsionantes. Los ejemplos de emulsionantes no iónicos útiles en la preparación de los concentrados emulsionables incluyen los éteres de polialquilenglicol y productos de condensación de alquil- y arilfenoles, alcoholes alifáticos, aminas alifáticas o ácidos grasos con óxido de etileno,

óxidos de propileno tales como los alquifenoles etoxilados y ésteres carboxílicos solubilizados con el poliol o polioxilalquileno. Los emulsionantes catiónicos incluyen compuestos de amonio cuaternario y sales de aminas grasas. Los emulsionantes aniónicos incluyen las sales solubles en aceite (p.ej., calcio) de ácidos alquilarilsulfónicos, sales solubles en aceite o éteres de poliglicol sulfatados y sales apropiadas de éter de poliglicol fosfatado.

Los líquidos orgánicos representativos que se pueden emplear en la preparación de los concentrados emulsionables de los compuestos de la presente invención son los líquidos aromáticos tales como fracciones de xileno, propilbenceno; o fracciones de naftaleno mixtas, aceites minerales, líquidos orgánicos aromáticos sustituidos tales como ftalato de dioctilo; queroseno; dialquilamidas de diversos ácidos grasos, particularmente las dimetilamidas de glicoles grasos y derivados de glicol tales como el éter *n*-butílico, éter etílico o éter metílico de dietilenglicol, y el éter metílico de trietilenglicol y similares. También se pueden emplear mezclas de dos o más líquidos orgánicos en la preparación del concentrado emulsionable. Los líquidos orgánicos incluyen xileno y fracciones de propilbenceno, siendo el xileno el más preferido en algunos casos. Se emplean típicamente agentes dispersantes activos superficialmente en las formulaciones líquidas, y en una cantidad de 0,1 a 20 por ciento en peso en base al peso combinado del agente dispersante con uno o más de los compuestos. Las formulaciones también pueden contener otros aditivos compatibles, por ejemplo, reguladores del crecimiento de las plantas y otros compuestos biológicamente activos usados en la agricultura.

Las suspensiones acuosas comprenden suspensiones de uno o más compuestos de Fórmula I insolubles en agua, dispersados en un vehículo acuoso en una concentración en el intervalo de aproximadamente 5 a aproximadamente 50 por ciento en peso, en base al peso total de la suspensión acuosa. Las suspensiones se preparan moliendo finamente uno o más de los compuestos, y mezclando vigorosamente el material molido en un vehículo comprendido de agua y tensioactivos elegidos de los mismos tipos discutidos anteriormente. También se pueden añadir otros componentes, tales como sales inorgánicas y gomas naturales o sintéticas, para aumentar la densidad y viscosidad del vehículo acuoso. Es a menudo muy eficaz moler y mezclar al mismo tiempo preparando la mezcla acuosa y homogeneizándola en un instrumento tal como un molino de arena, molino de bolas, u homogeneizador de tipo pistón.

Las emulsiones acuosas comprenden emulsiones de uno o más ingredientes pesticidamente activos insolubles en agua emulsionados en un vehículo acuoso en una concentración típicamente en el intervalo de aproximadamente 5 a aproximadamente 50 por ciento en peso, en base al peso total de la emulsión acuosa. Si el ingrediente pesticidamente activo es un sólido, debe ser disuelto en un disolvente inmiscible con el agua adecuado antes de la preparación de la emulsión acuosa. Las emulsiones se preparan emulsionando el ingrediente pesticidamente activo líquido o solución inmiscible con el agua del mismo en un medio acuoso, típicamente con inclusión de tensioactivos que ayudan en la formación y estabilización de la emulsión descrita anteriormente. Esto se lleva a cabo a menudo con la ayuda de una mezcla vigorosa proporcionada por mezcladores u homogeneizadores de alto cizallamiento.

Los compuestos de Fórmula I también pueden ser aplicados como formulaciones granulares, que son particularmente útiles para aplicaciones al suelo. Las formulaciones granulares contienen generalmente de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 10 por ciento en peso, en base al peso total de la formulación granular, del (de los) compuesto(s), dispersados en un vehículo inerte que consiste enteramente o en gran parte en un material inerte dividido de forma gruesa tal como atapulgita, bentonita, diatomita, arcilla o una sustancia barata similar. Tales formulaciones se preparan usualmente disolviendo los compuestos en un disolvente adecuado y aplicando ello a un vehículo granular que ha sido preformado hasta el tamaño de partícula apropiado, en el intervalo de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 3 mm. Un disolvente adecuado es un disolvente en el que el compuesto es sustancialmente o completamente soluble. Tales formulaciones también se pueden preparar haciendo una masa o pasta del vehículo y el compuesto y el disolvente, y machacando y secando para obtener la partícula granular deseada.

Los polvos que contienen los compuestos de Fórmula I se pueden preparar mezclando íntimamente uno o más de los compuestos en forma de polvo con un vehículo agrícola en polvo adecuado, tal como, por ejemplo, arcilla de caolín, roca volcánica molida, y similares. Los polvos pueden contener adecuadamente de aproximadamente 1 a aproximadamente 10 por ciento en peso de los compuestos, en base al peso total del polvo.

Las formulaciones pueden contener adicionalmente tensioactivos adyuvantes para potenciar la deposición, humedecimiento y penetración de los compuestos en el cultivo y organismo diana. Estos tensioactivos adyuvantes se pueden emplear opcionalmente como un componente de la formulación o como una mezcla en tanque. La cantidad de tensioactivo adyuvante variará típicamente de 0,01 a 1,0 por ciento en volumen, en base a un volumen de pulverización de agua, preferiblemente 0,05 a 0,5 por ciento en volumen. Los tensioactivos adyuvantes adecuados incluyen, pero no se limitan a, nonilfenoles etoxilados, alcoholes etoxilados sintéticos o naturales, sales de los ésteres o ácidos sulfosuccínicos, organosiliconas etoxiladas, aminas grasas etoxiladas y mezclas de tensioactivos con aceites minerales o vegetales. Las formulaciones también pueden incluir emulsiones aceite en agua tales como las descritas en la solicitud de patente de EE.UU. con número de serie 11/495.228.

Las formulaciones pueden incluir opcionalmente combinaciones que contienen otros compuestos pesticidas. Tales compuestos pesticidas adicionales pueden ser fungicidas, insecticidas, herbicidas, nematocidas, miticidas,

artropodocidas, bactericidas o combinaciones de los mismos que sean compatibles con los compuestos de la presente invención en el medio seleccionado para la aplicación, y no antagónicos a la actividad de los presentes compuestos. Por consiguiente, en tales realizaciones, el otro compuesto pesticida se emplea como tóxico suplementario para el mismo uso pesticida o para un uso pesticida diferente. Los compuestos de Fórmula I y el compuesto pesticida en la combinación pueden estar presentes generalmente en una relación de pesos de 1:100 a 100:1.

Los compuestos de la presente descripción también pueden ser combinados con otros fungicidas para formar mezclas fungicidas y mezclas sinérgicas con los mismos. Los compuestos fungicidas de la presente descripción se aplican a menudo conjuntamente con uno o más otros fungicidas para controlar una variedad más amplia de enfermedades indeseables. Cuando se usan conjuntamente con otro(s) fungicida(s), los compuestos ahora reivindicados pueden ser formulados con el (los) otro(s) fungicida(s), mezclados en tanque con el (los) otro(s) fungicida(s), o aplicados secuencialmente con el (los) otro(s) fungicida(s). Tales otros fungicidas pueden incluir 2-(tiocianatometil)-benzotiazol, 2-fenilfenol, sulfato de 8-hidroxiquinolina, ametoctradina, amisulbrom, antimicina, *Ampelomyces quisqualis*, azaconazol, azoxistrobina, *Bacillus subtilis*, *Bacillus subtilis* cepa QST713, benalaxilo, benomilo, bentiavalicarb-isopropilo, sal bencilaminobenceno-sulfonato (BABS), bicarbonatos, bifenilo, bismertiazol, biteranol, bixafeno, blastidina-S, bórax, mezcla de Burdeos, boscalida, bromuconazol, bupirimato, polisulfuro de calcio, captafol, captan, carbendazim, carboxina, carpropamida, carvona, clazafenona, cloroneb, clorotalonilo, clozolinato, *Coniothyrium minitans*, hidróxido de cobre, octanoato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, sulfato de cobre (tribásico), óxido cuproso, ciazofamida, ciflufenamida, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, diazomet, debacarb, etilenbis-(ditiocarbamato) de diamonio, diclofluanida, diclorofeno, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat ión, diflumerim, dimetomorph, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinobuton, dinocap, difenilamina, ditianon, dodemorph, dodemorph acetato, dodina, dodina base libre, edifenphos, enestrobina, epoxiconazol, etaboxam, etoxiquina, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenoxanilo, fempiclonilo, fenpropidina, fenpropimorph, fempirazamina, fentina, fentina acetato, fentina hidróxido, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumorph, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutianilo, flutolanilo, flutriafol, fluxapiroxad, folpet, formaldehído, fosetilo, fosetilo-aluminio, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, guazatina acetatos, GY-81, hexaclorobenceno, hexaconazol, himexazol, imazalilo, imazalilo sulfato, imibenconazol, iminocadina, iminocadina acetato, iminocadina tris(albesilato), iodocarb, ipconazol, ipfempirazolona, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoprotilano, isopirazam, isotianilo, kasugamicina, kasugamicina hidrocloreto hidrato, kresoxim-metilo, laminarina, mancozeb, mandipropamida, maneb, mapanipirim, mepronilo, cloruro mercurio, óxido mercurio, cloruro mercurioso, metalaxilo, metenoxam, meptil-dinocap, metalaxilo-M, metam, metam-amonio, metam-potasio, metam-sodio, metconazol, metasulfocarb, yoduro de metilo, isotiocianato de metilo, metiram, metominostrobina, metrafenona, mildiomicina, miclobutanilo, nabam, nitroal-isopropilo, nuarimol, octilina, ofurace, ácido oleico (ácidos grasos), orisastrobina, oxadixilo, oxina-cobre, oxpoconazol fumarato, oxicarboxina, pefurazoato, penconazol, pencicuron, penflufeno, pentaclorofenol, laurato de pentaclorofenilo, pentiopirad, acetato de fenilmercurio, ácido fosfónico, ftalida, picoxistrobina, polioxina B, polioxinas, polioxorim, bicarbonato de potasio, sulfato de hidroxiquinolona potasio, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propamocarb hidrocloreto, propiconazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobina, pirametostrobina, piraoxistrobina, pirazophos, piribencarb, piributicarb, pirifenox, pirimetanilo, pirofenona, piroquilon, quinoxifeno, quinoxifeno, quinoxifeno, extracto de *Reynoutria sachalinensis*, sedaxano, siltiofam, simconazol, 2-fenilfenóxido de sodio, bicarbonato de sodio, pentaclorofenóxido de sodio, espiroxamina, azufre, SYP-Z071, SYP-Z048, aceites de alquitrán, tebuconazol, tebufloquina, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifulazamida, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tolclorfen-metilo, tolilfluanida, triadimefon, triadimenol, triazóxido, triciclazol, tridemorph, trifloxistrobina, triflumizol, triforina, triticonazol, validamicina, valifenalato, velifenal, vinclozolina, zineb, ziram, zoxamida, *Candida oleophila*, *Fusarium oxysporum*, *Gliocladium* spp., *Phlebiopsis gigantea*, *Streptomyces griseoviridis*, *Trichoderma* spp., (RS)-N-(3,5-diclorofenil)-2-(metoximetil)-succinimida, 1,2-dicloropropano, 1,3-dicloro-1,1,3,3-tetrafluoroacetona hidrato, 1-cloro-2,4-dinitroftaleno, 1-cloro-2-nitropropano, 2-(2-heptadecil-2-imidazolin-1-il)etanol, 2,3-dihidro-5-fenil-1,4-ditiina 1,1,4,4-tetraóxido, acetato de 2-metoxietilmercurio, cloruro de 2-metoxietilmercurio, silicato de 2-metoxietilmercurio, 3-(4-clorofenil)-5-metilrodanina, 4-(2-nitroprop-1-enil)feniltiocianato, ampropilfos, anilazina, polisulfuro de bario, Bayer 32394, benodanilo, benquinox, bentluron, benzamacrilo, benzamacrilo-isobutilo, benzamorf, binapacrilo, sulfato de bis(metilmercurio), óxido de bis(tributilestaño), butiobato, cromato sulfato de cadmio calcio cobre cinc, carbamorph, CECA, clobentiazona, cloranifmetan, clorfenazol, clorquinox, climbazol, ciclafuramida, cipendazol, ciprofuram, decafentina, diclona, diclozolina, diclobutrazol, dimetirimol, dinocron, dinosulfon, dinoterbon, dipiritiona, ditalimfos, dodicina, drazoxolon, EBP, ESBP, etaconazol, etem, etirim, fenaminosulf, fenapanilo, fenitropan, 5-fluorocitosina y profungicidas de la misma, fluotrimazol, furcarbanilo, furconazol, furconazol-cis, furmeciclox, furofanato, gliodina, griseofulvina, halacrinato, Hercules 3944, hexiltiofos, ICIA0858, isopamphos, isovallediona, mebenilo, mecarbinzida, metazoxolon, metfuroxam, diciandiamida de metilmercurio, metsulfovax, milneb, anhídrido mucoclórico, miclozolina, N-3,5-diclorofenil-succinimida, N-3-nitrofenilitaconimida, natamicina, N-etilmercurio-4-toluenosulfonanilida, bis(dimetilditiocarbamato) de níquel, OCH, dimetilditiocarbamato de fenilmercurio, nitrato de fenilmercurio, fosdifeno, picolanimida UK-2A y derivados de la misma, protiocarb, protiocarb hidrocloreto, piracarbolido, piridinitrilo, piroxiclor, piroxifur, quinacetol, quinacetol sulfato, quinazamida, quinconazol, rabenzazol, salicilanilida, SSF-109, sultropen, tecoram, triadiflor, ticiofeno, tioclorfenim, tiofanato, tioquinox, tioximida, triamiphos, triarimol, triazbutilo, triclámida, urbacida, y zarilamida, y cualesquiera combinaciones de los mismos.

Adicionalmente, los compuestos de la presente invención se pueden combinar con otros pesticidas, que incluyen insecticidas, nematocidas, miticidas, artropodocidas, bactericidas o combinaciones de los mismos que sean compatibles con los compuestos de la presente invención en el medio seleccionado para la aplicación, y no antagónicos a la actividad de los presentes compuestos para formar mezclas pesticidas y mezclas sinérgicas de los mismos. Los compuestos fungicidas de la presente descripción pueden ser aplicados conjuntamente con uno o más otros pesticidas para controlar una variedad más amplia de plagas indeseables. Cuando se usan conjuntamente con otros pesticidas, los compuestos ahora reivindicados pueden ser formulados con el (los) otro(s) pesticida(s), mezclados en tanque con el (los) otro(s) pesticida(s), o aplicados secuencialmente con el (los) otro(s) pesticida(s).

Los insecticidas típicos incluyen, pero no se limitan a: *insecticidas antibióticos* tales como alosamidina y thuringiensina; *insecticidas de lactona macrocíclica* tales como espinosad y espinetoram; *insecticidas de avermectina* tales como abamectina, doramectina, emamectina, eprinomectina, ivermectina y selamectina; *insecticidas de milbemicina* tales como lepimectina, milbemectina, milbemectina oxima y moxidectina; *insecticidas arsenicales* tales como arseniato de calcio, acetoarsenito de cobre, arseniato de cobre, arseniato de plomo, arsenito de potasio y arsenito de sodio; *insecticidas botánicos* tales como anabasina, azadirachtina, *d*-limoneno, nicotina, piretrinas, cinerinas, cinerina I, cinerina II, jasmolina I, jasmolina II, piretrina I, piretrina II, quassia, rotenona, ryania y sabadilla; *insecticidas de carbamato* tales como bendiocarb y carbarilo; *insecticidas de metilcarbamato de benzofuranilo* tales como benfuracarb, carbofuran, carbosulfan, decarbofuran y furatiocarb; *insecticidas de dimetilcarbamato* tales como dimitan, dimetilan, hiquincarb y pirimicarb; *insecticidas de oxima carbamato* tales como alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, butocarboxim, butoxicarboxim, metomilo, nitrilacarb, oxamilo, tazimcarb, tiocarboxima, tiodicarb y tiofanox; *insecticidas de metilcarbamato de fenilo*, tales como alixicarb, aminocarb, bufencarb, butacarb, carbanolato, cloetocarb, dicresilo, dioxacarb, EMPC, etiofencarb, fenetacarb, fenobucarb, iosprocarb, metiocarb, metolcarb, mexacarbato, promacilo, promecarb, propoxur, trimetacarb, XMC y xilicarb; *insecticidas desecantes* tales como ácido bórico, tierra de diatomeas y gel de sílice; *insecticidas de diamida* tales como clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida; *insecticidas de dinitrofenol* tales como dinex, diniprop, dinosam y DNOC; *insecticidas de flúor* tales como hexafluorosilicato de bario, criolita, fluoruro de sodio, hexafluorosilicato de sodio y sulfluramida; *insecticidas de formamida* tales como amitraz, clordimeform, formetanato y formparanato; *insecticidas fumigantes* tales como acrilonitrilo, disulfuro de carbono, tetracloruro de carbono, cloroformo, cloropicrina, para-diclorobenceno, 1,2-dicloropropano, formiato de etilo, dibromuro de etileno, metilcloroformo, cloruro de metileno, naftaleno, fosfina, fluoruro de sulfuro y tetracloroetano; *insecticidas inorgánicos* tales como bórax, polisulfuro de calcio, oleato de cobre, cloruro mercurioso, tiocianato de potasio y tiocianato de sodio; *inhibidores de la síntesis de quitina* tales como bistrifluron, buprofezina, clorfuazuron, ciromazina, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, penfluron, teflubenzuron y triflumuron; *mimicos de la hormona juvenil* tales como epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, kinopreno, metopreno, piriproxifeno y tripreno; *hormonas juveniles* tales como hormona juvenil I, hormona juvenil II y hormona juvenil III; *agonistas de la hormona de la muda* tales como cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida; *hormonas de la muda* tales como α -ecdisona y ecdisterona; *inhibidores de la muda* tales como difenolan; *precocenos* tales como precoceno I, precoceno II y precoceno III; *reguladores del crecimiento de insectos no clasificados* tales como diciclanilo; *insecticidas análogos a la nereistoxina* tales como bensultap, cartap, tiociclam y tiosultap; *insecticidas nicotinoides* tales como flonicamid; *insecticidas de nitroguanidina* tales como clotianidina, dinotefuran, imidacloprida y tiametoxam; *insecticidas de nitrometileno* tales como nitempiram y nitiazina; *insecticidas de piridilmetil-amina* tales como acetamiprid, imidacloprid, nitempiram y tiacloprid; *insecticidas de organocloro* tales como bromo-DDT, camfeclor, DDT, pp'-DDT, etil-DDD, HCH, gamma-HCH, lindano, metoxiclor, pentaclorofenol y TDE; *insecticidas de ciclodieno* tales como aldrin, bromociclen, clorbiclen, clordano, clordecona, dieldrin, dilor, endosulfan, alfa-endosulfan, endrin, HEOD, heptaclor, HHDN, isobenzan, isodrin, kelevan y mirex; *insecticidas de organofosfato* tales como bromfenvinfos, clorfenvinfos, crotoxyphos, diclorvos, dicrotophos, dimetilvinphos, fospirato, heptenophos, metocrotophos, mevinphos, monocrotophos, naled, naftalofos, fosfamidon, propaphos, TEPP y tetraclorvinphos; *insecticidas de organotiofosfato* tales como dioxabenzofos, fosmetilan y fentoato; *insecticidas de organotiofosfato alifático* tales como acetion, amiton, cadusafos, cloretoxyphos, clormephos, demephion, demephion-O, demephion-S, demeton, demeton-O, demeton-S, demeton-metilo, demeton-O-metilo, demeton-S-metilo, demeton-S-metilsulphon, disulfoton, ethion, ethoprophos, IPSP, isotioato, malation, metacrifos, oxidemeton-metilo, oxideprofos, oxidisulfoton, forato, sulfotep, terbufos y tiometon; *insecticidas de organotiofosfato de amida alifática* tales como amidition, ciantoato, dimetoato, etoato-metilo, formotion, mecarbam, ometoato, protoato, sofamida y vamidotion; *insecticidas de organotiofosfato de oxima* tales como clorphoxim, phoxim y phoxim-metilo; *insecticidas de organotiofosfato heterocíclico* tales como azametiphos, coumaphos, coumitoato, dioxation, endotion, menazon, morfotion, fosalona, piraclafos, piridafention y quinotion; *insecticidas de organotiofosfato de benzotipirano* tales como diticrofos y ticrofos; *insecticidas de organotiofosfato de benzotriazina* tales como azinphos-etilo y azinphos-metilo; *insecticidas de organotiofosfato de isoindol* tales como dialifos y phosmet; *insecticidas de organotiofosfato de isoxazol* tales como isoxation y zolaprofos; *insecticidas de organotiofosfato de pirazolopirimidina* tales como clorprazophos y pirazophos; *insecticidas de organotiofosfato de piridina* tales como clorpirifos y clorpirifos-metilo; *insecticidas de organotiofosfato de pirimidina* tales como butathiofos, diazinon, etrimfos, lirimfos, pirimiphos-etilo, pirimiphos-metilo, pirimidophos, pirimitato y tebupirimfos; *insecticidas de organotiofosfato de quinoxalina* tales como quinalphos y quinalphos-metilo; *insecticidas de organotiofosfato de tiadiazol* tales como athidathion, lythidation, methidathion y prothidathion; *insecticidas de organotiofosfato de triazol* tales como isazofos y triazophos; *insecticidas de organotiofosfato de fenilo* tales como azotoato, bromophos, bromophos-etilo, carbophenotion, clortiophos, cianophos, citioato, dicapton, diclofention, etaphos, famphur, fenclorphos, fenitrotion, fensulfotion, fention, fention-etilo, heterophos, jodfenphos, mesulfenfos, paration, paration-metilo, phenkapton, phosniclor, profenofos, protiofos,

sulprofos, temephos, triclormetaphos-3 y trifenofos; *insecticidas de fosfonato* tales como butonato y triclorfon; *insecticidas de fosfonotioato* tales como mecarphon; *insecticidas de etilfosfonotioato de fenilo* tales como fonofos y tricloronat; *insecticidas de fenilfosfonotioato de fenilo* tales como cianofenphos, EPN y leptophos; *insecticidas de fosforamido* tales como dimefox, mazidox, mipafox y schradan; *insecticidas de oxadiazina* tales como indoxacarb; *insecticidas de oxadiazolina* tales como metoxadiazona; *insecticidas de ftalimida* tales como dialifos, phosmet y tetrametrina; *insecticidas de pirazol* tales como tebufenpyrad, tolefenpyrad; *insecticidas de fenilpirazol* tales como acetoprol, etiprol, fipronil, pirafluprol, piriprol y vaniliprol; *insecticidas de éster piretroide* tales como acrinatrina, aletrina, bioaletrina, bartrina, bifentrina, bioetanometrina, cilcetrina, ciclotriona, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cianotrina, lambda-cianotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, teta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, dimeflutrina, dimetrina, empenetrina, fenflutrina, fenpiritrina, fenpropatrina, fenvalerato, esfenvalerato, flucitrinato, fluvalinato, tau-fluvalinato, fuertrina, imiprotrina, meperflutrina, metoflutrina, permetrina, biopermetrina, transpermetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, piresmetrina, ersmetrina, bioersmetrina, cismetrina, teflutrina, teraletrina, tetrametrina, tetrametilflutrina, tralometrina y translutrina; *insecticidas de éster piretroide* tales como etofenprox, flufenprox, halfenprox, protrifenbut y silafluofen; *insecticidas de piridinamina* tales como flufenimer y pirimidifen; *insecticidas de pirrol* tales como clorfenapyr; *insecticidas de ácido tetrámico* tales como espirotetramat; *insecticidas de ácido tetrónico* tales como espiromesifen; *insecticidas de tiourea* tales como diafenthiuron; *insecticidas de urea* tales como flucufuron y sulcofuron; e *insecticidas no clasificados* tales como closantel, naftenato de cobre, crotamiton, EXD, fenazaflor, fenoxacrim, hidrametilnon, isoprotiolano, malonoben, metaflumizona, nifluridida, plifenato, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazon, raxoxanida, sulfoxaflor, triaraten y triazamato, y cualesquiera combinaciones de los mismos.

Adicionalmente, los compuestos de la presente invención se pueden combinar con herbicidas que sean compatibles con los compuestos de la presente invención en el medio seleccionado para la aplicación, y no antagónicos a la actividad de los presentes compuestos para formar mezclas pesticidas y mezclas sinérgicas de los mismos. Los compuestos fungicidas de la presente descripción pueden ser aplicados conjuntamente con uno o más otros herbicidas para controlar una variedad más amplia de plagas indeseables. Cuando se usan conjuntamente con herbicidas, los compuestos ahora reivindicados pueden ser formulados con el (los) otro(s) herbicida(s), mezclados en tanque con el (los) herbicida(s), o aplicados secuencialmente con el (los) herbicida(s). Los herbicidas típicos incluyen, pero no se limitan a: *herbicidas de amida* tales como alidoclor, beflubutamida, benzadox, benzipram, bromobutida, cafenstrol, CDEA, ciprazol, dimetenamida, dimetenamida-P, difenamida, epronaz, etnipromida, fentrazamida, flupoxam, fomesafeno, halosafeno, isocarbamida, isoxabeno, napropamida, naptalam, petoxamida, propizamida, quinonamida y tebutam; *herbicidas de anilida* tales como cloranocrilo, cisanilida, clomeprop, cipromida, diflufenican, etobenzamida, fenasulam, flufenacet, flufenican, mefenacet, mefluidida, metamifop, monalida, naproanilida, pentanoclor, picolinafeno y propanilo; *herbicidas de arilalanina* tales como benzoilprop, flamprop y flamprop-M; *herbicidas de cloroacetanilida* tales como acetoclor, alaclor, butaclor, delaclor, dietatilo, dimetacolor, metazacolor, metolacolor, S-metolacolor, pretilacolor, propacolor, propisocolor, prinacolor, terbutacolor, tenilcolor y xilacolor; *herbicidas de sulfoanilida* tales como benzo fluor, perfluidona, pirimisulfan y profluazol; *herbicidas de sulfonamida* tales como asulam, carbasulam, efenasulam y orizalina; *herbicidas de tioamida* tales como clortiamida; herbicidas antibióticos tales como bilanafos; *herbicidas de ácido benzoico* tales como clorambeno, dicamba, 2,3,6-TBA y tricamba; *herbicidas de ácido pirimidiniloxibenzoico* tales como bispiribaco y piriminobaco; *herbicidas de ácido pirimidiniltiobenzoico* tales como piritiobaco; *herbicidas de ácido ftálico* tales como clortal; *herbicidas de ácido picolínico* tales como aminopirialida, clopiralida y picloram; *herbicidas de ácido quinolinacarboxílico* tales como picloracolor y quinmeraco; *herbicidas arsenicales* tales como ácido cacodílico, CMA, DSMA, hexafluorato, MAA, MAMA, MSMA, arsenito de potasio y arsenito de sodio; *herbicidas de benzoilciclohexanodiona* tales como mesotriona, sulcotriona, tefuriltriona y tembotriona; *herbicidas de alquilsulfonato de benzofuranilo* tales como benfuresato y etofumesato; *herbicidas de benzotiazol* tales como benzazolin; *herbicidas de carbamato* tales como asulam, carboxazol clorprocarb, diclormato, fenasulam, karbutilato y terbucarb; *herbicidas de carbanilato* tales como barban, BCPC, carbasulam, carbetamida, CEPC, clorbufam, clorpropham, CPPC, desmedipham, phenisopham, phenmedipham, phenmedipham-etilo, propham y swep; *herbicidas de ciclohexeno oxima* tales como alloxidim, butroxidim, cletodim, cloproxidim, cicloxidim, profoxidim, setoxidim, tepraloxidim y tralcoxidim; *herbicidas de ciclopropilisoxazol* tales como isoxaclortol y isoxaflutol; *herbicidas de dicarboximida* tales como cinidon-etilo, flumezina, flumicloraco, flumioxazina y flumipropina; *herbicidas de dinitroanilina* tales como benfluralin, butralin, dinitramina, etalfuralina, flucloalrina, isopropalina, metalpropalina, nitalina, orizalina, pendimetalina, prodiamina, profluralina y trifluralina; *herbicidas de dinitrofenol* tales como dinofenato, dinoprop, dinosam, dinoseb, dinoterb, DNOC, etinofeno y medinoterb; *herbicidas de éster difenílico* tales como etoxifen; *herbicidas de éster nitrofenílico* tales como acifluorfen, aclonifeno, bifenox, clometoxifeno, clornitrofen, etnipromida, fluorodifeno, fluoroglicofeno, fluoronitrofen, fomesafen, furiloxifeno, halosafen, lactofeno, nitrofen, nitrofluorfen y oxifluorfen; *herbicidas de ditiocarbamato* tales como dazomet y metam; *herbicidas alifáticos halogenados* tales como alorac, cloropon, dalapon, flupropanato, hexafluoroacetona, yodometano, bromuro de metilo, ácido monocloroacético, SMA y TCA; *herbicidas de imidazolinona* tales como imazametabenz, imazamox, imazapico, imazapir, imazaquina e imazetapir; *herbicidas inorgánicos* tales como sulfamato de amonio, bórax, clorato de calcio, sulfato de cobre, sulfato ferroso, azida de potasio, cianato de potasio, azida de sodio, clorato de sodio y ácido sulfúrico; *herbicidas de nitrilo* tales como bromobonilo, bromoxinilo, cloroxinilo, diclobenilo, iodobenilo, ioxinilo y piraclonilo; *herbicidas de organofósforo* tales como amiprofos-metilo, anilofos, bensulida, bilanfos, butamifos, 2,4-DEP, DMPA, EBEP, fosamina, glufosinato, glufosinato-P, glifosato y piperofos; *herbicidas de fenoxi* tales como bromofenoxim, clomeprop, 2,4-DEB, 2,4-*DEP, difenopenten, disul, erbon, etnipromida, fenteracol y trifopsime; *herbicidas de oxadiazolina* tales

como metazol, oxadiargilo, oxadiazon; *herbicidas de oxazol* tales como fenoxasulfona; *herbicidas fenoxiacéticos* tales como 4-CPA, 2,4-D, 3,4-DA, MCPA, MCPA-tioetilo y 2,4,5-T; *herbicidas fenoxibutíricos* tales como 4-CPB, 2,4-DB, 3,4-DB, MCPB y 2,4,5-TB; *herbicidas fenoxipropiónicos* tales como cloprop, 4-CPP, diclorprop, diclorprop-P, 3,4-DP, fenoprop, mecoprop y mecoprop-P; *herbicidas ariloxifenoxipropiónicos* tales como clorazifop, clodinafop, clofop, cihalofof, diclofop, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fentiafop, fluazifop, fluazifop-P, haloxifop, haloxifop-P, isoxapirifop, metamifop, propaquizafop, quizalofop, quizalofop-P y trifop; *herbicidas de fenilendiamina* tales como dinitramina y prodiamina; *herbicidas de pirazol* tales como piroxasulfona; *herbicidas de benzoilpirazol* tales como benzofenap, pirasulfotol, pirazolinato, pirazoxifeno, y topamezona; *herbicidas de fenilpirazol* tales como fluazolato, nipiraclofen, pioxadeno y piraflufeno; *herbicidas de piridazina* tales como credazina, piridafol y piridato; *herbicidas de piridazinona* tales como brompirazon, cloridazon, dimidazon, flufenpir, metflurazon, norflurazon, oxapirazon y pidanon; *herbicidas de piridina* tales como aminopirialida, clidionato, clopiralida, ditiopir, fluroxipir, haloxidina, picloram, picolinafeno, piriclor, tiazopir y triclopir; *herbicidas de pirimidinadiamina* tales como iprimidam y tioclorim; *herbicidas de amonio cuaternario* tales como ciperquat, dietamquat, difenzoquat, diquat, morfamquat y paraquat; *herbicidas de tiocarbamato* tales como butilato, cicloato, di-allato, EPTC, esprocarb, etiolato, isopolinato, metiobencarb, molinato, orbencarb, pebulato, prosulfocarb, piributicarb, sulfalato, tiobencarb, tiocarbazil, tri-allato y vernolato; *herbicidas de tiocarbonato* tales como dimexano, EXD y proxan; *herbicidas de tiourea* tales como metiuron; *herbicidas de triazina* tales como dipropetrina, indaziflam, triaziflam y trihidroxitriazina; *herbicidas de clorotriazina* tales como atrazina, clorazina, cianazina, ciprazina, eglinazina, ipazina, mesoprazina, prociazina, proglinazina, propazina, sebutilazina, simazina, terbutilazina y trietazina; *herbicidas de metoxitriazina* tales como atraton, metometon, prometon, secbumeton, simeton y terbumeton; *herbicidas de metiltiotriazina* tales como ametrina, aziprotina, cianatrina, desmetrina, dimetametrina, metoprotina, prometrina, simetrina y terbutrina; *herbicidas de triazinona* tales como ametriflona, amibuzina, hexazinona, isometiozina, metamitron y metribuzina; *herbicidas de triazol* tales como amitrol, cafenstrol, epronaz y flupoxam; *herbicidas de triazolona* tales como amicarbazona, bencarbazona, carfentrazona, flucarbazona, ipfencarbazona, propoxicarbazona, sulfentrazona y tiencarbazona-metilo; *herbicidas de triazolopirimidina* tales como cloransulam, diclosulam, florasulam, flumetsulam, metosulam, penoxsulam y piroxsulam; *herbicidas de uracilo* tales como benzfendizona, bromacilo, butafenacilo, flupropacilo, isocilo, lenacilo, safluefnacilo y terbacilo; *herbicidas de urea* tales como benztiazuron, cumiluron, cicluron, dicloralurea, diflufenzopir, isonoruron, isouron, metabenztiazuron, monisouron y noruron; *herbicidas de fenilurea* tales como anisuron, buturon, clorbromuron, cloreturon, clorotoluron, cloroxuron, daimuron, difenoxuron, dimefuron, diuron, fenuron, fluometuron, fluotiuron, isoproturon, linuron, metiuron, metildimron, metobenzuron, metobromuron, metoxuron, monolinuron, monuron, neburon, parafluron, fenobenzuron, siduron, tetrafluron y tidiazuron; *herbicidas de pirimidinilsulfonilurea* tales como amidosulfuron, azimsulfuron, bensulfuron, clorimuron, ciclosulfamuron, etoxisulfuron, flazasulfuron, flucetosulfuron, flupirsulfuron, foramsulfuron, halosulfuron, imazosulfuron, mesosulfuron, metazosulfuron, nicosulfuron, ortosulfamuron, oxasulfuron, primisulfuron, propirisulfuron, pirazosulfuron, rimsulfuron, sulfometuron, sulfosulfuron y trifloxisulfuron; *herbicidas de triazinilsulfonilurea* tales como clorsulfuron, cinosulfuron, etametsulfuron, iodosulfuron, metsulfuron, prosulfuron, tifsulfuron, triasulfuron, tribenuron, triflusulfuron y tidiazuron; *herbicidas de tiadiazolilurea* tales como butiuron, etidimuron, tebutiuron, tiazafluron y tidiazuron; y *herbicidas no clasificados* tales como acroleína, alcohol alílico, aminociclopiraclor, azafenidina, bentazona, benzobiciclon, biciclopirona, butidazol, cianamida de calcio, cambendiclor, clorfenaco, clorfenprop, clorflurazol, clorflurenol, cinmetilina, clomazona, CPMF, cresol, cianamida, orto-diclorobenceno, dimepiperato, endotal, fluoromidina, fluridona, fluocloridona, flurtamona, flutiacet, indanofano, isotiocianato de metilo, OCH, oxaziclomefona, pentaclorofenol, pentoxazona, acetato de fenilmercurio, prosulfalina, piribenzoxim, piriftalida, quinoclamina, rodetanilo, sulglicapina, tidiazimina, tridifano, trimeturon, tripropindan y tritaco.

Otra realización de la presente descripción es un método para el control o prevención del ataque fúngico. Este método comprende aplicar al suelo, planta, raíces, hojas, semilla o locus del hongo, o a un locus donde se va a prevenir la infestación (por ejemplo aplicación a plantas de cereal o uva), una cantidad fungicidamente eficaz de uno o más de los compuestos de Fórmula I. Los compuestos son adecuados para el tratamiento de diversas plantas a niveles fungicidas, a la vez que exhiben una baja fitotoxicidad. Los compuestos pueden ser útiles tanto de un modo protector como erradicador.

Se ha encontrado que los compuestos tienen un efecto fungicida significativo, particularmente para uso agrícola. Muchos de los compuestos son particularmente eficaces para el uso con cultivos agrícolas y plantas de hortocultivo. Beneficios adicionales pueden incluir, pero no se limitan a, mejorar la salud de una planta; mejorar el rendimiento de una planta (p.ej. biomasa aumentada y/o contenido aumentado de ingredientes valiosos); mejorar el vigor de una planta (p.ej. crecimiento de la planta mejorado y/o hojas más verdes); mejorar la calidad de una planta (p.ej. contenido o composición mejorados de ciertos ingredientes); y mejorar la tolerancia a la tensión abiótica y/o biótica de la planta.

Los expertos en la técnica entenderán que la eficacia del compuesto para los hongos anteriores establece la utilidad general de los compuestos como fungicidas.

Los compuestos tienen amplios intervalos de actividad contra patógenos fúngicos. Los patógenos ilustrativos pueden incluir, pero no se limitan a, mancha de las hojas del trigo (*Septoria tritici*, también conocido como *Mycosphaerella graminicola*), sarna del manzano (*Venturia inaequalis*), y manchas de las hojas de remolachas azucareras por *Cercospora* (*Cercospora beticola*), manchas de las hojas de cacahuete (*Cercospora arachidicola* y *Cercosporidium personatum*) y otros cultivos, y la sigatoka negra de los plátanos (*Mycosphaerella fijiensis*). La cantidad exacta del

material activo a ser aplicada es dependiente no sólo del material activo específico que se aplica, sino también de la acción particular deseada, la especie fúngica a ser controlada y la fase de crecimiento de la misma, así como la parte de la planta u otro producto a ser puesto en contacto con el compuesto. Por tanto, todos los compuestos, y formulaciones que contienen los mismos, pueden no ser igualmente eficaces a concentraciones similares o contra la misma especie fúngica.

Los compuestos son eficaces en el uso con plantas en una cantidad inhibitoria de la enfermedad y fitológicamente aceptable. La expresión "cantidad inhibitoria de la enfermedad y fitológicamente aceptable" se refiere a una cantidad de un compuesto que elimina o inhibe la enfermedad de la planta para la que se desea el control, pero no es significativamente tóxica para la planta. Esta cantidad será generalmente de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 1.000 ppm (partes por millón), siendo preferido 1 a 500 ppm. La cantidad exacta de un compuesto requerida varía con la enfermedad fúngica a ser controlada, el tipo de formulación empleada, el método de aplicación, la especie de planta particular, las condiciones climáticas, y similares. Una tasa de aplicación adecuada está típicamente en el intervalo de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 0,45 gramos por metro cuadrado, g/m² (aproximadamente 0,10 a aproximadamente 4 libras/acre).

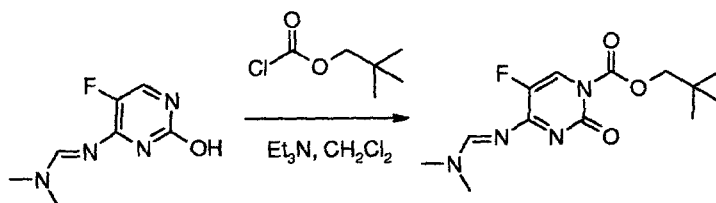
Cualquier intervalo o valor deseado dado en la presente memoria puede ser extendido o alterado sin perder los efectos buscados, como es evidente para el experto en la materia para un entendimiento de las enseñanzas de la presente memoria.

Los compuestos de Fórmula I se pueden preparar usando procedimientos químicos bien conocidos. Los compuestos intermedios no mencionados específicamente en esta descripción están disponibles en el mercado, se pueden preparar mediante rutas descritas en la bibliografía química, o bien pueden ser sintetizados fácilmente a partir de materiales de partida comerciales utilizando procedimientos estándar.

Los siguientes ejemplos se presentan para ilustrar los diversos aspectos de los compuestos de la presente descripción, y no deben ser interpretados como limitaciones a las reivindicaciones.

Ejemplos

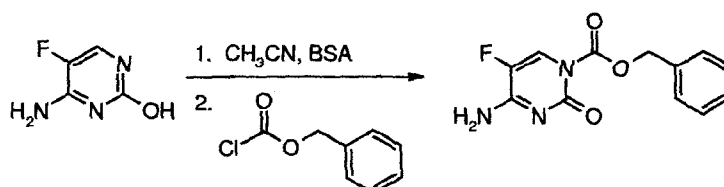
Ejemplo 1: Preparación de éster 2,2-dimetil-propílico del ácido 4-(dimetilamino-metilenamino)-5-fluoro-2-oxo-2H-pirimidina-1-carboxílico (1)



A un vial con tapa a rosca de 8 ml se añadió diclorometano (CH₂Cl₂; 3 mililitros (ml)), *N'*-(5-fluoro-2-hidroxi-pirimidin-4-il)-*N,N*-dimetilformamida (100 miligramos (mg), 0,54 milimoles (mmol)), trietilamina (Et₃N; 120 mg, 1,18 mmol), y cloroformato de 2,2-dimetilpropilo (90 mg, 0,60 mmol). Después de agitar durante 1,5 horas (h) a temperatura ambiente, la mezcla se repartió entre acetato de etilo (EtOAc) y agua (H₂O). La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio (MgSO₄), se filtró, y se evaporó. El material bruto se purificó por cromatografía de fase inversa para dar éster 2,2-dimetil-propílico del ácido 4-(dimetilamino-metilenamino)-5-fluoro-2-oxo-2H-pirimidina-1-carboxílico como un sólido blanco (33 mg, 20%): pf 162-164 °C; ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 8,77 (s, 1H), 7,93 (d, *J* = 6,6 Hz, 1H), 4,08 (s, 2H), 3,27 (s, 3H), 3,20 (s, 3H), 1,05 (s, 9H); ESIMS *m/z* 299 ([M+H]⁺).

Los compuestos 23-26 se prepararon usando un procedimiento similar al Ejemplo 1.

Ejemplo 2: Preparación de 4-amino-5-fluoro-2-oxopirimidina-1(2H)-carboxilato de bencilo (2)

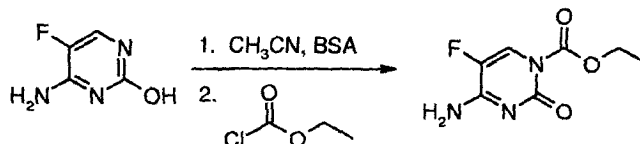


A una suspensión de 4-amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol* (0,5 g, 3,87 mmol) en acetonitrilo (CH₃CN; 10 ml) se añadió *N,O*-bis(trimetilsilil)acetamida (BSA; 1,42 ml, 5,81 mmol), y la mezcla se calentó a 55 °C durante 1,5 h. La disolución resultante se enfrió hasta la temperatura ambiente y a ella se añadió cloroformato de bencilo (1,38 ml, 9,67 mmol) causando un ligero exotermo. Después de 10 minutos (min), se formó un precipitado blanco que se dejó en agitación.

a temperatura ambiente durante una noche. El sólido se filtró por succión y se lavó con éter dietílico (Et₂O; 2 x 10 ml), CH₃CN (1 x 3 ml) y de nuevo con Et₂O (2 x 10 ml) para dar 4-amino-5-fluoro-2-oxopirimidina-1(2*H*)-carboxilato de bencilo (0,515 g, 50%) como un sólido blanco; pf 212-215 °C; ¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,35 (s, 1H), 8,07 (s, 1H), 8,04 (d, *J* = 7,25 Hz, 1H), 7,48-7,45 (m, 2H), 7,41-7,34 (m, 3H), 5,32 (s, 2H); ESIMS *m/z* 264 ([M+H]⁺).

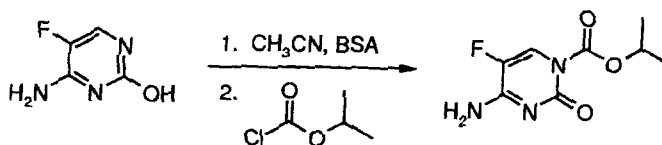
5 * el 4-amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol puede ser adquirido en el mercado.

Ejemplo 3: Preparación de 4-amino-5-fluoro-2-oxopirimidina-1(2*H*)-carboxilato de etilo (3)



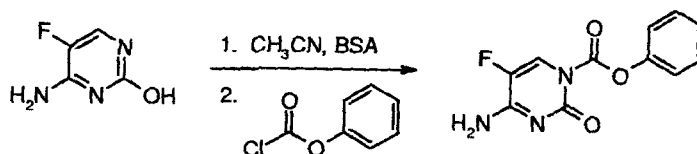
10 Usando el procedimiento del Ejemplo 2, se hicieron reaccionar 4-amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol (0,25 g, 1,9 mmol), BSA (1,41 ml, 5,8 mmol) y cloroformato de etilo (0,277 ml, 2,9 mmol), y el material resultante se purificó por cromatografía de fase inversa (gradiente, CH₃CN/H₂O) para dar 4-amino-5-fluoro-2-oxopirimidina-1(2*H*)-carboxilato de etilo (0,098 g, 25,6%) como un sólido blanco: pf 190-193 °C; ¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,29 (s, 1H), 8,04-8,01 (m, 2H), 4,27 (q, *J* = 7,25 Hz, 2H), 1,26 (t, *J* = 7,25 Hz, 3H); ESIMS *m/z* 200 ([M-H]⁻).

Ejemplo 4: Preparación de 4-amino-5-fluoro-2-oxopirimidina-1(2*H*)-carboxilato de isopropilo (4)



15 Usando el procedimiento del Ejemplo 2, se hicieron reaccionar 4-amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol (0,25 g, 1,9 mmol), BSA (1,41 ml, 5,8 mmol) y cloroformato de isopropilo (disolución 1 M en tolueno; 2,9 ml, 2,9 mmol), y el material resultante se purificó por cromatografía de fase inversa (gradiente, CH₃CN/H₂O) para dar 4-amino-5-fluoro-2-oxopirimidina-1(2*H*)-carboxilato de isopropilo (0,225 g, 55%) como un sólido blanco; pf 217-219 °C; ¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,28 (s, 1H), 8,02-7,99 (m, 2H), 4,97 (septete, *J* = 6,26 Hz, 1H), 1,28 (d, *J* = 6,26 Hz, 6H); ESIMS *m/z* 216 ([M+H]⁺).

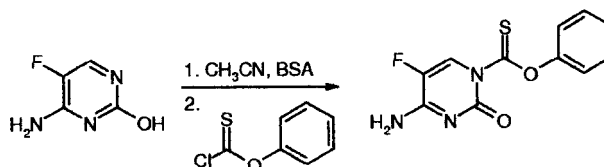
Ejemplo 5: Preparación de 4-amino-5-fluoro-2-oxopirimidina-1(2*H*)-carboxilato de fenilo (5)



25 A una suspensión de 4-amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol (1,0 g, 7,74 mmol) en CH₃CN (20 ml) se añadió BSA (2,84 ml, 11,61 mmol), y la mezcla se calentó a 65 °C durante 1 h. La disolución resultante se enfrió hasta la temperatura ambiente y a ella se añadió cloroformato de fenilo (2,1 ml, 19,35 mmol) causando un ligero exotermo. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una noche. La suspensión que se formó se filtró por succión, y el sólido se lavó con Et₂O (3 x 10 ml). El sólido se suspendió en Et₂O (10 ml) durante 2 h, se recogió mediante filtración por succión y se secó al aire durante una noche. Se aisló 4-amino-5-fluoro-2-oxopirimidina-1(2*H*)-carboxilato de fenilo (0,90 g, 47%) como un sólido blanco: pf 175-180 °C; ¹H NMR (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 9,25 (s ancho, 2H), 8,45 (d, *J* = 7,25 Hz, 1H), 7,49-7,43 (m, 2H), 7,35-7,28 (m, 3H); ESIMS *m/z* 250 [M+H]⁺.

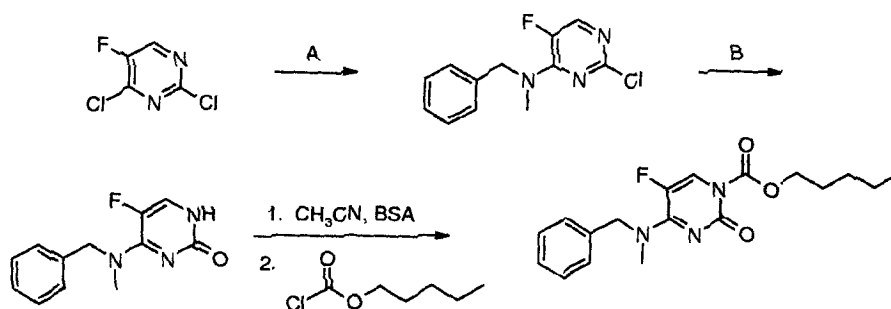
Los compuestos 6-20 se prepararon usando un procedimiento similar al Ejemplo 5.

Ejemplo 6: Preparación de 4-amino-5-fluoro-2-oxopirimidina-1(2*H*)-carbotoato de *O*-fenilo (21)



Se cargó un vial de cabeza a rosca de 25 ml con 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (99,7 mg, 0,772 mmol) y CH₃CN (3 ml). Se añadió BSA (0,284 ml, 1,16 mmol), se tapó el vial y la mezcla heterogénea resultante se agitó en un agitador rotatorio a 65 °C durante 80 min. La disolución transparente e incolora resultante se enfrió hasta la temperatura ambiente. Se añadió carbonocloridatoato de *O*-fenilo (0,118 ml, 0,853 mmol), y la reacción se agitó en un agitador rotatorio a 65 °C durante 15 h. Después de enfriar hasta la temperatura ambiente, el material bruto se diluyó con CH₂Cl₂ (100 ml) y se lavó con disolución de cloruro de sodio acuoso saturado (NaCl satd aq) (50 ml x 2). Después la disolución orgánica se secó sobre Na₂SO₄, se filtró y se concentró a vacío. El residuo verde/marrón se purificó después por cromatografía de fase normal (gradiente, 0 a 35% de alcohol metílico (MeOH)/CH₂Cl₂) para dar 4-amino-5-fluoro-2-oxipirimidina-1(2*H*)-carbotoiato de *O*-fenilo (60,7 mg, 30%) como un sólido marrón puro al 85%. Pf 113-116 °C; ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,56 (s, 1H), 8,44 (d, *J* = 7,2 Hz, 1H), 8,28 (s, 1H), 7,56-7,48 (m, 2H), 7,40-7,33 (m, 1H), 7,27-7,21 (m, 2H); ESIMS *m/z* 266 [M+H]⁺.

Ejemplo 7: Preparación de 4-(bencil(metil)amino)-5-fluoro-2-oxipirimidina-1(2*H*)-carboxilato de pentilo (22)



A) A una suspensión de 2,4-dicloro-5-fluoropirimidina (0,30 g, 1,80 mmol) en dioxano (3,6 ml) se añadió *N*-etil-*N*-isopropilpropan-2-amina (0,23 g, 1,80 mmol) y *N*-metil-1-fenilmetanamina (0,24 g, 1,98 mmol), y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 16 h. La mezcla de reacción se diluyó con EtOAc (15 ml) y la disolución resultante se lavó con H₂O (2 x 5 ml). La fase orgánica se secó sobre Na₂SO₄, se filtró, y se concentró a vacío hasta un aceite amarillo claro que se purificó por cromatografía de fase normal (40 g SiO₂; gradiente, EtOAc/hexanos) para dar un aceite incoloro que se solidificó tras enfriamiento. El sólido se secó a alto vacío a 23 °C durante 16 h para dar *N*-bencil-2-cloro-5-fluoro-*N*-metilpirimidin-4-amina (0,34 g, 76%) como un sólido blanco: pf 47-49 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8,18 (d, *J* = 6,4, 1H), 7,43-7,23 (m, 5H), 4,82 (s, 2H), 3,17 (d, *J* = 3,3, 3H); EIMS *m/z* 251 (M)⁺.

B) A una suspensión de *N*-bencil-2-cloro-5-fluoro-*N*-metilpirimidin-4-amina (0,075 g, 0,30 mmol) en dioxano/H₂O (1:1, 2 ml de volumen total) se añadió hidróxido de potasio (KOH; 0,17 g, 3,0 mmol). La mezcla se calentó a 100 °C y se agitó durante 72 h. La mezcla de reacción se diluyó con H₂O (5 ml), y el pH se ajustó a 7 con HCl 2 N. El precipitado blanco resultante se recogió por filtración a vacío, pero la mayoría del producto permaneció en la fase acuosa. El sólido y el filtrado se combinaron y el disolvente se retiró por destilación azeotrópica con CH₃CN a vacío. El residuo se disolvió/suspendió en CH₂Cl₂ (25 ml), se adsorbió sobre Celite (3,0 g) y se purificó por cromatografía de fase normal (24 g SiO₂; gradiente, MeOH/CH₂Cl₂) para dar 4-(bencil(metil)amino)-5-fluoropirimidin-2-ol (0,016 g, 23%) como un sólido blanco: pf 122,8-123,6 °C; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 12,72 (s, 1H), 7,42-7,14 (m, 6H), 4,88 (s, 2H), 3,20 (d, *J* = 3,2, 3H); ESIMS *m/z* 235 (M+2)⁺, 232 (M-H)⁻.

C) A una disolución agitada de 4-(bencil(metil)amino)-5-fluoropirimidin-2(1*H*)-ona (0,200 g, 0,858 mmol) en CH₂Cl₂ (18 ml) se añadieron cloroformato de *N*-pentilo (0,142 g, 0,944 mmol) y Et₃N (0,263 ml, 1,88 mmol) a 0 °C. Se dejó calentar la mezcla hasta la temperatura ambiente y se agitó 3 h adicionales. La mezcla de reacción bruta se evaporó a sequedad y el residuo se trituró con éter metil-*t*-butilico (MTBE; 4 x 5 ml) para retirar hidrocloreuro de trietilamina. Las capas orgánicas combinadas se evaporaron a vacío. El producto bruto se purificó por cromatografía de fase inversa. Se aisló 4-(bencil(metil)amino)-5-fluoro-2-oxipirimidina-1(2*H*)-carboxilato de pentilo (20,1 mg, 6,7%) como una goma amarilla: ¹H NMR (metanol-*d*₄) δ 8,04 (d, *J* = 6,2 Hz, 1H), 7,38-7,25 (m, 5H), 4,24 (t, *J* = 6,6 Hz, 2H), 3,21 (d, *J* = 3,3 Hz, 2H), 1,78-1,65 (m, 3H), 1,37 (dd, *J* = 9,2, 5,5 Hz, 6H), 0,92 (t, *J* = 7,1 Hz, 3H); ESIMS *m/z* 348 [(M+H)⁺].

Tabla I: Compuestos y datos de caracterización relacionados

Comp.	Estructura	Apariencia	pf (°C)	MS	¹ H NMR (δ, DMSO-d ₆) a menos que se indique lo contrario
6		sólido blanquecino	172,4-173,6	ESIMS m/z 280 [M+H] ⁺	8,65 (s, 1H), 8,52 (s, 1H), 8,31 (d, J = 7,2 Hz, 1H), 7,23 (d, J = 9,0 Hz, 2H), 7,01 (d, J = 9,1 Hz, 2H), 3,78 (s, 3H)
7		sólido blanquecino	143,2-146,3	ESIMS m/z 284 [M+H] ⁺	8,76 (s, 2H), 8,36 (d, J = 7,2 Hz, 1H), 7,61-7,50 (m, 2H), 7,42-7,31 (m, 2H)
8		sólido blanquecino	222,5-224,6	ESIMS m/z 284 [M+H] ⁺	8,64 (s, 1H), 8,43 (s, 1H), 8,32 (d, J = 7,2 Hz, 1H), 7,64 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 7,56-7,31 (m, 3H)
9		sólido blanquecino	156,8-158,2	ESIMS m/z 268 [M+H] ⁺	8,71 (s, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,33 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 7,37-7,29 (m, 4H)
10		sólido amarillo pálido	235-237	ESIMS m/z 264 ([M+H] ⁺ 1,0%), 128 ([M-COOC ₇ H ₇] ⁻ 99%)	8,65 (s, 1H), 8,52 (s, 1H), 8,30 (d, J = 7,2 Hz, 1H), 7,26 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,22-7,12 (m, 2H), 2,32 (s, 3H)

Comp.	Estructura	Apariencia	pf (°C)	MS	¹ H NMR (δ, DMSO-d ₆) a menos que se indique lo contrario
11		sólido blanco	145,8-146,8	ESIMS m/z 298 [M+H] ⁺	8,52 (s, 1H), 8,32 (s, 1H), 8,10 (d, J = 7,2 Hz, 1H), 7,70 (dd, J = 5,4, 3,9 Hz, 1H), 7,52 (dd, J = 5,6, 3,6 Hz, 1H), 7,41 (dd, J = 5,4, 3,9 Hz, 2H), 5,42 (s, 2H)
12		sólido blanquecino	142,8-145,1	ESIMS m/z 308 [M+H] ⁺	8,63 (s, 1H), 8,36 (s, 1H), 7,95 (d, J = 6,0 Hz, 1H), 7,43-7,24 (m, 5H), 4,52 (s, 2H), 4,25-4,23 (m, 2H), 3,69-3,62 (m, 2H)
13		sólido blanquecino	240-243	ESIMS m/z 188 ([M+H] ⁺ , 6,0%), 128 ([M-COOCH ₃] ⁺ , 94%)	8,60 (s, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,14 (d, J = 7,2 Hz, 1H), 3,86 (s, 3H)
14		sólido blanquecino	145,1-146,3	ESIMS m/z 248 [M-H] ⁻	8,93 (s, 2H), 8,25 (d, J = 7,1 Hz, 1H), 4,39 (t, J = 5,9 Hz, 2H), 3,79 (t, J = 6,5 Hz, 2H), 2,21-2,06 (m, 2H)
15		sólido blanquecino	94,2-96,3	ESIMS m/z 231 ([M-H] ⁻ , 18%), 128 ([M-CO ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃] ⁻ , 61%)	8,58 (s, 1H), 8,48 (s, 1H), 8,11 (d, J = 7,1 Hz, 1H), 4,45-4,33 (m, 2H), 3,70-3,56 (m, 2H), 3,29 (s, 3H)
16		sólido blanquecino	219,3-221,1	ESIMS m/z 304 ([M+H] ⁺ , 0,24%), 128 ([M-CO ₂ CH ₂ CCl ₂] ⁺ , 99,28%)	8,53 (s, 1H), 8,27 (s, 1H), 8,00 (d, J = 7,1 Hz, 1H), 5,09 (s, 2H)

Comp.	Estructura	Apariencia	pf (°C)	MS	¹ H NMR (δ, DMSO-d ₆) a menos que se indique lo contrario
17		sólido blanquecino	258-260,4	ESIMS m/z 214 [M+H] ⁺	9,38 (s, 1H), 8,80 (s, 1H), 8,14 (d, J = 6,0 Hz, 1H), 6,06-5,80 (m, 1H), 5,39-5,32 (m, 1H), 5,26-5,20 (m, 1H), 4,62-4,57 (m, 2H)
18		sólido blanquecino	165,8-168,1	ESIMS m/z 300 [M+H] ⁺	8,62 (s, 1H), 8,43 (s, 1H), 8,36 (d, J = 7,2 Hz, 1H), 8,10-7,93 (m, 2H), 7,87 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,65-7,53 (m, 2H), 7,49 (dd, J = 8,9, 2,3 Hz, 1H)
19		sólido blanquecino	125,9-128,2	ESIMS m/z 244 [M+H] ⁺	9,51 (s, 1H), 9,22 (s, 1H), 8,34 (d, J = 7,1 Hz, 1H), 4,30 (t, J = 6,5 Hz, 2H), 1,72-1,60 (m, 2H), 1,44-1,21 (m, 4H), 0,88 (t, J = 7,0 Hz, 3H)
20		sólido blanco	139,8-140,6	ESIMS m/z 242 [M+H] ⁺	8,94 (s, 2H), 8,29-8,10 (m, 1H), 5,25-5,20 (m, 1H), 2,04-1,32 (m, 8H)
23		sólido blanquecino	123,2-124,3	ESIMS m/z 319 [M+H] ⁺	(acetona-d ₆) 8,65 (s, 1H), 8,22 (d, J = 2,6 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 6,5 Hz, 2H), 7,46-7,35 (m, 3H), 5,30 (s, 2H), 3,30 (s, 3H), 3,18 (s, 3H)

Comp.	Estructura	Apariencia	pf (°C)	MS	¹ H NMR (δ, DMSO-d ₆) a menos que se indique lo contrario
24		sólido blanquecino	179-181,2	ESIMS m/z 319 ([M+H] ⁺)	(metanol-d ₄) 8,74 (s, 1H), 8,24 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 7,24 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,14 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 3,25 (s, 3H), 3,20 (s, 3H), 2,35 (s, 3H)
25		goma		ESIMS m/z 299 ([M+H] ⁺)	(CDCl ₃) 8,66 (s, 1H), 8,18 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 4,26 (t, J = 6,7 Hz, 2H), 3,22 (s, 3H), 3,20 (s, 2H), 1,85-1,67 (m, 2H), 1,45-1,28 (m, 4H), 0,91 (dd, J = 9,0, 4,4 Hz, 3H)
26		sólido blanquecino	103,5-104,6	ESIMS m/z 297 ([M+H] ⁺)	(CDCl ₃) 8,70 (s, 1H), 8,26 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 5,25-5,18 (m, 1H), 3,37 (s, 3H), 3,28 (s, 3H), 1,95-1,85 (m, 4H), 1,84-1,72 (m, 2H), 1,70-1,59 (m, 2H)

Ejemplo 8: Evaluación de la actividad fungicida: Mancha de la hoja del trigo (*Mycosphaerella graminicola*; anamorfo: *Septoria tritici*; código Bayer SEPTTR)

Se cultivaron plantas de trigo (variedad Yuma) a partir de semilla en un invernadero en 50% de suelo mineral/50% de mezcla Metro sin suelo hasta que la primera hoja emergió totalmente, con 7-10 plantones por maceta. Estas plantas fueron inoculadas con una suspensión acuosa de esporas de *Septoria tritici* antes de o después de los tratamientos fungicidas. Después de la inoculación las plantas fueron mantenidas en 100% de humedad relativa (un día en una cámara de rocío oscura seguido de dos a tres días en una cámara de rocío iluminada) para permitir que germinaran las esporas e infectaran la hoja. Las plantas fueron transferidas después a un invernadero para que se desarrollara la enfermedad.

- 10 La siguiente tabla presenta la actividad de compuestos típicos de la presente descripción cuando fueron evaluados en estos experimentos. La eficacia de los compuestos de ensayo en controlar la enfermedad fue determinada evaluando la gravedad de la enfermedad en las plantas tratadas, convirtiendo después la gravedad en tanto por ciento de control en base al nivel de enfermedad en plantas no tratadas, inoculadas.

En cada caso de la Tabla I, la escala de clasificación es como sigue:

% de control de la enfermedad	Clasificación
76-100	A
51-75	B
26-50	C
0-25	D
No ensayado	E

- 15 TABLA I: Actividad protectora de un día (1DP) y curativa de tres días (3DC) de los compuestos en SEPTTR a 100 ppm

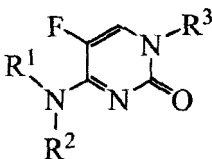
Comp.	SEPTTR 100 PPM 1DP	SEPTTR 100 PPM 3DC
1	A	A
2	A	A
3	A	A
4	A	A
5	A	A
6	A	A
7	A	A
8	A	A
9	A	A
10	A	A
11	A	A
12	A	A
13	A	A
14	A	A
15	A	A
16	A	A
17	A	A
18	A	A
19	A	A
20	A	A

ES 2 506 169 T3

21	A	A
22	E	E
23	E	E
24	E	E
25	E	E
26	E	E

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de Fórmula I:



Fórmula I

en donde R¹ es:

5 H;

alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con 1-3 R⁴;

alquenilo C₂-C₆ opcionalmente sustituido con 1-3 R⁴;

alquinilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con 1-3 R⁴;

10 fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵; o con un sistema anular saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema anular condensado 5-6, o con un sistema anular condensado 6-6, que contiene cada uno 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

-(CHR⁶)_mOR⁷;

-C(=O)R⁸;

15 -C(=S)R⁸;

-S(O)₂R⁸;

-C(=O)OR⁸;

-C(=S)OR⁸;

-(CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;

20 -C(=O)N(R⁹)R¹⁰; o

-C(=S)N(R⁹)R¹⁰;

en donde m es un número entero 1-3;

R² es H o alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con R⁴;

alternativamente R¹ y R² pueden unirse para formar =CR¹¹N(R¹²)R¹³;

25 R³ es -C(=O)OR⁸ o -C(=S)OR⁸;

R⁴ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil-C₁-C₆-tio, haloalquil-C₁-C₆-tio, amino, halotio, alquil-C₁-C₃-amino, alcoxi-C₂-C₆-carbonilo, alquil-C₂-C₆-carbonilo, alquil-C₂-C₆-aminocarbonilo, hidroxilo, o trialquil-C₃-C₆-sililo;

30 R⁵ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil-C₁-C₆-tio, haloalquil-C₁-C₆-tio, amino, alquil-C₁-C₆-amino, dialquil-C₂-C₆-amino, alcoxi-C₂-C₆-carbonilo, o alquil-C₂-C₆-carbonilo, nitro, hidroxilo, o ciano, halotio;

R⁶ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

35 R⁷ es H, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alquilo, alquil-C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema anular saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema anular condensado 5-6, o con un sistema anular condensado 6-6, que contienen cada uno 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

- 5 R^8 es H, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 -alquilo, $-(CH_2)_2OCH_2(C_6H_5)$, fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 ; o con un sistema anular saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema anular condensado 5-6, o con un sistema anular condensado 6-6, que contienen cada uno 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 , bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 ;
- 10 R^9 es H, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 -alquilo, alquil- C_2-C_6 -carbonilo, fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 ; o con un sistema anular saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema anular condensado 5-6, o con un sistema anular condensado 6-6, que contienen cada uno 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 , bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 ;
- R^{10} es H, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 -alquilo, alquil- C_2-C_6 -carbonilo, bencilo, en donde el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 ;
- alternativamente R^9 y R^{10} pueden unirse para formar un anillo saturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 ;
- 15 R^{11} es H o alquilo C_1-C_4 ;
- R^{12} es H, ciano, hidroxilo, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_6 , alquil- C_2-C_6 -carbonilo, fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 ; o con un sistema anular saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema anular condensado 5-6, o con un sistema anular condensado 6-6, que contienen cada uno 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 , bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 ;
- 20 alternativamente R^{11} y R^{12} pueden unirse para formar un anillo saturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 ;
- R^{13} es H, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_6 , alquil- C_2-C_6 -carbonilo, fenilo o bencilo, en donde cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 ; o con un sistema anular saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema anular condensado 5-6, o con un sistema anular condensado 6-6, que contienen cada uno 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 , bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 ; y
- 25 alternativamente R^{12} y R^{13} pueden unirse para formar un anillo saturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos, en donde cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R^5 .
- 30 2. Una composición para el control de un patógeno fúngico que incluye el compuesto de la reivindicación 1 y un material como vehículo fitológicamente aceptable.
- 35 3. La composición de la reivindicación 2, en donde el patógeno fúngico es sarna del manzano (*Venturia inaequalis*), mancha de las hojas del trigo (*Septoria tritici*, también conocido como *Mycosphaerella graminicola*), mancha de las hojas de remolachas azucareras (*Cercospora beticola*), manchas de las hojas del cacahuete (*Cercospora arachidicola* y *Cercosporidium personatum*) y la sigatoka negra de los plátanos (*Mycosphaerella fijiensis*).
4. Un método para el control y prevención del ataque fúngico a una planta, incluyendo el método las etapas de:
- aplicar una cantidad fungicidamente eficaz de al menos uno de los compuestos de la reivindicación 1 al menos a uno de la planta, un área adyacente a la planta, suelo adaptado para soportar el crecimiento de la planta, una raíz de la planta, hojas de las plantas, y una semilla adaptada para producir la planta.