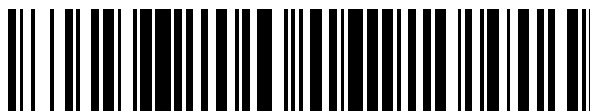


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 562 178**

51 Int. Cl.:

C07D 231/12 (2006.01) **A01N 25/00** (2006.01)

C07D 231/20 (2006.01)

C07D 231/38 (2006.01)

C07D 401/04 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

C07D 401/14 (2006.01)

C07D 403/12 (2006.01)

C07D 407/12 (2006.01)

C07D 409/04 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **03.03.2010 E 10707187 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **02.12.2015 EP 2403834**

54 Título: **Pirazoles fungicidas**

30 Prioridad:

03.03.2009 US 157046 P
12.02.2010 US 304053 P

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
02.03.2016

73 Titular/es:

E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY
(100.0%)
Chestnut Run Plaza 974 Center Road P.O. Box
2915
Wilmington, DE 19805, US

72 Inventor/es:

LONG, JEFFREY, KEITH;
HONG, WONPYO y
TAGGI, ANDREW, EDMUND

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

Observaciones :

Véase nota informativa (Remarks) en el folleto original publicado por la Oficina Europea de Patentes

ES 2 562 178 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

Pirazoles fungicidas

Campo de la invención

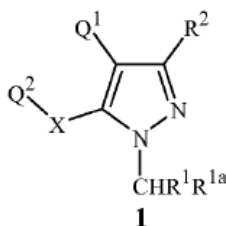
5 Esta invención se refiere a ciertos pirazoles, sus N-óxidos, sales y composiciones, y métodos de su uso como fungicidas.

Antecedentes de la invención

10 El control de enfermedades de plantas provocadas por patógenos de plantas fúngicos es extremadamente importante para alcanzar la alta eficacia de los cultivos. El daño por enfermedad de plantas a cultivos ornamentales, vegetales, de campo, de cereales y frutales puede provocar una reducción significativa en productividad y dar así por resultado costes aumentados al consumidor. Muchos productos están disponibles comercialmente para estos propósitos, pero continúa la necesidad de nuevos compuestos que sean más efectivos, menos costosos, menos tóxicos, más seguros medioambientalmente o que tengan diferentes sitios de acción. El documento JP08208620 describe derivados de *N*-fenilpirazolilamina y *N*-piridilpirazolilamina como insecticidas, herbicidas y fungicidas; sin embargo los fungicidas de la presente invención no están descritos en esta publicación.

15 **Compendio de la invención**

Esta invención se dirige a compuestos de Fórmula 1 (que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), *N*-óxidos y sales de los mismos, composiciones agrícolas que los contienen y su uso como fungicidas:



20 en donde

Q¹ es un anillo fenilo o un sistema anular naftalenilo, cada anillo o sistema anular opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R³; o un anillo heterocíclico totalmente insaturado de 5 o 6 miembros o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros, conteniendo cada anillo o sistema anular miembros seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 3 miembros anulares de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S), y los miembros anulares de átomo de azufre se seleccionan independientemente de S(=O)_u(=NR¹⁴)_v, cada anillo o sistema anular opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R³ en miembros anulares de átomo de carbono y seleccionados de ciano, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxialquilo C₂-C₆, alquil C₂-C₆ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ carbonilo, alquilaminoalquilo C₂-C₆ y dialquilaminoalquilo C₃-C₆ en miembros anulares de átomo de nitrógeno; Q² es un anillo fenilo o un sistema anular naftalenilo, cada anillo o sistema anular opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R³; o un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 5 a 6 miembros o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros, conteniendo cada anillo o sistema anular miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 3 miembros anulares de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S), y los miembros anulares de átomo de azufre se seleccionan independientemente de S(=O)_u(=NR¹⁴)_v, cada anillo o sistema anular opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R³ en miembros anulares de átomo de carbono y seleccionados de ciano, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxialquilo C₂-C₆, alquil C₂-C₆ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ carbonilo, alquilaminoalquilo C₂-C₆ y dialquilaminoalquilo C₃-C₆ en miembros anulares de átomo de nitrógeno; o alquilo C₁-C₁₂, alquenilo C₂-C₁₂, alquinilo C₂-C₁₂, cicloalquilo C₃-C₁₂ o cicloalquenilo C₃-C₁₂, cada uno sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes independientemente seleccionados de R³;

X es O, S(O)_m o NR⁴;

45 R¹ es H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₇, CO₂R⁵, C(O)NR⁶R⁷, ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o alcoxialquilo C₂-C₅; o

R¹ es fenilo opcionalmente sustituido con hasta 3 R⁸; o un heterociclo aromático que contiene nitrógeno de cinco o seis miembros opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{9a} en miembros anulares de átomo de carbono y R^{9b} en miembros anulares de átomo de nitrógeno;

R^{1a} es H; o

- 5 R^{1a} y R¹ se toman juntos con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo ciclopropilo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno y metilo;

R² es CH₃, CH₂CH₃, halógeno, ciano, cianometilo, halometilo, hidroximetilo, metoxi o metiltio; o ciclopropilo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno y metilo;

- 10 cada R³ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, amino, metilamino, dimetilamino, formilamino, alquil C₂-C₃ carbonilamino, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃ tio, haloalquil C₁-C₃ tio, alquil C₁-C₃ sulfinilo, haloalquil C₁-C₃ sulfinilo, alquil C₁-C₃ sulfonilo, haloalquil C₁-C₃ sulfonilo, alquil C₁-C₂ sulfonilo, haloalquil C₁-C₂ sulfonilo, cicloalquilo C₃-C₄, cicloalcoxi C₃-C₇, alquilocicloalquilo C₄-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₆, halocicloalquilo C₃-C₇, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, hidroxilo, formilo, alquil C₂-C₃ carbonilo, alquil C₂-C₃ carbonilo, -SF₅, -SCN, C(=S)NR¹⁹R²⁰ y -U-V-T;

- 15 R⁴ es H, formilo, alquenilo C₂-C₅, alquinilo C₃-C₅, cicloalquilo C₃-C₇, -SO₃⁻M⁺, -S(=O)_tR¹⁰, -(C=W)R¹¹, NH₂ u OR²¹; o alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 R¹²;

R⁵ es H o alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆;

R⁶ y R⁷ se seleccionan independientemente de H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₈ y alquilocicloalquilo C₄-C₈; o

- 20 R⁶ y R⁷ se toman juntos con el átomo de nitrógeno al que están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contiene miembros anulares, además del átomo de nitrógeno anular de conexión, seleccionados de átomos de carbono y opcionalmente hasta un miembro anular seleccionado de O, S(O)_n y NR¹³;

- 25 cada R⁸, R^{9a} y R^{9b} se selecciona independientemente de halógeno, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, haloalcoxi C₁-C₂, ciano, nitro, SCH₃, S(O)CH₃ y S(O)₂CH₃;

R¹⁰ es alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆;

R¹¹ es alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxialquilo C₂-C₇, alquilaminoalquilo C₂-C₇, dialquilaminoalquilo C₃-C₈, alquil C₁-C₆ tio o alquiltioalquilo C₂-C₇;

- 30 cada R¹² es independientemente cicloalquilo C₃-C₇, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄ tio, alquil C₁-C₄ sulfinilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo o ciano;

R¹³ es H, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₂-C₃;

cada R¹⁴ es independientemente H, ciano, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃;

cada R¹⁹ y R²⁰ es independientemente H o CH₃;

- 35 R²¹ es H, formilo, cicloalquilo C₃-C₇, -SO₃⁻M⁺ o -(C=W)R¹¹; o alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 R¹²;

cada U es independientemente O, S(=O)_w, NR²² o un enlace directo;

- 40 cada V es independientemente alquilenilo C₁-C₆, alquenilenilo C₂-C₆, alquinilenilo C₃-C₆, cicloalquilenilo C₃-C₆ o cicloalquenilenilo C₃-C₆, en donde hasta 3 átomos de carbono se seleccionan independientemente de C(=O), cada uno sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆;

cada T es independientemente ciano, NR^{23a}R^{23b}, OR²⁴ o S(=O)_yR²⁵;

cada R²² es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquil C₂-C₆ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ carbonilo, (alquiltio)C₂-C₆ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ (tiocarbonilo), cicloalquil C₄-C₈ carbonilo, cicloalcoxi C₄-C₈ carbonilo, (cicloalquiltio) C₄-C₈ carbonilo o cicloalcoxi C₄-C₈ (tiocarbonilo);

- 45 cada R^{23a} y R^{23b} es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquil C₂-C₆ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ carbonilo, (alquiltio) C₂-C₆ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ (tiocarbonilo), cicloalquil C₄-C₈ carbonilo, cicloalcoxi C₄-C₈ carbonilo, (cicloalquiltio) C₄-C₈ carbonilo o cicloalcoxi C₄-C₈ (tiocarbonilo); o

un par de R^{23a} y R^{23b} unidos al mismo átomo de nitrógeno se toman juntos con el átomo de nitrógeno para formar un anillo heterocíclico de 3 a 6 miembros, el anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{26} ;

5 cada R^{24} y R^{25} es independientemente H, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquil C_2-C_6 carbonilo, alcoxi C_2-C_6 carbonilo, (alquiltio) C_2-C_6 carbonilo, alcoxi C_2-C_6 (tiocarbonilo), cicloalquil C_4-C_8 carbonilo, cicloalcoxi C_4-C_8 carbonilo, (cicloalquiltio) C_4-C_8 carbonilo o cicloalcoxi C_4-C_8 (tiocarbonilo);

cada R^{26} es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 o alcoxi C_1-C_6 ;

W es O o S;

10 M^+ es un catión;

m es 0, 1 o 2;

n es 0, 1 o 2;

t es 0, 1 o 2;

15 cada u y v son independientemente 0, 1 o 2 en cada ejemplo de $S(=O)_u(NR^4)_v$, con tal que la suma de u y v sea 0, 1 o 2;

cada w es independientemente 0, 1 o 2; y

cada y es independientemente 0, 1 o 2;

con tal que:

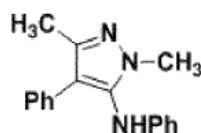
20 cuando Q^2 es un anillo fenilo sustituido en al menos una posición orto con un sustituyente seleccionado de -U-V-T en donde U es un enlace directo, V es $C(=O)$ y T es $NR^{23a}R^{23b}$ u OR^{24} , entonces X es distinto de NR^4 ;

y con tal que el compuesto de Fórmula 1 sea distinto de:

(a) 2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenol;

(b) 2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenol;

(c)



25

(d) HCl de 2-(1,3-dimetil-4-fenilpirazolil)amino-2-imidazolina;

(e) (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[4-(isoxazol-3-il)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo;

(f) ácido (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[4-(isoxazol-3-il)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico;

(g) (2S)-2-[2,4-dicloro-5-(4-[5-(hidroximetil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il]oxi)fenoxi]propionato de metilo;

30 (h) ácido (2S)-2-[2,4-dicloro-5-({4-[5-(hidroximetil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il]oxi)fenoxi]propiónico;

(i) (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metilisoxazol-3-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo;

(j) ácido (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metilisoxazol-3-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico;

(k) (2S)-2-[2,4-dicloro-5-(4-[5-(1-hidroxi-1-metiletil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il]oxi)fenoxi]propionato de metilo;

35 (l) ácido (2S)-2-[2,4-dicloro-5-({4-[5-(1-hidroxi-1-metiletil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il]oxi)fenoxi]propiónico;

(m) ácido (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico;

(n) (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo;

(o) ácido (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico; o

(p) (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo.

Más particularmente, esta invención pertenece a un compuesto de Fórmula 1 (que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), un *N*-óxido o una sal de los mismos.

5 Esta invención también se refiere a una composición fungicida que comprende un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.

Esta invención también se refiere a una composición fungicida que comprende: (a) un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y (b) al menos un fungicida distinto (por ejemplo, al menos un fungicida distinto que
10 tiene un sitio de acción diferente).

Esta invención se refiere adicionalmente a un método para controlar las enfermedades de plantas provocadas por patógenos de plantas fúngicos que comprende aplicar a la planta o parte de la misma, o a la semilla de la planta, una cantidad fúngicamente efectiva de un compuesto de la invención (por ejemplo, como una composición descrita en esta memoria).

15 Esta invención también se refiere a una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un compuesto o agente de control de plagas de invertebrados.

Detalles de la invención

Como se usa en esta memoria, los términos “comprende”, “que comprende”, “incluye”, “que incluye”, “tiene”, “que tiene”, “contiene”, “que contiene”, “caracterizado por” o cualquier variación de los mismos, se pretende que cubran
20 una inclusión no exclusiva, sujeta a cualquier limitación indicada de forma explícita. Por ejemplo, una composición, mezcla, proceso o método que comprende una lista de elementos no está necesariamente limitado a solo esos elementos aunque pueden incluir otros elementos no expresamente enumerados o inherentes a dicha composición, mezcla, proceso o método.

La frase de transición “que consiste en” excluye cualquier elemento, etapa o ingrediente no especificado. Si está en
25 la reivindicación, dicha frase debería cerrar la reivindicación a la inclusión de materiales distintos de los enumerados excepto para impurezas asociadas de normalmente con eso. Cuando la frase “que consiste en” aparece en una oración del cuerpo de una reivindicación, más que inmediatamente después del preámbulo, limita solo el elemento descrito en esa oración; otros elementos no se excluyen de la reivindicación como un todo.

La frase de transición “que consiste esencialmente en” se usa para definir una composición o método que incluye
30 materiales, etapas, características, componentes o elementos, además de los descritos literalmente, con tal que estos materiales, etapas, características, componentes o elementos adicionales no afecten de forma material a la(s) característica(s) básica(s) y nueva(s) de la invención reivindicada. El término “que consiste esencialmente en” ocupa un nivel medio entre “que comprende” y “que consiste en”.

Donde los solicitantes han definido una invención o una porción de la misma con un término de final abierto tal como
35 “que comprende”, debería entenderse fácilmente que (a menos que se afirme otra cosa) la descripción debería interpretarse para describir además dicha invención usando los términos “que consiste esencialmente en” o “que consiste en”.

Además, a menos que se afirme de forma expresa lo contrario, “o” se refiere a un o inclusivo y no a un o exclusivo.
40 Por ejemplo, una condición A o B se satisface por cualquiera de lo siguiente: A es verdad (o está presente) y B es falso (o no está presente), A es falso (o no está presente) y B es cierto (o está presente), y tanto A como B son ciertos (o están presentes).

Además, los artículos indefinidos “un” y “uno” que preceden un elemento o componente de la invención se pretende
45 que sean no restrictivos respecto al número de ejemplos (es decir, ocurrencias) del elemento o componente. Por lo tanto, “un” o “uno” debería leerse como que incluye uno o al menos uno, y la forma singular de la palabra del elemento o componente incluye también el plural a menos que se entienda de forma obvia que el número es singular.

Como se denomina en la presente descripción y reivindicaciones, “planta” incluye miembros del Reino Vegetal,
50 particularmente plantas de semilla (Spermatopsida), en todas las etapas de la vida, que incluyen plantas jóvenes (por ejemplo, semillas germinadas que se desarrollan en plántulas) y etapas maduras, reproductivas (por ejemplo, plantas que producen flores y semillas). Partes de plantas incluyen miembros geotrópicos que crecen típicamente debajo de la superficie del medio de crecimiento (por ejemplo, suelo), tal como raíces, tubérculos, bulbos y cormos, y también miembros que crecen por encima del medio de crecimiento, tal como follaje (que incluye tallos y hojas), flores, frutas y semillas.

Como se denomina en esta memoria, el término “plántula”, usado o bien solo o en una combinación de palabras significa una planta joven que se desarrolla a partir del embrión de una semilla.

Como se usa en esta memoria, el término “agente alquilante” se refiere a un compuesto químico en que un radical que contienen carbono se une a través de un átomo de carbono a un grupo saliente tal como haluro o sulfonato, que es desplazable por unión de un nucleófilo a dicho átomo de carbono. A menos que se indique otra cosa, el término “alquilante” no limita el radical que contiene carbono a alquilo; los radicales que contienen carbono en agentes alquilantes incluyen la variedad de radicales sustituyentes unidos a carbono especificados por R¹.

Generalmente cuando un fragmento molecular (es decir, radical) se indica por una serie de símbolos de átomo (por ejemplo, C, H, N, O, S) el punto o puntos implícitos de unión se reconocerán fácilmente por los expertos en la técnica. En algunos ejemplos en esta memoria, particularmente cuando son posibles puntos alternativos de unión, el punto o puntos de unión pueden indicarse de forma explícita por un guión (“-”). Por ejemplo, “-SCN” indica que el punto de unión es el átomo de azufre (es decir, tiocianato, no isotiocianato).

En las enumeraciones anteriores, el término “alquilo”, usado o bien solo o en palabras compuestas tal como “alquiltio” o “haloalquilo” incluye alquilo de cadena lineal o ramificada tal como metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo, o los diferentes isómeros de butilo, pentilo o hexilo. “Alquenilo” incluye alquenos de cadena lineal o ramificada tal como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, y los diferentes isómeros de butenilo. “Alquenilo” también incluye polienos tal como 1,2-propadienilo. “Alquinilo” incluye alquinos de cadena lineal o ramificada tal como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo y los diferentes isómeros de butinilo. “Alquenileno” indica un alqueniido de cadena lineal o ramificada que contiene un enlace olefínico. Ejemplos de “alquenileno” incluyen CH=CH, CH₂CH=CH, CH=C(CH₃). “Alquinileno” indica un alquinodiido de cadena lineal o ramificada que contiene un triple enlace. Ejemplos de “alquinileno” incluyen CH₂C≡C, C≡CCH₂ y los diferentes isómeros de butinileno, pentinileno o hexinileno.

“Alcoxi” incluye, por ejemplo, metoxi, etoxi, *n*-propiloxi, isopropiloxi y los diferentes isómeros de butoxi, pentoxi y hexiloxi. “Alcoxialquilo” indica sustitución alcoxi en alquilo. Ejemplos de “alcoxialquilo” incluyen CH₃OCH₂, CH₃OCH₂CH₂, CH₃CH₂OCH₂, CH₃CH₂CH₂CH₂OCH₂ y CH₃CH₂OCH₂CH₂. “Alquiltio” incluye restos alquiltio de cadena ramificada o lineal tal como metiltio, etiltio y los diferentes isómeros de propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio. “Alquilsulfinito” incluye ambos enantiómeros de un grupo alquilsulfinito. Ejemplos de “alquilsulfinito” incluyen CH₃S(O)-, CH₃CH₂S(O)-, (CH₃)₂CHS(O)-, y los diferentes isómeros de butilsulfinito. Ejemplos de “alquilsulfonilo” incluyen CH₃S(O)₂-, CH₃CH₂S(O)₂-, CH₃CH₂CH₂S(O)₂-, (CH₃)₂CHS(O)₂-, y los diferentes isómeros de butilsulfonilo. “Alquiltioalquilo” indica sustitución alquiltio en alquilo. Ejemplos de “alquiltioalquilo” incluyen CH₃SCH₂, CH₃SCH₂CH₂, CH₃CH₂SCH₂, CH₃CH₂CH₂CH₂SCH₂ y CH₃CH₂SCH₂CH₂. “(Alquiltio)carbonilo” indica un grupo alquiltio de cadena lineal o ramificada unido a un resto C(=O). Ejemplos de “(alquiltio)carbonilo” incluyen CH₃SC(=O), CH₃CH₂CH₂SC(=O) y (CH₃)₂CHSC(=O). “Alcoxi(tiocarbonilo)” indica un grupo alcoxi de cadena lineal o ramificada unido a un resto C(=S). Ejemplos de “alcoxi(tiocarbonilo)” incluyen CH₃OC(=S), CH₃CH₂CH₂OC(=S) y (CH₃)₂CHOC(=S). “Alquilaminoalquilo” indica unos restos alquilo de cadena lineal o ramificada unidos a un átomo de nitrógeno de un resto aminoalquilo (de cadena lineal o ramificada). Ejemplos de “alquilaminoalquilo” incluyen CH₃NHCH₂-, (CH₃)₂CHNHCH₂- y CH₃NHCH(CH₃)-. “Dialquilaminoalquilo” indica dos restos alquilo de cadena lineal o ramificada independientes unidos a un átomo de nitrógeno de un resto aminoalquilo (de cadena lineal o ramificada). Ejemplos de “dialquilaminoalquilo” incluyen (CH₃)₂NCH₂-, (CH₃)₂CH(CH₃)NCH₂- y (CH₃)₂NCH(CH₃)-. El término “alquilcarbonilamino” indica alquilo unido a un resto C(=O)NH. Ejemplos de “alquilcarbonilamino” incluyen CH₃CH₂C(=O)NH y CH₃CH₂CH₂C(=O)NH.

“Cicloalquilo” incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El término “alquilocicloalquilo” indica sustitución alquilo en un resto cicloalquilo e incluye, por ejemplo, etilciclopropilo, *i*-propilciclobutilo, 3-metilciclopentilo y 4-metilciclohexilo. El término “cicloalquilalquilo” indica sustitución de cicloalquilo en un resto alquilo. Ejemplos de “cicloalquilalquilo” incluyen ciclopropilmetilo, ciclopentiletilo y otros restos cicloalquilo unidos a grupos alquilo de cadena lineal o ramificada. El término “cicloalcoxi” indica cicloalquilo unido a través de un átomo de oxígeno tal como ciclopentiloxi y ciclohexiloxi. “Cicloalquenilo” incluye anillos carbocíclicos que contienen solo un doble enlace tal como ciclopentenilo y ciclohexenilo, además de anillos carbocíclicos con más de un doble enlace tal como 1,3- y 1,4-ciclohexadienilo, aunque no son aromáticos. “Cicloalquilcarbonilo” indica cicloalquilo unido a un grupo C(=O) que incluye, por ejemplo, ciclopropilcarbonilo y ciclopentilcarbonilo. El término “cicloalcoxicarbonilo” significa cicloalcoxi unido a un grupo C(=O), por ejemplo, ciclopropiloxycarbonilo y ciclopentiloxycarbonilo. El término “cicloalquileno” indica un anillo cicloalcanodiido. Ejemplos de “cicloalquileno” incluyen ciclopropileno, ciclobutileno, ciclopentileno y ciclohexileno. El término “cicloalquenileno” indica un anillo cicloalquenodiido que contiene un enlace olefínico. Ejemplos de “cicloalquenileno” incluyen ciclopropenodiido y ciclopentenodiido.

El término “halógeno”, o bien solo o en palabras compuestas tal como “haloalquilo” o cuando se usa en descripciones tal como “alquilo sustituido con halógeno” incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se usa en palabras compuestas tal como “haloalquilo”, o cuando se usa en descripciones tal como “alquilo sustituido con halógeno” dicho alquilo puede estar totalmente o parcialmente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos de “haloalquilo” o “alquilo sustituido con halógeno” incluyen F₃C-, ClCH₂-, CF₃CH₂- y CF₃CCl₂-. Los términos “halocicloalquilo”, “haloalcoxi”, “haloalquiltio” y similares, se definen de forma análoga al término “haloalquilo”. Ejemplos de “haloalcoxi” incluyen CH₂FO-, CHF₂O-, CF₃O-, CCl₃CH₂O-, HCF₂CH₂CH₂O- y CF₃CH₂O-. Ejemplos de “fluoroalcoxi” incluyen CH₂FO-, CHF₂O-, CF₃O-, HCF₂CH₂CH₂O- y CF₃CH₂O-. Ejemplos de

“fluorometoxi” incluyen CH_2FO -, CHF_2O - y CF_3O -. Ejemplos de “haloalquiltio” incluyen CCl_3S -, CF_3S -, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$ - y $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ -. Ejemplos de “haloalquilsulfinilo” incluyen $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})$ -, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})$ -, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ - y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})$ -. Ejemplos de “haloalquilsulfonilo” incluyen $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2$ -, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2$ -, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ - y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2$ -.

5 El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente se indica por el prefijo “ $\text{C}_1\text{-C}_j$ ” donde i y j son números de 1 a 12. Por ejemplo, alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$ sulfonilo designa metilsulfonilo a través de butilsulfonilo; alcoxialquilo C_2 designa CH_3OCH_2 -; alcoxialquilo C_3 designa, por ejemplo, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$ -, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ - o $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ -; y alcoxialquilo C_4 designa los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi que contiene un total de cuatro átomos de carbono, ejemplos que incluyen $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ - y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ -.

10 Como se usa en esta memoria, las siguientes definiciones se aplicarán a menos que se indique otra cosa. El término “opcionalmente sustituido” se usa de forma intercambiable con la frase “sustituido o no sustituido” o con el término “(no) sustituido”. A menos que se indique otra cosa, un grupo opcionalmente sustituido puede tener un sustituyente en cada posición sustituible del grupo, y cada sustitución es independiente de la otra.

15 El término “no sustituido” en conexión con un grupo tal como un anillo o sistema anular significa que el grupo no tiene ningún sustituyente distinto de su una o más uniones al resto de Fórmula 1. El término “opcionalmente sustituido” significa que el número de sustituyentes puede ser cero. A menos que se indique otra cosa, los grupos sustituidos opcionalmente pueden estar sustituidos con tantos sustituyentes opcionales como puedan acomodarse sustituyendo un átomo de hidrógeno con un sustituyente no hidrógeno en cualquier átomo de carbono o nitrógeno disponible. El número de sustituyentes opcionales puede estar restringido por una limitación expresada. Por ejemplo, la frase “opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados de R^{9a} en miembros anulares de carbono”
20 significa que 0, 1, 2 o 3 sustituyentes pueden estar presentes (si el número de puntos de conexión potenciales lo permite). De forma similar, la frase “opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados de R^3 en miembros anulares de carbono” significa que 0, 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes pueden estar presentes si el número de puntos de conexión disponibles lo permite. Cuando un intervalo especificado para el número de sustituyentes (por ejemplo, r que es un número entero de 0 a 4 o de 0 a 3 para heterociclos que contienen nitrógeno de 5 a 6 miembros
25 en la Exhibición A) sobrepasa el número de posiciones disponibles para sustituyentes en un anillo (por ejemplo, 2 posiciones disponibles para $(\text{R}^{\text{a}})_r$ en U-27 en la Exhibición A), el mayor extremo real del intervalo se reconoce que es el número de posiciones disponibles.

30 Cuando un compuesto se sustituye con un sustituyente que porta un subíndice que indica que el número de dichos sustituyentes puede sobrepasar 1, dichos sustituyentes (cuando sobrepasan 1) se seleccionan independientemente del grupo de sustituyentes definidos, por ejemplo, $(\text{R}^3)_p$ en la Tabla 1 donde p es 0, 1, 2, 3, 4 o 5. Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, por ejemplo, R^1 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 o R^{13} , entonces cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se reconoce que esto es equivalente a que dicho grupo no está sustituido. Cuando un grupo variable se muestra que está opcionalmente unido a una posición, por ejemplo $(\text{R}^{\text{a}})_r$ en H-23 de la Exhibición 1, en donde r puede ser 0, entonces el hidrógeno puede estar en la posición incluso si no se enumera en la definición de grupo variable. Cuando una o más posiciones en un grupo se dice que están “no sustituidas” o
35 “insustituidas”, entonces los átomos de hidrógeno están unidos para acaparar cualquier valencia libre.

40 Las variables “ m ”, “ n ”, “ t ”, “ u ”, “ v ”, “ w ” e “ y ” en el Compendio de la Invención y partes correspondientes de la memoria de patente se refieren a subíndices que aparecen a la derecha de los átomos u otros fragmentos moleculares entre paréntesis e indican el número integral de ejemplos presentes de los átomos u otros fragmentos moleculares en los paréntesis. “ m ” se refiere a “ $\text{S}(\text{O})_m$ ”, “ n ” se refiere a “ $\text{S}(\text{O})_n$ ”, “ t ” se refiere a “ $-\text{S}(=\text{O})_t\text{R}^{10}$ ”, “ u ” y “ v ” se refieren a “ $\text{S}(=\text{O})_u(=\text{NR}^{14})_v$ ”, “ w ” se refiere a “ $\text{S}(=\text{O})_w$ ”, e “ y ” se refiere a “ $\text{S}(=\text{O})_y\text{R}^{25}$ ”. Por ejemplo, que “ m ” sea 0, 1 o 2 significa que “ $\text{S}(\text{O})_m$ ” puede ser “ S ”, “ $\text{S}(\text{O})$ ” o “ $\text{S}(\text{O})_2$ ”.

45 A menos que se indique otra cosa, un “anillo” como un componente de Fórmula 1 es carbocíclico o heterocíclico. El término “sistema anular” como un componente de Fórmula 1 indica dos anillos condensados (por ejemplo, un anillo fenilo condensado con un anillo piridinilo para formar quinolinilo). El término “miembro anular” se refiere a un átomo u otro resto (por ejemplo, O , $\text{S}(\text{O})$, $\text{S}(\text{O})_2$ o $\text{S}(=\text{O})_u(=\text{NR}^{14})_v$) que forma el esqueleto de un anillo o sistema anular.

50 El término “anillo carbocíclico” indica un anillo en donde los átomos que forman el esqueleto del anillo se seleccionan solo a partir de carbono. A menos que se indique otra cosa, un anillo carbocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado. “Carbocíclico saturado” se refiere a un anillo que tiene un esqueleto que consiste en átomos de carbono unidos a otro por enlaces sencillos; a menos que se especifique otra cosa, las valencias del carbono restantes están ocupadas por átomos de hidrógeno.

55 Los términos “anillo heterocíclico” o “heterociclo” indican un anillo o sistema anular en que al menos un átomo que forma el esqueleto anular no es carbono, por ejemplo, nitrógeno, oxígeno o azufre. Típicamente un anillo heterocíclico contiene no más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres. A menos que se indique otra cosa, un anillo heterocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado. El término “anillo heterocíclico saturado” se refiere a un anillo heterocíclico que contiene solo enlaces sencillos entre miembros anulares. Respecto al grado de saturación, “un anillo heterocíclico parcialmente insaturado” es intermedio entre un anillo heterocíclico saturado y un anillo heterocíclico totalmente insaturado (que puede ser aromático). Por lo tanto, como se denomina en la presente descripción y reivindicaciones, el término “anillo

heterocíclico parcialmente insaturado" indica un anillo heterocíclico que comprende al menos un miembro anular unido a un miembro anular adyacente a través de un doble enlace y que conceptualmente acomoda potencialmente un número de dobles enlaces no acumulados entre miembros anulares adyacentes (es decir, en su forma equivalente totalmente insaturada) mayor que el número de dobles enlaces presentes (es decir, en su forma parcialmente insaturada). Cuando un anillo heterocíclico totalmente insaturado satisface la regla de Hückel, entonces dicho anillo se denomina también como un "anillo heteroaromático" o "anillo heterocíclico aromático". Los términos "sistema anular heteroaromático" y "sistema anular bicíclico heteroaromático" indica un sistema anular en que al menos un átomo que forma el esqueleto del anillo no es carbono, por ejemplo, nitrógeno, oxígeno o azufre, y al menos un anillo es aromático. A menos que se indique otra cosa, los anillos y sistemas anulares heterocíclicos pueden estar unidos a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible por sustitución de un hidrógeno en dicho carbono o nitrógeno.

"Aromático" indica que cada uno de los átomos anulares está esencialmente en el mismo plano y tiene un orbital p perpendicular al plano del anillo, y que $(4n + 2) \pi$ electrones, donde n es un número entero positivo, están asociados con el anillo para cumplir con los requisitos de la regla de Hückel. El término "sistema anular heterocíclico aromático" indica un sistema anular heterocíclico en que al menos un anillo del sistema anular es aromático. El término "sistema anular no aromático" indica un sistema anular carbocíclico o heterocíclico que puede estar totalmente saturado, además de parcialmente o totalmente insaturado, con tal que ninguno de los anillos en el sistema anular sea aromáticos. El término "anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros" se refiere a anillos que contienen cuatro a siete miembros anulares y que no satisfacen la regla de Hückel. Este término (como se usa donde R^6 y R^7 se toman juntos) no está limitado por átomos de carbono solo y puede incluir miembros anulares seleccionados de O, $S(O)_n$ y NR^{13} .

En el contexto de la presente invención cuando un ejemplo de Q^1 , Q^2 o R^1 comprende un fenilo o un anillo heterocíclico totalmente insaturado de 6 miembros, las posiciones orto, meta y para de cada anillo es relativa a la conexión de anillo al resto de Fórmula 1.

Como se anota anteriormente, Q^1 , Q^2 y R^1 pueden ser (entre otros) fenilo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes como se define en el Compendio de la invención. Un ejemplo de fenilo opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes es el anillo ilustrado como U-57 en la Exhibición A, en donde R^8 es como se define en el Compendio de la invención para R^8 y q es un número entero de 0 a 5.

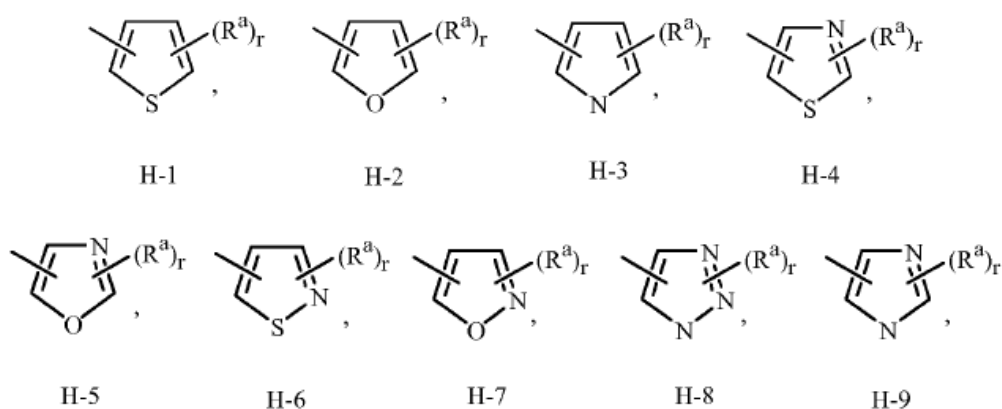
Como se anota anteriormente, Q^1 es, *entre otros*, un anillo heterocíclico totalmente insaturado de 5 a 6 miembros o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros, conteniendo cada anillo o sistema anular miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 3 miembros anulares de átomo de carbono se seleccionan independientemente de $C(=O)$ y $C(=S)$, los miembros anulares de átomo de azufre se seleccionan independientemente de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, cada anillo o sistema anular sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de cualquier sustituyente definido en el Compendio de la Invención para Q^1 (por ejemplo, un anillo o sistema anular Q^1 está opcionalmente sustituido con R^3 en miembros anulares de carbono y ciano, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_6 , alquil C_2-C_6 carbonilo, alcoxi C_2-C_6 carbonilo, alquilaminoalquilo C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo C_3-C_6 en miembros anulares de átomos de nitrógeno). De forma similar, Q^2 es, *entre otros*, un anillo heterocíclico saturado, parcialmente insaturado o totalmente insaturado de 5 a 6 miembros o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros, conteniendo cada anillo o sistema anular miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos independientemente seleccionados de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 3 miembros anulares de átomo de carbono se seleccionan independientemente de $C(=O)$ y $C(=S)$, los miembros anulares de átomo de azufre se seleccionan independientemente de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, cada anillo o sistema anular opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de cualquier sustituyente definido en el Compendio de la invención para Q^2 . Como los sustituyentes en el anillo o sistema anular de Q^1 o Q^2 son opcionales, 0 a 5 sustituyentes pueden estar presentes, limitados solo por el número de puntos de unión disponibles. En estas definiciones de anillo heterocíclico y sistema anular heteroaromático, los miembros anulares seleccionados a partir de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N son opcionales, con tal que al menos un miembro anular no sea carbono (por ejemplo, N, O o S). La definición de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$ permite que los hasta 2 miembros anulares de azufre, se oxiden a restos sulfuro (por ejemplo, $S(=O)$ o $S(=O)_2$) o átomos de azufre no oxidados (es decir, cuando u y v son ambos cero). Los miembros anulares de átomo de nitrógeno pueden oxidarse como N-óxidos, porque los compuestos que se refieren a la Fórmula 1 también incluyen derivados de N-óxido. Los hasta 3 miembros anulares de átomo de carbono seleccionados de $C(=O)$ y $C(=S)$ están añadidos a los hasta 4 heteroátomos seleccionados de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N.

También como se anota anteriormente, R^1 puede ser (entre otros) heterociclo aromático que contiene nitrógeno de 5 o 6 miembros, que puede estar opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes como se define en el Compendio de la invención.

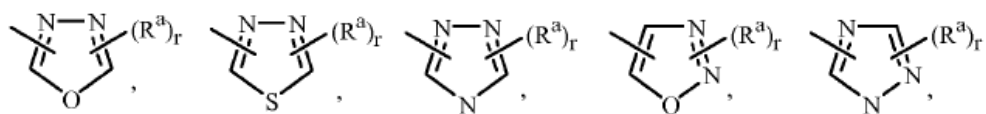
Cuando R^1 es fenilo o un heterociclo aromático que contiene nitrógeno de 5 o 6 miembros, puede estar unido al resto de Fórmula 1 a través de cualquier átomo anular de carbono o nitrógeno disponible, a menos que se describa otra cosa. Asimismo, el anillo o sistema anular de Q^1 o Q^2 puede estar unido al resto de Fórmula 1 a través de cualquier átomo anular de carbono o nitrógeno disponible, a menos que se describa otra cosa.

- 5 Los ejemplos de un anillo heterocíclico totalmente insaturado de 5 a 6 miembros incluyen los anillos H-1 a H-39 ilustrados en la Exhibición 1, y ejemplos de un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros incluyen los sistemas anulares B-1 a B-39 ilustrados en la Exhibición 2. En las Exhibiciones 1 y 2 la variable R^a es cualquier sustituyente como se define en el Compendio de la Invención para Q^1 , Q^2 o R^1 (por ejemplo, un anillo o sistema anular Q^1 está opcionalmente sustituido con R^3 en miembros anulares de átomo de carbono y ciano, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alcoxilquilo C_2-C_6 , alquil C_2-C_6 carbonilo, alcoxi C_2-C_6 carbonilo, alquilaminoalquilo C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo C_3-C_6 en miembros anulares de átomo de nitrógeno) y r es un número entero de 0 a 5 para Q^1 y Q^2 o de 0 a 3 para R^1 , limitado por el número de posiciones disponibles en cada anillo o sistema anular representado.

Exhibición 1



15



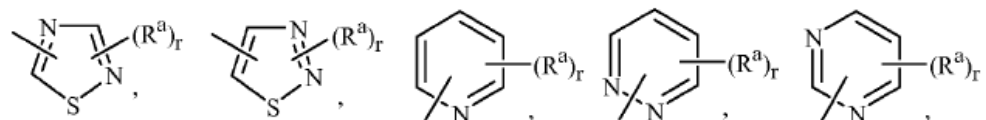
H-10

H-11

H-12

H-13

H-14



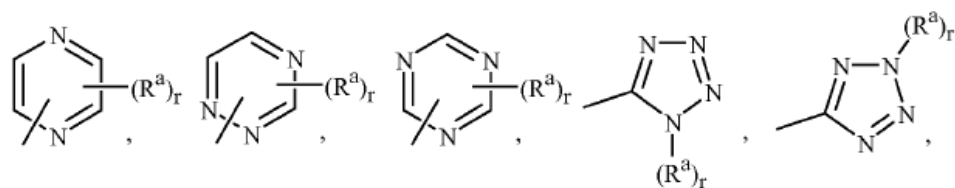
H-15

H-16

H-17

H-18

H-19



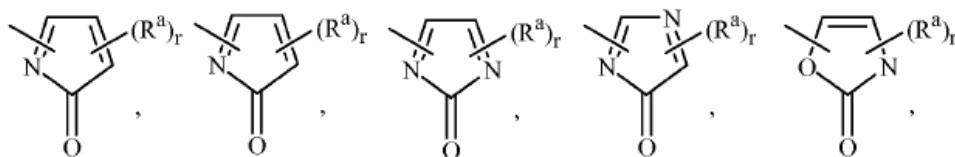
H-20

H-21

H-22

H-23

H-24



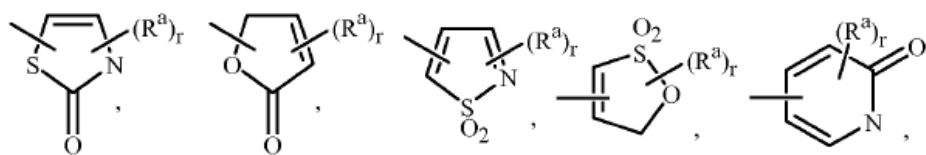
H-25

H-26

H-27

H-28

H-29



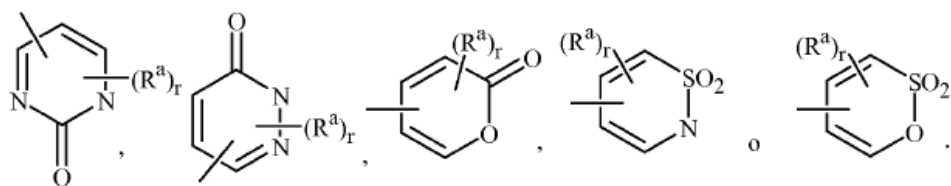
H-30

H-31

H-32

H-33

H-34



H-35

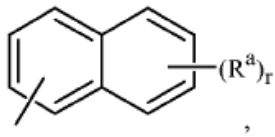
H-36

H-37

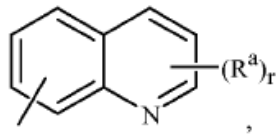
H-38

H-39

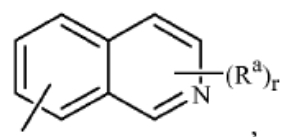
Exhibición 2



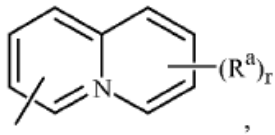
B-1



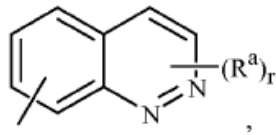
B-2



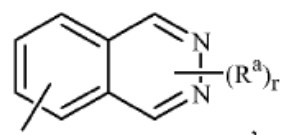
B-3



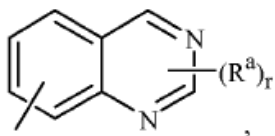
B-4



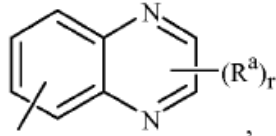
B-5



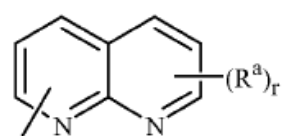
B-6



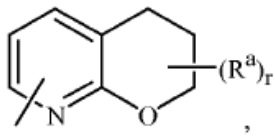
B-7



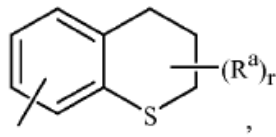
B-8



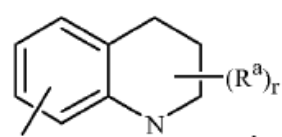
B-9



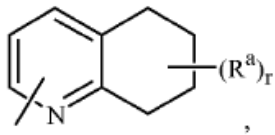
B-10



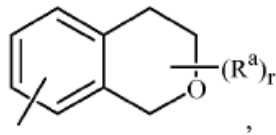
B-11



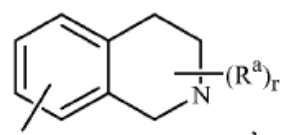
B-12



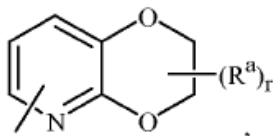
B-13



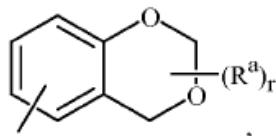
B-14



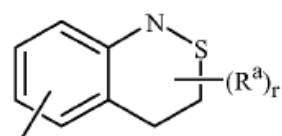
B-15



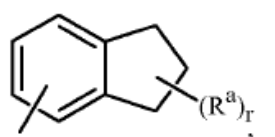
B-16



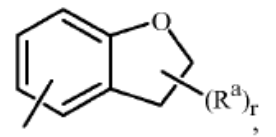
B-17



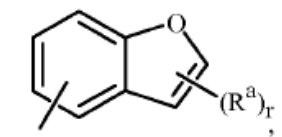
B-18



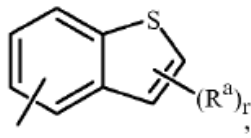
B-19



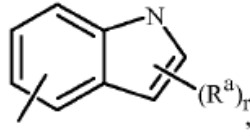
B-20



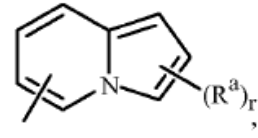
B-21



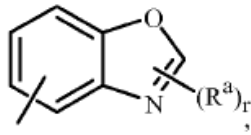
B-22



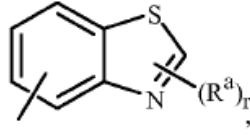
B-23



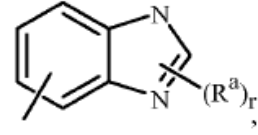
B-24



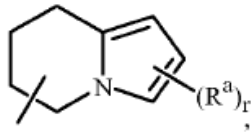
B-25



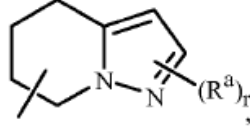
B-26



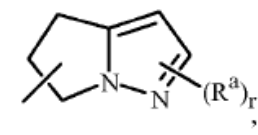
B-27



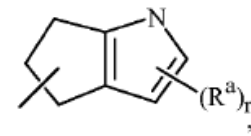
B-28



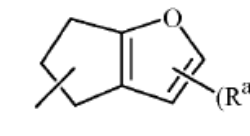
B-29



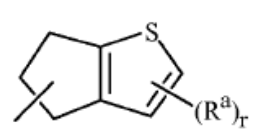
B-30



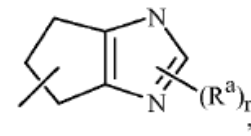
B-31



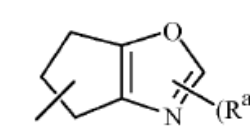
B-32



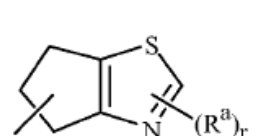
B-33



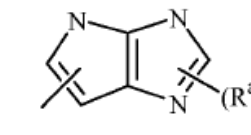
B-34



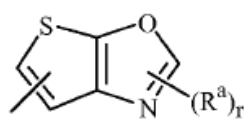
B-35



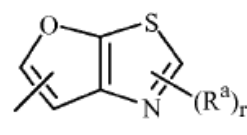
B-36



B-37



B-38



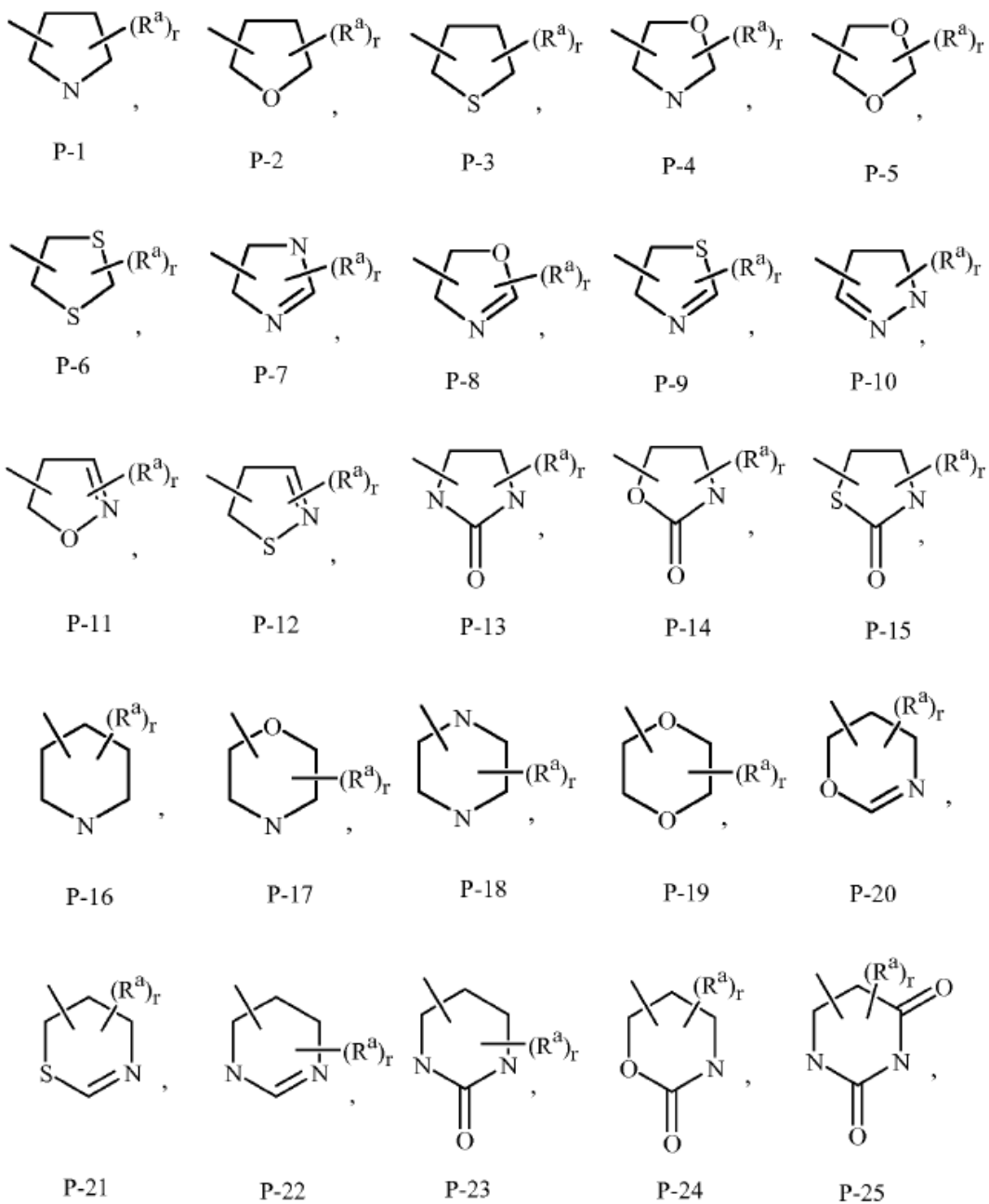
B-39

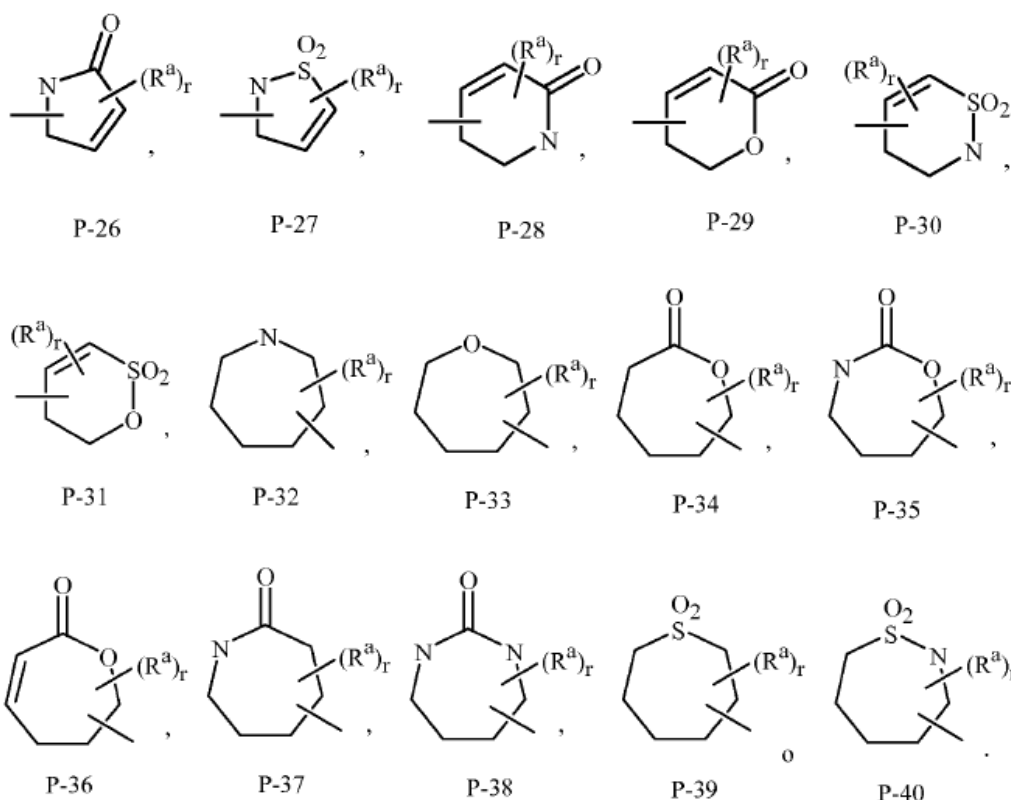
o

5

Ejemplos de un anillo heterocíclico totalmente insaturado de 5 a 6 miembros saturado o parcialmente insaturado incluyen los anillos P-1 a P-40 ilustrados en la Exhibición 3. En la Exhibición 3 la variable R^a es cualquier sustituyente como se define en el Compendio de la invención para Q^2 (por ejemplo, un anillo Q^2 está opcionalmente sustituido con R^3 en los miembros anulares de carbono y ciano, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alcoxilquilo C_2-C_6 , alquil C_2-C_6 carbonilo, alcoxi C_2-C_6 carbonilo, alquilaminoalquilo C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo C_3-C_6 en miembros anulares de átomo de nitrógeno) y r es un número entero de 0 a 5, limitado por el número de posiciones disponibles en cada anillo o sistema anular representado.

Exhibición 3

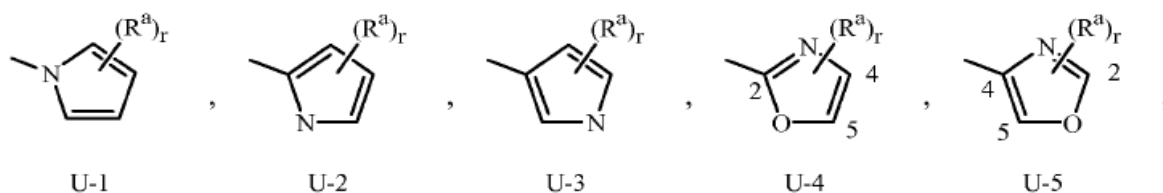


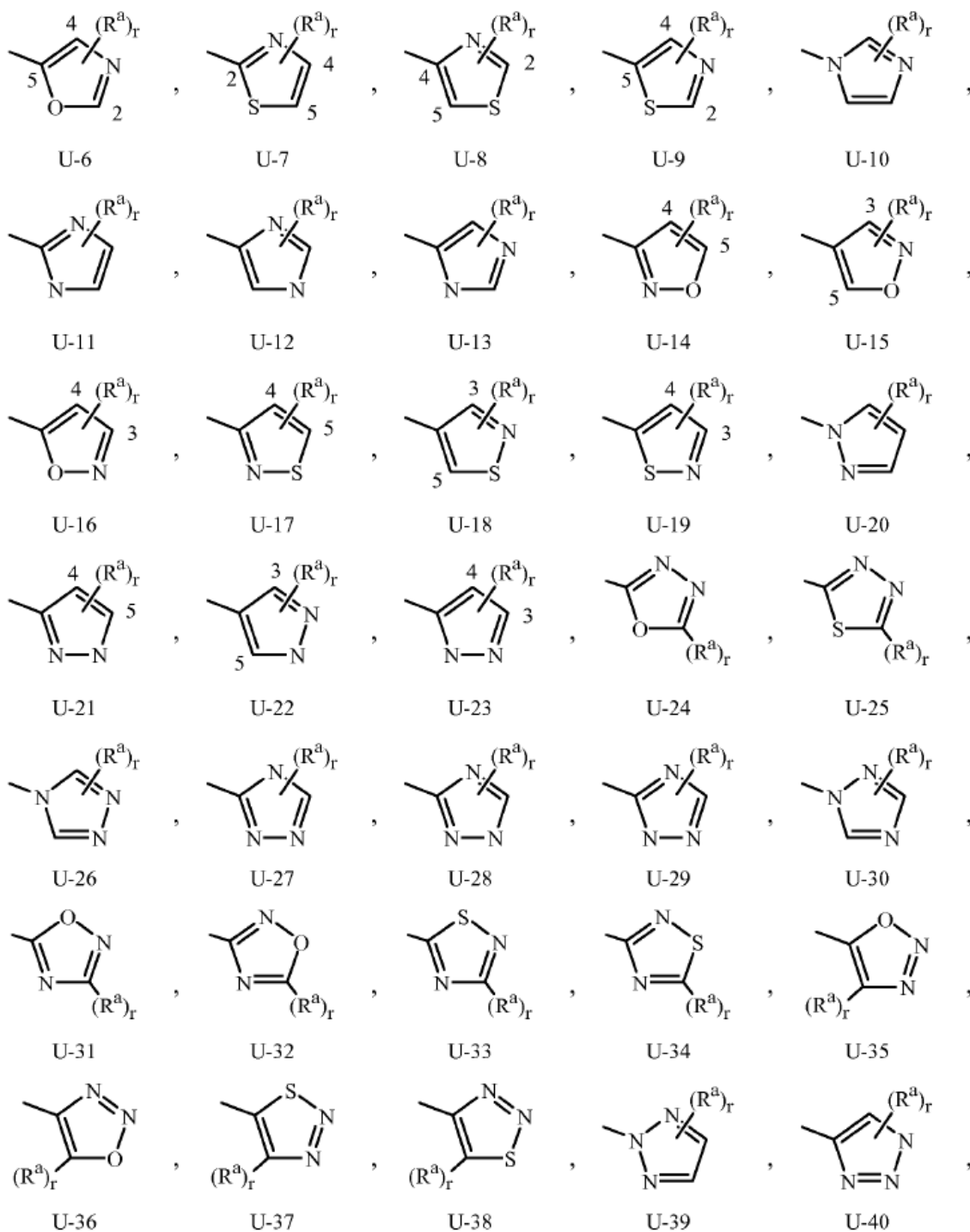


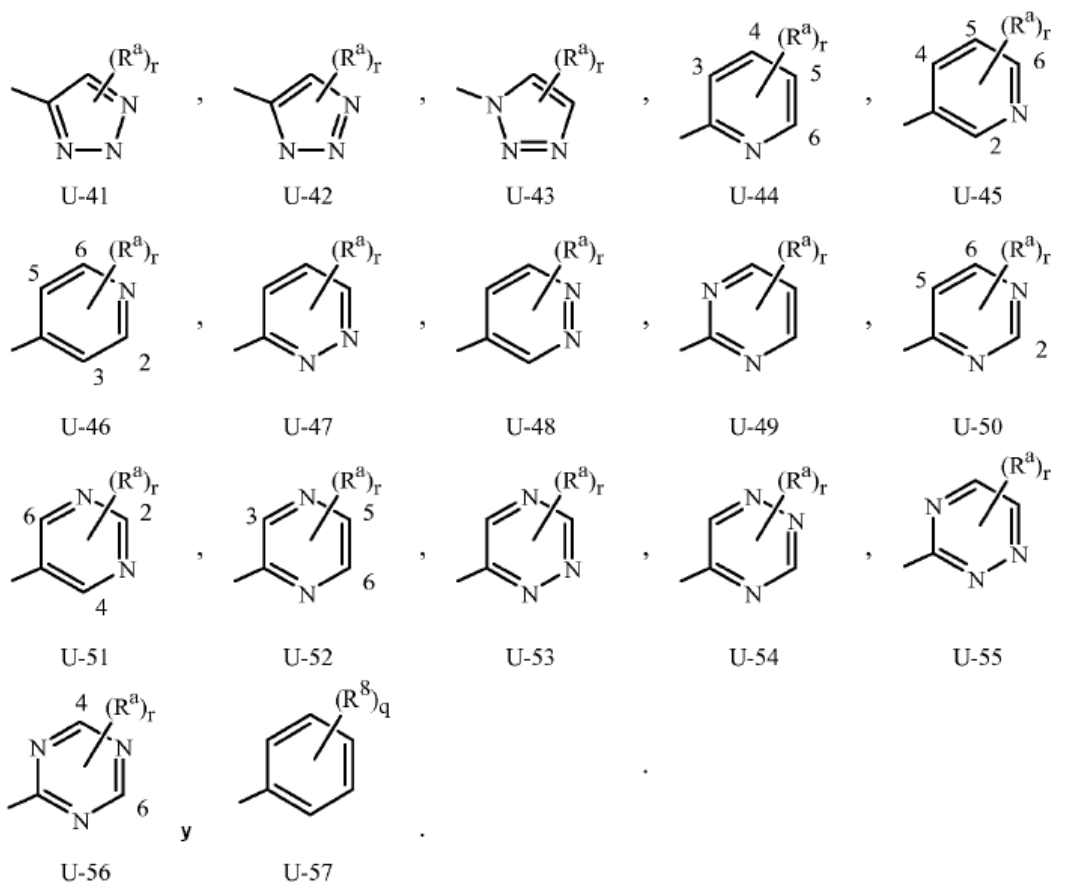
5 Ejemplos de un heterociclo que contiene nitrógeno de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con de uno o más sustituyentes de nota particular para Q¹, Q² y R¹ incluyen los anillos U-1 a U-56 ilustrados en la Exhibición A en donde R^a es cualquier sustituyente como se define en el Compendio de la invención para Q¹, Q² y R¹, respectivamente (es decir, para Q¹ y Q²; R³ en miembros anulares de átomo de carbono, y la lista enumerada de posibles sustituyentes en miembros anulares de átomo de nitrógeno; y para R¹, R^{9a} en miembros anulares de carbono y R^{9b} en miembros anulares de nitrógeno) y r es un número entero que oscila de 0 a 4 para Q¹ y Q² y de 0 a 3 para R¹, limitado por el número de posiciones disponibles en cada grupo U. Notar que algunos grupos U pueden estar sustituidos solo con menos de 4 grupos R^a (por ejemplo, U-4 a U-43 y U-47 a U-56). Como U-24, U-25, U-31, U-32, U-33, U-34, U-35, U-36, U-37 y U-38 tienen solo una posición disponible, para estos grupos U, r está limitado a los números enteros 0 o 1, y r siendo 0 significa que el grupo U no está sustituido y un hidrógeno está presente en la posición indicada por (R^a)_r.

10

Exhibición A



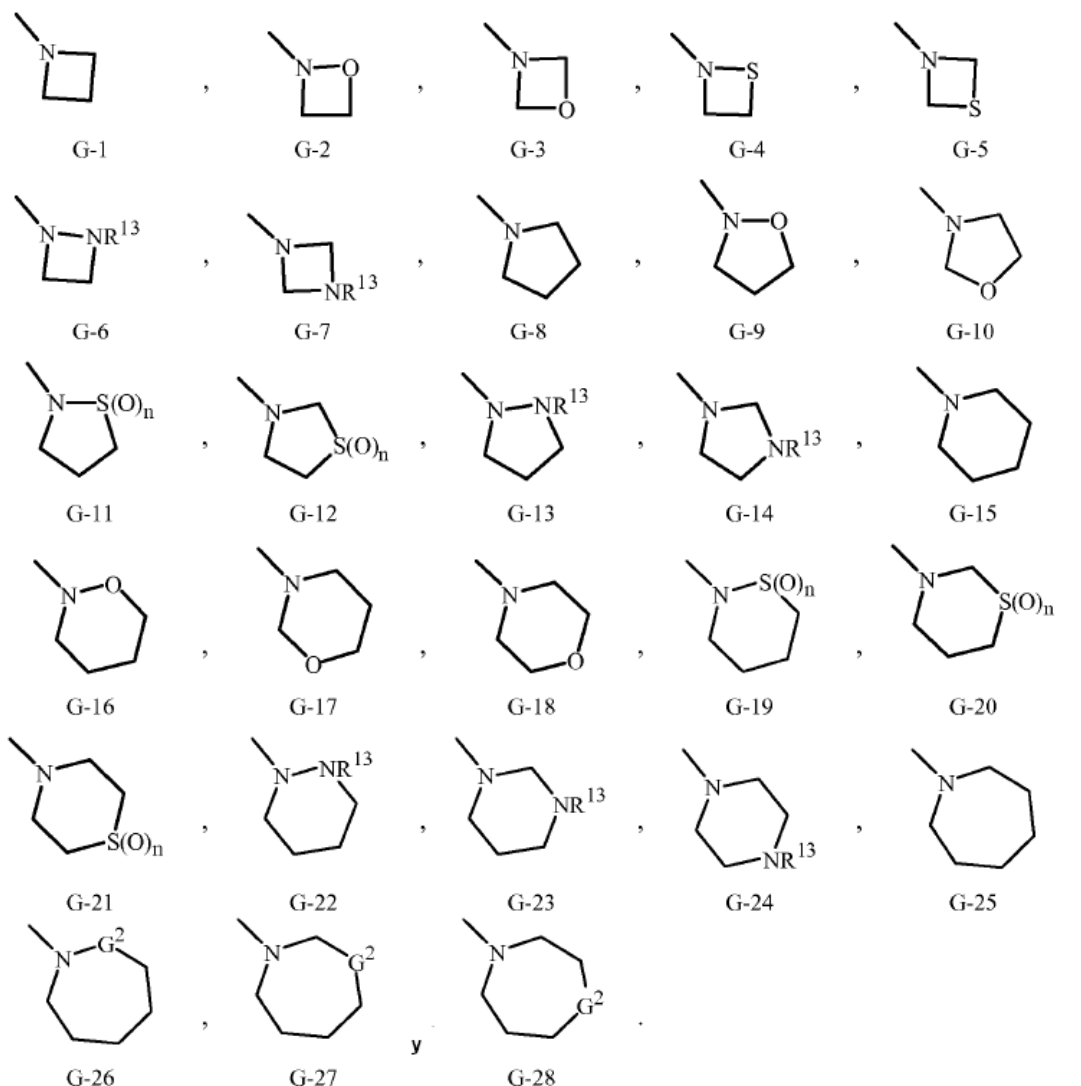




Aunque los grupos R^a se muestran en las estructuras H-1 a H-39, B-1 a B-39, P-1 a P-40 y U-1 a U-57 en las Exhibiciones 1 a 3 y la Exhibición A, se nota que no necesitan estar presentes ya que son sustituyentes opcionales. Los átomos de nitrógeno que necesitan sustitución para llenar sus valencias están sustituidos con H o R^a . Notar que cuando el punto de unión entre $(R^a)_r$ y el grupo H, B, P o U en las Exhibiciones 1 a 3 y la Exhibición A se ilustra como flotante, $(R^a)_r$ puede estar unido a cualquier átomo de carbono o átomo de nitrógeno disponible del grupo H, B, P o U. Notar que cuando el punto de unión en el grupo H, B o P en las Exhibiciones 1 a 3 se ilustra como flotante, el grupo H, B o P puede estar unido al resto de Fórmula 1 a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo H, B o P por sustitución de un átomo de hidrógeno. Son dignas de mención las representaciones alternativas de las estructuras químicas mostradas en las Exhibiciones 1 a 3 y la Exhibición A en que el sustituyente variable " R^{av} " se sustituye por " R^v ", en donde el superíndice "v" en " R^v " no se refiere a la variable subíndice "v" definido en el Compendio de la invención sino que diferencia " R^v " de otras variables sustituyentes que comienzan con "R".

Ejemplos de donde R^6 y R^7 se toman juntos para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros incluyen los anillos G-1 a G-28 como se ilustra en la Exhibición 4. Notar que cuando R^6 y R^7 se toman juntos para formar un anillo que comprende un anillo seleccionado de G-25 a G-28, G^2 se selecciona de O, $S(O)_n$ o NR^{13} . Notar que cuando G^2 es N, el átomo de nitrógeno puede completar su valencia por sustitución o bien con H o los sustituyentes correspondientes a R^{13} como se definen en el Compendio de la invención.

Exhibición 4



Una amplia variedad de métodos sintéticos se conocen en la técnica para permitir la preparación de anillos y sistemas anulares heterocíclicos aromáticos y no aromáticos; para revisiones extensas véase el conjunto de ocho volúmenes de *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky y C. W. Rees editores jefe, Pergamon Press, Oxford, 1984 y el conjunto de doce volúmenes de *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees y E. F. V. Scriven editores jefe, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Los compuestos de esta invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros e isómeros geométricos. Un experto en la técnica apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede mostrar efectos beneficiosos cuando se enriquece respecto al(a los) otro(s) estereoisómero(s) o cuando se separa del(de los) otro(s) estereoisómero(s). Adicionalmente, el experto sabe como separar, enriquecer y/o preparar de forma selectiva dichos estereoisómeros. Los compuestos de la invención pueden estar presentes como una mezcla de estereoisómeros, estereoisómeros individuales o como una forma ópticamente activa.

Un experto en la técnica apreciará que no todos los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar *N*-óxidos ya que el nitrógeno necesita un par libre de electrones disponible para la oxidación al óxido; un experto en la técnica reconocerá los heterociclos que contienen nitrógeno que pueden formar *N*-óxidos. Un experto en la técnica reconocerá también que aminas terciarias pueden formar *N*-óxidos. Los métodos sintéticos para la preparación de *N*-óxidos de heterociclos y aminas terciarias son muy bien conocidos por un experto en la técnica que incluyen la oxidación de heterociclos y aminas terciarias con peroxiacidos tales como ácido peracético y *m*-cloroperbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno, hidroperóxidos de alquilo tales como hidroperóxido de *t*-butilo, perborato sódico y dioxiranos tal como dimetildioxirano. Estos métodos para la preparación de *N*-óxidos se han descrito y revisado de forma extensa en la bibliografía, véase por ejemplo: T. L. Gilchrist en *Comprehensive Organic Chemistry*, vol. 7, págs. 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*,

vol. 3, págs. 18-20, A. J. Boulton y A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett y B. R. T. Keene en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, págs. 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, págs. 285-291, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press; y G. W. H. Cheeseman y E.S.G. Werstiuk en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, págs. 390-392, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Un experto en la técnica reconoce que algunos de los compuestos descritos en esta memoria pueden existir en equilibrio con uno o más de sus respectivos equivalentes tautoméricos. A menos que se indique otra cosa, se va a considerar que la referencia a un compuesto por una descripción de tautómero incluye todos los tautómeros. Por ejemplo, la referencia a la forma tautomérica representada por la Fórmula 1 (no reivindicada) también incluye la forma tautomérica representada por la Fórmula 2 (no reivindicada).



Un experto en la técnica reconoce que porque en el medio y bajo condiciones fisiológicas las sales de compuestos químicos están en equilibrio con sus formas no salinas correspondientes, las sales comparten la utilidad biológica de las formas no salinas. Así una amplia variedad de sales de los compuestos de Fórmula 1 son útiles para el control de enfermedades de las plantas provocadas por patógenos de plantas fúngicos (es decir, son agrícolamente adecuadas). Las sales de los compuestos de Fórmula 1 incluyen sales de adición de ácido con ácidos orgánicos o inorgánicos tal como ácidos bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propionico, salicílico, tartárico, 4-toluenosulfónico o valérico.

Los compuestos seleccionados de Fórmula 1, isómeros geométricos y estereoisómeros, tautómeros, *N*-óxidos y sales de los mismos, existen típicamente en más de una forma, y por lo tanto la Fórmula 1 incluye todas las formas cristalinas y no cristalinas de los compuestos que la Fórmula 1 representa. Las formas no cristalinas incluyen realizaciones que son sólidos tal como ceras y gomas además de realizaciones que son líquidos tal como disoluciones y fundidos. Las formas cristalinas incluyen realizaciones que representan esencialmente un tipo de cristal sencillo y realizaciones que representan una mezcla de polimorfos (es decir, diferentes tipos cristalinos). El término "polimorfo" se refiere a una forma cristalina particular de un compuesto químico que puede cristalizar en diferentes formas cristalinas, teniendo estas formas diferentes disposiciones y/o conformaciones de las moléculas en la lámina de cristal. Aunque los polimorfos pueden tener la misma composición química, pueden también diferir en la composición debido a la ausencia o presencia de agua co-cristalizada u otras moléculas, que pueden unirse de forma débil o fuerte en la lámina. Los polimorfos pueden diferir en dichas propiedades químicas, físicas y biológicas como forma del cristal, densidad, dureza, color, estabilidad química, punto de fusión, capacidad higroscópica, capacidad de suspensión, velocidad de disolución y disponibilidad biológica. Un experto en la técnica apreciará que un polimorfo de un compuesto representado por la Fórmula 1 puede mostrar efectos beneficiosos (por ejemplo, adecuación para la preparación de formulaciones útiles, rendimiento biológico mejorado) respecto a otro polimorfo o una mezcla de polimorfos del mismo compuesto representado por la Fórmula 1. La preparación y aislamiento de un polimorfo particular de un compuesto representado por la Fórmula 1 puede alcanzarse mediante métodos conocidos por los expertos en la técnica que incluyen por ejemplo, la cristalización usando disolventes y temperaturas seleccionadas.

Las realizaciones de la presente invención como se describen en el Compendio de la Invención incluyen (donde la Fórmula 1 como se usa en las siguientes Realizaciones incluye *N*-óxidos y sales, isómeros geométricos, estereoisómeros y atropisómeros de los mismos):

Realización 1. Un compuesto de Fórmula 1 en donde X es O o S(O)_m.

Realización 2. Un compuesto de Fórmula 1 en donde X es O.

Realización 3. Un compuesto de Fórmula 1 en donde X es NR⁴.

Realización 4. Un compuesto de Fórmula 1 en donde X es O o NR⁴.

Realización 5. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 4 en donde cuando Q¹ es un anillo de seis miembros (por ejemplo, fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo) y un sustituyente R³ está situado en una posición meta (respecto a la conexión del anillo Q¹ al resto de la Fórmula 1), entonces dicho sustituyente R³ se selecciona de F, Cl, Br y ciano (-CN).

- Realización 5a. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 5 en donde cuando Q^1 es un anillo de seis miembros y un sustituyente R^3 está situado en una posición meta (respecto a la conexión del anillo Q^1 al resto de Fórmula 1), entonces dicho sustituyente R^3 es F.
- 5 Realización 6. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 5a en donde cuando Q^1 es un anillo de seis miembros (por ejemplo, fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo) sustituido con solo un sustituyente R^3 , entonces dicho sustituyente R^3 está unido a una posición orto (respecto a la conexión del anillo Q^1 al resto de la Fórmula 1).
- 10 Realización 7. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 6 en donde Q^1 es fenilo, tienilo, piridinilo, piridazinilo, pirazinilo, pirimidinilo, naftalenilo, quinolinilo, isoquinolinilo o quinoxalinilo, cada uno sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- Realización 8. Un compuesto de la Realización 7 en donde Q^1 es fenilo, tienilo, piridinilo, piridazinilo, pirazinilo o pirimidinilo, cada uno sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados opcionalmente de R^3 .
- Realización 9. Un compuesto de la Realización 8 en donde Q^1 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo, cada uno sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- 15 Realización 10. Un compuesto de la Realización 9 en donde Q^1 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- Realización 11. Un compuesto de la Realización 10 en donde los sustituyentes están situados en las posiciones orto y/o para (respecto a la conexión del anillo Q^1 al resto de Fórmula 1) del fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo de Q^1 .
- 20 Realización 12. Un compuesto de las Realizaciones 10 u 11 en donde Q^1 es fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- Realización 13. Un compuesto de Realización 12 en donde Q^1 es fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 2 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- 25 Realización 14. Un compuesto de Realización 13 en donde Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 , o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- Realización 15. Un compuesto de la Realización 14 en donde Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- 30 Realización 16. Un compuesto de la Realización 15 en donde Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- Realización 17. Un compuesto de la Realización 15 en donde Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- 35 Realización 18. Un compuesto de la Realización 15 en donde Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- Realización 19. Un compuesto de la Realización 12 en donde Q^1 es piridinilo sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- 40 Realización 20. Un compuesto de la Realización 19 en donde Q^1 es piridinilo sustituido con 1 o 2 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- Realización 21. Un compuesto de la Realización 20 en donde Q^1 es piridinilo sustituido con 1 sustituyente seleccionado independientemente de R^3 .
- 45 Realización 22. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 21 en donde cuando Q^2 es un anillo de seis miembros (por ejemplo, fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo) y un sustituyente R^3 está situado en una posición meta (respecto a la conexión del anillo Q^2 al resto de Fórmula 1), entonces dicho sustituyente R^3 se selecciona de F, Cl, Br y ciano (-CN).
- Realización 23. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 22 en donde cuando Q^2 es un anillo de seis miembros y un sustituyente R^3 está situado en una posición meta (respecto a la conexión del anillo Q^2 al resto de Fórmula 1), entonces dicho sustituyente R^3 es F.

- Realización 24. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 23 en donde cuando Q^2 es un anillo de seis miembros (por ejemplo, fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo) sustituido con solo un sustituyente R^3 , entonces dicho sustituyente R^3 está unido a una posición orto (respecto a la conexión del anillo Q^2 al resto de Fórmula 1).
- 5 Realización 25. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 24 en donde Q^2 es fenilo, tienilo, piridinilo, piridazinilo, pirazinilo, pirimidinilo, naftalenilo, quinolinilo, isoquinolinilo o quinoxalinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- Realización 26. Un compuesto de la Realización 25 en donde Q^2 es fenilo, tienilo, piridinilo, piridazinilo, pirazinilo o pirimidinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 .
- 10 Realización 27. Un compuesto de la Realización 26 en donde Q^2 es un fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo, cada uno sustituido con de 1 a 4 sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 .
- Realización 28. Un compuesto de cualquiera de las Realizaciones 25 a 27 en donde Q^2 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 .
- 15 Realización 29. Un compuesto de la Realización 28 en donde los sustituyentes están situados en las posiciones orto y/o para (respecto a la conexión del anillo Q^2 al resto de Fórmula 1) del fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo de Q^2 .
- Realización 30. Un compuesto de cualquiera de las Realizaciones 28 o 29 en donde Q^2 es fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 .
- 20 Realización 31. Un compuesto de la Realización 30 en donde Q^2 es fenilo sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 .
- Realización 32. Un compuesto de la Realización 31 en donde Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 ; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 ; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 .
- 25 Realización 33. Un compuesto de la Realización 32 en donde Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 .
- Realización 34. Un compuesto de la Realización 32 en donde Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 .
- 30 Realización 35. Un compuesto de la Realización 32 en donde Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 .
- Realización 36. Un compuesto de la Realización 30 en donde Q^2 es piridinilo sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 .
- 35 Realización 37. Un compuesto de la Realización 36 en donde Q^2 es piridinilo sustituido con 1 o 2 sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 .
- Realización 38. Un compuesto de la Realización 37 en donde Q^2 es piridinilo sustituido con 1 sustituyente seleccionado de R^3 .
- Realización 39. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 38 en donde al menos uno de Q^1 y Q^2 es fenilo opcionalmente sustituido con R^3 (por ejemplo, opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes independientemente seleccionados de R^3).
- 40 Realización 40. Un compuesto de la Realización 39 en donde al menos uno de Q^1 y Q^2 es fenilo sustituido con 2, 3 o 4 sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 .
- Realización 41. Un compuesto de la Realización 40 en donde al menos un Q^1 y Q^2 es fenilo sustituido con 2 o 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 .
- 45 Realización 42. Un compuesto de la Realización 41 en donde cada uno de Q^1 y Q^2 es fenilo sustituido con 2 o 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 .
- Realización 43. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 42 en donde R^1 es H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , CO_2R^5 , $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 o alcóxialquilo C_2-C_5 , o R^1 es un heterociclo aromático que contiene nitrógeno de cinco a seis miembros opcionalmente sustituido con hasta 3

sustituyentes independientemente seleccionados de R^{9a} en miembros anulares de átomo de carbono y R^{9b} en miembros anulares de átomo de nitrógeno.

- 5 Realización 44. Un compuesto de la Realización 43 en donde R¹ es H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, ciano, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆; o R¹ es piridinilo, pirimidinilo, pirazolilo u oxazolilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes opcionalmente seleccionados de R^{9a} en miembros anulares de átomo de carbono y R^{9b} en miembros anulares de átomo de nitrógeno.
- Realización 45. Un compuesto de la Realización 44 en donde R¹ es H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, CO₂R⁵, C(O)NR⁶R⁷, ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o alcoxialquilo C₂-C₅.
- 10 Realización 46. Un compuesto de la Realización 45 en donde R¹ es H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, C(O)NR⁶R⁷, ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o alcoxialquilo C₂-C₅.
- Realización 47. Un compuesto de la Realización 46 en donde R¹ es H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o alcoxialquilo C₂-C₅.
- Realización 48. Un compuesto de la Realización 47 en donde R¹ es H, halógeno o alquilo C₁-C₆.
- Realización 49. Un compuesto de la Realización 48 en donde R¹ es H o CH₃.
- 15 Realización 50. Un compuesto de la Realización 49 en donde R¹ es H.
- Realización 51. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 50 en donde R¹ es distinto de un fenilo opcionalmente sustituido o un heterociclo aromático que contiene nitrógeno de cinco o seis miembros opcionalmente sustituido.
- 20 Realización 52. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 44 en donde R¹ es distinto de H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₇, CO₂R⁵, C(O)NR⁶R⁷, ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o alcoxialquilo C₂-C₅.
- Realización 53. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 52 en donde R^{1a} es H.
- Realización 54. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 53 en donde R² es CH₃, CH₂CH₃, halógeno, ciano, cianometilo, monohalometilo, hidroximetilo, metoxi o metiltio; o ciclopropilo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno y metilo.
- 25 Realización 55. Un compuesto de la Realización 54 en donde R² es CH₃, CH₂CH₃, Cl, Br o I.
- Realización 56. Un compuesto de la Realización 55 en donde R² es CH₃, CH₂CH₃, Cl o Br.
- Realización 57. Un compuesto de la Realización 56 en donde R² es CH₃, Cl o Br.
- Realización 58. Un compuesto de la Realización 57 en donde R² es CH₃ o Cl.
- 30 Realización 59. Un compuesto de la Realización 58 en donde R² es CH₃.
- Realización 60. Un compuesto de la Realización 56 en donde R² es Cl o Br.
- Realización 61. Un compuesto de la Realización 60 en donde R² es Cl.
- Realización 62. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 61 en donde R⁵ es H o alquilo C₁-C₆.
- 35 Realización 63. Un compuesto de la Realización 62 en donde R⁵ es H, CH₃ o CH₂CH₃.
- Realización 64. Un compuesto de la Realización 62 en donde R⁵ es alquilo C₁-C₆.
- Realización 65. Un compuesto de la Realización 63 o 64 en donde R⁵ es CH₃ o CH₂CH₃.
- Realización 66. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 65 en donde cuando R⁶ se separa (es decir, no se toma junto con R⁷ para formar un anillo), entonces R⁶ es H o alquilo C₁-C₆.
- 40 Realización 67. Un compuesto de la Realización 66 en donde R⁶ es H.
- Realización 68. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 67 en donde cuando R⁷ está separado (es decir, no tomado junto con R⁶ para formar un anillo), entonces R⁷ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o alquilcicloalquilo C₄-C₈.
- Realización 69. Un compuesto de la Realización 68 en donde R⁷ es H o alquilo C₁-C₆.

Realización 70 un compuesto de la Realización 69 en donde R^7 es H.

Realización 71. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 70 en donde cuando R^6 y R^7 se toman juntos con el átomo de nitrógeno al que están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático, el anillo contiene miembros anulares, además de su átomo de nitrógeno de conexión, seleccionados de átomos de carbono y hasta un miembro anular seleccionado de O y NR^{13} .

5

Realización 72. Un compuesto de la Realización 71 en donde cuando R^6 y R^7 se toman juntos con el átomo de nitrógeno al que están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático, el anillo tiene seis miembros y contiene un miembro anular seleccionado de O y NR^{13} además del átomo de nitrógeno de conexión y miembros anulares seleccionados de átomos de carbono.

10 Realización 73. Un compuesto de la Realización 71 en donde R^6 y R^7 se toman juntos con el átomo de nitrógeno al que están conectados para formar un anillo de piperidina.

Realización 74. Un compuesto de la Realización 72 en donde R^6 y R^7 se toman juntos con el átomo de nitrógeno al que están conectados para formar un anillo de piperazina o morfolina.

15 Realización 75. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 74 en donde cada R^8 se selecciona independientemente de halógeno, alquilo C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , haloalcoxi C_1-C_2 , ciano y nitro.

Realización 76. Un compuesto de la Realización 75 en donde cada R^8 se selecciona independientemente de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , ciano y nitro.

Realización 77. Un compuesto de la Realización 76 en donde cada R^8 es independientemente Cl o F.

20 Realización 78. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 77 en donde cada R^{9a} se selecciona independientemente de halógeno, alquilo C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , haloalcoxi C_1-C_2 , ciano y nitro.

Realización 79. Un compuesto de la Realización 78 en donde cada R^{9a} se selecciona independientemente de halógeno, alquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , ciano y nitro.

25 Realización 80. Un compuesto de la Realización 79 en donde cada R^{9a} se selecciona independientemente de Cl, F, CH_3 , $-OCH_3$ y ciano.

Realización 81. Un compuesto de la Realización 80 en donde cada R^{9a} es independientemente Cl o F.

Realización 82. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 81 en donde cada R^{9b} es independientemente alquilo C_1-C_2 .

30 Realización 83. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 82 en donde cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 tio, haloalquil C_1-C_3 tio, alquil C_1-C_3 sulfínilo, haloalquil C_1-C_3 sulfínilo, alquil C_1-C_3 sulfonilo, haloalquil C_1-C_3 sulfonilo, cicloalquilo C_3-C_4 , $C(=S)NH_2$ y $-U-V-T$.

35 Realización 84. Un compuesto de la Realización 83 en donde cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 y $-U-V-T$.

Realización 85. Un compuesto de la Realización 84 en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, CH_3 , CF_3 , $-OCH_3$, $-OCHF_2$ y $-U-V-T$.

Realización 86. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 85 en donde al menos un sustituyente R^3 en el anillo o sistema anular de Q^1 o Q^2 es $-U-V-T$.

40 Realización 87. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 85 en donde cada R^3 es distinto de $-U-V-T$.

Realización 88. Un compuesto de la Realización 83 en donde cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 tio, haloalquil C_1-C_3 tio, alquil C_1-C_3 sulfínilo, haloalquil C_1-C_3 sulfínilo, alquil C_1-C_3 sulfonilo, haloalquil C_1-C_3 sulfonilo y cicloalquilo C_3-C_4 .

45

Realización 89. Un compuesto de la Realización 88 en donde cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_3 y haloalcoxi C_1-C_3 .

Realización 90. Un compuesto de la Realización 89 en donde cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 y haloalcoxi C_1-C_3 .

- Realización 91. Un compuesto de la Realización 90 en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, alquilo C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 y haloalcoxi C_1-C_2 .
- Realización 92. Un compuesto de la Realización 91 en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, metilo, alcoxi C_1-C_2 y fluorometoxi.
- 5 Realización 93. Un compuesto de la Realización 92 en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, ciano, metilo, alcoxi C_1-C_2 y fluorometoxi.
- Realización 94. Un compuesto de la Realización 89 en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, CH_3 , CF_3 , $-OCH_3$ y $-OCHF_2$.
- 10 Realización 95. Un compuesto de las Realizaciones 83 a 92 o 94 en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano y metoxi.
- Realización 96. Un compuesto de la Realización 95 en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br y ciano.
- Realización 97. Un compuesto de la Realización 95 en donde cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, ciano y $-OCH_3$.
- 15 Realización 98. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 86 en donde cada U es independientemente O o NR^{22} .
- Realización 99. Un compuesto de la Realización 98 en donde cada U es independientemente O o NH.
- Realización 100. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 86 y 98 a 99 en donde cada V es alquileo C_2-C_4 .
- 20 Realización 101. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 86 y 98 a 100 en donde cada T es independientemente $NR^{23a}R^{23b}$ o OR^{24} .
- Realización 102. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 86 y 98 a 101 en donde cada R^{23a} y R^{23b} es independientemente H, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 .
- 25 Realización 103. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 86 y 98 a 102 en donde cada R^{24} es independientemente H, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 .
- Realización 104. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 103 en donde cuando un sustituyente R^3 unido a fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo de Q^1 o Q^2 es distinta de F, Cl, Br, ciano, metilo, alcoxi C_1-C_2 y fluorometoxi, después dicho sustituyente R^3 está unido a la posición para (del anillo fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo).
- 30 Realización 105. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 104 en donde R^4 es H, formilo, cicloalquilo C_3-C_7 o $-SR^{10}$, o alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 , cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 R^{12} .
- Realización 106. Un compuesto de Realización 105 en donde R^4 es H, formilo, cicloalquilo C_3-C_7 o $-SR^{10}$; o alquilo C_1-C_6 sustituido con un R^{12} .
- 35 Realización 107. Un compuesto de la Realización 106 en donde R^4 es H, formilo, $-CH_2OCH_3$, ciclopropilo, $-SCH_3$, $-SCF_3$ o $-CH_2CN$.
- Realización 108. Un compuesto de la Realización 107 en donde R^4 es H, formilo, ciclopropilo o $-CH_2CN$.
- Realización 109. Un compuesto de la Realización 107 en donde R^4 es H, formilo, $-CH_2OCH_3$, ciclopropilo, $-SCH_3$ o $-SCF_3$.
- Realización 110. Un compuesto de la Realización 109 en donde R^4 es H, formilo o ciclopropilo.
- 40 Realización 111. Un compuesto de la Realización 108 o 110 en donde R^4 es H.
- Realización 112. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 111 en donde R^{13} es H o CH_3 .
- Realización 113. Un compuesto de la Realización 112 en donde R^{13} es CH_3 .
- Realización 114. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 113 en donde cada R^{12} es independientemente cicloalquilo C_3-C_7 , alcoxi C_1-C_4 o ciano.
- 45 Realización 115. Un compuesto de la Realización 114 en donde cada R^{12} es independientemente ciclopropilo, $-OCH_3$ o ciano.

Realización 116. Un compuesto de la Realización 114 en donde cada R^{12} es independientemente cicloalquilo C_3-C_7 o alcoxi C_1-C_4 .

Realización 117. Un compuesto de la Realización 116 en donde cada R^{12} es independientemente ciclopropilo o $-OCH_3$.

5 Realización 118. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 117 en donde R^{10} es CH_3 , CH_2CH_3 , CF_3 o CF_2CF_3 .

Realización 119. Un compuesto de la Realización 118 en donde R^{10} es CH_3 .

Realización 120. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 119 en donde R^{11} es alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o alquil C_1-C_6 tio.

10 Realización 121. Un compuesto de la Realización 120 en donde R^{11} es CH_3 , CH_2CH_3 , $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, $-SCH_3$ o $-SCH_2CH_3$.

Realización 122. Un compuesto de la Realización 121 en donde R^{11} es CH_3 , $-OCH_3$ o $-SCH_3$.

Realización 123. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 122 en donde W es O.

15 Realización 124. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 123 en donde M^+ es un catión seleccionado de iones sodio, potasio y litio.

Realización 125. Un compuesto de la Realización 124 en donde M^+ es un catión seleccionado de iones sodio y potasio.

Realización 126. Un compuesto de la Realización 125 en donde M^+ es ión sodio.

Realización 127. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 126 en donde m es 0.

20 Realización 128. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las Realizaciones 1 a 127 en donde n es 0.

Las realizaciones de esta invención, que incluyen las Realizaciones 1-128 anteriores además de cualquier otra realización descrita en esta memoria, pueden combinarse de cualquier forma, y las descripciones de variables en las realizaciones pertenecen no solo a los compuestos de Fórmula 1 sino también a los compuestos de partida y compuestos intermedios (por ejemplo compuestos de Fórmula 2) útiles para preparar los compuestos de Fórmula 1.

25 Además, las realizaciones de esta invención, que incluyen las Realizaciones 1-128 anteriores además de cualquier otra realización descrita en esta memoria, y cualquier combinación de las mismas, pertenecen a las composiciones y métodos de la presente invención.

Las combinaciones de las Realizaciones 1-128 se ilustran por:

Realización A. Un compuesto de Fórmula 1 en donde

30 Q^1 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo, cada uno sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; con tal que cuando un sustituyente R^3 esté situado en una posición meta, entonces dicho sustituyente R^3 se seleccione de F, Cl, Br y ciano;

35 Q^2 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; con tal que cuando un sustituyente R^3 esté situado en una posición meta, entonces dicho sustituyente R^3 se seleccione de F, Cl, Br y ciano;

X es O o NR^4 ;

R^1 es H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , CO_2R^5 , $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 o alcoxialquilo C_2-C_5 ;

R^{1a} es H;

40 R^2 es CH_3 , CH_2CH_3 , Cl o Br;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 tio, haloalquil C_1-C_3 tio, alquil C_1-C_3 sulfinilo, haloalquil C_1-C_3 sulfinilo, alquil C_1-C_3 sulfonilo, haloalquil C_1-C_3 sulfonilo, cicloalquilo C_3-C_4 , $C(=S)NH_2$ y $-U-V-T$;

45 R^4 es H, formilo, cicloalquilo C_3-C_7 o $-SR^{10}$; o alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 , cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 R^{12} ;

R^5 es alquilo C_1-C_6 ;

R⁶ es H o alquilo C₁-C₆;

R⁷ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, o alquilocicloalquilo C₄-C₈; o

5 R⁶ y R⁷ se toman juntos con el átomo de nitrógeno al que están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contienen miembros anulares, además del átomo de nitrógeno de conexión, seleccionados de átomos de carbono y hasta un miembro anular seleccionado de O y NR¹³;

cada R¹² es independientemente cicloalquilo C₃-C₇, alcoxi C₁-C₄ o ciano; y

R¹³ es H o CH₃.

Realización B. Un compuesto de la realización A en donde

Q¹ es fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R³;

10 Q² es un fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R³;

R¹ es H, halógeno o alquilo C₁-C₆;

R² es CH₃, Cl o Br;

cada R³ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃ y -U-V-T;

15 R⁴ es H, formilo, cicloalquilo C₃-C₇ o -SR¹⁰; o alquilo C₁-C₆ sustituido con un R¹²;

R¹² es ciclopropilo, OCH₃ o ciano;

cada U es independientemente O o NH;

cada V es alquileno C₂-C₄;

cada T es independientemente NR^{23a}R^{23b} u OR²⁴;

20 cada R^{23a} y R^{23b} es independientemente H, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆; y

cada R²⁴ es independientemente H, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆.

Realización C. Un compuesto de la Realización B en donde

al menos uno de Q¹ y Q² es fenilo sustituido con 2 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R³;

R¹ es H o CH₃;

25 R² es CH₃;

R⁴ es H; y

cada R³ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ y haloalcoxi C₁-C₃.

Realización D. Un compuesto de la Realización C en donde

30 Q¹ es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R³; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes opcionalmente seleccionados de R³; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes independientemente seleccionados de R³;

35 Q² es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes independientemente seleccionados de R³; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes independientemente seleccionados de R³; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes independientemente seleccionados de R³;

R¹ es H; y

cada R³ se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ y haloalcoxi C₁-C₂.

Realización E. Un compuesto de la Realización D en donde

40 cada R³ se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, metilo, alcoxi C₁-C₂ y fluorometoxi.

Realización F. Un compuesto de la Realización E en donde

X es O o NH; y

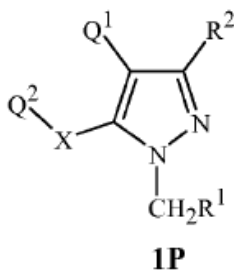
cada R³ se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano y metoxi

Las realizaciones específicas incluyen compuestos de Fórmula 1 seleccionados del grupo que consiste en:

- 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 18),
- 5 *N*-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 22),
- 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-*N*-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 23),
- 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 24),
- N*-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-(3,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 36),
- 4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 41),
- 10 4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo (compuesto 45),
- 4-[[4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3-fluorobenzonitrilo (compuesto 361),
- 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 172),
- 4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3-fluorobenzonitrilo (compuesto 118),
- 3-cloro-4-[[4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo (compuesto 358),
- 15 *N*,4-bis(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 175),
- N*-(2-cloro-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 193),
- N*-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 297),
- N*-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 343),
- N*-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 349),
- 20 *N*-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 357),
- 3-cloro-4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo (compuesto 139),
- 4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]amino]-3,5-difluoro-benzonitrilo (compuesto 91),
- 4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-2,5-difluoro-benzonitrilo (compuesto 148),
- N*-(2-cloro-4-fluorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 87),
- 25 *N*-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 286),
- N*-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 287),
- N*-(2,6-dicloro-4-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 368),
- 3-cloro-4-[5-[(2-cloro-4,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]-benzonitrilo (compuesto 332),
- 3-cloro-4-[5-[(4-cloro-2,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]-benzonitrilo (compuesto 336),
- 30 *N*-(2-bromo-4-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 346),
- 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,4-dicloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 367),
- 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,6-dicloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 369),
- 4-[[4-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3-fluorobenzonitrilo (compuesto 284),
- N*-(2-bromo-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 265),
- 35 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 266),
- N*-(4-bromo-2,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 364),
- 4-[[4-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluoro-benzonitrilo (compuesto 232),

- 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-*N*-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 292),
 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-*N*-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 360),
N-(4-bromo-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 365),
 3-bromo-4-[[4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzocitrilo (compuesto 372),
 5 3-cloro-4-[[4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzocitrilo (compuesto 373),
N-(2,4-dicloro-6-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 374),
N-(2,6-dicloro-4-fluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 375),
N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 376),
N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 377),
 10 *N*-(4-bromo-2,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 378),
N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 379),
N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (compuesto 380),
 4-[5-[(2-cloro-4,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]-3-fluorobenzocitrilo (compuesto 382), y
 4-[5-[(4-cloro-2,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]-3-fluorobenzocitrilo (compuesto 383).
- 15 Esta invención proporciona una composición fungicida que comprende un compuesto de Fórmula 1 (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos y sales de los mismos), y al menos un fungicida distinto. Son dignas de mención como realizaciones de dichas composiciones las composiciones que comprenden un compuesto que corresponde a cualquiera de las realizaciones de compuesto descritas anteriormente.
- 20 Esta invención proporciona una composición fungicida que comprende una cantidad fúngicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1 (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos y sales de los mismos), y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Son dignas de mención como realizaciones de dichas composiciones las composiciones que comprenden un compuesto que corresponde a cualquiera de las realizaciones de compuesto descritas anteriormente.
- 25 Esta invención proporciona un método para controlar enfermedades de plantas provocadas por patógenos de plantas fúngicos que comprende aplicar a la planta o a parte de ella, o a la semilla de la planta, una cantidad fúngicamente aceptable de un compuesto de Fórmula 1 (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos y sales de los mismos). Son dignos de mención como realización de dichos métodos los métodos que comprenden aplicar una cantidad fúngicamente efectiva de un compuesto que corresponde a
- 30 cualquiera de las realizaciones de compuesto descritas anteriormente. Son dignas de mención particular las realizaciones donde los compuestos se aplican como composiciones de esta invención.

Son dignos de mención los compuestos de Fórmula 1 que son compuestos de Fórmula 1P (que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), *N*-óxidos y sales de los mismos, y además composiciones agrícolas que los contienen y su uso como fungicidas:



- 35 en donde
- Q^1 y Q^2 son independientemente fenilo, tienilo, piridinilo, piridazinilo, pirazinilo o pirimidinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ;
- X es O, $S(O)_m$ o NR^4 ;

R¹ es H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₇, CO₂R⁵, C(O)NR⁶R⁷, ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o alcoxialquilo C₂-C₅; o

5 R¹ es fenilo opcionalmente sustituido con hasta 3 R⁸; o un heterociclo aromático que contiene nitrógeno de cinco o seis miembros opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{9a} en miembros anulares de átomo de carbono y R^{9b} en miembros anulares de átomo de nitrógeno;

R² es CH₃, CH₂CH₃, ciclopropilo o halógeno;

10 cada R³ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃ tio, haloalquil C₁-C₃ tio, alquil C₁-C₃ sulfinilo, haloalquil C₁-C₃ sulfinilo, alquil C₁-C₃ sulfonilo, haloalquil C₁-C₃ sulfonilo, cicloalquilo C₃-C₄, cicloalcoxi C₃-C₇, alquilocicloalquilo C₄-C₆, cicloalquilalquilo C₄-C₆, halocicloalquilo C₃-C₇, alqueno C₂-C₄ y alquino C₂-C₄;

R⁴ es H, formilo, cicloalquilo C₃-C₇, -SO₃⁻M⁺, -SR¹⁰ o -(C=W)R¹¹; o alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 R¹²;

R⁵ es H, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆;

15 R⁶ y R⁷ se seleccionan independientemente de H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₈ y alquilocicloalquilo C₄-C₈; o

R⁶ y R⁷ se toman juntos con el átomo de nitrógeno al que están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contiene miembros anulares, además del átomo de nitrógeno anular de conexión, seleccionado de átomos de carbono y opcionalmente hasta un miembro anular seleccionado de O, S(O)_n y NR¹³;

20 cada R⁸, R^{9a} y R^{9b} se selecciona independientemente de halógeno, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, haloalcoxi C₁-C₂, ciano, nitro, SCH₃, S(O)CH₃ y S(O)₂CH₃;

R¹⁰ es alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆;

R¹¹ es alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxialquilo C₂-C₇, alquilaminoalquilo C₂-C₇, dialquilaminoalquilo C₂-C₈, alquil C₁-C₆ tio o alquiltioalquilo C₂-C₇;

25 cada R¹² es independientemente cicloalquilo C₃-C₇, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄ tio, alquil C₁-C₄ sulfinilo o alquil C₁-C₄ sulfonilo;

R¹³ es H, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₂-C₃;

W es O o S;

M⁺ es un catión;

30 m es 0, 1 o 2; y

n es 0, 1 o 2.

35 Por consiguiente es digno de mención un compuesto seleccionado a partir de la Fórmula 1P (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), N-óxidos y sales de los mismos, como se define anteriormente. Además son dignas de mención las realizaciones equivalentes que son equivalentes de realización a las Realizaciones 1 a 139 y las Realizaciones A a F en donde en dichas realizaciones equivalentes "Fórmula 1" se sustituye por "Fórmula 1P" y el alcance de dichas realizaciones equivalentes no supera el alcance definido anteriormente para la Fórmula 1P. Ejemplos de combinaciones de Realizaciones 1 a 139 como se aplica a la Fórmula 1P son las Realizaciones AP, BP, CP, DP y EP:

Realización AP. Un compuesto de Fórmula 1P en donde

40 Q¹ es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo, cada uno sustituido con 1 a 4 sustituyentes independientemente seleccionados de R³;

Q² es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R³;

X es O o NR⁴;

45 R¹ es H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, CO₂R⁵, C(O)NR⁶R⁷, ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o alcoxialquilo C₂-C₅; o

R¹ es un heterociclo aromático que contiene nitrógeno de cinco o seis miembros opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R^{9a} en miembros anulares de átomo de carbono y R^{9b} en miembros anulares de átomo de nitrógeno;

R² es CH₃, CH₂CH₃, Cl o Br;

- 5 cada R³ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃ tio, haloalquil C₁-C₃ tio, alquil C₁-C₃ sulfinilo, haloalquil C₁-C₃ sulfinilo, alquil C₁-C₃ sulfonilo, haloalquil C₁-C₃ sulfonilo y cicloalquilo C₃-C₄;

R⁴ es H, formilo, cicloalquilo C₃-C₇ o -SR¹⁰; o alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 R¹²;

- 10 R⁵ es H o alquilo C₁-C₆;

R⁶ es H o alquilo C₁-C₆;

R⁷ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o alquilcicloalquilo C₄-C₈; o

- 15 R⁶ y R⁷ se toman juntos con el átomo de nitrógeno al que están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contiene miembros anulares, además del átomo de nitrógeno de conexión, seleccionado de átomos de carbono y hasta un miembro anular seleccionado de O y NR¹³;

cada R⁸ se selecciona independientemente de halógeno, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, haloalcoxi C₁-C₂, ciano y nitro;

cada R^{9a} se selecciona independientemente de halógeno, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, haloalcoxi C₁-C₂, ciano y nitro;

- 20 cada R^{9b} es alquilo C₁-C₂;

R¹⁰ es CH₃, CH₂CH₃, CF₃ o CF₂CF₃;

cada R¹² es independientemente cicloalquilo C₃-C₇ o alcoxi C₁-C₄; y

R¹³ es H o CH₃.

Realización BP. Un compuesto de la Realización AP en donde

- 25 Q¹ es fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R³;

Q² es fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R³;

X es NR⁴;

R¹ es H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, ciano, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆;

R² es CH₃;

- 30 cada R³ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₃ y haloalcoxi C₁-C₃;

R⁴ es H, formilo, cicloalquilo C₃-C₇ o -SR¹⁰; o alquilo C₁-C₆ sustituido con un R¹²;

R¹⁰ es CH₃; y

cada R¹² es independientemente ciclopropilo o -OCH₃.

- 35 Realización CP. Un compuesto de la Realización AP en donde

Q¹ es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R³; o

Q¹ es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R³;

Q² es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes independientemente seleccionados de R³;

X es O;

- 40 R² es CH₃;

cada R³ se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, CH₃, CF₃, -OCH₃, y -OCHF₂; y

R⁴ es H, formilo o ciclopropilo.

Realización DP. Un compuesto de la Realización CP en donde

Q¹ es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes independientemente seleccionados de R³;

Q² es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes independientemente seleccionados de R³;

5 cada R³ se selecciona independientemente de F, Cl, ciano y –OCH₃; y

R⁴ es H.

Realización EP. Un compuesto de la Realización BP en donde

Q¹ es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes independientemente seleccionados de R³;

Q² es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes independientemente seleccionados de R³;

10 cada R³ se selecciona independientemente de F, Cl, CN y –OCH₃; y

R⁴ es H.

Además es digno de mención una composición fungicida que comprende una cantidad fúngicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1P (que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos y sales de los mismos) o cualquier realización equivalente que son equivalentes de realización a las Realizaciones 1 a 139 y Realizaciones A a F (por ejemplo, Realización AP, BP, CP, DP o EP), y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. También es digno de mención un método para controlar las enfermedades de plantas provocadas por patógenos de plantas fúngicos que comprende aplicar a la planta o parte de ella, o a la semilla de la planta, una cantidad fúngicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1P (que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, *N*-óxidos y sales de los mismos) o cualquiera de dichas realizaciones equivalentes. Son dignas de mención particular las realizaciones donde los compuestos de Fórmula 1P se aplican como composiciones de esta invención.

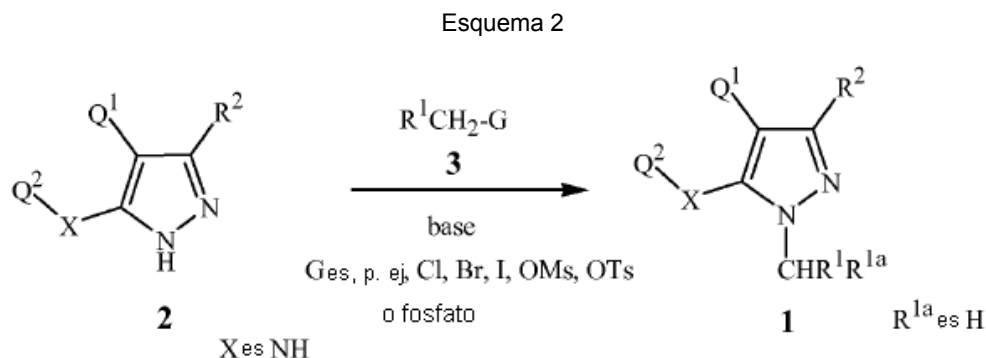
Uno o más de los siguientes métodos y variaciones como se describen en los Esquemas 1-24 pueden usarse para preparar los compuestos de Fórmula 1 (incluyendo la Fórmula 1P). Las definiciones de Q¹, Q², R¹, R² y m en los compuestos de Fórmulas 1-33 posteriores son como se definen anteriormente en el Compendio de la invención a menos que se anote otra cosa. Las Fórmulas 1a, 1b, 1c, 1f, 1g y 1h son varios subconjuntos de la Fórmula 1; las Fórmulas 4a, 4b y 4c son varios subconjuntos de Fórmula 4; las Fórmulas 6a y 6b son varios subconjuntos de Fórmula 6; la Fórmula 11a es un subconjunto de la Fórmula 11; la Fórmula 13a es un subconjunto o análogo de la Fórmula 13; y la Fórmula 17a es un subconjunto de la Fórmula 17. Los sustituyentes para cada fórmula subconjunto son como se definen para su fórmula madre a menos que se anote otra cosa.

30 Como se ilustra en el Esquema 1, sulfóxidos y sulfonas de Fórmula 1b (es decir, Fórmula 1 en donde X es S(O)_m y m es 1 o 2) pueden hacerse por medio de oxidación del átomo de azufre de unión o sulfuros de Fórmula 1a (es decir Fórmula 1 en donde X es S(O)_m y m es 0). En este método un compuesto de Fórmula 1b en donde m es 1 (es decir sulfóxidos) o m es 2 (es decir sulfonas) se prepara oxidando un sulfuro correspondiente de Fórmula 1a con un agente oxidante adecuado. En un procedimiento típico, un agente oxidante en una cantidad de 1 a 4 equivalentes dependiendo del estado de oxidación del producto deseado se añade a una disolución del compuesto de Fórmula 1a en un disolvente. Agentes oxidantes útiles incluyen Oxone® (peroxi-monosulfato de potasio), peróxido de hidrógeno, peryodato sódico, ácido peracético y ácido 3-cloroperbenzoico. El disolvente se selecciona con respecto al agente oxidante empleado. Se usa preferiblemente etanol acuoso o acetona acuosa con peroximonosulfato de potasio y el diclorometano es generalmente preferible con ácido 3-cloroperbenzoico. Las temperaturas de reacción útiles típicamente oscilan de -78 a 90°C. Los procedimientos particulares útiles para oxidar sulfuros a sulfóxidos y sulfonas se describen por Brand et al., J. Agaric. Food Chem. 1984, 32, 221-226 y referencias citada en él.

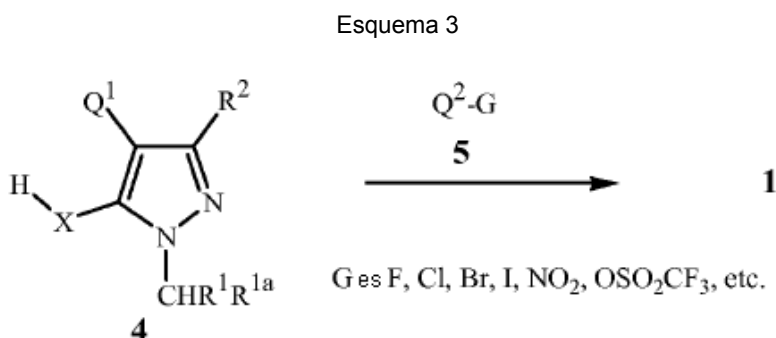
Esquema 1



- Como se muestra en el Esquema 2, los compuestos de Fórmula 1 en que X es NH y R^{1a} es H pueden prepararse mediante la reacción de compuestos de 1H-pirazol de Fórmula 2 con varios agentes alquilantes (por ejemplo, Fórmula 3), tal como yodoalcanos, alquilsulfonatos (por ejemplo, mesilato (OMs) o tosilato (OTs)) o trialquilsulfatos, preferiblemente en presencia de una base orgánica o inorgánica tal como 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno, carbonato de potasio o hidróxido de potasio, y en un disolvente tal como N,N-dimetilformamida, tetrahidrofurano, tolueno y agua.



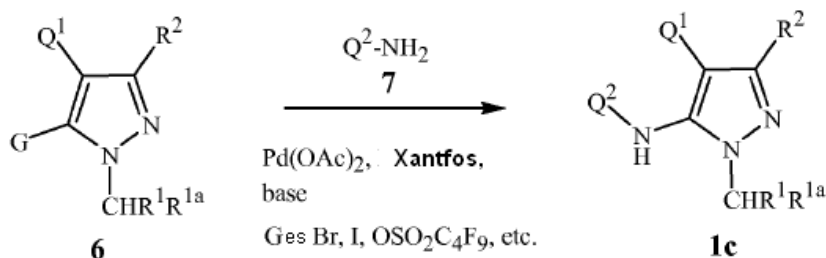
- Los compuestos de Fórmula 1 en donde CHR^{1a}R^{1a} forma un anillo ciclopropilo opcionalmente sustituido puede igualmente prepararse por reacción de un pirazol de Fórmula 2 con un reactivo organometálico, tal como triciclopropilbismuto, en presencia de un catalizador, tal como acetato de cobre, bajo condiciones conocidas en la técnica. Véase por ejemplo, J. Am. Chem. Soc. 2007, 129(1), 44-45. Son dignos de mención como materiales de partida en el método del Esquema 2 los compuestos de Fórmula 2 descritos específicamente en las Tablas 588 a 671 posteriores.
- Como se muestra en el Esquema 3, los compuestos de Fórmula 1 pueden prepararse mediante la reacción de compuestos de Fórmula 4 (es decir, 5-aminopirazoles para X siendo NR⁴, 5-hidroxipirazoles (5-pirazolones) para X siendo O, o 5-mercatopirazoles para X siendo S) con compuestos aromáticos de Fórmula 5 que contienen un grupo saliente G (es decir, halógeno o (halo)alquilsulfonato), opcionalmente en presencia de un catalizador metálico, y generalmente en presencia de una base y un disolvente aprótico polar tal como N,N-dimetilformamida o dimetilsulfóxido. Por ejemplo, los compuestos de Fórmula 5 en que Q² es un anillo heteroaromático deficiente en electrones, o un anillo benceno con sustituyentes aceptores de electrones, reaccionan por desplazamiento directo del grupo saliente G del anillo para proporcionar compuestos de Fórmula 1. Para compuestos de Fórmula 5 en donde Q² está unido a través de un átomo de carbono hibridado sp³, G es típicamente Cl, Br, I o un sulfonato (por ejemplo, OS(O)₂CH₃). Los compuestos de Fórmula 5 están disponibles comercialmente o su preparación se conoce en la técnica. Son dignas de mención las realizaciones del método del Esquema 3 en donde un compuesto de Fórmula 4 se usa para preparar un compuesto correspondiente de Fórmula 1 descrito específicamente en las Tablas 85 a 252 posteriores.



- Para reacciones según el método del Esquema 3 de un compuesto de Fórmula 4 en donde X es O o NR⁴ con un compuesto de Fórmula 5 (Q²-G) en donde Q es un anillo aromático o heteroaromático Q que carece suficientemente de sustituyentes aceptores de electrones, o para mejorar la velocidad de reacción, rendimiento o pureza de producto, el uso de un catalizador metálico (por ejemplo, metal o sal metálica) en cantidades que oscilan de catalíticas a superestequiométricas pueden facilitar la reacción deseada. Típicamente para estas condiciones, G es Br o I o un sulfonato tal como OS(O)₂CF₃ o OS(O)₂(CF₂)₃CF₃. Por ejemplo, pueden usarse complejos de sales de cobre (por ejemplo, CuI con N,N'-dimetiletildiamina, prolina o biperidilo), complejos de paladio (por ejemplo, tris(dibencilidenoacetona)dipaladio (0)) o sales de paladio (por ejemplo, acetato de paladio) con ligandos tales como 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno (es decir, "Xantfos"), 2-diciclohexil-fosfino-2',4',6'-trisisopropilbifenilo (es decir "Xfos") o 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftaleno (es decir "BINAP"), en presencia de una base tal como carbonato de

- potasio, carbonato de cesio, fenóxido sódico o *tert*-butóxido sódico, en un disolvente tal como *N,N*-dimetilformamida, 1,2-dimetoxietano, dimetilsulfóxido, 1,4-dioxano o tolueno, opcionalmente mezclado con alcoholes tal como etanol. De forma alternativa como se ilustra en el Esquema 4, los compuestos de Fórmula 1c (es decir, Fórmula 1 en que X es NR⁴ y R⁴ es H) pueden prepararse por reacción de compuestos de Fórmula 6 (es decir, 5-bromopirazoles u otros pirazoles sustituidos en la posición 5 con un grupo saliente) con compuestos de Fórmula 7 bajo condiciones catalizadas con metal similares a las descritas anteriormente para el Esquema 3. Los compuestos de Fórmula 7 están disponibles comercialmente o su preparación se conoce en la técnica.

Esquema 4



- Como se muestra en el Esquema 5, los compuestos de Fórmula 6 en donde G es Br o I pueden prepararse por reacción de 5-aminopirazoles de Fórmula 4a (es decir, Fórmula 4 en donde X es NH) bajo condiciones de diazotización o bien en presencia de, o seguido por combinación con, sales de cobre que contienen bromuro o yoduro. Por ejemplo, la adición de nitrito de *tert*-butilo a una disolución de un 5-aminopirazol de Fórmula 4a en presencia de CuBr₂ en un disolvente tal como acetonitrilo proporciona el correspondiente 5-bromopirazol de Fórmula 6. Asimismo, un 5-aminopirazol de Fórmula 4a puede convertirse a una sal de diazonio y después a un correspondiente 5-halopirazol de Fórmula 6 por tratamiento con nitrito sódico en disolventes tales como agua, ácido acético o ácido trifluoroacético, en presencia de un ácido mineral que contiene típicamente el mismo átomo haluro (tal como disolución de HI acuoso para G siendo I), seguido por tratamiento con la correspondiente sal de cobre (I) o cobre (II) según procedimientos generales bien conocidos por los expertos en la técnica.

20

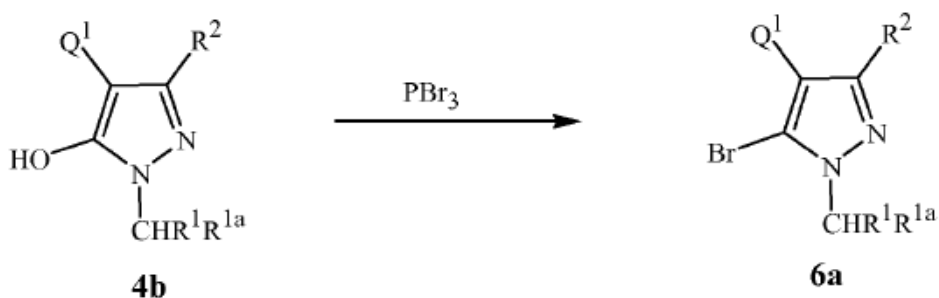
Esquema 5



Como se muestra en el Esquema 6, los 5-bromopirazoles de Fórmula 6a (es decir, la Fórmula 6 en donde G es Br) pueden prepararse haciendo reaccionar 5-hidroxipirazoles de Fórmula 4b (es decir, Fórmula 4 en donde X es O) con tribromuro de fósforo como se describe en Tetrahedron Lett. 2000, 41(24), 4713.

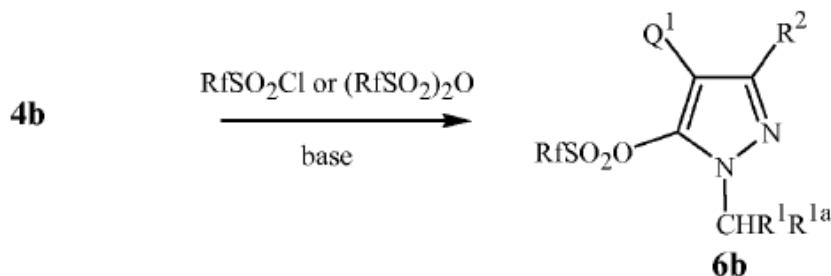
25

Esquema 6



Como se muestra en el Esquema 7, los 5-hidroxipirazoles de Fórmula 4b pueden usarse también para preparar 5-fluoroalquilsulfonilo (por ejemplo, 5-trifluorometanosulfonilo, 5-nonafluorobutilsulfonilo) pirazoles de Fórmula 6b (es decir, Fórmula 6 en donde G es fluoroalquilsulfonilo) como se describen en Synlett 2004, 5, 795.

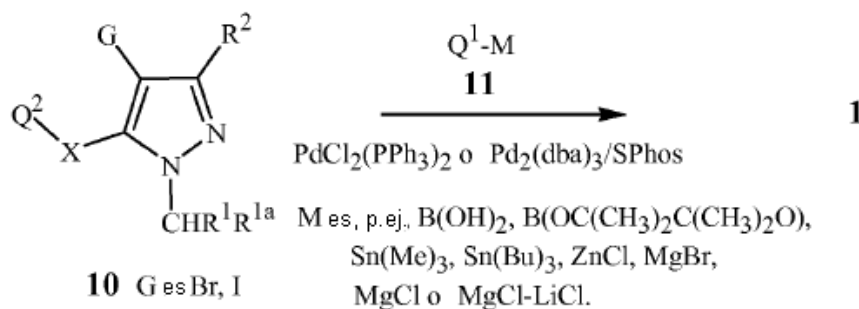
Esquema 7



en donde Rf es fluoroalquilo tal como CF_3 o $(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$

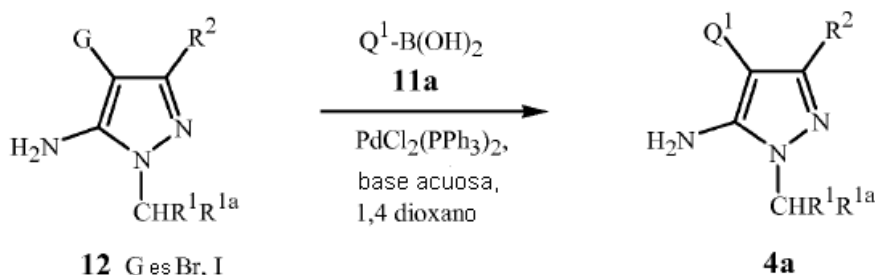
Como se muestra en el Esquema 8, los compuestos de Fórmula 1 pueden prepararse por reacción de 4-bromo o yodo pirazoles de Fórmula 10 en donde X es O, NR^4 o $\text{S}(\text{O})_m$ en que m es 2 con compuestos organometálicos de Fórmula $\text{Q}^1\text{-M}$ (Fórmula 11) bajo condiciones de reacción de acoplamiento cruzado catalizado por metal de transición. La reacción de un 4-bromo o yodo pirazol de Fórmula 10 con un ácido borónico, trialquilestaño, zinc o reactivo de organomagnesio de Fórmula 11 en presencia de un catalizador de paladio o níquel que tiene ligandos apropiados (por ejemplo, trifenilfosfina (PPh_3), dibencilidenoacetona (dba), dicitclohexil(2',6'-dimetoxi-[1,1'-bifenil]-2-il)fosfina (SPhos)) y una base, si se necesita, proporciona el correspondiente compuesto de Fórmula 1. Por ejemplo, un ácido arilborónico sustituido o derivado (por ejemplo, Fórmula 11 en donde Q^1 es fenilo o heterocíclico opcionalmente sustituido y M es $\text{B}(\text{OH})_2$, $\text{B}(\text{OC}(\text{CH}_3)_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{O})$ o $\text{B}(\text{O}-i\text{-Pr})_3$ Li, reacciona con un 4-bromo o 4-yodopirazol de Fórmula 10 en presencia de diclorobis(trifenilfosfina) paladio (II) y base acuosa tal como carbonato sódico o hidróxido de potasio, en disolventes tales como 1,4-dioxano, 1,2-dimetoxietano, tolueno o alcohol etílico, o bajo condiciones anhidras con un ligando tal como óxido de fosfina o ligando fosfito (por ejemplo, óxido de difenilfosfina) y fluoruro de potasio en un disolvente tal como 1,4-dioxano (véase Angewandte Chemie, International Edition 2008, 47(25), 4695-4698) para proporcionar el correspondiente compuesto de Fórmula 1.

Esquema 8

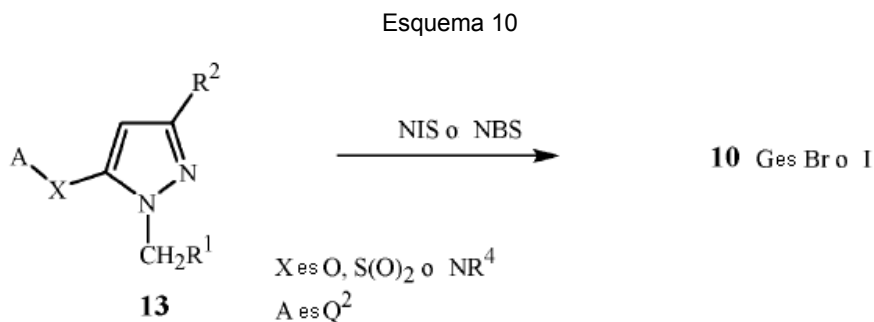


Como se ilustra en el Esquema 9, los compuestos de Fórmula 4a (es decir, Fórmula 4 en donde X es NH) pueden prepararse por reacción de compuestos de Fórmula 12 con compuestos de Fórmula 11 (tal como $\text{Q}^1\text{-B}(\text{OH})_2$ (Fórmula 11a)) usando condiciones de reacción de acoplamiento cruzado catalizado por metal de transición como las descritas para el método del Esquema 8.

Esquema 9



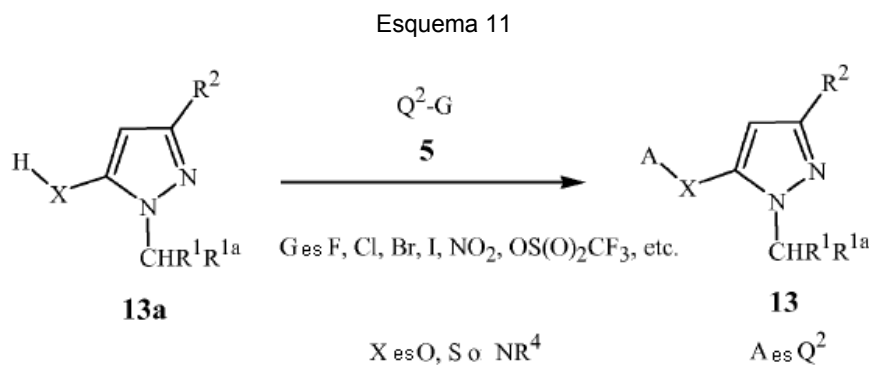
5 Como se ilustra en el Esquema 10, los pirazoles de Fórmula 10 en donde X es O, S(O)₂ o NR⁴ y G es Br o I se preparan fácilmente mediante la reacción de pirazoles no sustituidos en la posición 4 (Fórmula 13) con reactivos halogenantes tales como bromo, bromito sódico, *N*-bromosuccinimida (NBS) o *N*-yodosuccinimida (NIS), en disolventes tales como ácido acético, acetonitrilo, *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida o 1,4-dioxano, o una mezcla de agua con los disolventes mencionados anteriormente a temperaturas que oscilan de ambiente al punto de ebullición del disolvente.



10 Además, usando condiciones de reacción similares a las del método del Esquema 10, los compuestos de Fórmula 13 en donde A es H o un grupo protector pueden convertirse en intermedios correspondientes a la Fórmula 10 en donde Q² se sustituye por A o un grupo protector, respectivamente, que son útiles para preparar compuestos de Fórmula 1. Los compuestos de Fórmula 13 en donde A es H pueden prepararse por métodos conocidos en la técnica; véase por ejemplo, Synlett 2004, 5, 795-798, documento US 4256902 y referencias citadas en ellos.

15 Además, algunos compuestos de Fórmula 13 en donde A es H, particularmente aquellos en que R² es metilo, etilo o halógeno, están disponibles comercialmente.

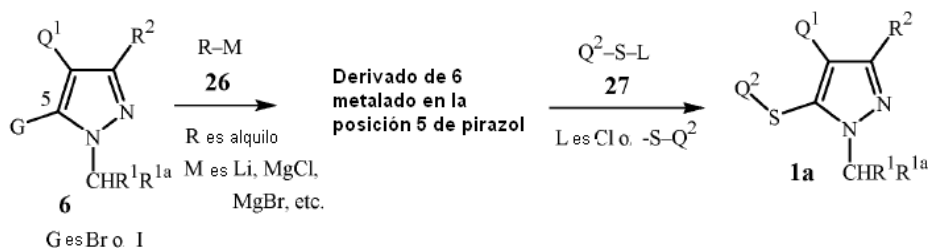
20 Como se muestra en el Esquema 11, los compuestos de Fórmula 13 en donde X es O, S(O)_m o NR⁴, m es 0, y A es Q² pueden prepararse a partir de los compuestos correspondientes de Fórmula 13a (es decir, Fórmula 13 en donde A es H) por procedimientos análogos a los usados para el método del Esquema 3. Los compuestos de Fórmula 13 en donde X es S (es decir, S(O)_m en donde m es 0) pueden oxidarse entonces usando procedimientos tales como los usados para el método del Esquema 1 para proporcionar los compuestos correspondientes de Fórmula 13 en donde X es S(O)₂ para el uso en el método del Esquema 10. Los compuestos de Fórmula 13a están disponibles comercialmente o pueden prepararse por métodos conocidos en la técnica.



25 Como se muestra en el Esquema 12, los compuestos de Fórmula 1a (es decir, Fórmula 1 en donde X es S(O)_m y m es 0), pueden prepararse por tratamiento de compuestos de Fórmula 6 con un reactivo organometálico (es decir Fórmula 26) tal como un alquil-litio, preferiblemente *n*-butil-litio, o un reactivo de alquilmagnesio, preferiblemente cloruro de isopropilmagnesio (opcionalmente complejado con cloruro de litio), seguido por la adición de un electrófilo de azufre (es decir, Fórmula 27). La temperaturas de reacción pueden oscilar de -90°C al punto de ebullición del disolvente de reacción, las temperaturas de -78°C a temperatura ambiente se prefieren generalmente, con temperaturas preferidas de -78 a -10°C cuando se usa un reactivo de alquil-litio, y preferidas de -20°C a temperatura ambiente con uso de reactivos de alquilmagnesio. Una variedad de disolventes son útiles, tal como tolueno, etiléter, tetrahidrofurano o dimetoximetano; se prefiere tetrahidrofurano anhidro. Los intermedios de azufre que contienen Q² de Fórmulas 27 están disponibles comercialmente o pueden prepararse por métodos conocidos en la técnica.

35

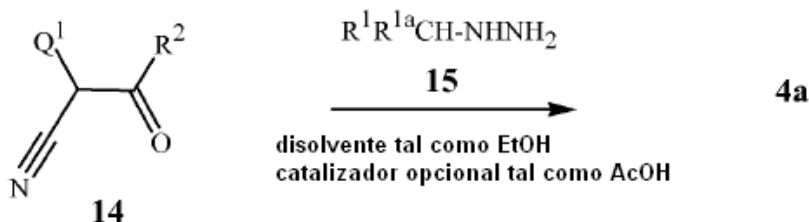
Esquema 12



Se reconocerá por un experto en la técnica que análogos de reacciones a las mostradas en el Esquema 12 pueden utilizarse también con pirazoles que carecen de sustituyente Q¹, proporcionando así ciertos compuestos de Fórmula 13 que son útiles en el método delineado en el Esquema 10.

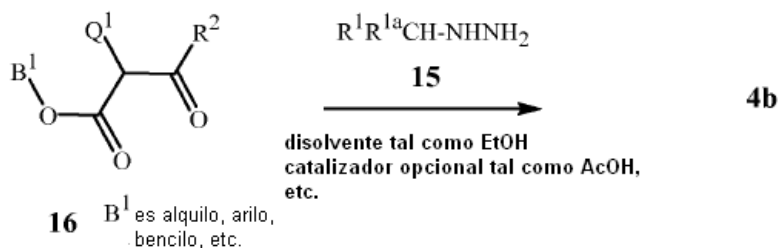
Métodos generales útiles para preparar 5-aminopirazoles de Fórmula 4a se conocen bien en la técnica; véase, por ejemplo, Journal für Praktische Chemie (Leipzig) 1911, 83, 171 y J. Am Chem Soc 1954, 76, 501. Dicho método se ilustra en el Esquema 13 en que R² es alquilo o cicloalquilo.

Esquema 13



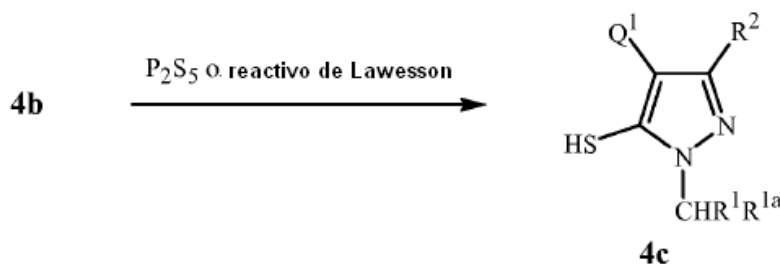
De forma similar, los métodos generales útiles para preparar 5-hidroxipirazoles de Fórmula 4b se conocen bien en la técnica; véase por ejemplo, Annalen der Chemie 1924, 436, 88. Dicho método se ilustra en el Esquema 14 en el que R² es alquilo o cicloalquilo.

Esquema 14



Como se muestra en el Esquema 15, los compuestos de 5-tiopirazol de Fórmula 4c (es decir, Fórmula 4 en donde X es S) pueden prepararse por reacción de compuestos 5-hidroxipirazol correspondientes de Fórmula 4b con P₂S₅ (véase, por ejemplo, Justus Liebigs Annalen der Chemie 1908, 361, 251) o con Reactivo de Lawesson (2,4-disulfuro de 2,4-bis-(4-metoxifenil)-1,3-ditiazol-2,4-difosfetano; véase, por ejemplo, la Publicación de Patente Internacional WO 2005/118575) en disolventes tales como tolueno, xileno o tetrahidrofurano.

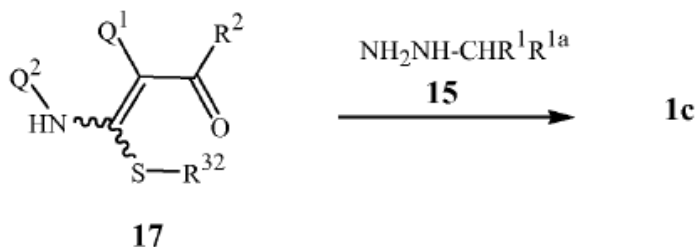
Esquema 15



Como se muestra en el Esquema 16, los compuestos de Fórmula 1c (es decir, Fórmula 1 en donde X es NR⁴ y R⁴ es H) pueden prepararse condensando compuestos de Fórmula 17 con alquilhidrazinas de Fórmula 15 en un disolvente tal como etanol o metanol y opcionalmente en presencia de un catalizador ácido o básico tal como ácido acético, piperidina o metóxido sódico, según los procedimientos generales conocidos en la técnica.

5

Esquema 16

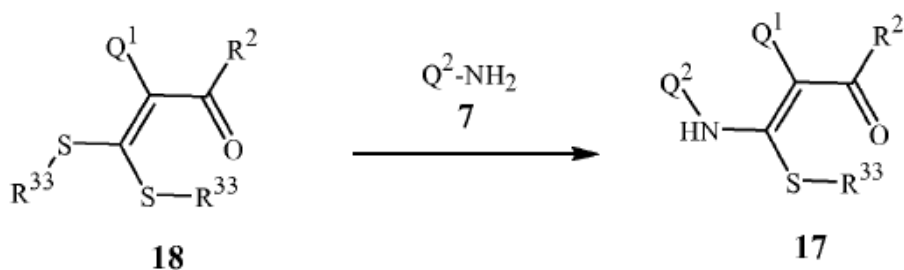


en donde R³² es H o alquilo inferior (p.ej., CH₃, CH₂CH₃ o (CH₂)₂CH₃)

De manera análoga al método del Esquema 16, los compuestos de Fórmula 2 en donde X es NH pueden prepararse de forma similar condensando compuestos de Fórmula 17 con hidrazina. Este método se describe en Chemistry of Heterocyclic Compounds 2005, 41(1), 105-110.

10 Como se muestra en el Esquema 17, los compuestos de Fórmula 17 (en donde, por ejemplo, R² es metilo, etilo o ciclopropilo opcionalmente sustituido y R³³ es H o alquilo inferior como CH₃, CH₂CH₃ o (CH₂)₂CH₃) pueden prepararse por reacción de compuestos ceteno ditioacetil correspondientes de Fórmula 18 con compuestos de fórmula Q²-NH₂ (es decir, Fórmula 7) opcionalmente en presencia de una base, tal como hidruro sódico o cloruro de etilmagnesio, en disolventes tales como tolueno, tetrahidrofurano o dimetoximetano, a temperaturas que oscilan de -10°C al punto de ebullición del disolvente. Véase, por ejemplo, J. Heterocycl. Chem. 1975, 12(1), 139. Los métodos
15 útiles para preparar compuestos de Fórmula 18 se conocen en la técnica.

Esquema 17



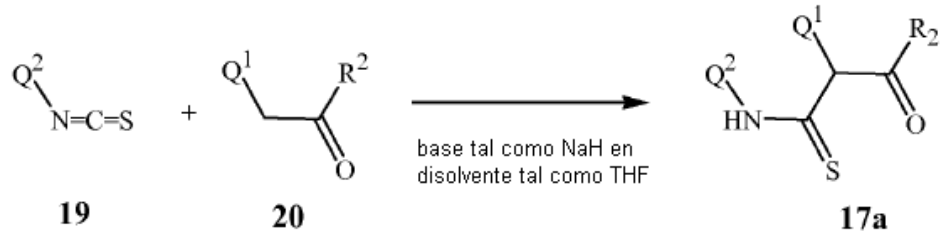
en donde R³³ es H o alquilo inferior (p.ej., CH₃, CH₂CH₃ o (CH₂)₂CH₃)

20 También se conoce en la técnica (véase, por ejemplo, Synthesis, 1989, 398) que los compuestos de Fórmula 18 en que los dos grupos R³³ se toman juntos como un grupo CH₂ sencillo (formando así un anillo ditietano) reaccionan con una cantidad en exceso estequiométrica de hidrazinas de Fórmula 15 para proporcionar compuestos de Fórmula 4c, que son útiles para la preparación de compuestos de Fórmula 1 en que X es S según el método del Esquema 3.

25 Como se muestra en el Esquema 18, los compuestos de Fórmula 17a (es decir, tautómero de Fórmula 17 en donde R³³ es H) pueden prepararse por reacción de compuestos de isotiocianato correspondientes de Fórmula 19 con compuestos de arilacetona de Fórmula 20 en donde R² es metilo, etilo o ciclopropilo opcionalmente sustituido; véase, por ejemplo, Zhurnal Organicheskoi Khimii 1982, 18(12), 2501. Bases útiles para esta reacción incluyen hidruro sódico, bases de alcóxido (por ejemplo, *tert*-butóxido de potasio o etóxido sódico), hidróxido de potasio, hidróxido sódico, carbonato de potasio, o bases de amina (por ejemplo, trietilamina o *N,N*-diisopropiletilamina). Una variedad de disolventes son útiles, tal como tetrahidrofurano, éter, tolueno, *N,N*-dimetilformamida, alcoholes (por
30 ejemplo, etanol), ésteres (por ejemplo, acetato de etilo o acetato de isopropilo), o mezclas de los mismos. Los disolventes se eligen por compatibilidad con la base seleccionada, como se sabe bien en la técnica. Las temperaturas de reacción pueden oscilar de -78°C al punto de ebullición del disolvente. Una mezcla útil de base y disolvente es *tert*-butóxido de potasio en tetrahidrofurano, al que a -70°C a 0°C se añade una disolución combinada de un isotiocianato de Fórmula 19 y un compuesto de carbonilo de Fórmula 20.

35

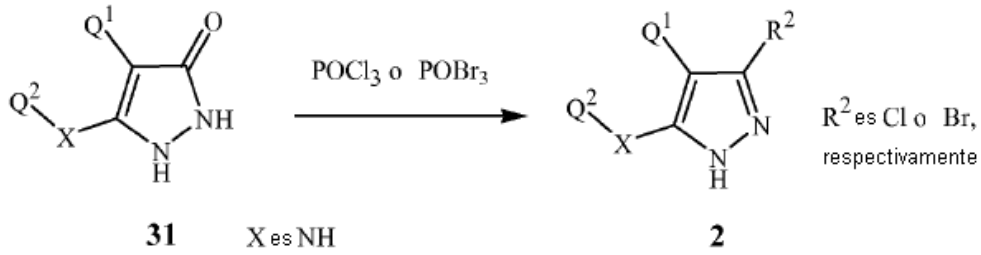
Esquema 18



Las cetotioamidas de Fórmula 17 pueden prepararse también dejando que las correspondientes cetoamidas reaccionen con agentes sulfurantes tal como reactivo de Lawesson o P_2S_5 ; véase, por ejemplo, Helv. Chim. Act. 1998, 81(7), 1207.

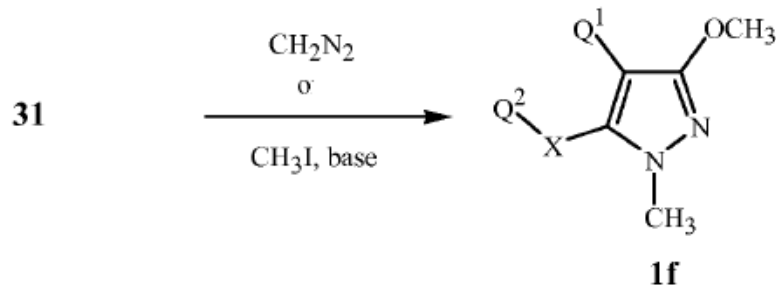
Los compuestos de Fórmula 2 en donde X es NH y R^2 es Cl o Br, que son útiles por preparar compuestos de Fórmula 1 según el método del Esquema 2, pueden prepararse por reacción de compuestos correspondientes de Fórmula 31 con POCl_3 o POBr_3 usando procedimientos generales conocidos en la técnica, como se muestra en el Esquema 19.

Esquema 19



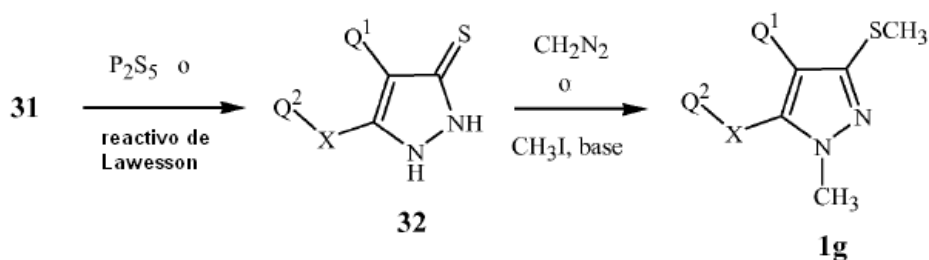
Como se muestra en el Esquema 20, los compuestos de Fórmula 1f (es decir, Fórmula 1 en donde R^1 y R^{1a} son H y R^2 es OCH_3) pueden prepararse haciendo reaccionar los compuestos correspondientes de Fórmula 31 con diazometano o yodometano en presencia de base usando procedimientos generales conocidos en la técnica, tal como los descritos en J. Heterocyclic Chem. 1988, 1307-1310.

Esquema 20



Los compuestos de Fórmula 1g (es decir, Fórmula 1 en donde R^1 y R^{1a} son H y R^2 son SCH_3) pueden prepararse tratando los compuestos correspondientes de Fórmula 31 con P_2S_5 o Reactivo de Lawesson para preparar compuestos de Fórmula 32, que se hacen reaccionar entonces con diazometano o yodometano en presencia de base usando procedimientos generales conocidos en la técnica, como se muestra en el Esquema 21.

Esquema 21

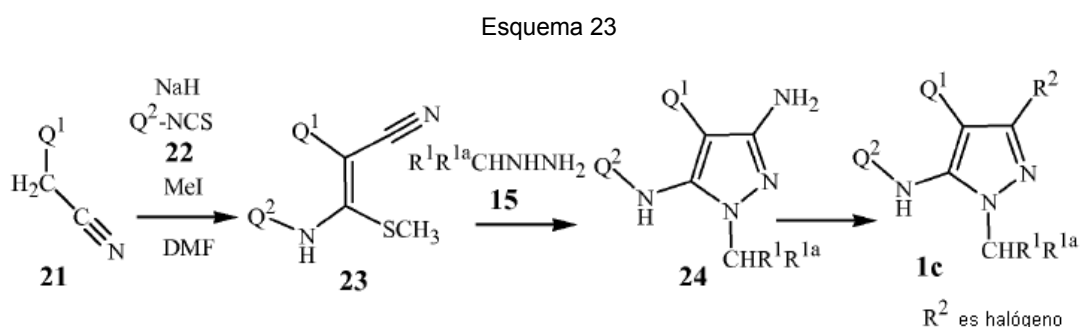


Como se muestra en el Esquema 22, los compuestos de Fórmula 31 en donde X es NH pueden prepararse por condensación de los correspondientes isotiocianatos de Fórmula 19 con ésteres de Fórmula 33 en donde R³³ es alquilo inferior (por ejemplo, metilo, etilo, propilo) en presencia de una base fuerte, no nucleófila, tal como hidruro sódico o hexametildisilazida de litio, en un disolvente inerte tal como tetrahidrofurano (análogo al método del Esquema 18), seguido por reacción del intermedio con hidrazina o una sal de ácido de hidrazina, tal como, por ejemplo, una sal de acetato o hidrocloreuro (análogo al método del Esquema 16).



Un experto en la técnica reconocerá que el uso de una hidrazina sustituida de fórmula H₂NNHCHR¹R^{1a} en vez de hidrazina no sustituida en el método del Esquema 22, seguido por las manipulaciones adicionales descritas para los Esquemas 19, 20 y 21 también proporcionarán compuestos de Fórmula 1.

Los compuestos de Fórmula 1c (es decir, Fórmula 1 en donde X es NR⁴ y R⁴ es H) en que R² es halógeno puede prepararse también como se muestra en el Esquema 23. En este método un compuesto de acetonitrilo de Fórmula 21 se condensa con un compuesto de isotiocianato de Fórmula 22 en presencia de una base tal como hidruro sódico o *tert*-butóxido de potasio, en un disolvente tal como, *N,N*-dimetilformamida o tetrahidrofurano, para proporcionar un compuesto intermedio de ciano cetoamida, que se hace reaccionar entonces con un agente metilante tal como yodometano o sulfato de dimetilo, en presencia de una base para proporcionar el correspondiente compuesto de Fórmula 23. De forma alternativa, el agente metilante puede incluirse en la mezcla de reacción con los compuestos de Fórmulas 21 y 22 sin aislamiento del intermedio ciano cetoamida. Un experto en la técnica reconocerá que los compuestos de Fórmula 23 pueden también prepararse por un método análogo al Esquema 17 en donde el C(O)R² del compuesto de Fórmula 18 se sustituye por ciano. Según el método del Esquema 23, el compuesto resultante de Fórmula 23 se hace reaccionar entonces con una alquilhidrazina de Fórmula 15 para formar el correspondiente compuesto de 3-aminopirazol de Fórmula 24 usando procedimientos generales conocidos en la técnica; véase, por ejemplo, J. Chem. Soc. Perkin 1 1988, 2, 169-173 y J. Med. Chem. 2003, 46(7), 1229-1241. El grupo amino del compuesto de Fórmula 24 puede convertirse entonces a R² que es halógeno en la Fórmula 1c por una reacción de diazotización usando condiciones conocidas en la técnica, tal como las descritas anteriormente para el Esquema 5.

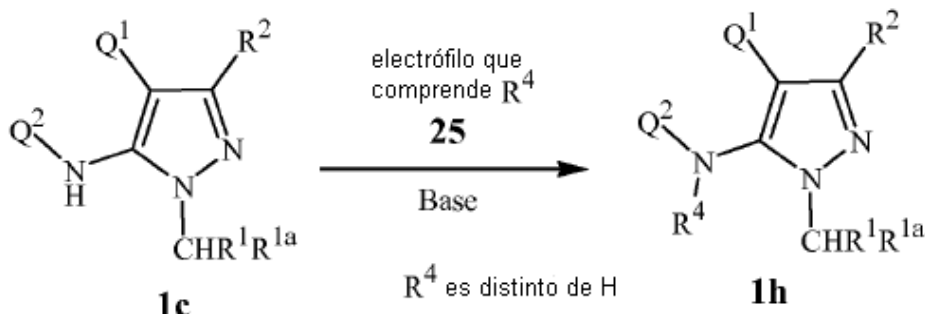


Análogo al método del Esquema 23, los compuestos de Fórmula 2 en donde X es NH y R² es halógeno pueden prepararse de forma similar condensando compuestos de Fórmula 23 con hidrazina en vez de una alquilhidrazina de Fórmula 15.

Como se muestra en el Esquema 24, los compuestos de Fórmula 1h (es decir, Fórmula 1 en donde X es NR⁴) puede prepararse haciendo reaccionar los correspondientes compuestos de Fórmula 1c (es decir, Fórmula 1 en donde X es NH) con un electrófilo que comprende R⁴ (es decir Fórmula 25) típicamente en presencia de una base tal como NaH y un disolvente polar tal como *N,N*-dimetilformamida. En este contexto la expresión "electrófilo que comprende R⁴" significa un compuesto químico capaz de transferir un resto R⁴ a un nucleófilo (tal como el átomo de nitrógeno unido a Q² en la Fórmula 1c). A menudo los electrófilos que comprenden R⁴ tienen la fórmula R⁴Lg en donde Lg es un nucleófilo (es decir, grupo saliente en reacciones nucleófilas). Nucleófilos típicos incluyen halógenos (por ejemplo, Cl, Br, I) y sulfonatos (por ejemplo, OS(O)₂CH₃, OS(O)₂CF₃, OS(O)₂-(4-CH₃-Ph)). Sin embargo, algunos electrófilos que comprenden R⁴ no comprenden un nucleófilo; un ejemplo es trióxido de azufre (SO₃), que después de la

desprotonación (tal como mediante una base de las fórmulas M^+H^- en donde M^+ es un catión) del átomo de nitrógeno unido a Q^2 en la Fórmula 1c, pueden unirse al átomo de nitrógeno como un sustituyente $-SO_3^+M^+$.

Esquema 24



- 5 Se reconoce por un experto en la técnica que diversos grupos funcionales pueden convertirse en otros para proporcionar diferentes compuestos de Fórmula 1. Por ejemplo, los compuestos de Fórmula 1 en que R^2 es metilo, etilo o ciclopropilo pueden modificarse por halogenación con radicales libres para formar compuestos de Fórmula 1 en donde R^2 es halometilo, haloetilo o halociclopropilo. Los compuestos de halometilo pueden usarse como intermedios para preparar compuestos de Fórmula 1 en donde R^2 es hidroximetilo o cianometilo. Los compuestos de Fórmula 1 o intermedios para su preparación pueden contener grupos nitro aromáticos, que pueden reducirse a grupos amino, y después convertirse por medio de reacciones bien conocidas en la técnica tales como la reacción de Sandmeyer, a varios haluros, proporcionando otros compuestos de Fórmula 1. Mediante reacciones similares conocidas, las aminas aromáticas (anilinas) pueden convertirse por medio de sales de diazonio a fenoles, que pueden alquilarse entonces para preparar compuestos de Fórmula 1 con sustituyentes alcoxi. Igualmente, los haluros aromáticos tal como bromuros o yoduros preparados por medio de la reacción de Sandmeyer pueden reaccionar con alcoholes bajo condiciones catalizadas con cobre, tal como la reacción de Ullmann o modificaciones conocidas de la misma, para proporcionar compuestos de Fórmula 1 que contienen sustituyentes alcoxi. Adicionalmente, algunos grupos halógeno, tal como flúor o cloro, pueden desplazarse con alcoholes bajo condiciones básicas para proporcionar compuestos de Fórmula 1 que contienen los correspondientes sustituyentes alcoxi. Los compuestos alcoxi resultantes pueden usarse a sí mismos en reacciones adicionales para preparar compuestos de Fórmula 1 en donde R^3 es -U-V-T (véase, por ejemplo, la Publicación PCT WO 2007/149448 A2). Los compuestos de Fórmula 1 o precursores de los mismos en que R^2 o R^3 es haluro, preferiblemente bromuro o yoduro, son intermedios particularmente útiles para las reacciones de acoplamiento cruzado catalizadas por metal de transición para preparar compuestos de Fórmula 1. Estos tipos de reacción están bien documentados en la bibliografía; véase por ejemplo, Tsuji en *Transition Metal Reagents and Catalysts: Innovations in Organic Synthesis*, John Wiley y Sons, Chichester, 2002; Tsuji en *Palladium in Organic Synthesis*, Springer, 2005; y Miyaura y Buchwald en *Cross Coupling Reactions: A Practical Guide*, 2002; y referencias citadas en ellas.

Un experto en la técnica reconocerá que grupos sulfuro pueden oxidarse a los correspondientes sulfóxidos o sulfonas mediante condiciones bien conocidas en la técnica.

- 30 Las reacciones anteriores pueden también llevarse a cabo en muchos casos en secuencia alterna, tal como la preparación de 1H-pirazoles para el uso en la reacción del Esquema 2 mediante reacciones ilustradas más tarde para la preparación general de pirazoles sustituidos. La presencia de ciertos grupos funcionales pueden no ser compatibles con todas estas condiciones de reacción, y el uso de grupos protectores puede ser deseable para obtener los productos deseados con rendimientos y/o pureza mejorados.
- 35 Se reconoce que algunos reactivos y condiciones de reacción descritos anteriormente para preparar compuestos de Fórmula 1 pueden no ser compatibles con ciertas funcionalidades presentes en los intermedios. En estos ejemplos, la incorporación de secuencias de protección/desprotección o interconversiones de grupo funcional en la síntesis ayudará en la obtención de los productos deseados. El uso y elección de los grupos protectores será evidente para un experto en síntesis química (véase, por ejemplo, Greene, T.W.; Wuts, P.G.M *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2ª ed.; Wiley: Nueva York, 1991). Un experto en la técnica reconocerá que, en algunos casos, después de la introducción de un reactivo dado como se representa en cualquier esquema individual, puede ser necesario realizar etapas sintéticas rutinarias adicionales no descritas en detalle para completar la síntesis de compuestos de Fórmula 1. Un experto en la técnica reconocerá también que puede ser necesario realizar una combinación de las etapas ilustradas en los esquemas anteriores en un orden distinto del implicado por la secuencia particular presentada para preparar los compuestos de la Fórmula 1. Un experto en la técnica también reconocerá que los compuestos de Fórmula 1 y los intermedios descritos en esta memoria pueden someterse a varias reacciones electrófilas, nucleófilas, radicales, organometálicas, de oxidación y de reducción para añadir sustituyentes o modificar sustituyentes existentes.

Sin elaboración adicional, se cree que un experto en la técnica que usa la descripción anterior puede utilizar la presente invención en su extensión total. Los siguientes Ejemplos de Síntesis, por lo tanto, se van a construir como meramente ilustrativos, y no limitantes de la descripción de ninguna forma sea la que sea. Las etapas en los siguientes Ejemplos de Síntesis ilustran un procedimiento para cada etapa en una transformación sintética total, y el material de partida para cada etapa puede no haberse preparado necesariamente mediante una marcha preparativa particular cuyo procedimiento se describe en otros Ejemplos o Etapas. Los porcentajes son en peso excepto para mezclas de disolvente cromatográfico o donde se indique de otra forma. Las partes y porcentajes para mezclas de disolventes cromatográficos son en volumen a menos que se indique de otra forma. Los espectros de ^1H RMN se presentan en ppm campo abajo del tetrametilsilano en CDCl_3 a menos que se anote otra cosa; "s" significa singlete, "m" significa multiplete, "br s" significa singlete ancho. Los espectros de masas se presentan como el peso molecular del ion parental de abundancia isotópica mayor (M+1) formado por adición de H^+ (peso molecular de 1) a la molécula, observado por espectrometría de masas usando ionización química a presión atmosférica (AP^+) donde "amu" significa unidades de masa atómica.

Ejemplo de síntesis 1

15 Preparación de *N*-(3-clorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 1)

Etapas A: Preparación de α -acetil-2,4-difluorobencenoacetnitrilo (denominado alternativamente α -ciano-2,4-difluorobencenoacetato de metilo)

Se agitó hidruro sódico (60% en aceite mineral) (1,5 g, 38 mmoles) en xilenos (7 mL) bajo una atmósfera de nitrógeno a temperatura ambiente. Se añadió una disolución de etanol anhidro (6,3 mL, 64 mmoles) en xilenos (2 mL) en gotas durante aproximadamente 20 minutos a una temperatura de aproximadamente 40°C. La mezcla de reacción se calentó a 70°C, y una disolución de 2,4-difluorofenilacetnitrilo (3,9 g, 25 mmoles), acetato de etilo (3,8 mL, 38 mmoles) y xilenos (1 mL) se añadió en gotas durante 15 min. Se añadieron xilenos adicionales (5 mL) para ayudar a la agitación. La mezcla de reacción se calentó durante 2 h, después se dejó enfriar. Se añadió agua (50 mL), y la mezcla se extrajo con hexanos (50 mL). La fase acuosa se aciduló entonces a pH 3-4 con disolución acuosa de HCl 1N. La fase acuosa se extrajo con éter (50 mL), y el extracto etéreo se lavó con agua (25 mL) y salmuera, después se secó sobre MgSO_4 , y se concentró para dar el compuesto del título como un residuo viscoso (3,3 g).

^1H RMN: δ 7,42 (m, 1H), 6,8-7,0 (m, 2H), 4,95 (s, 1H), 2,36 (s, 3H).

Etapas B: Preparación de 4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina

Se añadieron ácido acético (0,5 mL, 8,3 mmoles) y metilhidrazina (534 μL , 10,0 mmoles) a una disolución del residuo obtenido en la Etapa A (1,6 g, 8,5 mmoles) en alcohol etílico (8 mL). La mezcla de reacción se calentó entonces a reflujo durante 16 h bajo atmósfera de nitrógeno. Mientras la mezcla de reacción estaba aún caliente, se añadió agua en pequeñas porciones (1 mL cada vez) hasta que se formó un precipitado (aproximadamente 12 mL de agua total). La mezcla se calentó de nuevo para disolver los sólidos y después se dejó enfriar a temperatura ambiente. El precipitado se recogió en una frita de vidrio, se lavó con 2 a 3 mL de alcohol etílico acuoso al 50%, y se secó al vacío para obtener el compuesto como un sólido blanco (0,99 g).

^1H RMN: δ 7,20 (m, 1H), 6,92 (m, 2H), 3,68 (s, 3H), 3,47 (br s, 2H), 2,14 (s, 3H).

Etapas C: Preparación de *N*-(3-clorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina

Se combinaron acetato de paladio (II) (90 mg, 0,40 mmoles), 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetixanteno (460 mg, 0,80 mmoles) y carbonato de potasio en polvo (5,5 g, 40 mmoles) en 1,4-dioxano anhidro (20 mL), y la mezcla se trató por aspersión con una corriente por debajo de la superficie de gas N_2 durante 10 min. Se añadió 4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (es decir, el producto de la Etapa B) (0,89 g, 4,0 mmoles) en una porción, y se añadió 1-bromo-3-clorobenceno (0,47 mL, 4,0 mmoles) por medio de una jeringa. La mezcla de reacción se calentó a reflujo bajo una atmósfera de nitrógeno durante 3 h. Se añadió 1-bromo-3-clorobenceno adicional (0,09 mL, 0,8 mmoles), y se continuó el calentamiento durante 1 h. La mezcla de reacción se dejó enfriar a temperatura ambiente, y después se repartió entre agua (40 mL) y acetato de etilo (40 mL). La fase orgánica se lavó con agua adicional (40 mL), salmuera (40 mL), se secó sobre MgSO_4 y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna a través de 10 g de gel de sílice eluido con hexanos/acetato de etilo (1:1) para dar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido (0,41 g).

^1H RMN: δ 7,2-7,3 (m, 2H), 7,10 (m, 1H), 6,9-7,0 (m, 2H), 6,70 (m, 1H), 6,58 (m, 1H), 6,52 (m, 1H), 3,64 (s, 3H), 2,14 (s, 3H). MS: 334 amu.

Ejemplo de síntesis 2

Preparación de 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 17)

Etapas A: Preparación de 5-bromo-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol

Se añadió bromuro de cobre (II) (3,94 g, 17,7 mmoles) a una disolución de 4-[2-cloro-4-fluorofenil]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (preparado de forma similar a la preparación de 4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina en las Etapas A y B del Ejemplo de Síntesis 1) (2,4 g, 10 mmoles) en acetonitrilo (50 mL), y la mezcla se agitó y se enfrió en un baño de hielo-agua mientras se añadía nitrito de *tert*-butilo (90% de grado técnico, 2,33 mL, 17,7 mmoles) en gotas durante 5 min. La mezcla de reacción se dejó calentar lentamente a temperatura ambiente. Se añadió disolución acuosa de HCl (20 mL), y después se añadió acetato de etilo (20 mL). Esta mezcla se filtró a través de una almohadilla de 2 cm de auxiliar de filtración de diatomeas Celite®. La almohadilla de filtrado se lavó con acetato de etilo (20 mL) y las fases se separaron. La fase orgánica se lavó con disolución acuosa de ácido clorhídrico 1,0 N y salmuera, se secó sobre MgSO₄, y se concentró para dejar el compuesto del título como un semisólido naranja-marrón (2,8 g).

¹H RMN: δ 7,18-7,25 (m, 2H), 7,04 (m, 1H), 3,89 (s, 3H), 2,14 (s, 3H).

Etapa B: Preparación de 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina

Se combinaron 5-bromo-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol (es decir, el producto de la Etapa A) (0,20 g, 0,66 mmoles), acetato de paladio (II) (15 mg, 0,066 mmoles), 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno (76 mg, 0,13 mmoles) y carbonato de potasio en polvo (1,8 g, 13 mmoles) en 1,4-dioxano anhidro (3 mL), y la mezcla se pulverizó por aspersion con una corriente por debajo de la superficie de gas N₂ durante 10 min. Se añadió de una vez 2,6-difluoro-4-metoxianilina (0,22 g, 1,3 mmoles), y la mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 22 h. La mezcla de reacción se filtró a través de un auxiliar de filtración de diatomeas de Celite®, y la almohadilla de filtrado se lavó con acetato de etilo (20 mL). El filtrado se lavó con agua (10 mL) y salmuera (10 mL), se secó sobre MgSO₄, y se concentró para dejar un residuo semisólido. Este residuo se purificó por cromatografía en columna a través de 5 g de gel de sílice eluido con un gradiente de hexanos/acetato de etilo (20:1 a 1:3) para dar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido marrón claro (48 mg).

¹H RMN: δ 7,0-7,1 (m, 2H), 6,85 (m, 1H), 6,26 (m, 2H), 4,84 (br s, 1H), 3,78 (s, 3H), 3,66 (s, 3H), 2,08 (s, 3H). MS: 382 amu.

Ejemplo de síntesis 3

Preparación de 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 24)

Etapa A: Preparación de 2,6-difluoro-4-metoxibencenoacetonitrilo

Una disolución de KCN (0,88 g, 13 mmoles) disuelto en agua (2 mL) se añadió en gotas a una disolución enfriada en baño de agua de bromuro de 2,6-difluoro-4-metoxibencilo (2,50 g, 10,5 mmoles) en *N,N*-dimetilformamida (10 mL). La mezcla de reacción se agitó durante 20 min. Se añadió agua (20 mL) y después la mezcla de reacción se vertió en disolución acuosa saturada de NaHCO₃ (20 mL) y se extrajo con éter (50 mL). La fase orgánica se lavó con agua (5 x 25 mL), se secó sobre MgSO₄ y se concentró para dar un aceite, que cristalizó en reposo para proporcionar el compuesto del título como un sólido blanco (1,9 g).

¹H RMN: δ 6,50 (m, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,65 (s, 2H).

Etapa B: Preparación de α-acetil-2,6-difluoro-4-metoxibencenoacetonitrilo

Se agitó etóxido sódico sólido (4,7 g, 66 mmoles) en una mezcla de xileno (20 mL) y etanol (10 mL) y se calentó a 50°C. Una disolución de 2,6-difluoro-4-metoxibenceno-acetonitrilo (es decir, el producto de Etapa A) (8,0 g, 44 mmoles) en acetato de etilo (10,4 mL) se añadió en gotas. La mezcla de reacción se calentó a 50°C durante 4 h y después se dejó enfriar a temperatura ambiente. La mezcla de la reacción se vertió en agua (100 mL) y se extrajo con acetato de etilo (25 mL). La fase acuosa se aciduló con HCl acuoso 3 N a pH 4 y se extrajo con acetato de etilo (100 mL). Esta fase orgánica se lavó con agua (50 mL), salmuera (50 mL), entonces se secó sobre MgSO₄ y se concentró para dejar el compuesto del título como un semisólido de estaño (8,0 g).

¹H RMN: δ 6,56 (m, 2H), 4,86 (s, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,40 (s, 3H).

Etapa C: Preparación de 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina

Se agitaron α-acetil-2,6-difluoro-4-metoxibencenoacetonitrilo (es decir, el producto de la Etapa B) (8,03 g, 35,7 mmoles) y ácido acético (5 mL) en etanol (35 mL) y se añadió metilhidrazina (1,91 mL, 35,7 mmoles). La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 16 h, se enfrió y después se vertió en agua (100 mL). La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (100 mL). La fase orgánica se lavó con NaOH acuoso 1 N (50 mL) y después salmuera (50 mL), se secó sobre MgSO₄, y se concentró para dejar un sólido. El sólido se disolvió en metanol, y la disolución resultante se calentó a 45°C. Se añadió agua (25 mL) en gotas, y la mezcla se dejó enfriar. El precipitado se recogió en una frita de vidrio para dar el compuesto del título como un sólido blanco (3,88 g).

¹H RMN: δ 6,55 (m, 2H), 3,81 (s, 3H), 3,67 (s, 3H), 3,43 (br s, 2H), 2,09 (s, 3H).

Etapa D: Preparación de 5-bromo-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol

Se añadió bromuro de cobre (II) (3,81 g, 16,9 mmoles) a una disolución de 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol (es decir el producto de la Etapa C) (3,88 g, 15,4 mmoles) en acetonitrilo (50 mL), y la mezcla se agitó y se enfrió en un baño de agua-hielo mientras se añadía nitrato de *tert*-butilo (90% de grado técnico, 3,54 mL, 26,9 mmoles) en gotas durante 5 min. La mezcla de reacción se dejó calentar lentamente a temperatura ambiente. Se añadió disolución acuosa de ácido clorhídrico (25 mL), después se añadió acetato de etilo (25 mL), y la mezcla resultante se filtró a través de una almohadilla de 2 cm de auxiliar de filtración de diatomeas de Celite®. La almohadilla de filtrado se lavó con acetato de etilo (50 mL), y las fases se separaron. La fase orgánica se lavó con disolución acuosa de HCl 1 N (25 mL) y salmuera (25 mL), se secó sobre MgSO₄ y se concentró. El residuo se purificó por cromatografía en columna a través de 24 g de gel de sílice eluido con un gradiente de hexanos/acetato de etilo (9:1 a 1:1) para dar el compuesto del título como un sólido blanco (3,25 g).

¹H RMN: δ 6,54 (m, 2H), 3,88 (s, 3H), 3,83 (s, 3H), 2,16 (s, 3H).

Etapa E: Preparación de 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina

Se combinaron 5-bromo-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol (es decir, el producto de la Etapa D) (0,30 g, 0,94 mmoles), acetato de paladio (II) (20 mg, 0,090 mmoles), 4,5-bis(difenilfosfina)-9,9-dimetilxanteno (0,11 g, 0,19 mmoles) y carbonato de potasio en polvo (2,6 g, 19 mmoles) en 1,4-dioxano anhidro (4 mL), y la mezcla se pulverizó por aspersión con una corriente por debajo de la superficie de gas N₂ durante 10 min. Se añadió de una vez 2,4,6-trifluoroanilina (0,28 g, 1,9 mmoles), y la mezcla de reacción se calentó a reflujo bajo nitrógeno durante 22 h. La mezcla de reacción se enfrió, después se filtró a través de un auxiliar de filtración de diatomeas de Celite®. La almohadilla de filtrado se lavó con acetato de etilo (20 mL) y el filtrado se lavó con agua (10 mL) y salmuera (10 mL), se secó sobre MgSO₄, y se concentró para dejar un residuo semisólido. El residuo se purificó por cromatografía en columna a través de 12 g de gel de sílice eluido con un gradiente de hexanos/acetato de etilo (20:1 a 1:3) para dar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un semisólido (73 mg).

¹H RMN (acetona-*d*₆) δ 6,84 (br s, 1H), 6,68 (m, 2H), 6,43 (m, 2H), 3,77 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 1,99 (s, 3H). MS: 384 amu (AP⁺).

Ejemplo de síntesis 4

Preparación de 4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo (Compuesto 45)Etapa A: Preparación de 4-[[1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo

Se añadió carbonato de potasio (1,38 g, 10 mmoles) a una disolución de 2,4-dihidro-2,5-dimetil-3*H*-pirazol-3-ona (0,70 g, 6,3 mmoles) en *N,N*-dimetilformamida (15 mL). Se añadió 3,4,5-trifluorobenzonitrilo (0,94 g, 6,0 mmoles), y la mezcla de reacción se calentó a 75°C bajo una atmósfera de nitrógeno durante 16 h, después se dejó enfriar. La mezcla de reacción se repartió entre agua (60 mL) y acetato de etilo (30 mL). La fase orgánica se lavó con agua (2 x 30 mL) y salmuera (30 mL), se secó sobre MgSO₄ y se concentró para dar el producto del título como un aceite amarillo (1,38 g).

¹H RMN: δ 7,36 (m, 2H), 5,24 (s, 1H), 3,78 (s, 3H), 2,16 (s, 3H).

Etapa B: Preparación de 3,5-difluoro-4-[[4-yodo-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo

Una disolución de 4-[[1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo (es decir, el producto de la Etapa A) (1,38 g, 5,5 mmoles) en acetonitrilo (20 mL) se agitó a temperatura ambiente, y se añadió de una vez *N*-yodosuccinimida (1,35 g, 6,0 mmoles). La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 2 h, se enfrió, y después se vertió en agua (40 mL). La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (40 mL). La fase orgánica se lavó con agua (20 mL) y disolución acuosa saturada de NaHCO₃ (20 mL), se secó sobre MgSO₄, y se concentró a presión reducida para dar el compuesto del título como un sólido tostado (2,1 g).

¹H RMN (acetona-*d*₆): δ 7,80 (m, 2H), 3,82 (s, 3H), 2,09 (s, 3H). MS: 376 amu (AP⁺)

Etapa C: Preparación de 4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo

A una disolución de 3,5-difluoro-4-[[4-yodo-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo (es decir, el producto de la Etapa B) (1,0 g, 2,67 mmoles) en 1,4-dioxano (6 mL) se añadió ácido 2-cloro-4-fluorobencenoborónico (denominado alternativamente ácido *B*-(2-cloro-4-fluorofenil)-borónico) (0,93 g, 5,33 mmoles), dicloro (bis)trifenilfosfina paladio (II) (denominado alternativamente dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II)) (93 mg, 0,13 mmoles), carbonato de potasio (0,74 g, 5,33 mmoles) y agua (4 mL). La mezcla resultante se calentó a reflujo durante 5 h, se dejó enfriar y se repartió entre agua (20 mL) y acetato de etilo (20 mL). La fase orgánica se secó sobre MgSO₄ y se concentró. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice con un gradiente de hexanos/acetato de etilo para obtener el compuesto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido de color crudo (110 mg).

¹H RMN: δ 7,00-7,09 (m, 3H), 6,97 (m, 1H), 6,86 (m, 1H), 3,85 (s, 3H), 2,02 (s, 3H).

Ejemplo de síntesis 5

Preparación de 4-(2,4-diclorofenil)-*N*-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina (Compuesto 69)Etapa A: Preparación de α -acetil-2,4-dicloro-*N*-(2,4-difluorofenil)benceno-etanotioamida

5 Se añadió isotiocianato de 2,4-difluorofenilo (0,27 mL, 2,0 mmoles) a una suspensión agitada de hidruro sódico (60% en aceite mineral) (112 mg, 2,8 mmoles) en tetrahidrofurano anhidro (4 mL) enfriado en un baño de hielo-agua bajo una atmósfera de nitrógeno. Se añadió una disolución de (2,4-diclorofenil)-2-propanona (570 mg, 2,8 mmoles) en tetrahidrofurano (4 mL) en gotas durante 5 min. La disolución amarilla resultante se agitó a 5-10°C durante 1 h. Se añadió agua (10 mL) cuidadosamente, y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo (10 mL). La fase acuosa se aciduló a pH 3 con HCl acuoso 1N, después se extrajo con acetato de etilo (20 mL). El extracto orgánico se lavó con agua (10 mL) y salmuera (10 mL), se secó sobre MgSO₄, y se concentró para dejar un sólido. El sólido se trituró con hexanos/acetato de etilo (2:1), se recogió en una frita de vidrio y se secó al aire para dar el compuesto del título como un sólido blanco (240 mg). MS: 373 amu (AP⁺).

Etapa B: Preparación de 4-(2,4-diclorofenil)-*N*-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina

15 Se añadió ácido acético (50 μ L) y metilhidrazina (41 μ L) a una suspensión agitada de α -acetil-2,4-dicloro-*N*-(2,4-difluorofenil)bencenoetanotioamida (238 mg, 0,64 mmoles) en etanol (4 mL). La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 2 h y se dejó enfriar. Después la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo (10 mL) y se lavó con NaOH acuoso 1N (10 mL), agua (10 mL) y salmuera (10 mL), se secó sobre MgSO₄ y se concentró para dejar un residuo sólido. El residuo se purificó por cromatografía de columna en 5 g de gel de sílice con un gradiente de hexanos/acetato de etilo (2:1 a 1:1) para dar el compuesto del título como un sólido (170 mg).

20 ¹H RMN: δ 7,43 (s, 1H), 7,19 (m, 1H), 7,07 (m, 1H), 6,78 (m, 1H), 6,62 (m, 1H), 6,37 (m, 1H), 5,22 (br s, 1H), 3,70 (s, 3H), 2,18 (s, 3H). MS: 368 amu (AP⁺).

Ejemplo de síntesis 6 (solo referencia, no reivindicado)

Preparación de 5-(2,6-difluoro-4-nitrofenoxi)-1,3-dimetil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol (Compuesto 54)

Etapa A: Preparación de 2,4,6-trifluorobencenoacetato de metilo

25 Una disolución de ácido 2,4,6-trifluorobencenoacético (5,00 g, 26,3 mmoles) en metanol (25 mL) se agitó a temperatura ambiente, y se añadió en gotas cloruro de tionilo (6 mL, ~3 eq.), provocando que la temperatura de la mezcla de reacción alcanzara los 60°C. La mezcla de reacción se dejó enfriar a temperatura ambiente y se agitó durante 3 h. Se añadió agua (25 mL) con enfriamiento de hielo. La mezcla se extrajo con acetato de etilo (2 x 100 mL). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con agua (2x), con disolución acuosa saturada de bicarbonato sódico y con salmuera, se secaron sobre MgSO₄. La concentración proporcionó el compuesto del título como un aceite claro (5,38 g).

30 ¹H RMN: δ 6,68 (m, 2H), 3,72 (s, 3H), 3,66 (s, 2H).

Etapa B: Preparación de α -acetil-2,4,6-trifluorobencenoacetato de metilo

35 A una disolución de tetrahidrofurano obtenida comercialmente de bis(trimetil-silil)amida de litio (1,0 M, 21,0 mL), agitada bajo una atmósfera de nitrógeno y enfriada a una temperatura interna de -65°C, se añadió en gotas durante 30 minutos una disolución de 2,4,6-trifluorobencenoacetato de metilo (es decir, el producto de la Etapa A) (2,04 g, 10,0 mmoles) disuelta en tetrahidrofurano seco (10 mL). La mezcla de reacción se agitó durante unos 30 minutos adicionales, y después mientras se mantienen los -65°C de temperatura, una disolución de cloruro de acetilo recién destilado (0,80 mL, 11 mmoles) en tetrahidrofurano seco (3 mL) se añadió en gotas. La mezcla de reacción se dejó calentar lentamente a temperatura ambiente, y después se añadió agua (30 mL). La mezcla resultante se extrajo con acetato de etilo (60 mL). La fase acuosa se aciduló con ácido clorhídrico 1N y se extrajo con acetato de etilo (60 mL). Solo el primer extracto se retuvo, porque el análisis cromatográfico de capa fina mostró que el segundo extracto contenía evidentes impurezas polares en vez de producto deseado adicional. La fase orgánica inicial se lavó adicionalmente con ácido clorhídrico 1N, agua y salmuera, se secó sobre MgSO₄ y se concentró para proporcionar el producto del título como un aceite claro (1,86 g).

45 ¹H RMN: δ 6,69 (m, 2H), 3,7 (m, 1H y s, 3H), 1,87 (s, 3H); resonancias minoritarias a 13,2 ppm y 4,9 ppm indicaron la presencia de tautómero enólico.

Etapa C: Preparación de 1,3-dimetil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-ol

50 A una disolución de α -acetil-2,4,6-trifluorobencenoacetato de metilo (es decir, el producto de la Etapa B) (2,46 g, 10,0 mmoles) en metanol (15 mL) se añadió metilhidrazina (0,665 mL, 12,5 mmoles) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 días. Se añadió disolución acuosa de ácido cítrico (1 M, 10 mL), y después se añadió agua (50 mL). La mezcla se extrajo con acetato de etilo (2 x 50 mL). Los extractos orgánicos combinados se lavaron con agua y con salmuera, se secaron sobre MgSO₄, y se concentraron para dejar un sólido amarillo. Este

sólido se suspendió en un pequeño volumen de acetato de etilo (aproximadamente 5 mL), y se añadió gradualmente un volumen igual de hexanos, y la suspensión se agitó durante 30 minutos. El componente sólido se recogió en una frita de vidrio, se lavó con pequeñas porciones de acetato de etilo/hexanos (1:1 y 1:2 en v:v), y se dejó secar al aire para proporcionar un sólido blanco (1,02 g). La evaporación de las agua madres y el tratamiento del residuo resultante con pequeños volúmenes de acetato de etilo y hexanos como ya se ha descrito proporcionó unos 0,13 g adicionales de sólido que contenía el producto del título (1,15 g total). El análisis de los sólidos combinados por LC/MS mostró un componente principal de masa 242 (AP+) y un componente minoritario, eluyendo más tarde por LC de fase inversa, teniendo además una masa de 242 (AP+). La relación aparente de componentes fue 94:6.

^1H RMN (acetona- d_6): δ 6,95 (m, 2H), 3,52 (s, 3H), 1,98 (s, 3H); la resonancia de 5-hidroxi no se observó en este disolvente.

Etapa D: Preparación de 5-(2,6-difluoro-4-nitrofenoxi)-1,3-dimetil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol

Se combinó 1,3-dimetil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-ol (es decir, el producto de la etapa C) (0,310 g, 1,28 mmoles) con 3,4,5-trifluoronitrobenzoceno (157 μL , 1,35 mmoles) y polvo de carbonato de potasio (0,27 g, 2 mmoles) en *N,N*-dimetilformamida seca (4 mL). Esta mezcla se agitó y se calentó a 80°C durante 45 minutos y después se dejó enfriar. La mezcla de reacción se diluyó con agua (10 mL) y se extrajo con acetato de etilo (2 x 10 mL). La fase orgánica se lavó con agua y con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró para dejar un residuo viscoso. Este residuo se purificó por cromatografía en columna a través de gel de sílice eluido con un gradiente de acetato de etilo (30% a 100%) en hexano para dar el producto del título, un compuesto de la presente invención, como un sólido de color crudo (209 mg).

^1H RMN δ 7,71 (m, 2H), 6,54 (m, 2H), 3,86 (s, 3H), 2,07 (s, 3H); 400 amu (AP⁺).

Ejemplo de síntesis 7

Preparación de 4-[[1,3-dimetil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobencenoamina (Compuesto 371)

Se combinó 5-(2,6-difluoro-4-nitrofenoxi)-1,3-dimetil-4-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol (es decir, el producto del Ejemplo de Síntesis 6) (0,780 g, 1,95 mmoles) con polvo de hierro (325 de malla, 0,58 g, 10 mmoles) y cloruro de amonio (64 mg, 1,2 mmoles) en etanol (27 mL) al que se había añadido agua (3 mL). La mezcla se calentó a reflujo durante 1,25 h y después se dejó enfriar. La mezcla de reacción se diluyó con un volumen igual de acetato de etilo y se filtró a través de auxiliar de filtración de Celite. El filtrado se secó con MgSO_4 y se concentró. El análisis por LC/MS mostró que el componente principal (93%) tiene masa de 370 amu (AP+). El residuo se disolvió en dimetilsulfóxido anhidro (8 mL), y una disolución comercial de metóxido sódico en metanol (0,45 mL de disolución al 25%) se añadió. Esta disolución se agitó en nitrógeno y se calentó a reflujo durante 1 h. Se añadió disolución adicional de metóxido sódico/metanol (0,20 mL), y el calentamiento se continuó durante unos 30 minutos adicionales. La mezcla de reacción se dejó enfriar, y se trató después con disolución acuosa de ácido cítrico (1 M, 5 mL), se diluyó con agua (50 mL) y se extrajo con acetato de etilo (2 x 25 mL). La fase orgánica se lavó con agua (3x) y con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró para dejar el producto del título, un compuesto de la presente invención, como un aceite viscoso (0,52 g).

^1H RMN δ 6,29 (m, 2H), 5,95 (m, 2H), 3,80 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 3,55-3,75 (br s, NH_2), 2,01 (s, 3H); 382 amu (AP+).

Ejemplo de síntesis 8

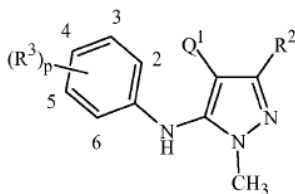
Preparación de 5-(4-cloro-2,6-difluorofenoxi)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol (Compuesto 58)

Se añadió cloruro de cobre (I) (56 mg, 0,42 mmoles) a una disolución de 4-[[4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobencenoamina (preparado análogo al Ejemplo de Síntesis 7) (132 mg, 0,346 mmoles) en acetonitrilo (5 mL). La mezcla agitada se enfrió usando un baño de hielo-agua, y se añadió en gotas nitrito de *tert*-butilo (90% de grado técnico, 72 μL). La mezcla de reacción se dejó calentar lentamente a temperatura ambiente y se agitó a temperatura ambiente toda la noche, y después se calentó a reflujo durante 1 h. Se añadió ácido clorhídrico (1 N, 5 mL) y la mezcla se extrajo con acetato de etilo (~20 mL). La fase orgánica se lavó con salmuera, se secó sobre MgSO_4 y se concentró. El residuo se purificó por cromatografía en columna a través de gel de sílice eluido con acetato de etilo al 20% en hexano para dar el producto del título, un compuesto de la presente invención, como un aceite viscoso (45 mg).

^1H RMN: δ 6,74 (m, 2H), 6,30 (m, 2H), 3,83 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 2,03 (s, 3H); 401 amu (AP+).

Por los procedimientos descritos en esta memoria junto con métodos conocidos en la técnica, pueden prepararse los compuestos descritos en las Tablas que siguen. Las siguientes abreviaturas se usan en la Tabla que sigue: Me significa metilo, Et significa etilo, *n*-Pr significa *n*-propilo, *c*-Pr significa ciclopropilo, Ph significa fenilo, OMe (o MeO) significa metoxi, OEt (o EtO) significa etoxi, -CN significa ciano y - NO_2 significa nitro.

Tabla 1



Q¹ es 2,6-di-F-Ph y R² es Me.

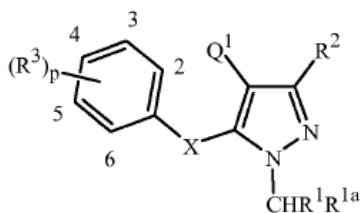
(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p
2-F	3-F	4-F	2-Cl	3-Cl
4-Cl	2-Br	3-Br	4-Br	2,4-di-F
2,6-di-F	2,4,6-tri-F	2,4,5-tri-F	2,3,5-tri-F	2,3,6-tri-F
2-Cl-4-F	2-F-4-Cl	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2,4,6-tri-Cl
2-Br-4-F	2-I-4-F	2-Me-4-F	2-F-4-MeO	2-Cl-4-MeO
2-Br-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	2-F-4-CN	2-Cl-4-CN	2-Br-4-CN
2,6-di-F-4-CN	2-Cl-4,5-di-F	2-Cl-4,6-di-F	2-Br-4,5-di-F	2-Br-4,6-di-F
4-Cl-2,5-di-F	4-Cl-2,6-di-F	4-Br-2,5-di-F	4-Br-2,6-di-F	2,4-di-Cl-6-F
2,6-di-Cl-4-F	2,6-di-Cl-4-MeO	2-CF ₃ -4-F	4-Me	2,4-di-Me
2-F-4-Br	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-Br-4-F-6-Cl	2-Cl-4-Br-6-F

5 La presente descripción también incluye las Tablas 2 a 84, cada una de las cuales se construye igual que la Tabla 1 anterior, excepto que el encabezado de fila en la Tabla 1 (es decir "Q¹ es 2,6-di-F-Ph y R² es Me") se sustituye con el encabezado de fila respectivo mostrado a continuación. Por ejemplo, en la Tabla 2 el encabezado de fila es "Q¹ es 2,6-di-F-Ph y R² es Cl" y (R³)_p es como se define en la Tabla 1 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 2 describe específicamente 2-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1-metil-1H-pirazol-5-amina. Las Tablas 3 a 84 se construyen de forma similar.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
2	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph y R ² es Cl.	47	Q ¹ es 2-Br-Ph y R ² es Cl.
3	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph y R ² es Br.	48	Q ¹ es 2-Br-Ph y R ² es Br.
4	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph y R ² es Me.	49	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph y R ² es Me.
5	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph y R ² es Cl.	50	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph y R ² es Cl.
6	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph y R ² es Br.	51	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph y R ² es Br.
7	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph y R ² es Me.	52	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph y R ² es Me.
8	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph y R ² es Cl.	53	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph y R ² es Cl.
9	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph y R ² es Br.	54	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph y R ² es Br.
10	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph y R ² es Me.	55	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph y R ² es Me.
11	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph y R ² es Cl.	56	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph y R ² es Cl.
12	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph y R ² es Br.	57	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph y R ² es Br.
12A	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph y R ² es Me.	58	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph y R ² es Me.
12B	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph y R ² es Cl.	59	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph y R ² es Cl.
12C	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph y R ² es Br.	60	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph y R ² es Br.
13	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph y R ² es Me.	60A	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph y R ² es Me.
14	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph y R ² es Cl.	60B	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph y R ² es Cl.
15	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph y R ² es Br.	60C	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph y R ² es Br.
16	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph y R ² es Me.	61	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph y R ² es Me.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
17	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph y R ² es Cl.	62	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph y R ² es Cl.
18	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph y R ² es Br.	63	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph y R ² es Br.
19	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph y R ² es Me.	63A	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph y R ² es Me.
20	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph y R ² es Cl.	63B	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph y R ² es Cl.
21	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph y R ² es Br.	63C	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph y R ² es Br.
22	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph y R ² es Me.	64	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph y R ² es Me.
23	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph y R ² es Cl.	65	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph y R ² es Cl.
24	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph y R ² es Br.	66	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph y R ² es Br.
25	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph y R ² es Me.	66A	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph y R ² es Me.
26	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph y R ² es Cl.	66B	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph y R ² es Cl.
27	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph y R ² es Br.	66C	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph y R ² es Br.
28	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph y R ² es Me.	67	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph y R ² es Me.
29	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph y R ² es Cl.	68	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph y R ² es Cl.
30	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph y R ² es Br.	69	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph y R ² es Br.
31	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph y R ² es Me.	70	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph y R ² es Me.
32	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph y R ² es Cl.	71	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph y R ² es Cl.
33	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph y R ² es Br.	72	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph y R ² es Br.
34	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph y R ² es Me.	73	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph y R ² es Me.
35	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph y R ² es Cl.	74	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph y R ² es Cl.
36	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph y R ² es Br.	75	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph y R ² es Br.
37	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph y R ² es Me.	76	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo y R ² es Me.
38	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph y R ² es Cl.	77	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo y R ² es Cl.
39	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph y R ² es Br.	78	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo y R ² es Br.
40	Q ¹ es 2-F-Ph y R ² es Me.	79	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo y R ² es Me.
41	Q ¹ es 2-F-Ph y R ² es Cl.	80	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo y R ² es Cl.
42	Q ¹ es 2-F-Ph y R ² es Br.	81	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo y R ² es Br.
43	Q ¹ es 2-Cl-Ph y R ² es Me.	82	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo y R ² es Me.
44	Q ¹ es 2-Cl-Ph y R ² es Cl.	83	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo y R ² es Cl.
45	Q ¹ es 2-Cl-Ph y R ² es Br.	84	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo y R ² es Br.
46	Q ¹ es 2-Br-Ph y R ² es Me.		

Tabla 85



Q¹ es 2,6-di-F-Ph, X es O, R¹ y R^{1a} son ambos H y R² es Me.

(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p
4-F	4-Cl	4-Br	2,4-di-F	2-Br-4-F
2,6-di-F	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2-Cl-4-F	2-F-4-Cl

Q¹ es 2,6-di-F-Ph, X es O, R¹ y R^{1a} son ambos H y R² es Me.

(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p
2-F-4-Br	2-Br-6-F	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-I-4-F
2-F-4-I	2-Cl-4,6-di-F	4-Cl- 2,6-di-F	2-Br-4,6-di-F	4-Br-2,6-di-F
2-F-4-MeO	2-Cl-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	2-F-4-CN	2-Cl-4-CN
2-Br-4-CN	2,6-di-F-4-CN			
2,5-di-F-4-CN	4-Cl-2,5-di-F	2-Br-4,5-di-F	4-Br-2,5-di-F	2-Cl-4,5-di-F

5 La presente descripción también incluye las Tablas 86 a 280, cada una de las cuales está construida igual que la Tabla 85 anterior, excepto que el encabezado de fila en la Tabla 85 (es decir, "Q¹ es 2,6-di-F-Ph, X es O, R¹ y R^{1a} son ambos H y R² es Me") se sustituye con el respectivo encabezado de fila mostrado a continuación. Por ejemplo, en la Tabla 86 el encabezado de fila es "Q¹ es 2,6-di-F-Ph, X es O, R¹ y R^{1a} son ambos H y R² es Cl", y (R³)_p es como se define en la Tabla 85 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 86 describe específicamente 3-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-5-(4-fluorofenoxi)-1-metil-1*H*-pirazol. Las Tablas 87 a 280 se construyen de forma similar.

Tabla	Encabezado de fila
86	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
87	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
88	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
89	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
90	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
91	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
92	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
93	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
94	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
95	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
96	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
96A	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
96B	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
96C	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
97	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
98	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
99	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
100	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
101	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
102	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
103	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
104	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
105	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
106	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
107	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
108	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
109	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
110	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
111	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.

ES 2 562 178 T3

Tabla	Encabezado de fila
112	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
113	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
114	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
115	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
116	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
117	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
118	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
119	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
120	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
121	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
122	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
123	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
124	Q ¹ es 2-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
125	Q ¹ es 2-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
126	Q ¹ es 2-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
127	Q ¹ es 2-Cl-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
128	Q ¹ es 2-Cl-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
129	Q ¹ es 2-Cl-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
130	Q ¹ es 2-Br-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
131	Q ¹ es 2-Br-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
132	Q ¹ es 2-Br-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
133	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
134	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
135	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
136	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
137	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
138	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
139	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
140	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
141	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
142	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
143	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
144	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
144A	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
144B	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
144C	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
145	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
146	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
147	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
147A	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.

ES 2 562 178 T3

Tabla	Encabezado de fila
147B	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
147C	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
148	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
149	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
150	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
150A	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
150B	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
150C	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
151	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
152	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
153	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
154	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
155	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
156	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
157	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
158	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
159	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
160	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
161	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
162	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
163	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
164	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
165	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
166	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
167	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
168	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
169	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
170	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
171	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
172	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
173	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
174	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
175	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
176	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
177	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
178	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
179	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
180	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
180A	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
180B	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.

ES 2 562 178 T3

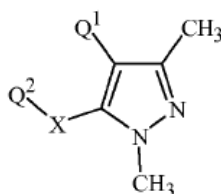
Tabla	Encabezado de fila
180C	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
181	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
182	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
183	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
184	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
185	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
186	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
187	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
188	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
189	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
190	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
191	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
192	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
193	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
194	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
195	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
196	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
197	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
198	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
199	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
200	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
201	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
202	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
203	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
204	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
205	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
206	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
207	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
208	Q ¹ es 2-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
209	Q ¹ es 2-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
210	Q ¹ es 2-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
211	Q ¹ es 2-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
212	Q ¹ es 2-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
213	Q ¹ es 2-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
214	Q ¹ es 2-Br-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
215	Q ¹ es 2-Br-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
216	Q ¹ es 2-Br-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
217	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
218	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
219	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.

ES 2 562 178 T3

Tabla	Encabezado de fila
220	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
221	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
222	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
223	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
224	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
225	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
226	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
227	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
228	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
228A	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
228B	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
228C	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
229	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
230	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
231	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
231A	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
231B	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
231C	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
232	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
233	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
234	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
234A	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
234B	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
234C	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
235	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
236	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
237	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
238	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
239	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
240	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
241	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
242	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
243	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
244	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
245	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
246	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
247	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.
248	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
249	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
250	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Me.

Tabla	Encabezado de fila
251	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Cl.
252	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Br.
253	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph, X es NH, R ¹ y R ^{1a} forman c-Pr, y R ² es Me.
254	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph, X es O, R ¹ es Et, R ^{1a} es H, y R ² es Cl.
255	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H, y R ² es Et.
257	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph, X es NH, R ¹ es CH=CH ₂ , R ^{1a} es H y R ² es Cl.
259	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} forman c-Pr, y R ² es Me.
261	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph, X es NH, R ¹ es Et, R ^{1a} es H, y R ² es Br.
262	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph, X es O, R ¹ y R ^{1a} son ambos H, y R ² es Et.
263	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph, X es S, R ¹ es CH ₂ CH=CH ₂ , R ^{1a} es H y R ² es Cl.
265	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph, X es NH, R ¹ es CH ₂ CF ₃ , R ^{1a} es H y R ² es Me.
266	Q ¹ es 2-F-Ph, X es O, R ¹ es CH ₂ F, R ^{1a} es H, y R ² es Cl.
267	Q ¹ es 2-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es CH ₂ Cl.
270	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph, X es O, R ¹ es Et, R ^{1a} es H, y R ² es Br.
271	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H, y R ² es OMe.
273	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph, X es NH, R ¹ y R ^{1a} forman c-Pr, y R ² es Br.
274	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph, X es O, R ¹ es n-Pr, R ^{1a} es H, y R ² es Me.
275	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph, X es NH, R ¹ es CH ₂ C≡CH, R ^{1a} es H y R ² es Cl.
277	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph, X es NH, R ¹ y R ^{1a} forman c-Pr, y R ² es Me.
278	Q ¹ es 2,4-di-Cl-3-piridinilo, X es O, R ¹ es c-Pr, R ^{1a} es H y R ² es Cl.
279	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo, X es S, R ¹ y R ^{1a} son ambos H y R ² es Et.

Tabla 449



Q¹ es 2,6-di-F-Ph, y X es NH.

Q ²	Q ²	Q ²	Q ²
2-Cl-3-piridinilo	6-Cl-3-piridinilo	2,6-di-Cl-3-piridinilo	3-Cl-2-piridinilo
3,5-di-Cl-2-piridinilo	3,5-di-F-2-piridinilo	5-Me-2-piridinilo	5-CN-2-piridinilo
5-pirimidinilo	2-Cl-5-pirimidinilo	1,3-di-Me-5-pirazolilo	5-Me-2-tiazolilo
5-Cl-2-piridinilo	3,5-di-Cl-4-piridinilo	Tetrahidro-2H-piran-4-ilo	Quinolin-2-ilo

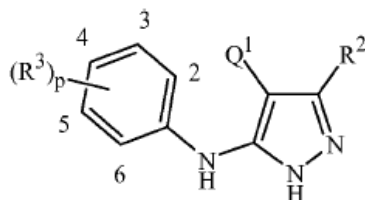
La presente descripción también incluye las Tablas 450 a 587, cada una de las cuales se construye igual que la Tabla 449 anterior, excepto que el encabezado de fila en la Tabla 449 (es decir, "Q¹ es 2,6-di-F-Ph y X es NH") se sustituye con el encabezamiento de fila respectivo mostrado a continuación. Por ejemplo, en la Tabla 450 el encabezado de fila es "Q¹ es 2,4-di-F-Ph y X es NH" y Q² es como se define en la Tabla 449 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 450 describe específicamente 2-cloro-N-[4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il]-3-piridinamina. Las Tablas 451 a 587 se construyen de forma similar.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
450	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph y X es NH.	500	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph y X es O.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
451	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph y X es NH.	501	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph y X es O.
452	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph y X es NH.	502	Q ¹ es 2,5-di-Cl-piridin-3-ilo y X es O.
453	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph y X es NH.	503	Q ¹ es 2-Cl-tien-3-ilo y X es O.
454	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph y X es NH.	504	Q ¹ es 2,5-di-Cl-tien-3-ilo y X es O.
455	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph y X es NH.	505	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph y X es S.
456	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph y X es NH.	506	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph y X es S.
457	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph y X es NH.	507	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph y X es S.
458	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph y X es NH.	508	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph y X es S.
459	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph y X es NH.	509	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph y X es S.
460	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph y X es NH.	510	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph y X es S.
461	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph y X es NH.	511	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph y X es S.
462	Q ¹ es 2-F-Ph y X es NH.	512	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph y X es S.
463	Q ¹ es 2-Cl-Ph y X es NH.	513	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph y X es S.
464	Q ¹ es 2-Br-Ph y X es NH.	514	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph y X es S.
465	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph y X es NH.	515	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph y X es S.
466	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph y X es NH.	516	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph y X es S.
467	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph y X es NH.	517	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph y X es S.
468	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph y X es NH.	518	Q ¹ es 2-F-Ph y X es S.
469	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph y X es NH.	519	Q ¹ es 2-Cl-Ph y X es S.
470	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph y X es NH.	520	Q ¹ es 2-Br-Ph y X es S.
471	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph y X es NH.	521	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph y X es S.
472	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph y X es NH.	522	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph y X es S.
473	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph y X es NH.	523	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph y X es S.
474	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo y X es NH.	524	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph y X es S.
475	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo y X es NH.	525	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph y X es S.
476	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo y X es NH.	526	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph y X es S.
477	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph y X es O.	527	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph y X es S.
478	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph y X es O.	528	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph y X es S.
479	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph y X es O.	529	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph y X es S.
480	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph y X es O.	530	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo y X es S.
481	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph y X es O.	531	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo y X es S.
482	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph y X es O.	532	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo y X es S.
483	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph y X es O.		
484	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph y X es O.		
485	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph y X es O.		
486	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph y X es O.		
487	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph y X es O.		
488	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph y X es O.		
489	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph y X es O.		
490	Q ¹ es 2-F-Ph y X es O.		

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
491	Q ¹ es 2-Cl-Ph y X es O.		
492	Q ¹ es 2-Br-Ph y X es O.		
493	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph y X es O.		
494	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph y X es O.		
495	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph y X es O.		
496	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph y X es O.		
497	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph y X es O.		
498	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph y X es O.		
499	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph y X es O.		

Tabla 588



Q¹ es 2,6-di-F-Ph y R² es Me.

(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p
2-F	3-F	4-F	2-Cl	3-Cl
4-Cl	2-Br	3-Br	4-Br	2,4-di-F
2,6-di-F	2,4,6-tri-F	2,4,5-tri-F	2,3,5-tri-F	2,3,6-tri-F
2-Cl-4-F	2-F-4-Cl	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2,4,6-tri-Cl
2-Br-4-F	2-I-4-F	2-Me-4-F	2-F-4-MeO	2-Cl-4-MeO
2-Br-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	2-F-4-CN	2-Cl-4-CN	2-Br-4-CN
2,6-di-F-4-CN	2-Cl-4,5-di-F	2-Cl-4,6-di-F	2-Br-2,5-di-F	2-Br-4,6-di-F
4-Cl-2,5-di-F	4-Cl-2,6-di-F	4-Br-2,5-di-F	4-Br-2,6-di-F	2,4-di-Cl,-6-F
2,6-di-Cl-4-F	2,6-di-Cl-4-MeO	2-CF ₃ -4-F	4-Me	2,4-di-Me
2-F-4-Br	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-Br-4-F-6-Cl	2-Cl-4-Br-6-F

5 La presente descripción también incluye las Tablas 589 a 671, cada una de los cuales está construida igual que la Tabla 588 anterior, excepto que el encabezado de fila en la Tabla 588 (es decir, "Q¹ es 2,6-di-F-Ph y R² es Me") se sustituye con el encabezado de fila respectivo mostrado a continuación. Por ejemplo, en la Tabla 589 el encabezado de fila es "Q¹ es 2,6-di-F-Ph y R² es Cl" y (R³)_p es como se define en la Tabla 588 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 589 describe específicamente 5-cloro-4-(2,6-difluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1H-pirazol-3-amina. Las Tablas 589 a 671 se construyen de forma similar.

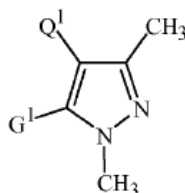
Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
589	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph y R ² es Cl.	634	Q ¹ es 2-Br-Ph y R ² es Cl.
590	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph y R ² es Br.	635	Q ¹ es 2-Br-Ph y R ² es Br.
591	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph y R ² es Me.	636	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph y R ² es Me.
592	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph y R ² es Cl.	637	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph y R ² es Cl.
593	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph y R ² es Br.	638	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph y R ² es Br.
594	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph y R ² es Me.	639	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph y R ² es Me.
595	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph y R ² es Cl.	640	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph y R ² es Cl.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
596	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph y R ² es Br.	641	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph y R ² es Br.
597	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph y R ² es Me.	642	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph y R ² es Me.
598	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph y R ² es Cl.	643	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph y R ² es Cl.
599	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph y R ² es Br.	644	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph y R ² es Br.
599A	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph y R ² es Me.	645	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph y R ² es Me.
599B	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph y R ² es Cl.	646	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph y R ² es Cl.
599C	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph y R ² es Br.	647	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph y R ² es Br.
600	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph y R ² es Me.	647A	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph y R ² es Me.
601	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph y R ² es Cl.	647B	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph y R ² es Cl.
602	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph y R ² es Br.	647C	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph y R ² es Br.
603	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph y R ² es Me.	648	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph y R ² es Me.
604	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph y R ² es Cl.	649	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph y R ² es Cl.
605	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph y R ² es Br.	650	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph y R ² es Br.
606	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph y R ² es Me.	650A	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph y R ² es Me.
607	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph y R ² es Cl.	650B	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph y R ² es Cl.
608	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph y R ² es Br.	650C	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph y R ² es Br.
609	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph y R ² es Me.	651	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph y R ² es Me.
610	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph y R ² es Cl.	652	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph y R ² es Cl.
611	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph y R ² es Br.	653	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph y R ² es Br.
612	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph y R ² es Me.	653A	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph y R ² es Me.
613	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph y R ² es Cl.	653B	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph y R ² es Cl.
614	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph y R ² es Br.	653C	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph y R ² es Br.
615	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph y R ² es Me.	654	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph y R ² es Me.
616	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph y R ² es Cl.	655	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph y R ² es Cl.
617	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph y R ² es Br.	656	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph y R ² es Br.
618	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph y R ² es Me.	657	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph y R ² es Me.
619	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph y R ² es Cl.	658	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph y R ² es Cl.
620	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph y R ² es Br.	659	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph y R ² es Br.
621	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph y R ² es Me.	660	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph y R ² es Me.
622	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph y R ² es Cl.	661	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph y R ² es Cl.
623	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph y R ² es Br.	662	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph y R ² es Br.
624	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph y R ² es Me.	663	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo y R ² es Me.
625	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph y R ² es Cl.	664	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo y R ² es Cl.
626	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph y R ² es Br.	665	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo y R ² es Br.
627	Q ¹ es 2-F-Ph y R ² es Me.	666	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo y R ² es Me.
628	Q ¹ es 2-F-Ph y R ² es Cl.	667	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo y R ² es Cl.
629	Q ¹ es 2-F-Ph y R ² es Br.	668	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo y R ² es Br.
630	Q ¹ es 2-Cl-Ph y R ² es Me.	669	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo y R ² es Me.
631	Q ¹ es 2-Cl-Ph y R ² es Cl.	670	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo y R ² es Cl.
632	Q ¹ es 2-Cl-Ph y R ² es Br.	671	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo y R ² es Br.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
633	Q ² es 2-Br-Ph y R ² es Me.		

Los compuestos de las Tablas 588 a 671 ilustran compuestos de Fórmula 2 (no reivindicados) en donde X es NH, que son intermedios útiles para preparar los compuestos de Fórmula 1 usando el método del Esquema 2.

Tabla 672



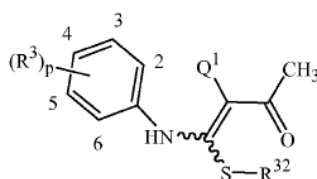
G ¹ es -OH			
Q ¹	Q ¹	Q ¹	Q ¹
2,6-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	2-Cl-Ph	2-Br-4-MeO-Ph
2,4-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	2-Br-Ph	2-F-4-CN-Ph
2,4,6-tri-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-OMe-Ph	2-Br-6-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	2-Br-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-CN-Ph	2-Me-4-F-Ph	2,6-di-Cl-Ph	2,5-di-Cl-3-piridinilo
2-Cl-4-F-Ph	2-I-4-F-Ph	2-F-4-MeO-Ph	2-Cl-3-tienilo
2-Cl-6-F-Ph	2-F-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph	2,5-di-Cl-3-tienilo
2,6-di-F-4-EtO-Ph	2-F-4-EtO-Ph	2-Cl-4-EtO-Ph	2-Br-4-EtO-Ph

- 5 La presente descripción también incluye las Tablas 673 a 676, cada una de las cuales está construida igual que la Tabla 672 anterior, excepto que el encabezado de fila en la Tabla 672 (es decir, "G¹ es -OH") se sustituye con el respectivo encabezado de fila mostrado a continuación. Por ejemplo, en la Tabla 673 el encabezado de fila es "G¹ es -SH", y Q¹ es como se define en la Tabla 672 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 673 específicamente describe 4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-tiol. Las Tablas 674 a 676 se construyen de forma similar.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
673	G ¹ es -SH.	675A	G ¹ es I.
674	G ¹ es Cl.	676	G ¹ es -NH ₂ .
675	G ¹ es Br.		

- 10 Los compuestos de las Tablas 672 y 673 ilustran compuestos de Fórmula 4 en donde X es O o S, R¹ y R^{1a} son cada uno H, y R² es CH₃, que son intermedios útiles para preparar compuestos de Fórmula 1 usando el método del Esquema 3. Los compuestos de la Tabla 672 ilustran además compuestos de Fórmula 4b en donde R¹ y R^{1a} son cada uno H, y R² es CH₃, que son intermedios útiles para preparar compuestos intermedios de Fórmula 6a usando el método del Esquema 6 y para preparar compuestos intermedios de Fórmula 6b usando el método del Esquema 7.
- 15 Las Tablas 674 y 675 ilustran compuestos de Fórmula 6 en donde G es Cl o Br, y R^{1a} son cada uno H, y R² es CH₃ que son intermedios útiles para preparar compuestos de Fórmula 1c usando el método del Esquema 4. La Tabla 676 ilustra compuestos de Fórmula 4a en donde R¹ y R^{1a} son cada uno H, y R² es CH₃, que son intermedios útiles para preparar compuestos intermedios de Fórmula 6 usando el método del Esquema 5.

Tabla 677



Q¹ es 2,6-di-F-Ph y R³² es Me.

(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p	(R ³) _p
2-F	3-F	4-F	2-Cl	3-Cl
4-Cl	2-Br	3-Br	4-Br	2,4-di-F
2,6-di-F	2,4,6-tri-F	2,4,5-tri-F	2,3,5-tri-F	2,3,6-tri-F
2-Cl-4-F	2-F-4-Cl	2,4-di-Cl	2,6-di-Cl	2,4,6-tri-Cl
2-Br-4-F	2-I-4-F	2-Me-4-F	2-F-4-MeO	2-Cl-4-MeO
2-Br-4-MeO	2,6-di-F-4-MeO	2-F-4-CN	2-Cl-4-CN	2-Br-4-CN
2,6-di-F-4-CN	2-Cl-4,5-di-F	2-Cl-4,6-di-F	2-Br-4,5-di-F	2-Br-4,6-di-F
4-Cl-2,5-di-F	4-Cl-2,6-di-F	4-Br-2,5-di-F	4-Br-2,6-di-F	2,4-di-Cl-6-F
2,6-di-Cl-4-F	2,6-di-Cl-4-MeO	2-CF ₃ -4-F	4-Me	2,4-di-Me
2-F-4-Br	2-Cl-4-Br	2-Br-4-Cl	2-Br-4-F-6-Cl	2-Cl-4-Br-6-F

La presente descripción también incluye las Tablas 678 a 704, cada una de las cuales está construida igual que la Tabla 677 anterior, excepto que el encabezado de fila en la Tabla 677 (es decir, "Q¹ es 2,6-di-F-Ph") está sustituido con el respectivo encabezado de fila mostrado a continuación. Por ejemplo, en la Tabla 2 el encabezado de fila es "Q¹ es 2,4-di-F-Ph" y (R³)_p es como se define en la Tabla 677 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 678 describe específicamente 3-(2,6-difluorofenil)-4-[(2,4-difluorofenil)amino]-4-(metiltio)-3-buten-2-ona. Las Tablas 679 a 704 se construyen de forma similar.

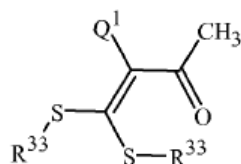
5

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
678	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph y R ³² es Me.	721	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph y R ³² es Et.
679	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph y R ³² es Me.	722	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph y R ³² es Et.
680	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph y R ³² es Me.	723	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph y R ³² es Et.
680A	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph y R ³² es Me.	724	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph y R ³² es Et.
681	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph y R ³² es Me.	724A	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph y R ³² es Et.
682	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph y R ³² es Me.	725	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph y R ³² es Et.
683	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph y R ³² es Me.	725A	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph y R ³² es Et.
684	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph y R ³² es Me.	726	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph y R ³² es Et.
685	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph y R ³² es Me.	726A	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph y R ³² es Et.
686	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph y R ³² es Me.	727	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph y R ³² es Et.
687	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph y R ³² es Me.	728	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph y R ³² es Et.
688	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph y R ³² es Me.	729	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph y R ³² es Et.
689	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph y R ³² es Me.	730	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo y R ³² es Et.
690	Q ¹ es 2-F-Ph y R ³² es Me.	731	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo y R ³² es Et.
691	Q ¹ es 2-Cl-Ph y R ³² es Me.	732	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo y R ³² es Et.
692	Q ¹ es 2-Br-Ph y R ³² es Me.	733	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
693	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph y R ³² es Me.	734	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
694	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph y R ³² es Me.	735	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
695	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph y R ³² es Me.	736	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
696	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph y R ³² es Me.	736A	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
696A	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph y R ³² es Me.	737	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
697	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph y R ³² es Me.	738	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
697A	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph y R ³² es Me.	739	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
698	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph y R ³² es Me.	740	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
698A	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph y R ³² es Me.	741	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
699	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph y R ³² es Me.	742	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
700	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph y R ³² es Me.	743	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
701	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph y R ³² es Me.	744	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
702	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo y R ³² es Me.	745	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
703	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo y R ³² es Me.	746	Q ¹ es 2-F-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
704	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo y R ³² es Me.	747	Q ¹ es 2-Cl-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
705	Q ¹ es 2,6-di-F-Ph y R ³² es Et.	748	Q ¹ es 2-Br-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
706	Q ¹ es 2,4-di-F-Ph y R ³² es Et.	749	Q ¹ es 2-F-4-Cl-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
707	Q ¹ es 2,4,6-tri-F-Ph y R ³² es Et.	750	Q ¹ es 2,4-di-Cl-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
708	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OMe-Ph y R ³² es Et.	751	Q ¹ es 2,6-di-Cl-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
708A	Q ¹ es 2,6-di-F-4-OEt-Ph y R ³² es Et.	752	Q ¹ es 2-F-4-MeO-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
709	Q ¹ es 2,6-di-F-4-CN-Ph y R ³² es Et.	752A	Q ¹ es 2-F-4-EtO-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
710	Q ¹ es 2-Cl-4-F-Ph y R ³² es Et.	753	Q ¹ es 2-Cl-4-MeO-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
711	Q ¹ es 2-Cl-6-F-Ph y R ³² es Et.	753A	Q ¹ es 2-Cl-4-EtO-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
712	Q ¹ es 2-Cl-4,6-di-F-Ph y R ³² es Et.	754	Q ¹ es 2-Br-4-MeO-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
713	Q ¹ es 4-Cl-2,6-di-F-Ph y R ³² es Et.	754A	Q ¹ es 2-Br-4-EtO-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
714	Q ¹ es 2-Br-4-F-Ph y R ³² es Et.	755	Q ¹ es 2-F-4-CN-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
715	Q ¹ es 2-Br-6-F-Ph y R ³² es Et.	756	Q ¹ es 2-Cl-4-CN-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
716	Q ¹ es 2-Me-4-F-Ph y R ³² es Et.	757	Q ¹ es 2-Br-4-CN-Ph y R ³² es <i>n</i> -Pr.
717	Q ¹ es 2-I-4-F-Ph y R ³² es Et.	758	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-piridinilo y R ³² es <i>n</i> -Pr.
718	Q ¹ es 2-F-Ph y R ³² es Et.	759	Q ¹ es 2-Cl-3-tienilo y R ³² es <i>n</i> -Pr.
719	Q ¹ es 2-Cl-Ph y R ³² es Et.	760	Q ¹ es 2,5-di-Cl-3-tienilo y R ³² es <i>n</i> -Pr.
720	Q ¹ es 2-Br-Ph y R ³² es Et.		

Los compuestos de las Tablas 677 a 760 ilustran compuestos de Fórmula 17 en donde R² es CH₃, que son intermedios útiles para preparar compuestos de Fórmula 1c usando el método del Esquema 16.

Tabla 761



Cada R³³ es Me

Q ¹	Q ¹	Q ¹	Q ¹
2,6-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	2-Cl-Ph	2-Br-4-MeO-Ph
2,4-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	2-Br-Ph	2-F-4-CN-Ph
2,4,6-tri-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-OMe-Ph	2-Br-6-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	2-Br-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-CN-Ph	2-Me-4-F-Ph	2,6-di-Cl-Ph	2,5-di-Cl-3-piridinilo
2-Cl-4-F-Ph	2-I-4-F-Ph	2-F-4-MeO-Ph	2-Cl-3-tienilo

Cada R³³ es Me

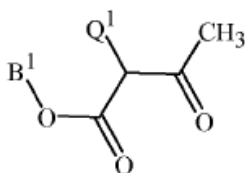
Q ¹	Q ¹	Q ¹	Q ¹
2-Cl-6-F-Ph	2-F-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph	2,5-di-Cl-3-tienilo
2,6-di-F-4-EtO-Ph	2-F-4-EtO-Ph	2-Cl-4-EtO-Ph	2-Br-4-EtO-Ph

La presente descripción también incluye las Tablas 762 a 764, cada uno de los cuales está construido igual que la Tabla 761 anterior, excepto que el encabezado de fila en la Tabla 761 (es decir, "Cada R³³ es Me.") se sustituye con el respectivo encabezado de fila mostrado a continuación. Por ejemplo, en la Tabla 762 el encabezado de fila es "Cada R³³ es Et.", y Q¹ es como se define en la Tabla 761 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 762 describe específicamente 3-(2,6-difluorofenil)-4,4-bis(etiltio)-3-buten-2-ona. Las Tablas 763 y 764 se construyen de forma similar.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
762	Cada R ³³ es Et.	764	Los dos R ³³ se toman juntos como -CH ₂ -
763	Cada R ³³ es <i>n</i> -Pr.		

Los compuestos de las Tablas 761 a 763 ilustran compuestos de Fórmula 18 en donde R² es CH₃, que son intermedios útiles para preparar compuestos intermedios de Fórmula 17 usando el método del Esquema 17. Los compuestos de la Tabla 764 ilustran compuestos de Fórmula 18 en donde R² es CH₃, que son intermedios útiles para preparar compuestos intermedios de Fórmula 4c usando el método descrito a continuación del Esquema 17.

Tabla 765



B¹ es Me

Q ¹	Q ¹	Q ¹	Q ¹
2,6-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	2-Cl-Ph	2-Br-4-MeO-Ph
2,4-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	2-Br-Ph	2-F-4-CN-Ph
2,4,6-tri-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-OMe-Ph	2-Br-6-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	2-Br-4-CN-Ph
2,6-di-F-4-CN-Ph	2-Me-4-F-Ph	2,6-di-Cl-Ph	2,5-di-Cl-3-piridinilo
2-Cl-4-F-Ph	2-I-4-F-Ph	2-F-4-MeO-Ph	2-Cl-3-tienilo
2-Cl-6-F-Ph	2-F-Ph	2-Cl-4-MeO-Ph	2,5-di-Cl-3-tienilo
2,6-di-F-4-EtO-Ph	2-F-4-EtO-Ph	2-Cl-4-EtO-Ph	2-Br-4-EtO-Ph

La presente descripción también incluye las Tablas 766 a 769, cada una de las cuales se construye igual que la Tabla 765 anterior, excepto que el encabezado de fila en la Tabla 765 (es decir "B¹ es Me.") se sustituye con el encabezado de fila respectivo mostrado a continuación. Por ejemplo, en la Tabla 766 el encabezado de fila es "B¹ es Et." y Q¹ es como se define en la Tabla 765 anterior. Así, la primera entrada en la Tabla 766 describe específicamente α-acetil-2,6-difluorobenoacetato de etilo. Las Tablas 767 a 769 se construyen de forma similar.

Tabla	Encabezado de fila	Tabla	Encabezado de fila
766	B ¹ es Et.	768	B ¹ es Ph
767	B ¹ es <i>n</i> -Pr.	769	B ¹ es CH ₂ Ph

Los compuestos de las Tablas 765 a 769 ilustran los compuestos de Fórmula 16 en donde R² es CH₃, que son intermedios útiles para preparar compuestos intermedios de Fórmula 4b usando el método de Esquema 14.

Formulación/utilidad

5 Un compuesto de esta invención se usará generalmente como un ingrediente activo fungicida en una composición, es decir, formulación, con al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, que sirve como un vehículo. Los ingredientes de la formulación o composición se seleccionan para ser consecuentes con las propiedades físicas del ingrediente activo, modo de aplicación y factores medioambientales tales como tipo de suelo, humedad y temperatura.

10 Formulaciones útiles incluyen composiciones tanto líquidas como sólidas. Las composiciones líquidas incluyen disoluciones (que incluyen concentrados emulsificables), suspensiones, emulsiones (que incluyen microemulsiones y/o suspoemulsiones) y similares, que opcionalmente pueden espesarse a geles. Los tipos generales de composiciones líquidas acuosas son concentrado soluble, concentrado en suspensión, suspensión en cápsula, emulsión concentrada, microemulsión y suspo-emulsión. Los tipos generales de composiciones líquidas no acuosas son concentrado emulsificable, concentrado microemulsificable, concentrado dispersable y dispersión oleosa.

15 Los tipos generales de composiciones sólidas son polvos, materiales pulverulentos, gránulos, perlas, pastillas, comprimidos, películas rellenas (que incluyen recubrimientos de semilla) y similares, que pueden ser dispersables en agua ("mojables") o solubles en agua. Las películas y recubrimientos formados a partir de disoluciones formadoras de película o suspensiones que fluyen son particularmente útiles para el tratamiento de semillas. El ingrediente activo puede estar (micro)encapsulado y formado además en una suspensión o formulación sólida; de forma alternativa la formulación total de ingrediente activo puede estar encapsulada (o "sobre-recubierta"). La encapsulación puede controlar o retrasar la liberación del ingrediente activo. Un gránulo emulsificable combina las ventajas tanto de una formulación concentrada emulsificable como una formulación granular seca. Las composiciones de alta resistencia se usan principalmente como intermedios para la formulación adicional.

25 Las formulaciones pulverizables se extienden típicamente en un medio adecuado antes de pulverizar. Dichas formulaciones líquidas y sólidas se formulan para diluirse fácilmente en el medio de pulverización, normalmente agua. Los volúmenes de pulverizado pueden oscilar de aproximadamente uno a varios miles de litros por hectárea, aunque más típicamente están en el intervalo de aproximadamente diez a varios cientos de litros por hectárea. Las formulaciones pulverizables pueden mezclarse en tanque con agua u otro medio adecuado para el tratamiento foliar por aplicación aérea o al suelo, o para aplicación al medio de crecimiento de la planta. Las formulaciones líquidas y secas pueden medirse directamente en sistemas de irrigación por goteo o medirse en los surcos durante la plantación. Las formulaciones líquidas y sólidas pueden aplicarse en semillas de cultivos y otra vegetación deseable como tratamientos de semillas antes de plantar para proteger el desarrollo de raíces y otras partes de plantas subterráneas y/o follaje a través de absorción sistémica.

30 Las formulaciones contendrán típicamente cantidades efectivas de ingrediente activo, diluyente y tensioactivo en los siguientes intervalos aproximados que añaden hasta 100 por cien en peso.

	Porcentaje en peso		
	Ingrediente activo	Diluyente	Tensioactivo
Gránulos, comprimidos y polvos dispersables en agua y solubles en agua	0,001-90	0-99,999	0-15
Dispersiones, suspensiones, emulsiones, disoluciones oleosas (que incluyen concentrados emulsificables)	1-50	40-99	0-50
Polvos	1-25	70-99	0-5
Gránulos y bolitas	0,001-95	5-99,999	0-15
Composiciones de alta resistencia	90-99	0-10	0-2

35 Los diluyentes sólidos incluyen, por ejemplo, arcillas tal como bentonita, montmorillonita, atapulgita y caolín, yeso, celulosa, dióxido de titanio, óxido de zinc, almidón, dextrina, azúcares (por ejemplo, lactosa, sacarosa), sílice, talco, mica, tierra diatomea, urea, carbonato de calcio, carbonato y bicarbonato sódico y sulfato sódico. Diluyentes sólidos típicos se describen en Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2ª Ed., Dorland Books, Caldwell, Nueva Jersey.

40 Los diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, *N,N*-dimetilalcanamidas (por ejemplo, *N,N*-dimetilformamida), limoneno, dimetilsulfóxido, *N*-alquilpirrolidonas (por ejemplo, *N*-metilpirrolidinona), etilenglicol, trietilenglicol, propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (por ejemplo, aceites minerales blancos, parafinas normales, isoparafinas), alquilbencenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de glicerol, sorbitol, triacetina, hidrocarburos aromáticos, compuestos alifáticos desaromatizados, alquilbencenos, alquilnaftalenos, cetonas tal como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, acetatos tal como acetato de isoamilo, acetato de hexilo, acetato de heptilo, acetato de octilo, acetato de nonilo, acetato de tridecilo y acetato de isobornilo, otros ésteres tales como ésteres de lactato alquilados, ésteres

dibásicos y γ -butirolactona, y alcoholes, que pueden ser lineales, ramificados, saturados o insaturados, tal como metanol, etanol, *n*-propanol, alcohol isopropílico, *n*-butanol, alcohol de isobutilo, *n*-hexanol, 2-etilhexanol, *n*-octanol, decanol, alcohol isodecílico, isooctadecanol, alcohol cetílico, alcohol laurílico, alcohol tridecílico, alcohol oleílico, ciclohexanol, alcohol de tetrahidrofurfurilo, alcohol de diacetona y alcohol bencílico. Los diluyentes líquidos incluyen también ésteres de glicerol de ácidos grasos saturado e insaturados (típicamente C₆-C₂₂) tal como aceites de semilla y frutos de planta (por ejemplo, aceites de oliva, ricino, linaza, sésamo, maíz, cacahuete, girasol, pepitas de uva, cártamo, semilla de algodón, soja, colza, coco y palmiste), grasas de fuente animal (por ejemplo, sebo de ternera, sebo de cerdo, manteca, aceite de hígado de bacalao, aceite de pescado), y mezclas de los mismos. Los diluyentes líquidos también incluyen ácidos grasos alquilados (por ejemplo, metilados, etilados, butilados) en donde los ácidos grasos pueden obtenerse por hidrólisis de ésteres de glicerol de fuentes vegetales o animales, y pueden purificarse por destilación. Los diluyentes líquidos típicos se describen en Marsden, Solvents Guide, 2ª Ed., Interscience, Nueva York, 1950.

Las composiciones sólidas y líquidas de la presente invención a menudo incluyen uno o más tensioactivos. Cuando se añaden a un líquido, los tensioactivos (también conocidos como "agentes de superficie activa") generalmente modifican, lo más a menudo reducen, la tensión superficial del líquido. Dependiendo de la naturaleza de los grupos hidrófilos y lipófilos en una molécula de tensioactivo, los tensioactivos pueden ser útiles como agentes humectantes, agentes dispersantes, emulsificantes o desespumantes.

Los tensioactivos pueden clasificarse como no iónicos, aniónicos o catiónicos. Los tensioactivos no iónicos útiles para la presentes composiciones incluyen, aunque no están limitados a: alcoxilatos de alcohol tal como alcoxilatos de alcohol basados en alcoholes naturales y sintéticos (que pueden ser ramificados o lineales) y preparados a partir de los alcoholes y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos; etoxilatos de amina, alcanolamidas y alcanolamidas etoxiladas; triglicéridos alcoxilados tales como aceites de soja, ricino y colza etoxilados; alcoxilatos de alquilfenol tales como etoxilatos de octilfenol, etoxilatos de nonilfenol, etoxilatos de dinonilfenol, y etoxilatos de dodecilfenol (preparados a partir de los fenoles y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); polímeros en bloque preparados a partir de óxido de etileno u óxido de propileno y polímeros de bloque inverso donde los bloques terminales se preparan a partir de óxido de propileno; ácidos grasos etoxilados; ésteres y aceites grasos etoxilados; ésteres de metilo etoxilados; tristirilfenol etoxilado (que incluyen los preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); ésteres de ácidos grasos, ésteres de glicerol, derivados basados en lanolina, ésteres de polietoxilato tal como ésteres de ácido graso de sorbitano polietoxilado, ésteres de ácido graso de sorbitol polietoxilado y ésteres de ácido gras de glicerol polietoxilado; otros derivados de sorbitano tal como ésteres de sorbitano; tensioactivos poliméricos tal como copolímeros aleatorios, copolímeros en bloque, resinas de peg (polietilenglicol) de alquido, polímeros de injerto o de peine y polímeros en estrella; polietilenglicoles (pegs); ésteres de ácidos grasos de polietilenglicol; tensioactivos basados en silicona; y derivados de azúcar tal como ésteres de sacarosa, alquilpoliglucósidos y polisacáridos de alquilo.

Tensioactivos aniónicos útiles incluyen, aunque no están limitados a: ácidos alquilaril-sulfónicos y sus sales; alcohol carboxilado o etoxilatos de alquilfenol; derivados de sulfonato de difenilo; lignina y derivados de lignina tal como lignosulfonatos; ácidos maleico o succínico o sus anhídridos; sulfonatos de olefina; ésteres de fosfato tal como ésteres de fosfato de alcoxilatos de alcohol, ésteres de fosfato de alcoxilatos de alquilfenol y ésteres de fosfato de etoxilatos de estirilfenol; tensioactivos basados en proteína; derivados de sarcosina; sulfato de estirilfenoléter; sulfatos y sulfonatos de aceites y ácidos grasos; sulfatos y sulfonatos de alquilfenoles etoxilados; sulfatos de alcoholes; sulfatos de alcoholes etoxilados; sulfonatos de aminas y amidas tal como *N,N*-alquiltauratos; sulfonatos de benceno, cumeno, tolueno, xileno y dodecil y tridecibencenos; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno y naftaleno de alquilo, sulfonatos de petróleo fraccionado; sulfosuccinamatos; y sulfosuccinatos y sus derivados tal como sales de dialquil-sulfosuccinato.

Tensioactivos catiónicos útiles incluyen, aunque no están limitados a: amidas y amidas etoxiladas; aminas tal como *N*-alquil-propanodiaminas, tripropilentriaminas y dipropilentetraminas, y aminas etoxiladas, diaminas etoxiladas y aminas propoxiladas (preparadas a partir de aminas y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); sales de amina tal como acetatos de amina y sales de diamina; sales de amonio cuaternario tal como sales cuaternarias, sales cuaternarias etoxiladas y sales dicuaternarias; y óxidos de amina tal como óxidos de alquildimetilamina y óxidos de bis-(2-hidroxietyl)-alquilamina.

Útiles también para las presentes composiciones son mezclas de tensioactivos no iónicos y aniónicos o mezclas de tensioactivos no iónicos y catiónicos. Los tensioactivos no iónicos, aniónicos y catiónicos y sus usos recomendados se describen en una variedad de referencias publicadas que incluyen McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, anual American and International Editions publicado por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely y Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., Nueva York, 1964; y A.S. Davidson y B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Séptima Edición, John Wiley and Sons, Nueva York, 1987.

Las composiciones de esta invención pueden contener también auxiliares y aditivos de formulación, conocidos por los expertos en la técnica como auxiliares de formulación (algunos de los cuales pueden considerarse que funcionan además como diluyentes sólidos, diluyentes líquidos o tensioactivos). Dichos auxiliares y aditivos de formulación pueden controlar: pH (tampones), espumado durante el procesado (antiespumantes tal como poliorganosiloxanos),

- sedimentación de ingredientes activos (agentes de suspensión), viscosidad (espesantes tixotrópicos), crecimiento microbiano en el recipiente (antimicrobianos), congelantes de producto (anticongelantes), color (dispersiones de tintes/pigmentos), lavado (formadores de película o etiquetas engomadas), evaporación (retardantes de la evaporación) y otros atributos de la formulación. Los formadores de película incluyen, por ejemplo, poli(acetatos de vinilo), copolímeros de poli(acetato de vinilo), copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo, poli(alcoholes de vinilo), copolímeros de poli(alcohol de vinilo) y ceras. Ejemplos de auxiliares y aditivos de formulación incluyen los enumerados en McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, Ediciones anuales Internacional y de Norte América publicados por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; y Publicación PCT WO 03/024222.
- El compuesto de la Fórmula 1 y cualquier otro ingrediente activo se incorporan típicamente en las presentes composiciones disolviendo el ingrediente activo en un disolvente o moliendo en un líquido o diluyente seco. Las disoluciones, que incluyen concentrados emulsificables, pueden prepararse por mezcla sencilla de los ingredientes. Si el disolvente de una composición líquida pretendida para el uso como un concentrado emulsionable es inmisible en agua, un emulsionante se añade típicamente para emulsionar el disolvente que contiene el compuesto activo en la dilución con agua. Las lechadas de ingrediente activo, con diámetros de partícula de hasta 2.000 µm pueden molerse en húmedo usando molinos medios para obtener partículas con diámetros promedio por debajo de 3 µm. Las lechadas acuosas pueden hacerse en concentrados de suspensión acabados (véase, por ejemplo, documento U.S. 3.060.084) o procesarse adicionalmente por secado por pulverizado para formar gránulos dispersables en agua. Las formulaciones secas normalmente necesitan procedimientos de molido en seco, que producen diámetros de partícula promedio en el intervalo de 2 a 10 µm. Los polvos y compuestos pulverulentos pueden prepararse mezclando y normalmente moliendo (tal como con un molino de martillo o molino de energía por fluido). Los gránulos y bolitas pueden prepararse pulverizando el material activo en vehículos granulares preformados o por técnicas de aglomeración. Véase Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de Diciembre de 1967, págs. 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4ª Ed., McGraw-Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y siguientes y documento WO 91/13546. Las bolitas pueden prepararse como se describe en el documento US. 4.172.714. Los gránulos dispersables en agua y solubles en agua pueden prepararse como se enseña en los documentos US. 4.144.050, U.S. 3.920.442 y DE 3.246.493. Los comprimidos pueden prepararse como se enseña en los documentos U.S. 5.180.587, U.S. 5.232.701 y U.S. 5.208.030. Las películas pueden prepararse como se enseña en los documentos GB 2.095.558 y U.S. 3.299.566.
- Para información adicional respecto a la técnica de formulación, véase, T.S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" en Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks y T.R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, págs. 120-133. Véase también el documento U.S. 3.235.361, Col. 6, línea 16 a Col. 7, línea 19 y Ejemplos 10-41; documento U.S. 3.309.192, Col. 5, línea 43 a Col. 7, línea 62 y Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; documento U.S. 2.891.855, Col. 3, línea 66 a Col. 5, línea 17 y Ejemplos 1-4; Klingman, Weed control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, págs. 81-96; Hance et al. Weed Control Handbook, 8ª Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; y Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

En los siguientes Ejemplos, todos los porcentajes son en peso y todas las formulaciones se preparan de formas convencionales. Los números de compuesto se refieren a compuestos en las Tablas de Índice A. Sin elaboración adicional, se cree que un experto en la técnica que usa la descripción anterior puede utilizar la presente invención en su extensión más completa. Los siguientes Ejemplos, por lo tanto, se van a construir como meramente ilustrativos, y no limitantes de la descripción de ninguna otra forma. Los porcentajes son en peso excepto donde se indique otra cosa.

45 Ejemplo A

Concentrado de alta resistencia

Compuesto 18	98,5%
aerogel de sílice	0,5%
sílice fino amorfo sintético	1,0%

Ejemplo B

Polvo humectable

Compuesto 22	65,0%
dodecilfenol-polietilenglicol-éter	2,0%
ligninsulfonato sódico	4,0%

ES 2 562 178 T3

Polvo humectable

silicoaluminato sódico	6,0%
montmorillonita (calcinada)	23,0%

Ejemplo C

Gránulo

Compuesto 23	10,0%
gránulos de atapulgita (materia de baja volatilidad, 0,71/0,30 mm; U.S.S. Núm. 25-50 de malla)	90,0%

Ejemplo D

Bolita extruida

Compuesto 24	25,0%
sulfato sódico anhidro	10,0%
ligninsulfonato de calcio en bruto	5,0%
alquilnaftalenosulfonato sódico	1,0%
bentonita de calcio/magnesio	59,0%

Ejemplo E

Concentrado emulsificable

Compuesto 36	10,0%
poli(hexoleato de oxietilensorbitol)	20,0%
metiléster de ácido graso C ₆ -C ₁₀	70,0%

Ejemplo F

Microemulsión

Compuesto 41	5,0%
copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	30,0%
alquilpoliglucósido	30,0%
monooleato de glicerilo	15,0%
Agua	20,0%

5 Ejemplo G

Tratamiento de semilla

Compuesto 45	20,00%
copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	5,00%
cera de ácido de montano	5,00%
ligninsulfonato de calcio	1,00%
copolímeros de bloque de polioxietileno/polioxipropileno	1,00%
alcohol de estearilo (POE 20)	2,00%

Tratamiento de semilla

poliorganosilano	0,20%
tinte rojo colorante	0,05%
Agua	65,75%

Las formulaciones tales como aquellas en la Tabla de Formulación se diluyen típicamente con agua para formar composiciones acuosas antes de la aplicación. Las composiciones acuosas para aplicaciones directas a la planta o parte de la misma (por ejemplo, composiciones de tanque de pulverizado) típicamente al menos aproximadamente 1 ppm o más (por ejemplo, de 1 ppm a 100 ppm) del(de los) compuesto(s) de esta invención.

- 5 Los compuestos de esta invención son útiles como agentes de control de enfermedad de la planta. La presente invención por lo tanto comprende además un método para controlar enfermedades de planta provocadas por patógenos de planta fúngicos que comprende aplicar a la planta o parte de la misma a proteger, o a la semilla de la planta a proteger, una cantidad efectiva de un compuesto de la invención o una composición fungicida que contiene dicho compuesto. Los compuestos y/o composiciones de esta invención proporcionan control de enfermedades
- 10 provocadas por un amplio espectro de patógenos de planta fúngicos en las clases Basidiomycete, Ascomycete, Oomycete y Deuteromycete. Son efectivos en el control de un amplio espectro de enfermedades de plantas, particularmente patógenos foliares de cultivos ornamentales, de césped, vegetales, de campo, de cereales y frutales. Estos patógenos incluyen: Oomycetes, que incluyen enfermedades de *Phytophthora* tales como *Phytophthora infestans*, *Phytophthora megasperma*, *Phytophthora parasitica*, *Phytophthora cinnamoni* y *Phytophthora capsici*, enfermedades de *Pythium* tal como *Pythium aphanidermatum*, y enfermedades en la familia
- 15 Peronosporaceae tal como *Plasmopara viticola*, *Peronospora* spp. (que incluye *Peronospora tabacina* y *Peronospora parasitica*), *Pseudoperonospora* spp. (que incluye *Pseudoperonospora cubensis*) y *Bremia lactucae*; Ascomycetes, que incluyen enfermedades de *Alternaria* tal como *Alternaria solani* y *Alternaria brassicae*, enfermedades de *Guignardia* tal como *Guignardia bidwell*, enfermedades de *Venturia* tal como *Venturia inaequalis*, enfermedades de
- 20 *Septoria* tal como *Septoria nodorum* y *Septoria tritici*, enfermedades de moho pulverulento tal como *Erysiphe* spp. (que incluyen *Erysiphe graminis* y *Erysiphe polygoni*), *Uncinula necator*, *Sphaerotheca fuliginea* y *Podospaera leucotricha*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, enfermedades de *Botrytis* tal como *Botrytis cinerea*, *Monilinia fructicola*, enfermedades de *Sclerotinia* tal como *Sclerotinia sclerotiorum*, *Magnaporthe grisea*, *Phomopsis viticola*, enfermedades de *Helminthosporium* tal como *Helminthosporium tritici repentis*, *Pyrenophora teres*, enfermedades de
- 25 antracnosa tal como *Glomerella* o *Colletotrichum* spp. (tal como *Colletotrichum graminicola* y *Colletotrichum orbiculare*), y *Gaeumannomyces graminis*; Basidiomycetes, que incluyen enfermedades de moho provocadas por *Puccinia* spp. (tal como *Puccinia recondita*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia hordei*, *Puccinia graminis* y *Puccinia arachidis*), *Hemileia vastatrix* y *Phakopsora pachryhizi*; otros patógenos que incluyen *Rutstroemia floccosum* (también conocido como *Sclerotinia homoeocarpa*); *Rhizoctonia* spp. (tal como *Rhizoctonia solani*); enfermedades de
- 30 *Fusarium* tal como *Fusarium roseum*, *Fusarium graminearum* y *Fusarium oxysporum*; *Verticillium dahliae*; *Sclerotium rolfsii*; *Rynchosporium secalis*; *Cercosporidium personatum*, *Cercospora arachidicola* y *Cercospora beticola*; y otros géneros y especies estrechamente relacionadas con estos patógenos. Además de su actividad fungicida, las composiciones o combinaciones también tienen actividad frente a las bacterias tales como *Erwinia amylovora*, *Xanthomonas campestris*, *Pseudomonas syringae* y otras especies relacionadas.
- 35 El control de enfermedad de plantas se consigue normalmente aplicando una cantidad efectiva de un compuesto de esta invención o bien antes después de la infección, a la parte de la planta a proteger al como las raíces, tallos, follaje, fruta, semillas, tubérculos o bulbos, o el medio (tierra o arena) en que las plantas a proteger están creciendo. Los compuestos pueden además aplicarse a semillas para proteger las semillas y plántulas que se desarrollan de las semillas. Los compuestos pueden aplicarse también a través de la irrigación de agua para tratar plantas.
- 40 Por consiguiente, este aspecto de la presente invención puede describirse también como un método para proteger una planta o semilla de planta de enfermedades provocadas por patógenos fúngicos que comprende aplicar una cantidad fúngicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido, o sal del mismo a la planta (o parte de la misma) o semilla de planta (directamente o a través del medio (por ejemplo, medio de crecimiento) de la planta o semilla de la planta).
- 45 Las tasas de aplicación para estos compuestos pueden estar influidas por muchos factores del medio y se determinarían bajo condiciones de uso reales. El follaje puede protegerse normalmente cuando se trata a una tasa de menos que aproximadamente 1 g/ha a aproximadamente 5.000 g/ha de ingrediente activo. La semilla y las plántulas pueden protegerse normalmente cuando la semilla se trata a una tasa de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 10 g por kilogramo de semilla.
- 50 Los compuestos de esta invención pueden mezclarse también con uno o más compuestos o agentes biológicamente activos distintos que incluyen fungicidas, insecticidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, herbicidas, protectores de herbicida, reguladores de crecimiento tal como inhibidores de formación de moho de insectos y estimulantes de formación de raíces, quimioesterilizantes, semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes de la alimentación, nutrientes de plantas, otros compuestos biológicamente activos o bacterias, virus u hongos

entomopatógenos para formar un pesticida multicomponente que da un espectro incluso más ancho de protección agrícola. Así la presente invención también se relaciona con una composición que comprende una cantidad fúngicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1 y una cantidad biológicamente efectiva de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional y puede comprender además al menos uno de un tensioactivo, un diluyente sólido o un diluyente líquido. Los demás compuestos o agentes biológicamente activos pueden formularse en composiciones que comprenden al menos uno de un tensioactivo, diluyente sólido o líquido. Para mezclas de la presente invención, uno o más compuestos biológicamente activos distintos pueden formularse junto con un compuesto de Fórmula 1, para formar una premezcla, o uno o más compuestos o agentes biológicamente activos distintos pueden formularse de forma separada del compuesto de Fórmula 1, y las formulaciones combinadas juntas antes de la aplicación (por ejemplo, en un tanque de pulverizado) o, alternativamente, aplicado en sucesión.

Como se menciona en el Compendio de la invención, un aspecto de la presente invención es una composición fungicida que comprende (es decir, una mezcla o combinación de) un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido, o una sal del mismo (es decir, componente a), y al menos un fungicida distinto (es decir, componente b).

Digna de mención es una composición que, además del compuesto de Fórmula 1 de componente (a), incluye como componente (b) al menos un compuesto fungicida seleccionado del grupo que consiste en las clases (b1) fungicidas de carbamato de metilbenzimidazol (MBC); (b2) fungicidas de dicarboximida; (b3) fungicidas inhibidores de desmetilación (DMI); (b4) fungicidas de fenilamida; (b5) fungicidas de amina/morfolino; (b6) fungicidas inhibidores de biosíntesis de fosfolípido; (b7) fungicidas de carboxamida; (b8) fungicidas de hidroxil(2-amino-)pirimidina; (b9) fungicidas de anilino-pirimidina; (b10) fungicidas de *N*-fenilcarbamato; (b11) fungicidas inhibidores fuera de la quinona (Qol); (b12) fungicidas de fenilpirrol; (b13) fungicidas de quinolina; (b14) fungicidas inhibidores de peroxidación de lípidos; (b15) fungicidas inhibidores de la biosíntesis de melanina-reductasa (MBI-R); (b16) fungicidas inhibidores de biosíntesis de melanina-deshidratasa (MBI-D); (b17) fungicidas de hidroxianilida; (b18) fungicidas inhibidores de escualeno-epoxidasa; (b19) fungicidas de polioxina; (b20) fungicidas de fenilurea; (b21) fungicidas inhibidores dentro de quinona (Qil); (b22) fungicidas de benzamida; (b23) fungicidas antibióticos de ácido enopiranurónico; (b24) fungicidas antibióticos de hexopiranosilo; (b25) fungicidas de antibiótico de glucopiranosilo:síntesis de proteína; (b26) fungicidas de antibiótico de glucopiranosilo: biosíntesis de trehalasa e inositol; (b27) fungicidas de cianoacetamidoxima; (b28) fungicidas de carbamato; (b29) fungicidas desacoplantes de la fosforilación oxidativa; (b30) fungicidas de organoestaño; (b31) fungicidas de ácido carboxílico; (b32) fungicidas heteroaromáticos; (b33) fungicidas de fosfonato; (b34) fungicidas de ácido ftalámico; (b35) fungicidas de benzotriazina; (b36) fungicidas de benceno-sulfonamida; (b37) fungicidas de piridazinona; (b38) fungicidas de tiofeno-carboxamida; (b39) fungicidas de pirimidinamida; (b40) fungicidas de amida de ácido carboxílico (CAA); (b41) fungicidas antibióticos de tetraciclina; (b42) fungicidas de tiocarbamato; (b43) fungicidas de benzamida; (b44) fungicidas de inducción de la defensa de la planta huésped; (b45) fungicidas de actividad por contacto multi-sitio; (b46) fungicidas distintos de las clases (b1) a (b45); y sales de compuestos de clases (b1) a (b46).

Descripciones adicionales de estas clases de compuestos fungicidas se proporcionan a continuación.

(b1) "Fungicidas de carbamato de metilbenzimidazol (MBC)" (Comité de Acción de Resistencia a Fungicidas (FRAC) código 1) inhibe la mitosis mediante unión a β -tubulina durante el montaje de microtúbulo. La inhibición del montaje de microtúbulo puede interrumpir la división celular, el transporte en la célula y estructura celular. Los fungicidas de carbamato de metilbenzimidazol incluyen fungicidas de benzimidazol y tiofanato. Los benzimidazoles incluyen benomilo, carbendazim, fuberidazol y tiabendazol. Los tiofanatos incluyen tiofanato y tiofanato-metilo.

(b2) "Fungicidas de dicarboxamida" (FRAC código 2) se proponen para inhibir una peroxidación de lípidos en hongos a través de la interferencia con NADH citocromo c reductasa. Ejemplos incluyen clozolinato, iprodiona, procimidona y vinclozolina.

(b3) "Fungicidas inhibidores de desmetilación (DMI)" (FRAC código 3) inhiben la C14-desmetilasa, que juega un papel en la producción de esterol. Los esteroides, tal como ergosterol, son necesarios para la estructura y función de membrana, haciéndolos esenciales para el desarrollo de paredes celulares funcionales. Por lo tanto, la exposición a estos fungicidas da por resultado el crecimiento anormal y eventualmente la muerte de hongos sensibles. Los fungicidas DMI se dividen entre varias clases químicas: azoles (que incluyen triazoles e imidazoles), pirimidinas, piperazinas y piridinas. Los triazoles incluyen azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol (que incluyen diniconazol-M), epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, flouquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, prothioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefona, triadimenol, triticonazol y uniconazol. Los imidazoles incluyen clotrimazol, econazol, imazalilo, isoconazol, miconazol, oxpoconazol, procloraz, pefurazoato y triflumizol. Las pirimidinas incluyen fenarimol, nuarimol y triarimol. Las piperazinas incluyen triforina. Las piridinas incluyen butiobato y pirifenox. Las investigaciones bioquímicas han mostrado que todos los fungicidas mencionados anteriormente son fungicidas DMI como se describe por K. H. Kuck et al. en *Modern Selective Fungicides-Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.) Gustav Fischer Verlag: Nueva York, 1995, 205-258.

(b4) "Fungicidas de fenilamida" (FRAC código 4) son inhibidores específicos de ARN polimerasa en hongos Oomycete. Los hongos sensibles expuestos a estos fungicidas muestran una capacidad reducida para incorporar

uridina en ARNr. El crecimiento y desarrollo en hongos sensibles se evita por exposición a esta clase de fungicida. Los fungicidas de fenilamida incluyen fungicidas de acilalanina, oxazolidinona y butirolactona. Las acilalaninas incluyen benalaxilo, benalaxilo-M, furalaxilo, metalaxilo y metalaxilo-M (también conocidos como mefenoxam). Las oxazolidinonas incluyen oxadixilo. Las butirolactonas incluyen ofurace.

5 (b5) "Fungicidas de amina/morfolina" (FRAC código 5) inhiben dos sitios diana en la ruta biosintética del esteroles, $\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$ isomerasa y Δ^{14} reductasa. Los esteroides, tal como ergosterol, se necesitan para la estructura y función de la membrana, haciéndolos esenciales para el desarrollo de paredes celulares funcionales. Por lo tanto, la exposición de estos fungicidas da por resultado el crecimiento anormal y eventualmente la muerte de los hongos sensibles. Los fungicidas de amina/morfolina (también conocidos como inhibidores de la biosíntesis de esteroles no DMI) incluyen
10 fungicidas de morfolina, piperidina y espirocetal-amina. Las morfolinas incluyen aldiformo, dodemormo, fenpropimormo, tridemormo y trimorfamida. Las piperidinas incluyen fenpropidina y piperalina. Las espirocetal-aminas incluyen espiroxamina.

(b6) "Fungicidas inhibidores de la biosíntesis de fosfolípido" (FRAC código 6) inhiben el crecimiento de hongos afectando a la biosíntesis de fosfolípidos. Los fungicidas de biosíntesis de fosfolípidos incluyen fungicidas de fosforotiolato y ditiolano. Los fosforotiolatos incluyen edifenfos, iprobenfos y pirazofos. Los ditiolanos incluyen isoprotilano.

(b7) "Fungicidas de carboxamida" (FRAC código 7) inhiben el Complejo II (succinato deshidrogenasa) de la respiración de hongos afectando a una enzima clave en el Ciclo de Krebs (ciclo TCA) denominada succinato deshidrogenasa. Inhibir la respiración evita que el hongo fabrique ATP, y así inhibe el crecimiento y reproducción.
20 Los fungicidas de carboxamida incluyen benzamida, carboxamida de furano, carboxamida de oxatiina, carboxamida de tiazol, carboxamida de pirazol y carboxamida de piridina. Las benzamidas incluyen benodanilo, flutolanilo y mepronilo. Las carboxamidas de furano incluyen fenfuram. Las carboxamidas de oxatiina incluyen carboxina y oxicarboxina. Las carboxamidas de tiazol incluyen tifuluzamida. Las carboxamidas de pirazol incluyen bixafeno, furametpir, isopirazam, fluxapiroxad, sedaxano (*N*-[2-(1*S*,2*R*)-[1,1'-biciclopropil]-2-ilfenil]-3-(difluorometil)-1-metil-1*H*-pirazol-4-carboxamida) y penflufen (*N*-[2-(1,3-dimetil-butil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida (Publicación de Patente PCT WO 2003/010149)). Las carboxamidas de piridina incluyen boscalid.

(b8) "Fungicidas de hidroxil(2-amino-)pirimidina" (FRAC código 8) inhibe la síntesis de ácido nucleico interfiriendo con la adenosina desaminasa. Ejemplos incluyen bupirimato, dimetirimol y etirimol.

(b9) "Fungicidas de anilino-pirimidina" (FRAC código 9) se proponen para inhibir la biosíntesis del aminoácido metionina e interrumpir la secreción de enzimas hidrolíticos que lisan las células de las plantas durante la infección. Ejemplos incluyen ciprodinilo, mepanipirim y pirimetanilo.

(b10) "Fungicidas de *N*-fenil-carbamato" (FRAC código 10) inhiben la mitosis por unión a β -tubulina e interrumpen el montaje de microtúbulo. La inhibición del montaje de microtúbulo puede interrumpir la división celular, el transporte en la célula y la estructura celular. Ejemplos incluyen dietofencarb.

(b11) "Fungicidas inhibidores fuera de quinona (QoI)" (FRAC código 11) inhiben el Complejo III de la respiración mitocondrial en los hongos afectando a la ubiquinol oxidasa. La oxidación de ubiquinol se bloquea en el sitio "fuera de quinona" (Q_o) del complejo de citocromo bc_1 , que está localizado en la membrana mitocondrial interna de los hongos. Inhibir la respiración mitocondrial evita el crecimiento y desarrollo normal del hongo. Los fungicidas inhibidores fuera de quinona (también conocidos como fungicidas de estrobilurina) incluyen fungicidas de metoxiacrilato, metoxicarbamato, oximinoacetato, oximinoacetamida, oxazolidinadiona, dihidrodioxazina, imidazolinona y bencilcarbamat. Los metoxiacrilatos incluyen azoxistrobina, enestroburina (SYP-Z071), picoxistrobina. Los metoxicarbamatos incluyen piraclostrobina y pirametostrobina. Los oximinoacetatos incluyen cresoxim-metilo, piraoxistrobina y trifloxistrobina. Las oximinoacetamidas incluyen dimoxistrobina, metominostrobrina, orisastrobina, α -[metoxiimino]-*N*-metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]-metil]bencenoacetamida y 2-[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-ilideno]-amino]oxi]metil]- α -(metoxiimino)-*N*-metilbenceno-acetamida. Las
45 teoxazolidinonas incluyen famoxadona. Las dihidrodioxazinas incluyen fluoxastrobina. Las imidazolinonas incluyen fenamidona. Los bencilcarbamatos incluyen piribencarb.

(b12) "Fungicidas de fenilpirrol" (FRAC código 12) inhiben una MAP proteína quinasa asociada con la transducción de señal osmótica en hongos. Fenpiclonilo y fludioxonilo son ejemplos de esta clase de fungicidas.

(b13) "Fungicidas de quinolina" (FRAC código 13) se proponen para inhibir la transducción de señal afectando a las proteínas G en la señalización celular temprana. Se ha mostrado que interfieren con la germinación y/o formación de apresorio en hongos que provocan enfermedades de moho en polvo. El quinoxifeno es un ejemplo de esta clase de fungicida.

(b14) "Fungicidas inhibidores de peroxidación de lípidos" (FRAC código 14) se proponen para inhibir la peroxidación de lípidos que afecta a la síntesis de la membrana en hongos. Los miembros de esta clase, tal como etridiazol, pueden afectar también otros procesos biológicos tales como respiración y biosíntesis de melanina. Los fungicidas de peroxidación de lípidos incluyen fungicidas de carbono aromático y de 1,2,4-tiadiazol. Los fungicidas de carbono

aromático incluyen bifenilo, cloroneb, diclorano, quintoceno, tecnaceno y tolclofos-metilo. Los fungicidas de 1,2,4-tiadiazol incluyen etridiazol.

- 5 (b15) “Fungicidas inhibidores de biosíntesis de melanina-reductasa (MBI-R)” (FRAC código 16.1) inhiben la etapa de reducción de naftal en la biosíntesis de melanina. La melanina se necesita para la infección de plantas huésped por algunos hongos. Los fungicidas inhibidores de biosíntesis de melanina-reductasa incluyen fungicidas de isobenzofuranona, pirroloquinolinona y triazolobenzotiazol. Las isobenzofuranonas incluyen ftalida. Las pirroloquinolinonas incluyen piroquilona. Los triazolobenzotiazoles incluyen triciclazol.
- 10 (b16) “Fungicidas inhibidores de biosíntesis de melanina-deshidratasa (MBI-D)” (FRAC código 16.2) inhiben la escitalona deshidratasa en la biosíntesis de melanina. La melanina se necesita para la infección de plantas huésped por algunos hongos. Los fungicidas inhibidores de biosíntesis de melanina-deshidratasa incluyen fungicidas de ciclopropanocarboxamida, carboxamida y propionamida. Las ciclopropanocarboxamidas incluyen carpropamid. Las carboxamidas incluyen diclocimet. Las propionamidas incluyen fenoxanilo.
- (b17) “Fungicidas de hidroxianilida” (FRAC código 17) inhiben la C4-desmetilasa que juega un papel en la producción de esterol. Los ejemplos incluyen fenhexamida.
- 15 (b18) “Fungicidas inhibidores de escualeno-epoxidasa” (FRAC código 18) inhiben la escualeno-epoxidasa en la ruta de la biosíntesis del ergosterol. Los esteroides tal como ergosterol se necesitan para la estructura y función de membrana, haciéndolos esenciales para el desarrollo de paredes celulares funcionales. Por lo tanto la exposición a estos fungicidas da por resultado el crecimiento anormal y eventualmente la muerte de hongos sensibles. Los fungicidas inhibidores de escualeno-epoxidasa incluyen fungicidas de tiocarbamato y alilamina. Los tiocarbamatos incluyen piributicarb. Las alilaminas incluyen naftifina y terbinafina.
- 20 (b19) “Fungicidas de polioxina” (FRAC código 19) inhiben la quitina sintasa. Ejemplos incluyen polioxina.
- (b20) “Fungicidas de fenilurea” (FRAC código 20) se proponen para afectar la división celular. Ejemplos incluyen pencicurona.
- 25 (b21) “Fungicidas inhibidores dentro de quinona (Qil)” (FRAC código 21) inhiben el Complejo III de la respiración mitocondrial en hongos afectando la ubiquinol reductasa. La reducción de ubiquinol se bloquea en el sitio “dentro de quinona” (Q_i) del complejo citocromo bc_1 , que está localizado en la membrana mitocondrial interna de los hongos. Inhibir la respiración mitocondrial evita el crecimiento y desarrollo normal de los hongos. Los fungicidas inhibidores dentro de quinona incluyen fungicidas de cianoimidazol y sulfamoiltriazol. Los cianoimidazoles incluyen ciazofamid. Los sulfamoiltriazoles incluyen amisulbrom.
- 30 (b22) “Fungicidas de benzamida” (FRAC código 22) inhiben la mitosis mediante unión de β -tubulina e interrumpen el montaje de microtúbulos. La inhibición del montaje de microtúbulos puede interrumpir la división celular, transporte en la célula y estructura celular. Ejemplos incluyen zoxamida.
- (b23) “Fungicidas antibióticos de ácido enopiranurónico” (FRAC código 23) inhiben el crecimiento de hongos afectando la biosíntesis de proteína. Ejemplos incluyen blasticidina-S.
- 35 (b24) “Fungicidas antibióticos de hexopiranosilo” (FRAC código 24) inhiben el crecimiento de hongos afectando la biosíntesis de proteína. Ejemplos incluyen casugamicina.
- (b25) “Fungicidas de antibiótico de glucopiranosilo: síntesis de proteína” (FRAC código 25) inhiben el crecimiento de hongos afectando la biosíntesis de proteína. Ejemplos incluyen estreptomina.
- 40 (b26) “Fungicidas de antibiótico glucopiranosilo: biosíntesis de trehalasa e inositol” (FRAC código 26) inhiben la trehalasa en la ruta de la biosíntesis de inositol. Ejemplos incluyen la validamicina.
- (b27) “Fungicidas de cianoacetamidaoxima” (FRAC código 27) incluyen cimoxanilo.
- (b28) “Fungicidas de carbamato” (FRAC código 28) se consideran inhibidores multi-sitio del crecimiento de hongos. Se proponen para interferir con la síntesis de ácidos grasos en membranas celulares, que afectan entonces a la permeabilidad de la membrana celular. Propamacarb, hidrocloreto de propamacarb, yodocarb y protiocarb son ejemplos de esta clase fungicida.
- 45 (b29) “Fungicidas desacoplantes de fosforilación oxidativa” (FRAC código 29) inhiben la respiración fúngica desacoplando la fosforilación oxidativa. Inhibir la respiración evita el crecimiento y desarrollo normal de los hongos. Esta clase incluye 2,6-dinitroanilinas tal como fluazinam, pirimidonahidrazonas tal como ferimzona y crotonatos de dinitrofenilo tal como dinocap, meptildinocap y binapacilo.
- 50 (b30) “Fungicidas de organoestaño” (FRAC código 30) inhiben la adenosin trifosfato (ATP) sintasa en la ruta de la fosforilación oxidativa. Ejemplos incluyen acetato de fentina, cloruro de fentina e hidróxido de fentina.

- (b31) "Fungicidas de ácidos carboxílicos" (FRAC código 31) inhiben el crecimiento de hongos afectando la topoisomerasa tipo (II) (girasa) del ácido desoxirribonucleico (ADN). Los ejemplos incluyen ácido oxolínico.
- (b32) "Fungicidas heteroaromáticos" (FRAC código 32) se proponen para afectar la síntesis de ADN/ácido ribonucleico (ARN). Los fungicidas heteroaromáticos incluyen fungicidas de isoxazol e isotiazolona. Los isoxazoles incluyen himexazol y las isotiazolonas incluyen octilina.
- (b33) "Fungicidas de fosfonato" (FRAC código 33) incluyen ácido fosforoso y sus diversas sales, que incluyen fosetil-aluminio.
- (b34) "Fungicidas de ácido ftalámico" (FRAC código 34) incluyen tecloftalam.
- (b35) "Fungicidas de benzotriazina" (FRAC código 35) incluyen triazoxida.
- (b36) "Fungicidas de benceno-sulfonamida" (FRAC código 36) incluyen flusulfamida.
- (b37) "Fungicidas de piridazinona" (Comité de Acción de Resistencia a los Fungicidas (FRAC) código 37) incluyen diclomezina.
- (b38) "Fungicidas de tiofeno-carboxamida" (FRAC código 38) se proponen para afectar la producción de ATP. Los ejemplos incluyen siltiofam.
- (b39) "Fungicidas de pirimidinamida" (FRAC código 39) inhiben el crecimiento de hongos afectando la biosíntesis de fosfolípido e incluye diflumetorim.
- (b40) "Fungicidas de amida de ácido carboxílico (CAA)" (FRAC código 40) se proponen para inhibir la biosíntesis de fosfolípidos y la deposición en pared celular. La inhibición de estos procesos evita el crecimiento y lleva a la muerte del hongo diana. Los fungicidas de amida de ácido carboxílico incluyen fungicidas de amida de ácido cinámico, carbamato de valinamida y amida de ácido mandélico. Las amidas de ácido cinámico incluyen dimetomorfo y flumorfo. Los carbamatos de valinamida incluyen bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, iprovalicarb, valifenalato (valifenal). Las amidas de ácido mandélico incluyen mandipropamid, *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida y *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida.
- (b41) "Fungicidas antibióticos de tetraciclina" (FRAC código 41) inhiben el crecimiento de hongos afectando al complejo 1 nicotinamida adenina dinucleótido (NADH) oxidoreductasa. Los ejemplos incluyen oxitetraciclina.
- (b42) "Fungicidas de tiocarbamato (b42)" (FRAC código 42) incluyen metasulfocarb.
- (b43) "Fungicidas de benzamida" (FRAC código 43) inhiben el crecimiento de hongos por deslocalización de proteínas tipo espectrina. Los ejemplos incluyen fungicidas de acilpicolida tal como fluopicolida y fluopiram.
- (b44) "Fungicidas de inducción a la defensa de plantas huésped" (FRAC código P) inducen mecanismos de defensa de plantas huésped. Los fungicidas de inducción a la defensa de plantas huésped incluyen fungicidas de benzo-tiadiazol, benzisotiazol y tiadiazol-carboxamida. Los benzo-tiadiazoles incluyen acibenzolar-S-metilo. Los benzisotiazoles incluyen probenazol. Las tiadiazol-carboxamidas incluyen tiadinilo e isotianilo.
- (b45) "Fungicidas de contacto multi-sitio" inhiben crecimiento de hongos a través de múltiples sitios de acción y tienen actividad de contacto/preventiva. Esta clase de fungicidas incluye: (b45.1) "fungicidas de cobre" (FRAC código M1), (b45.2) "fungicidas de azufre" (FRAC código M2), (b45.3) "fungicidas de ditiocarbamato" (FRAC código M3), (b45.4) "fungicidas de ftalimida" (FRAC código M4), (b45.5) "fungicidas de cloronitrilo" (FRAC código M5), (b45.6) "fungicidas de sulfamida" (FRAC código M6), (b45.7) "fungicidas de guanidina" (FRAC código M7), (b45.8) "fungicidas de triazina" (FRAC código M8) y (b45.9) "fungicidas de quinona" (FRAC código M9). "Fungicidas de cobre" son compuestos inorgánicos que contienen cobre, típicamente en el estado de oxidación cobre (II); ejemplos incluyen oxiclورو de cobre, sulfato de cobre e hidróxido de cobre, que incluyen composiciones tales como mezcla de Bordeaux (sulfato de cobre tribásico). "Fungicidas de azufre" son compuestos químicos inorgánicos que contienen anillos y cadenas de átomos de azufre; ejemplos incluyen azufre elemental. "Fungicidas de ditiocarbamato" contienen un resto molecular de ditiocarbamato; los ejemplos incluyen mancozeb, metiram, propineb, ferbam, maneb, thiram, zineb y ziram. "Fungicidas de ftalimida" contienen un resto molecular ftalimida; ejemplos incluyen folpet, captan y captafol. "Fungicidas de cloronitrilo" contienen un anillo aromático sustituido con cloro y ciano; ejemplos incluyen clorotalonilo. "Fungicidas de sulfamida" incluyen diclofluanid y tolifluanid. "Fungicidas de guanidina" incluyen dodina, guazatina e imoctadina, que incluyen albesilato de iminoctadina y triacetato de iminoctadina. "Fungicidas de triazina" incluyen anilazina. "Fungicidas de quinona" incluyen ditianona.
- (b46) "Fungicidas distintos a los fungicidas de clases (b1) a (b45)" incluyen ciertos fungicidas cuyo modo de acción puede ser desconocido. Estos incluyen: (b46.1) "fungicidas de tiazol carboxamida" (FRAC código U5), (b46.2) "fungicidas de fenil-acetamida" (FRAC código U6), (b46.3) "fungicidas de quinazolinona" (FRAC código U7), (b46.4) "fungicidas de benzofenona" (FRAC código U8). Las tiazol carboxamidas incluyen etaboxam. Las fenil-acetamidas incluyen ciflufenamid y *N*-[[[ciclopropilmetoxi]amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]-metileno]bencenoacetamida.

Las quinazolinonas incluyen proquinazid y 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona. Las benzofenonas incluyen metrafenona y pirofenona. La clase (b46) incluyen además betoxazina, neo-asozina (metanoarsonato férrico), fenpirazamina, pirrolnitrina, quinometionato, tebufloquina, *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida, *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida, 2-[[2-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]tio]-2-[3-(2-metoxifenil)-2-tiazolidinilideno]acetonitrilo, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]piridina, *N*-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil]metil]-propil]carbamato de 4-fluorofenilo, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]-triazolo[1,5-*a*]pirimidina, *N*-(4-cloro-2-nitrofenil)-*N*-etil-4-metilbencenosulfonamida, *N*-[[[ciclopropilmetoxi]amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metileno]-bencenoacetamida, *N'*-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-*N*-etil-*N*-metilmetanimidamida y 1-[(2-propeniltio)carbonil]-2-(1-metiletil)-4-(2-metilfenil)-5-amino-1*H*-pirazol-3-ona.

Por lo tanto es digna de mención una mezcla (es decir, composición) que comprende como componente (a) un compuesto de Fórmula 1 (o un *N*-óxido o sal del mismo) y como componente (b) al menos un compuesto fungicida seleccionado del grupo que consiste en las clases descritas anteriormente (b1) a (b46). Además son dignas de mención realizaciones en donde el componente (b) comprende al menos un fungicida de cada uno de dos grupos diferentes seleccionados de (b1) a (b46). Además es digna de mención una composición que comprende dicha mezcla (en cantidad fúngicamente efectiva) y que comprende además al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Digna de mención particular es una mezcla (es decir composición) que comprende un compuesto de Fórmula 1 y al menos un compuesto fungicida seleccionado del grupo de compuestos específicos enumerados anteriormente en conexión con las clases (b1) a (b46). También es digna de mención particular una composición que comprende dicha mezcla (en cantidad fúngicamente efectiva) y que comprende además al menos un tensioactivo adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.

Ejemplos de otros compuestos o agentes biológicamente activos con cuyos compuestos de esta invención pueden formularse son: insecticidas tal como abamectina, acefato, acetamiprid, acetoprol, aldicarb, amidoflumet (S-1955), amitraz, avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, bifenazato, bistriflurona, buprofezina, carbofurano, cartap, quinometionato, clorfenapir, clorfluazurona, clorantraniliprol (DPX-E2Y45), clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorobenzilato, cromafenozida, clotianidina, ciantraniliprol (3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-*N*-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-1*H*-pirazol-5-carboxamida), ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cihexatina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuirona, diazinona, dicofol, dieldrina, dienocloro, diflubenzurona, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etoxazol, fenamifos, rotenona, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiacarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenpiroximato, fenvalerato, fipronilo, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim (UR-50701), flufenoxurona, fonofos, halofenozida, hexaflumurona, hexitiazox, hidrametilnona, imiciafos, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, lufenurona, malatión, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidationa, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoxifeno, metoflutrina, monocrotofos, nitenpiram, nitiazina, novalurona (XDE-007), noviflumurona, oxamila, paratión, paratión-metilo, permetrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargita, protiocarb, protrifenbute, pimetozina, pirafuprol, piretrina, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazona, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno (BSN 2060), espirotetramat, sulprofos, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurona, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfona, triflumurona; nematocidas tal como aldicarb, imiciafos, oxamilo y fenamifos; bactericidas tal como estreptomocina; acaricidas tal como amitraz, quinometionato, clorobenzilato, cienpirafeno, cihexatino, dicofol, dienocloro, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridabeno y tebufenpirad; y agentes biológicos que incluyen bacterias entomopatógenicas, tal como *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, y las delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, Cellcap, MPV, MPVII); hongos entomopatógenicos, tal como hongos muscardina verde; y virus entomopatógenicos que incluyen baculovirus, nucleopoliedrovirus (NPV) tal como HzNPV, AfNPV; y virus granulosos (GV) tal como CpGV.

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

Para realizaciones donde se usan uno o más de estos diversos compañeros de mezcla, la relación de peso de estos diversos compañeros de mezcla (en total) al compuesto de Fórmula 1 (o un *N*-óxido o sal del mismo) está típicamente entre aproximadamente 1:3000 y aproximadamente 3000:1. Dignas de mención son las relaciones en peso entre aproximadamente 1:300 a aproximadamente 300:1 (por ejemplo relaciones entre aproximadamente 1:30 y aproximadamente 30:1). Un experto en la técnica puede determinar fácilmente a través de experimentación sencilla las cantidades biológicamente efectivas de ingredientes activos necesarios para el espectro deseado de actividad biológica. Será evidente que incluyendo estos componentes adicionales pueden expandir el espectro de enfermedades controladas más allá del espectro controlado por el compuesto de Fórmula 1 solo.

En ciertos ejemplos, las combinaciones de un compuesto de esta invención con otros compuestos o agentes biológicamente activos (particularmente fungicidas) (es decir, ingredientes activos) pueden dar por resultado un efecto mayor que aditivo (es decir, sinérgico). Reducir la cantidad de ingredientes activos liberados en el medio mientras se asegura el efectivo control de plagas siempre es deseable. Cuando el sinergismo de ingredientes activos fungicidas se da a tasas de aplicación que dan niveles agrónomicamente satisfactorios de control fúngico, dichas combinaciones pueden ser ventajosas para reducir los costes de producción del cultivo y disminuir la carga medioambiental.

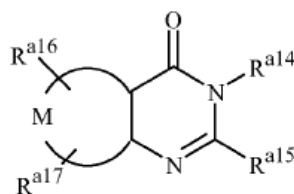
Los compuestos de esta invención y composiciones de los mismos pueden aplicarse a plantas transformadas genéticamente para expresar proteínas tóxicas para plagas de invertebrados (tal como delta-endotoxinas *Bacillus thuringiensis*). El efecto de los compuestos fungicidas aplicados de forma exógena de esta invención pueden ser sinérgicos con las proteínas de toxina expresadas.

Digna de mención es una combinación de un compuesto de Fórmula 1 (o un *N*-óxido o sal del mismo) con al menos otro ingrediente activo fungicida. Es digna de mención particular dicha combinación donde el otro ingrediente activo fungicida tiene diferente sitio de acción del compuesto de Fórmula 1. En ciertos ejemplos, una combinación con al menos un ingrediente activo fungicida distinto que tiene un espectro similar de control aunque un sitio de acción diferente será particularmente ventajoso para la gestión de resistencia. Así, una composición de la presente invención puede comprender además una cantidad biológicamente efectiva de al menos un ingrediente activo fungicida adicional que tiene un espectro similar de control pero un diferente sitio de acción.

Son dignas de mención particular las composiciones que además del compuesto de Fórmula 1 incluyen al menos un compuesto seleccionado del grupo que consiste en (1) fungicidas de alquilenobis(ditiocarbamato); (2) cimoxanilo; (3) fungicidas de fenilamida; (4) fungicidas de pirimidinona; (5) clortalonilo; (6) carboxamidas que actúan en el complejo II del sitio de transferencia de electrones respiratorios mitocondriales fúngicos; (7) quinoxifeno; (8) metrafenona o piriofenona; (9) ciflufenamid; (10) ciprodinilo; (11) compuestos de cobre; (12) fungicidas de ftalimida; (13) fosetilo-aluminio; (14) fungicidas de benzimidazol; (15) ciazofamid; (16) fluazinam; (17) iprovalicarb; (18) propamocarb; (19) validomicina; (20) fungicidas de diclorofenil dicarboximida; (21) zoxamida; (22) fluopicolida; (23) mandipropamida; (24) amidas de ácido carboxílico que actúan en la biosíntesis de fosfolípidos y la deposición de la pared celular; (25) dimetomorfo; (26) inhibidores de la biosíntesis de esteroles no DMI; (27) inhibidores de desmetilasa en la biosíntesis de esteroles; (28) fungicidas del complejo *bc1*; y sales de compuestos de (1) a (28).

Descripciones adicionales de clases de compuestos fungicidas se proporcionan a continuación.

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



A1

en donde M forma un anillo fenilo, tiofeno o piridina condensado; R^{a14} es alquilo C_1-C_6 ; R^{a15} es alquilo C_1-C_6 o alcoxi C_1-C_6 ; R^{a16} es halógeno; y R^{a17} es hidrógeno o halógeno.

Los fungicidas de pirimidinona se describen en la Publicación de Solicitud de Patente PCT WO 94/26722 y las Patentes de EE.UU. 6.066.638, 6.245.770, 6.262.058 y 6.277.858. De interés son los fungicidas de pirimidinona seleccionados del grupo: 6-bromo-3-propil-2-propiloxi-4(3*H*)-quinazolinona, 6,8-diyodo-3-propil-2-propiloxi-4(3*H*)-quinazolinona, 6-yodo-3-propil-2-propiloxi-4(3*H*)-quinazolinona (proquinazid), 6-cloro-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-*d*]pirimidin-4(3*H*)-ona, 6-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[2,3-*d*]pirimidin-4(3*H*)-ona, 7-bromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-*d*]pirimidin-4(3*H*)-ona, 6-bromo-2-propoxi-3-propilpirido[2,3-*d*]pirimidin-4(3*H*)-ona, 6,7-dibromo-2-propoxi-3-propiltieno[3,2-*d*]pirimidin-4(3*H*)-ona y 3-(ciclopropilmetil)-6-yodo-2-(propiltio)pirido-[2,3-*d*]pirimidin-4(3*H*)-ona.

Los inhibidores de la biosíntesis de esteroles (grupo (27)) controlan los hongos inhibiendo las enzimas en la ruta de biosíntesis del esteroles. Los fungicidas que inhiben la desmetilasa tienen un sitio común de acción en la ruta de la biosíntesis del esteroles fúngico, que implica la inhibición de la desmetilación en la posición 14 de lanosterol o 24-metilenodihidrolanosterol, que son precursores de esteroides en los hongos. Los compuestos que actúan en este sitio se denominan a menudo como inhibidores de desmetilasa, fungicidas DMI, o DMIs. La enzima desmetilasa se denomina a veces por otros nombres en la bibliografía bioquímica, que incluyen citocromo P-450 (14DM). La enzima desmetilasa se describe en, por ejemplo, J. Biol. Chem. 1992, 267, 13175-79 y las referencias citadas en él. Los fungicidas DMI se dividen entre varias clases químicas: azoles (que incluyen triazoles e imidazoles), pirimidinas, piperazinas y piridinas. Los triazoles incluyen azaconazol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol

- (que incluye diniconazol-M), epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, penconazol, propiconazol, protioconazol, quinconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefona, triadimenol, triticonazol y uniconazol. Los imidazoles incluyen clotrimazol, econazol, imizalilo, isoconazol, miconazol, oxpoconazol, procloraz y triflumizol. Las pirimidinas incluyen fenarimol, nuarimol y triarimol. Las piperazinas incluyen triforina. Las piridinas incluyen butiobato y pirifenox. Las investigaciones bioquímicas han mostrado que todos los fungicidas mencionados anteriormente son fungicidas DMI como se describe por K.H. Kuck et al. en *Modern Selective Fungicides – Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (Ed.), Gustav Fischer Verlag: Nueva York, 1995, 205-258.
- Los fungicidas del complejo bc_1 (grupo 28) tienen un modo de acción fungicida que inhibe el complejo bc_1 en la cadena respiratoria mitocondrial. El complejo bc_1 se denomina a veces por otros nombres en la bibliografía bioquímica, que incluyen complejo III de la cadena de transferencia de electrones y ubihidroquinona:citocromo c oxidoreductasa. Este complejo se identifica únicamente por el número de Comisión de Enzimas EC1.10.2.2. El complejo bc_1 se describe en, por ejemplo, J. Biol. Chem. 1989, 264, 14543-48; Methods Enzymol. 1986, 126, 253-71; y referencias citadas en él. Los fungicidas de estrobilurina tal como azoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina (SYP-Z071), fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominostrobina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobrina y trifloxistrobina se conocen por tener este modo de acción (H. Sauter et al., Angew. Chem. Int. Ed. 1999, 38, 1328-1349). Otros compuestos fungicidas que inhiben el complejo bc_1 en la cadena respiratoria mitocondrial incluyen famoxadona y fenamidona.
- Los alquilenobis(ditiocarbamato)s (grupo (1)) incluyen compuestos tal como mancozeb, maneb, propineb y zineb. Las fenilamidas (grupo (3)) incluyen compuestos tales como metalaxilo, benalaxilo, furalaxilo y oxadixilo. Las carboxamidas (grupo (6)) incluyen compuestos tal como boscalid carboxina, fenfuram, flutolanilo, furametpir, mepronilo, oxicarboxina, tifluzamida, pentiopirad y penflufeno (*N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida (Publicación de Patente PCT WO 2003/010149)), y se conocen por inhibir la función mitocondrial perturbando el complejo II (succinato deshidrogenasa) en la cadena de transporte de electrones respiratorios. Los compuestos de cobre (grupo (11)) incluyen compuestos tales como oxiclورو de cobre, sulfato de cobre e hidróxido de cobre, que incluyen composiciones tales como mezcla de Bordeaux (sulfato de cobre tribásico). Las ftalimidas (grupo (12)) incluyen compuestos tales como folpet y captano. Los fungicidas de benzimidazol (grupo (14)) incluyen benomilo y carbendazim. Los fungicidas de diclorofenil dicarboximida (grupo (20)) incluyen clozolinato, diclozolina, iprodiona, isovalediona, miclozolina, procimidona y vinclozolina.
- Los inhibidores de biosíntesis de esteroles no DMI (grupo (26)) incluyen fungicidas de morfolina y piperidina. Las morfolininas y piperidininas son inhibidores de la biosíntesis de esteroles que se ha mostrado que inhiben las etapas en la ruta de biosíntesis de esteroles a un punto posterior que las inhibiciones alcanzadas por la biosíntesis de esteroles DMI (grupo (27)). Las morfolininas incluyen aldimorfo, dodemorfo, fenpropimorfo, tridemorfo y trimorfamida. Las piperidininas incluyen fenpropidina.
- Ejemplos de fungicidas de componente (b) incluyen acibenzolar-S-metilo, aldimorfo, ametotradina, amisulbrom, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo, benalaxilo-M, benodanilo, benomilo, bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, betoxazina, binapacril, bifenilo, bitertanol, bixafeno, blasticidina-S, boscalid, bromuconazol, bupirimato, carboxina, carpropamid, captafol, captano, carbendazim, cloroneb, clorotalonilo, clozolinato, clotrimazol, sales de cobre tal como mezcla de Bordeaux (sulfato de cobre tribásico), hidróxido de cobre y oxiclورو de cobre, ciazofamid, ciflufenamid, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, diclofluanid, diclocimet, diclomezina, diclorano dietofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimetirimol, dimetomorfo, dimetoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, ditianona, dodemorfo, dodina, edifenfos, enestroburina, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenoxanilo, fenciclonilo, fenpropidina, fenpropimorfo, fenpirazamina, acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumetover, flumorfo, fluopicolida (también conocido como picobenzamid), fluopiram, fluoroimida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutianilo (2-[[[2-fluoro-5-(trifluorometil)fenil]tio]-2-[3-(2-metoxifenil)-2-tiazolidinilideno]acetónitrilo], flutolanilo, flutriafol, fluxapiroxad, folpet, fosetilo-aluminio, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalilo, imibenconazol, iminoctadina, yodocarb, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoprotioloano, isopirazam, isotianilo, casugamicina, cresoxim-metilo, mancozeb, mandipropamid, maneb, mepronilo, meptildinocap, metalaxilo, metalaxilo-M, metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobina, mepanipirim, metrafenona, miclobutanilo, naftifina, neoasozina (metanoarsonato férrico), naurimol, octilina, ofurace, orisastrobina, oxadixilo, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, oxitetraciclina, penconazol, pencicurona, penflufeno, pentiopirad, pefurazoato, ácido fosforoso y sales, ftalida, picoxistrobina, piperalina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propamocarb-hidrocloreuro, propiconazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobrina, pirametostrobina, piraoxistrobina, pirazofos, piribencarb, piributicarb, pirifenox, pirimetanilo, pirofenona, piroquilona, pirrolnitrino, quinometionato, quinoxifeno, quintozeno, sedaxano, siltiofiam, simeconazol, espiroxamina, estreptomycinina, azufre, tebuconazol, tebufloquina, tecloftalam, tecnazeno, terbinafina, tetraconazol, tiabendazol, tifluzamida, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tolclfos-metilo, toliifluid, triadimefona, triadimenol, triazoxida, triciclazol, tridemorfo, triflumizol, triciclazol, trifloxistrobina, triforina, trimorfamida, triticonazol, uniconazol, validamicina, valifenalato (valifenal), vinclozolina, zineb, ziram, zoxamida, *N*-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-*N*-etil-*N*-metil-metanimidamida, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pirimidina (BAS600), penflufeno (*N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxamida), *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-

5 [(metilsulfonyl)amino]butanamida, *N*-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-
 10 [(etilsulfonyl)amino]butanamida, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4*H*-1-benzopiran-4-ona, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-
 isoxazolidinil]-piridina, *N*-[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonyl]metil]propil]carbamato de 4-fluorofenilo, *N*-
 5 [[(ciclopropilmetoxi)amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metileno]bencenoacetamida, α -(metoxiimino)-*N*-metil-2-
 [[1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]metil]bencenoacetamida, *N*'-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]-*N*-
 etil-*N*-metilmetanimidamida, *N*-(4-cloro-2-nitrofenil)-*N*-etil-4-metilbencenosulfonamida, 2-[[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-
 2-propen-1-ilideno]amino]oxi]metil]- α -(metoxiimino)-*N*-metilbencenoacetamida, 1-[(2-propenil)carbonil]-2-(1-
 metiletil)-4-(2-metilfenil)-5-amino-1*H*-pirazol-3-ona, etil-6-octil-[1,2,4]triazolo[1,5-*a*]pirimidin-7-ilamina, *N*-[4-[[[[[1-metil-
 1*H*-tetrazol-5-il]fenilmetileno]amino]oxi]metil]-2-tiazolil]carbamato de pentilo y *N*-[6-[[[[[1-metil-1*H*-tetrazol-5-
 10 il]fenilmetileno]amino]oxi]metil]-2-piridinil]carbamato de pentilo.

15 Dignas de mención son las combinaciones de compuestos de Fórmula 1 (o un *N*-óxido o sal del mismo) (es decir, Componente (a) en las composiciones) con azoxistrobina, cresoxim-metilo, trifloxistrobina, piraclostrobina, picoxistrobina, pirametostrobina, piraoxistrobina, dimoxistrobina, metominostrobina/fenominostrobina, carbendazim, clorotalonilo, quinoxifeno, metrafenona, ciflufenamid, fenpropidina, fenpropimorfo, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, flusilazol, fluxapiroxad, hexaconazol, ipconazol, metconazol, penconazol, propiconazol, proquinazid, protioconazol, piriufenona, tebuconazol, triticonazol, famoxadona, procloraz, pentiopirad y boscalid (nicobifeno) (es decir, como Componente (b) en las composiciones).

20 Preferidas para el mejor control de enfermedades de plantas provocadas por patógenos de plantas fúngicos (por ejemplo, menor tasa de uso o espectro más amplio de patógenos de plantas controlado) o gestión de resistencia son mezclas de un compuesto de esta invención con un fungicida seleccionado del grupo: azoxistrobina, cresomix-metilo, trifloxistrobina, piraclostrobina, picoxistrobina, pirametostrobina, piraoxistrobina, dimoxistrobina, metominostrobina/fenominostrobina, quinoxifeno, metrafenona, ciflufenamid, fenpropidina, fenpropimorfo, ciproconazol, epoxiconazol, flusilazol, metconazol, propiconazol, proquinazid, protioconazol, piriufenona, tebuconazol, triticonazol, famoxadona y pentiopirad.

25 Las Tablas A1 a A54 enumeran combinaciones específicas de un compuesto de Componente (b) con Componente (a) (los números de compuesto se refieren a compuestos en la Tabla de Índice A) ilustrativas de la mezclas, composiciones y métodos de la presente invención. En la Tabla A1, cada línea debajo de los encabezados de columna "Componente (a)" y "Componente (b)" describe específicamente una combinación (es decir, mezcla) de Componente (a), que es Compuesto 22, con un fungicida Componente (b). Las entradas bajo el encabezado
 30 "Relaciones ilustrativas" describe tres relaciones de peso específicas de Componente (b) a Componente (a) para la mezcla descrita. Por ejemplo, la primera línea de la Tabla A1 describe una mezcla de Compuesto 22 con acibenzolar-S-metilo y enumera las relaciones en peso de acibenzolar-S-metilo a Compuesto 22 de 1:1, 1:4 o 1:17.

Tabla A1

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas (*)		
Compuesto 22	Acibenzolar-S-metilo	1:1	1:4	1:18
Compuesto 22	Aldimorfo	7:1	3:1	1:1
Compuesto 22	Ametoctradina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Amisulbrom	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Anilazina	22:1	8:1	4:1
Compuesto 22	Azaconazol	2:1	1:2	1:4
Compuesto 22	Azoxistrobina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Benalaxilo	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Benalaxilo-M	1:1	1:3	1:8
Compuesto 22	Benodanilo	4:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Benomilo	11:1	4:1	1:1
Compuesto 22	Bentiavalicarb	1:1	1:4	1:12
Compuesto 22	Bentiavalicarb-isopropilo	1:1	1:4	1:12
Compuesto 22	Betoxazina	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Binapacril	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Bifenilo	15:1	5:1	2:1

ES 2 562 178 T3

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas (*)		
Compuesto 22	Bitertanol	3:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Bixafeno	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Blasticidina-S	1:4	1:12	1:30
Compuesto 22	Mezcla de Bordeaux (sulfato de cobre tribásico)	45:1	15:1	5:1
Compuesto 22	Boscalid	4:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Bromuconazol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Bupirimato	1:3	1:10	1:30
Compuesto 22	Captafol	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Captano	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Carbendazim	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Carboxina	4:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Carpropamid	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Cloroneb	100:1	35:1	14:1
Compuesto 22	Clorotalonilo	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Clozolinato	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Clotrimazol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Hidróxido de cobre	45:1	15:1	5:1
Compuesto 22	Oxicloruro de cobre	45:1	15:1	5:1
Compuesto 22	Ciazofamid	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Ciflufenamid	1:2	1:6	1:24
Compuesto 22	Cimoxanilo	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Ciproconazol	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Ciprodinilo	4:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Diclofluanid	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Diclocimet	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Diclomezina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Diclorano	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Dietofencarb	7:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Difenoconazol	1:1	1:3	1:12
Compuesto 22	Diflumetorim	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Dimetirimol	1:3	1:8	1:30
Compuesto 22	Dimetomorfo	3:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Dimoxistrobina	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Diniconazol	1:1	1:3	1:8
Compuesto 22	Diniconazol-M	1:1	1:3	1:12
Compuesto 22	Dinocap	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Ditianona	5:1	2:1	1:2

ES 2 562 178 T3

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas (*)		
Compuesto 22	Dodemorfo	7:1	3:1	1:1
Compuesto 22	Dodina	10:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Edifenfos	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Enestroburina	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Epoxiconazol	1:1	1:3	1:7
Compuesto 22	Etaboxam	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Etirimol	7:1	3:1	1:1
Compuesto 22	Etridiazol	7:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Famoxadona	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Fenamidona	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Fenarimol	1:2	1:7	1:24
Compuesto 22	Fenbuconazol	1:1	1:3	1:10
Compuesto 22	Fenfuram	4:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Fenhexamid	10:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Fenoxanilo	15:1	4:1	1:1
Compuesto 22	Fenpiclonilo	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Fenpropidina	7:1	2:1	1:1
Compuesto 22	Fenpropimorfo	7:1	2:1	1:1
Compuesto 22	Fenpirazamina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Sal de fentina tal como acetato de fentina, cloruro de fentina o hidróxido de fentina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Ferbam	30:1	10:1	4:1
Compuesto 22	Ferimzona	7:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Fluazinam	3:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Fludioxonilo	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Flumetover	3:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Flumorfo	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Fluopicolida	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Fluopiram	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Fluoroimida	37:1	14:1	5:1
Compuesto 22	Fluoxastrobina	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Fluquinconazol	1:1	1:2	1:4
Compuesto 22	Flusilazol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Flusulfamida	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Flutianilo	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Flutolanilo	4:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Flutriafol	1:1	1:2	1:4

ES 2 562 178 T3

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas (*)		
Compuesto 22	Fluxapiroxad	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Folpet	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Fosetilo-aluminio	30:1	12:1	5:1
Compuesto 22	Fuberidazol	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Furalaxilo	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Furametpir	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Guazatina	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Hexaconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Himexazol	75:1	25:1	9:1
Compuesto 22	Imazalilo	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Imibenconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Iminoctadina	15:1	4:1	1:1
Compuesto 22	Yodocarb	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Ipconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Iprobenfos	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Iprodiona	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Iprovalicarb	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Isoprotiolano	45:1	15:1	5:1
Compuesto 22	Isopirazam	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Isotianilo	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Casugamicina	1:2	1:7	1:24
Compuesto 22	Cresoxim-metilo	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Mancozeb	22:1	7:1	3:1
Compuesto 22	Mandipropamid	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Maneb	22:1	7:1	3:1
Compuesto 22	Mepanipirim	6:1	2:1	1:1
Compuesto 22	Mepronilo	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Meptildinocap	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Metalaxilo	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Metalaxilo-M	1:1	1:4	1:12
Compuesto 22	Metconazol	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Metasulfocarb	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Metiram	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Metominostrobina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Metrafenona	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Miclobutanilo	1:1	1:3	1:8
Compuesto 22	Naftifina	15:1	5:1	2:1

ES 2 562 178 T3

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas (*)		
Compuesto 22	Neo-asozina (metanoarsonato férrico)	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Naurimol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Octilinona	15:1	4:1	1:1
Compuesto 22	Ofurace	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Orisastrobina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Oxadixilo	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Ácido oxolínico	7:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Oxpoconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Oxicarboxina	4:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Oxitetraciclina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Pefurazoato	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Penconazol	1:2	1:6	1:15
Compuesto 22	Pencicurona	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Pentiopirad	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Ácido fosforoso o una sal del mismo	15:1	6:1	2:1
Compuesto 22	Ftalida	15:1	6:1	2:1
Compuesto 22	Picoxistrobina	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Piperalina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Polioxina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Probenazol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Procloraz	7:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Procimidona	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Propamocarb o propamocarb-hidrocloruro	10:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Propiconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Propineb	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Proquinazid	1:1	1:3	1:12
Compuesto 22	Protiocarb	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Protioconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Piraclostrobina	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Pirametostrobina	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Piraoxistrobina	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Pirazofos	15:1	4:1	1:1
Compuesto 22	Piribencarb	4:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Piributicarb	15:1	4:1	1:1
Compuesto 22	Pirifenox	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Pirimetanilo	3:1	1:1	1:2
Compuesto 22	Piriofenona	2:1	1:1	1:4

ES 2 562 178 T3

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas (*)		
Compuesto 22	Piroquilona	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Pirrolnitrino	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Quinometonato	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Quinoxifeno	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Quintozeno	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Siltiofam	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Simeconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Espiroxamina	5:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Estreptomicina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Azufre	75:1	25:1	9:1
Compuesto 22	Tebuconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Tebufloquina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Tecloftalam	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Tecnazeno	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Terbinafina	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Tetraconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Tiabendazol	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Tifluzamida	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Tiofanato	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Tiofanato-metilo	11:1	4:1	2:1
Compuesto 22	Tiram	37:1	14:1	5:1
Compuesto 22	Tiadinilo	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Tolclofos-metilo	37:1	14:1	5:1
Compuesto 22	Tolilfluanid	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Triadimefona	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Triadimenol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Triazóxido	15:1	5:1	2:1
Compuesto 22	Triciclazol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Tridemorfo	7:1	2:1	1:1
Compuesto 22	Trifloxistrobina	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	Triflumizol	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Triforina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Trimorfamida	7:1	2:1	1:2
Compuesto 22	Triticonazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Uniconazol	1:1	1:2	1:5
Compuesto 22	Validamicina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	Valifenalato (valifenal)	2:1	1:1	1:4

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas (*)		
Compuesto 22	Vinclozolino	15:1	6:1	2:1
Compuesto 22	Zineb	37:1	14:1	5:1
Compuesto 22	Ziram	37:1	14:1	5:1
Compuesto 22	Zoxamida	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina	1:1	1:2	1:6
Compuesto 22	Penflufeno (<i>N</i> -[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-4-carboxamida)	2:1	1:1	1:3
Compuesto 22	<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonil)amino]butanamida	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	2-butoxi-6-yodo-3-propil-4 <i>H</i> -1-benzopiran-4-ona	1:1	1:3	1:12
Compuesto 22	3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]piridina	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	<i>N</i> -[1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonil]metil]propil]carbamato de 4-fluorofenilo	2:1	1:1	1:4
Compuesto 22	<i>N</i> -[[[ciclopropilmetoxi]amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metileno]bencenoacetamida	1:2	1:7	1:24
Compuesto 22	α -[metoximimino]- <i>N</i> -metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]metil]-bencenoacetamida	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	<i>N</i> -[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]- <i>N</i> -etil- <i>N</i> -metilmetanimidamida	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	<i>N</i> -(4-cloro-2-nitrofenil)- <i>N</i> -etil-4-metilbencenosulfonamida	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	2-[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-ilideno]amino]oxi]metil]- α -(metoxiimino)- <i>N</i> -metilbencenoacetamida	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	<i>N</i> -[4-[[[[(1-metil-1 <i>H</i> -tetrazol-5-il)fenil-metileno]amino]oxi]metil]-2-tiazolil]carbamato de pentilo	3:1	1:1	1:3
Compuesto 22	<i>N</i> -[6-[[[[(1-metil-1 <i>H</i> -tetrazol-5-il)fenil-metileno]amino]oxi]metil]-2-piridinil]carbamato de pentilo	3:1	1:1	1:3

(*) Relaciones de Componente (b) respecto a Componente (a) en peso

5 Las Tablas A2 a A54 se construyen cada una igual que la Tabla A1 anterior excepto que las entradas debajo de los encabezados de columna "Componente (a)" se sustituyen con la Entrada de Columna de Componente (a) respectiva mostrada a continuación. Así, por ejemplo, en la Tabla A2 las entradas debajo del encabezado de columna "Componente (a)" todas enumeran "Compuesto 18", y la primera línea debajo de los encabezados de columna en la Tabla A2 describe específicamente una mezcla de Compuesto 18 con acibenzolar-S-metilo. Las Tablas A3 a A54 se construyen de forma similar.

Número de tabla	Entradas de columna de Componente (a)	Número de tabla	Entradas de columna de Componente (a)
A2	Compuesto 18	A31	Compuesto 357
A3	Compuesto 23	A32	Compuesto 358
A4	Compuesto 24	A33	Compuesto 360
A5	Compuesto 36	A34	Compuesto 361
A6	Compuesto 41	A35	Compuesto 364
A7	Compuesto 45	A36	Compuesto 365
A8	Compuesto 87	A37	Compuesto 367

Número de tabla	Entradas de columna de Componente (a)	Número de tabla	Entradas de columna de Componente (a)
A9	Compuesto 91	A38	Compuesto 368
A10	Compuesto 118	A39	Compuesto 369
A11	Compuesto 139	A40	Compuesto 372
A12	Compuesto 148	A41	Compuesto 373
A13	Compuesto 172	A42	Compuesto 374
A14	Compuesto 175	A43	Compuesto 375
A15	Compuesto 193	A44	Compuesto 376
A16	Compuesto 232	A45	Compuesto 377
A17	Compuesto 265	A46	Compuesto 378
A18	Compuesto 266	A47	Compuesto 379
A19	Compuesto 284	A48	Compuesto 380
A20	Compuesto 286	A50	Compuesto 382
A21	Compuesto 287	A51	Compuesto 383
A22	Compuesto 292		
A23	Compuesto 297		
A24	Compuesto 332		
A25	Compuesto 336		
A26	Compuesto 343		
A27	Compuesto 346		
A28	Compuesto 349		

5 La tabla B1 enumera combinaciones específicas de un compuesto Componente (b) con Componente (a) ilustrativas de las mezclas, composiciones y métodos de la presente invención. La primera columna de la Tabla B1 enumera el compuesto Componente (b) específico (por ejemplo, "acibenzolar-S-metilo" en la primera línea). Las columnas segunda, tercera y cuarta de la Tabla B1 enumera intervalos de relaciones en peso para tasas al que el compuesto Componente (b) se aplica típicamente a un cultivo de crecimiento en el campo respecto al Componente (a) (por ejemplo, "2:1 a 1:180" de acibenzolar-S-metilo respecto al Componente (a) en peso). Así, por ejemplo, la primera línea de la Tabla B1 describe específicamente la combinación de acibenzolar-S-metilo con Componente (a) se aplica típicamente en una relación en peso entre 2:1 a 1:180. Las restantes líneas de Tabla B1 se van a construir de forma similar. La Tabla B1 complementa así las relaciones específicas descritas en las Tablas A1 a A54 con intervalos de relaciones para estas combinaciones.

10

Tabla B1

Componente (b)	Relación de peso típico	Relación de peso más típico	Relación de peso lo más típico
Acibenzolar-S-metilo	2:1 a 1:180	1:1 a 1:60	1:1 a 1:18
Aldimorfo	30:1 a 1:3	10:1 a 1:1	7:1 a 1:1
Ametoctradina	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3
Amisulbrom	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Anilazina	90:1 a 2:1	30:1 a 4:1	22:1 a 4:1
Azaconazol	7:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Azoxistrobina	9:1 a 1:12	3:1 a 1:4	3:1 a 1:3
Benalaxilo	4:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Benalaxilo-M	4:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:8

ES 2 562 178 T3

Componente (b)	Relación de peso típico	Relación de peso más típico	Relación de peso lo más típico
Benodanilo	18:1 a 1:6	6:1 a 1:2	4:1 a 1:2
Benomilo	45:1 a 1:4	15:1 a 1:1	11:1 a 1:1
Bentiavalicarb o bentiavalicarb-isopropilo	2:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:12
Betoxazina	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Binapacril	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Bifenilo	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Bitertanol	15:1 a 1:5	5:1 a 1:2	3:1 a 1:2
Bixafeno	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Blasticidina-S	3:1 a 1:90	1:1 a 1:30	1:4 a 1:30
Boscalid	18:1 a 1:6	6:1 a 1:2	4:1 a 1:2
Bromuconazol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Bupirinato	3:1 a 1:90	1:1 a 1:30	1:3 a 1:30
Captafol	90:1 a 1:4	30:1 a 1:2	15:1 a 2:1
Captano	90:1 a 1:4	30:1 a 1:2	15:1 a 2:1
Carbendazina	45:1 a 1:4	15:1 a 1:2	11:1 a 2:1
Carboxina	18:1 a 1:6	6:1 a 1:2	4:1 a 1:2
Carpropamid	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Cloroneb	300:1 a 2:1	100:1 a 4:1	100:1 a 14:1
Clorotalonilo	90:1 a 1:4	30:1 a 1:2	15:1 a 2:1
Clozolinato	45:1 a 1:2	15:1 a 2:1	11:1 a 2:1
Clotrimazol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Sales de cobre tal como mezcla de Bordeaux (sulfato de cobre tribásico), oxiclورو de cobre, sulfato de cobre e hidróxido de cobre	450:1 a 1:1	150:1 a 4:1	45:1 a 5:1
Ciazofamid	4:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Ciflufenamid	1:1 a 1:90	1:2 a 1:30	1:2 a 1:24
Cimoxanilo	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	1:1 a 1:5
Ciproconazol	4:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Ciprodinilo	22:1 a 1:9	7:1 a 1:3	4:1 a 1:2
Diclofluanid	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Diclocimet	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Diclomezina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Diclorano	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Dietofencarb	22:1 a 1:9	7:1 a 1:3	7:1 a 1:2
Difenoconazol	4:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:12
Diflumetorim	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Dimetirimol	3:1 a 1:90	1:1 a 1:30	1:3 a 1:30
Dimetomorfo	9:1 a 1:6	3:1 a 1:2	3:1 a 1:2
Dimoxistrobina	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	2:1 a 1:4

ES 2 562 178 T3

Componente (b)	Relación de peso típico	Relación de peso más típico	Relación de peso lo más típico
Diniconazol	3:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:8
Diniconazol M	3:1 a 1:90	1:1 a 1:30	1:1 a 1:12
Dinocap	7:1 a 1:9	2:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Ditianona	15:1 a 1:4	5:1 a 1:2	5:1 a 1:2
Dodemorfo	30:1 a 1:3	10:1 a 1:1	7:1 a 1:1
Dodina	30:1 a 1:2	10:1 a 2:1	10:1 a 2:1
Edifenfos	30:1 a 1:9	10:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Enestroburina	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Epoxiconazol	3:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:7
Etaboxam	7:1 a 1:9	2:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Etirimol	30:1 a 1:3	10:1 a 1:1	7:1 a 1:1
Etridiazol	30:1 a 1:9	10:1 a 1:3	7:1 a 1:2
Famoxadona	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Fenamidona	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Fenarimol	3:1 a 1:90	1:1 a 1:30	1:2 a 1:24
Fenbuconazol	3:1 a 1:30	1:1 a 1:10	1:1 a 1:10
Fenfuram	18:1 a 1:6	6:1 a 1:2	4:1 a 1:2
Fenhexamid	30:1 a 1:2	10:1 a 2:1	10:1 a 2:1
Fenoxanilo	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 1:1
Fenpiclonilo	75:1 a 1:9	25:1 a 1:3	15:1 a 2:1
Fenpropidina	30:1 a 1:3	10:1 a 1:1	7:1 a 1:1
Fenpropimorfo	30:1 a 1:3	10:1 a 1:1	7:1 a 1:1
Fenpirazamina	100:1 a 1:100	10:1 a 1:10	3:1 a 1:3
Sal de fentina tal como el acetato, cloruro o hidróxido	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Ferbam	300:1 a 1:2	100:1 a 2:1	30:1 a 4:1
Ferimzona	30:1 a 1:5	10:1 a 1:2	7:1 a 1:2
Fluazinam	22:1 a 1:5	7:1 a 1:2	3:1 a 1:2
Fludioxonilo	7:1 a 1:12	2:1 a 1:4	2:1 a 1:4
Flumetover	9:1 a 1:6	3:1 a 1:2	3:1 a 1:2
Flumorfo	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3
Fluopicolida	3:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Fluopiram	15:1 a 1:90	5:1 a 1:30	3:1 a 1:3
Fluoromida	150:1 a 2:1	50:1 a 4:1	37:1 a 5:1
Fluoxastrobina	4:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Fluquinconazol	4:1 a 1:12	1:1 a 1:4	1:1 a 1:4
Flusilazol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Flusulfamida	90:1 a 1:2	30:1 a 2:1	15:1 a 2:1
Flutianilo	7:1 a 1:36	2:1 a 1:12	1:1 a 1:6
Flutolanilo	18:1 a 1:6	6:1 a 1:2	4:1 a 1:2

ES 2 562 178 T3

Componente (b)	Relación de peso típico	Relación de peso más típico	Relación de peso lo más típico
Flutriafol	4:1 a 1:12	1:1 a 1:4	1:1 a 1:4
Fluxapiroxad	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Folpet	90:1 a 1:4	30:1 a 1:2	15:1 a 2:1
Fosetil-aluminio	225:1 a 2:1	75:1 a 5:1	30:1 a 5:1
Fuberidazol	45:1 a 1:4	15:1 a 1:2	11:1 a 2:1
Furalaxilo	15:1 a 1:45	5:1 a 1:15	1:1 a 1:6
Furametpir	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Guazatina o iminoctadina	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Hexaconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Himexazol	225:1 a 2:1	75:1 a 4:1	75:1 a 9:1
Imazalilo	7:1 a 1:18	2:1 a 1:6	1:1 a 1:5
Imibenconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Yodocarb	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Ipconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Iprobenfos	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Iprodiona	120:1 a 1:2	40:1 a 2:1	15:1 a 2:1
Iprovalicarb	9:1 a 1:9	3:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Isoprotiolano	150:1 a 2:1	50:1 a 4:1	45:1 a 5:1
Isopirazam	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Isotianilo	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Casugamicina	7:1 a 1:90	2:1 a 1:30	1:2 a 1:24
Cresoxim-metilo	7:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Mancozeb	180:1 a 1:3	60:1 a 2:1	22:1 a 3:1
Mandipropamid	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Maneb	180:1 a 1:3	60:1 a 2:1	22:1 a 3:1
Mepanipirim	18:1 a 1:3	6:1 a 1:1	6:1 a 1:1
Mepronilo	7:1 a 1:36	2:1 a 1:12	1:1 a 1:6
Meptildinocap	7:1 a 1:9	2:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Metalaxilo	15:1 a 1:45	5:1 a 1:15	1:1 a 1:6
Metalaxilo-M	7:1 a 1:90	2:1 a 1:30	1:1 a 1:12
Metconazol	3:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Metasulfocarb	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 1:1
Metiram	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 1:1
Metominostrobina	9:1 a 1:12	3:1 a 1:4	3:1 a 1:3
Metrafenona	6:1 a 1:12	2:1 a 1:4	2:1 a 1:4
Miclobutanilo	5:1 a 1:26	1:1 a 1:9	1:1 a 1:8
Naftifina	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Neo-asozina (metanoarsonato férrico)	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Nuarimol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3

ES 2 562 178 T3

Componente (b)	Relación de peso típico	Relación de peso más típico	Relación de peso lo más típico
Octilina	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 1:1
Ofurace	15:1 a 1:45	5:1 a 1:15	1:1 a 1:6
Orisastrobina	9:1 a 1:12	3:1 a 1:4	3:1 a 1:3
Oxadixilo	15:1 a 1:45	5:1 a 1:15	1:1 a 1:6
Ácido oxolínico	30:1 a 1:9	10:1 a 1:3	7:1 a 1:2
Oxpoconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Oxicarboxina	18:1 a 1:6	6:1 a 1:2	4:1 a 1:2
Oxitetraciclina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Pefurazoato	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Penconazol	1:1 a 1:45	1:2 a 1:15	1:2 a 1:15
Pencicurona	150:1 a 1:2	50:1 a 2:1	11:1 a 2:1
Penthiopirad	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Ácido fosforoso y sales del mismo	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Ftalida	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Picoxistrobina	7:1 a 1:18	2:1 a 1:6	1:1 a 1:5
Piperalina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Polioxina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Probenazol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Procloraz	22:1 a 1:4	7:1 a 1:1	7:1 a 1:2
Procimidona	45:1 a 1:3	15:1 a 1:1	11:1 a 2:1
Propamocarb o propamocarb-hidrocloruro	30:1 a 1:2	10:1 a 2:1	10:1 a 2:1
Propiconazol	4:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:5
Propineb	45:1 a 1:2	15:1 a 2:1	11:1 a 2:1
Proquinazid	3:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:12
Protiocarb	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3
Protioconazol	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	1:1 a 1:5
Piraclostrobina	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Pirametostrobina	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Piraoxistrobina	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Pirazofos	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 1:1
Piribencarb	15:1 a 1:6	5:1 a 1:2	4:1 a 1:2
Pirifenox	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Pirimetanilo	30:1 a 1:6	10:1 a 1:2	3:1 a 1:2
Piriofenona	6:1 a 1:12	2:1 a 1:4	2:1 a 1:4
Piroquilona	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Pirrolnitrino	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Quinmetionato	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Quinoxifeno	4:1 a 1:18	1:1 a 1:6	1:1 a 1:6
Quintozeno	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1

ES 2 562 178 T3

Componente (b)	Relación de peso típico	Relación de peso más típico	Relación de peso lo más típico
Siltiofam	7:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Simeconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Espiroxamina	22:1 a 1:4	7:1 a 1:2	5:1 a 1:2
Estreptomicina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Azufre	300:1 a 3:1	100:1 a 9:1	75:1 a 9:1
Tebuconazol	7:1 a 1:18	2:1 a 1:6	1:1 a 1:5
Tebufloquina	100:1 a 1:100	10:1 a 1:10	3:1 a 1:3
Tecloftalam	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Tecnazeno	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Terbinafina	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Tetraconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Tiabendazol	45:1 a 1:4	15:1 a 1:2	11:1 a 2:1
Tifluzamida	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Tiofanato	45:1 a 1:3	15:1 a 2:1	11:1 a 2:1
Tiofanato-metilo	45:1 a 1:3	15:1 a 2:1	11:1 a 2:1
Tiram	150:1 a 1:2	50:1 a 2:1	37:1 a 5:1
Tiadinilo	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3
Tolclofos-metilo	150:1 a 1:2	50:1 a 2:1	37:1 a 5:1
toliifluanid	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Triadimefona	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Triadimenol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Triazóxido	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	15:1 a 2:1
Triciclazol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Tridemorfo	30:1 a 1:3	10:1 a 1:1	7:1 a 1:1
Trifloxistrobina	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Triflumizol	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Triforina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
Trimorfamida	45:1 a 1:9	15:1 a 1:3	7:1 a 1:2
Triticonazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Uniconazol	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:5
Validamicina	150:1 a 1:36	50:1 a 1:12	3:1 a 1:3
Valifenalato (valifenal)	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
Vinclozolino	120:1 a 1:2	40:1 a 2:1	15:1 a 2:1
Zineb	150:1 a 1:2	50:1 a 2:1	37:1 a 5:1
Ziram	150:1 a 1:2	50:1 a 2:1	37:1 a 5:1
Zoxamida	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-7-(4-metilpiperidin-1-il)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina	15:1 a 1:36	5:1 a 1:12	1:1 a 1:6

Componente (b)	Relación de peso típico	Relación de peso más típico	Relación de peso lo más típico
Penflufeno (<i>N</i> -[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1 <i>H</i> -pirazol-4-carboxamida)	12:1 a 1:9	4:1 a 1:3	2:1 a 1:3
<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonyl)amino]butanamida	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propin-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(etilsulfonyl)amino]butanamida	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
2-butoxi-6-yodo-3-propil-4 <i>H</i> -1-benzopiran-4-ona	3:1 a 1:36	1:1 a 1:12	1:1 a 1:12
3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-3-isoxazolidinil]piridina	15:1 a 1:9	5:1 a 1:3	3:1 a 1:3
<i>N</i> -1-[[[1-(4-cianofenil)etil]sulfonyl]metil]propil]carbamato de 4-fluorofenilo	6:1 a 1:18	2:1 a 1:6	2:1 a 1:4
<i>N</i> -[[[ciclopropilmetoxi]amino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metileno]benceno-acetamida	1:1 a 1:90	1:2 a 1:30	1:2 a 1:24
α -[metoxiimino]- <i>N</i> -metil-2-[[[1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]-metil]bencenoacetamida	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3
<i>N</i> '-[4-[4-cloro-3-(trifluorometil)fenoxi]-2,5-dimetilfenil]- <i>N</i> -etil- <i>N</i> -metilmetanimidamida	15:1 a 1:18	5:1 a 1:6	3:1 a 1:3
<i>N</i> -(4-cloro-2-nitrofenil)- <i>N</i> -etil-4-metilbencenosulfonamida	15:1 a 1:18	5:1 a 1:6	3:1 a 1:3
2-[[[3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-2-propen-1-ilideno]amino]oxi]metil]- α -(metoxiimino)- <i>N</i> -metilbencenoacetamida	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3
<i>N</i> -[4-[[[[1-(1-metil-1 <i>H</i> -tetrazol-5-il)fenilmetileno]amino]oxi]metil]-2-tiazolil]carbamato de pentilo	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3
<i>N</i> -[6-[[[[1-(1-metil-1 <i>H</i> -tetrazol-5-il)fenilmetileno]amino]oxi]metil]-2-piridinil]carbamato de pentilo	9:1 a 1:18	3:1 a 1:6	3:1 a 1:3

Como se nota ya, la presente invención incluye realizaciones en donde en la composición que comprende componentes (a) y (b), el componente (b) comprende al menos un fungicida de cada uno de los dos grupos seleccionados de (b1) a (b46). Las Tablas C1 a C54 enumeran mezclas específicas (números de compuestos se refieren a compuestos en la Tabla de Índice A) para ilustrar realizaciones en donde el componente (b) incluye al menos un fungicida de cada uno de los dos grupos seleccionados de (b1) a (b46). En la Tabla C1, cada línea posterior a los encabezados de columna "Componente (a)" y "Componente (b)" describe específicamente una mezcla de Componente (a), que es Compuesto 22, con al menos dos fungicidas Componente (b). Las entradas bajo el encabezado "Relaciones ilustrativas" describen tres relaciones en peso específicas de Componente (a) a cada fungicida Componente (b) en secuencia para la mezcla descrita. Por ejemplo, la primera línea describe una mezcla de Compuesto 22 con ciproconazol y azoxistrobina y enumera relaciones en peso de Compuesto 22 a ciproconazol a azoxistrobina de 1:1:1, 2:1:1 o 3:1:1.

Tabla C1

Componente (a)	Componente (b)	Relaciones ilustrativas (*)
Compuesto 22	Ciproconazol Azoxistrobina	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Compuesto 22	Ciproconazol Quiresoxim-metilo	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Compuesto 22	Ciproconazol Picoxistrobina	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Compuesto 22	Ciproconazol Piraclostrobina	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Compuesto 22	Ciproconazol Trifloxistrobina	1:1:1 2:1:1 3:1:1
Compuesto 22	Ciproconazol Bixafeno	1:1:2 2:1:2 3:1:2

ES 2 562 178 T3

Componente (a)	Componente (b)		Relaciones ilustrativas (*)			
Compuesto 22	Ciproconazol	Boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	Ciproconazol	Ciflufenamid	1:2:1	2:2:1	3:2:1	
Compuesto 22	Ciproconazol	Fluopiram	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	Ciproconazol	Isopirazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	Ciproconazol	Metrafenona	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	Ciproconazol	Pentipirad	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	Ciproconazol	Proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	Ciproconazol	Quinoxifeno	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	Ciproconazol	Sedaxano	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	Ciproconazol	Picoxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	Ciproconazol	Trifloxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	difenconazol	Azoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	difenconazol	Quiresoxim-metilo	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	difenconazol	Picoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	difenconazol	Piraclostrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	difenconazol	Trifloxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	difenconazol	Bixafeno	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	difenconazol	Boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	difenconazol	Ciflufenamid	1:2:1	2:2:1	3:2:1	
Compuesto 22	difenconazol	Fluopiram	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	difenconazol	Isopirazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	difenconazol	Metrafenona	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	difenconazol	Pentipirad	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	difenconazol	Proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	difenconazol	Quinoxifeno	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	difenconazol	Sedaxano	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	difenconazol	Picoxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	difenconazol	Trifloxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	epoxiconazol	Azoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	epoxiconazol	Quiresoxim-metilo	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	epoxiconazol	Picoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	epoxiconazol	Piraclostrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	epoxiconazol	Trifloxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	epoxiconazol	Bixafeno	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	epoxiconazol	Boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	epoxiconazol	Ciflufenamid	1:2:1	2:2:1	3:2:1	
Compuesto 22	epoxiconazol	Fluopiram	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	epoxiconazol	Isopirazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2	

ES 2 562 178 T3

Componente (a)	Componente (b)		Relaciones ilustrativas (*)			
Compuesto 22	epoxiconazol	Metrafenona	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	epoxiconazol	Pentiopirad	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	epoxiconazol	Proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	epoxiconazol	Quinoxifeno	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	epoxiconazol	Sedaxano	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	epoxiconazol	Picoxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	epoxiconazol	Trifloxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	metconazol	Azoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	metconazol	Quiresoxim-metilo	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	metconazol	Picoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	metconazol	Piraclostrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	metconazol	Trifloxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	metconazol	Bixafeno	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	metconazol	Boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	metconazol	Ciflufenamid	1:2:1	2:2:1	3:2:1	
Compuesto 22	metconazol	Fluopiram	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	metconazol	Isopirazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	metconazol	Metrafenona	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	metconazol	Pentiopirad	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	metconazol	Proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	metconazol	Quinoxifeno	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	metconazol	Sedaxano	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	metconazol	Picoxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	metconazol	Trifloxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	miclobutanilo	Azoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	miclobutanilo	Quiresoxim-metilo	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	miclobutanilo	Picoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	miclobutanilo	Piraclostrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	miclobutanilo	Trifloxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	miclobutanilo	Bixafeno	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	miclobutanilo	Boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	miclobutanilo	Ciflufenamid	1:2:1	2:2:1	3:2:1	
Compuesto 22	miclobutanilo	Fluopiram	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	miclobutanilo	Isopirazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	miclobutanilo	Metrafenona	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	miclobutanilo	Pentiopirad	1:1:2	2:1:2	3:1:2	

ES 2 562 178 T3

Componente (a)	Componente (b)		Relaciones ilustrativas (*)			
Compuesto 22	miclobutanilo	Proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	miclobutanilo	Quinoxifeno	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	miclobutanilo	Sedaxano	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	miclobutanilo	Picoxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	miclobutanilo	Trifloxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	protioconazol	Azoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	protioconazol	Quiresoxim-metilo	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	protioconazol	Picoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	protioconazol	Piraclostrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	protioconazol	Trifloxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	protioconazol	Bixafeno	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	protioconazol	Boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	protioconazol	Ciflufenamid	1:2:1	2:2:1	3:2:1	
Compuesto 22	protioconazol	Fluopiram	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	protioconazol	Isopirazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	protioconazol	Metrafenona	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	protioconazol	Pentiopirad	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	protioconazol	Proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	protioconazol	Quinoxifeno	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	protioconazol	Sedaxano	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	protioconazol	Picoxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	protioconazol	Trifloxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	tebuconazol	Azoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	tebuconazol	Cresoxim-metilo	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	tebuconazol	Picoxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	tebuconazol	Piraclostrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	tebuconazol	Trifloxistrobina	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	tebuconazol	Bixafeno	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	tebuconazol	Boscalid	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	tebuconazol	Ciflufenamid	1:2:1	2:2:1	3:2:1	
Compuesto 22	tebuconazol	Fluopiram	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	tebuconazol	Isopirazam	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	tebuconazol	Metrafenona	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	tebuconazol	Pentiopirad	1:1:2	2:1:2	3:1:2	
Compuesto 22	tebuconazol	Proquinazid	1:1:1	2:1:1	3:1:1	
Compuesto 22	tebuconazol	Quinoxifeno	1:1:1	2:1:1	3:1:1	

Componente (a)	Componente (b)			Relaciones ilustrativas (*)		
Compuesto 22	tebuconazol	Sedaxano		1:1:2	2:1:2	3:1:2
Compuesto 22	tebuconazol	Picoxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1
Compuesto 22	tebuconazol	Trifloxistrobina	Proquinazid	1:1:1:1	2:1:1:1	3:1:1:1

(*) Relaciones de Componente (a) respecto a Componente (b) en secuencia, en peso.

5 Las Tablas C2 a C54 se construyen cada una igual que la Tabla C1 anterior excepto que las entradas debajo del encabezado de columna "Componente (a)" se sustituyen con la Entrada de Columna de Componente (a) respectivo mostrado a continuación. Así, por ejemplo, en la Tabla C2 las entradas debajo del encabezado de columna "Componente (a)" todas enumeran "Compuesto 18", y la primera línea debajo de los encabezados de columna en la Tabla C2 describe específicamente una mezcla de Compuesto 18 con ciproconazol y azoxistrobina, y las relaciones en peso ilustrativas de 1:1:1, 2:1:1 y 3:1:1 de Compuesto 18:ciproconazol:azoxistrobina. Las Tablas C3 a C54 se construyen de forma similar.

Número de tabla	Entradas de columna Componente (a)	Número de tabla	Entradas de columna componente (a)
C2	Compuesto 18	C31	Compuesto 357
C3	Compuesto 23	C32	Compuesto 358
C4	Compuesto 24	C33	Compuesto 360
C5	Compuesto 36	C34	Compuesto 361
C6	Compuesto 41	C35	Compuesto 364
C7	Compuesto 45	C36	Compuesto 365
C8	Compuesto 87	C37	Compuesto 367
C9	Compuesto 91	C38	Compuesto 368
C10	Compuesto 118	C39	Compuesto 369
C11	Compuesto 139	C40	Compuesto 372
C12	Compuesto 148	C41	Compuesto 373
C13	Compuesto 172	C42	Compuesto 374
C14	Compuesto 175	C43	Compuesto 375
C15	Compuesto 193	C44	Compuesto 376
C16	Compuesto 232	C45	Compuesto 377
C17	Compuesto 265	C46	Compuesto 378
C18	Compuesto 266	C47	Compuesto 379
C19	Compuesto 284	C48	Compuesto 380
C20	Compuesto 286	C50	Compuesto 382
C21	Compuesto 287	C51	Compuesto 383
C22	Compuesto 292		
C23	Compuesto 297		
C24	Compuesto 332		
C25	Compuesto 336		
C26	Compuesto 343		
C27	Compuesto 346		
C28	Compuesto 349		

10 Como se menciona en el Compendio de la invención, un aspecto de la presente invención es una composición que comprende (es decir, una mezcla o combinación de) un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido, o una sal del mismo, y al menos un compuesto o agente de control de plagas de invertebrados (por ejemplo, insecticida, acaricida). Digna

de mención es una composición que comprende componente (a) y al menos un (es decir, uno o más) compuesto o agente de control de plagas de invertebrados, que puede entonces combinarse posteriormente con componente (b) para proporcionar una composición que comprende componentes (a) y (b) y el uno o más compuestos o agentes de control de plagas de invertebrados. De forma alternativa sin mezclar primero con el componente (b), una cantidad biológicamente efectiva de la composición que comprende componente (a) con al menos un agente de control de plagas de invertebrados puede aplicarse a una planta o semilla de planta (directamente o a través del medio de la planta o semilla de planta) para proteger a la planta o semilla de planta de enfermedades provocadas por patógenos fúngicos y lesión provocada por plagas de invertebrados.

Para realizaciones donde se usan uno o más compuestos de control de plagas de invertebrados, la relación en peso de estos compuestos (en total) a los compuestos de componente (a) está típicamente entre aproximadamente 1:3000 y aproximadamente 3000:1. Dignas de mención son las relaciones en peso entre aproximadamente 1:300 y aproximadamente 300:1 (por ejemplo, relaciones entre aproximadamente 1:30 y aproximadamente 30:1). Un experto en la técnica puede determinar fácilmente a través de experimentación sencilla las cantidades biológicamente efectivas de ingredientes activos necesarios para el espectro deseado de actividad biológica.

Digna de mención es una composición de la presente invención que comprende además un compuesto componente (a), solo o en combinación con componente (b) fungicida, al menos un compuesto o agente de control de plagas de invertebrados seleccionado del grupo que consiste en abamectina, acetamiprid, acetoprol, aldicarb, amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, bifenazato, bistriflurona, buprofezina, carbofurano, cartap, quinometionat, clorfenapir, clorfluazurona, clorantraniliprol, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorobenzilato, cromafenozida, clotianidina, ciantraniliprol, ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cihexatina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuirona, diazinona, dicofol, dieldrina, dienocloro, diflubenzurona, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etoxazol, fenamifos, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenpiroximato, fenvalerato, fipronilo, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim, flufenoxurona, fonofos, halofenozida, hexaflumurona, hexitiazox, hidrametilnona, imicafos, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, lufenurona, malatión, meperflutrina, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidationa, metomilo, metopreno, metoxicloro, metoxifenozida, metoflutrina, monocrotofos, nitenpiram, nitiazina, novalurona, noviflumurona, oxamilo, paratión, paratión-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargita, protriefenbute, pimetozina, pirafluprol, piretrina, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazona, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espiridiclofeno, espiromesifeno, espirotetramat, sulfoxaflor, sulprofos, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurona, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tetrametilflutina, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenirad, tralometrina, triazamato, triclofona, triflumurona, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopoliedrovirus, delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis*, baculovirus, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos.

En ciertos ejemplos, las combinaciones de un compuesto de Fórmula 1 o un *N*-óxido o sal del mismo (es decir, componente (a)), solo o en mezcla con componente (b) fungicida, con otros compuestos o agentes biológicamente activos (particularmente control de plagas de invertebrados) (es decir, ingredientes activos) pueden dar por resultado un efecto más que aditivo (es decir, sinérgico). Reducir la cantidad de ingredientes activos liberados en el medioambiente mientras se asegura el control de plagas efectivo siempre es deseable. Cuando el sinergismo de ingredientes activos para el control de plagas de invertebrados se da a tasas de aplicación que dan niveles agrónomicamente satisfactorios de control de plaga de invertebrados, dichas combinaciones pueden ser ventajosas para reducir el coste de producción del cultivo y disminuir la carga medioambiental.

La Tabla D1 enumera combinaciones específicas de agentes de control de plagas de invertebrados con Compuesto 22 (identificado en la Tabla de índice A) como un compuesto componente (a) ilustrativo de mezclas y composiciones que comprenden estos ingredientes activos y métodos que los usan según la presente invención. La segunda columna de la Tabla D1 enumera los agentes de control de plagas de invertebrados específicos (por ejemplo, "abamectina" en la primera línea). La tercera columna de la Tabla D1 enumera el modo de acción (si se conoce) o clase química de los agentes de control de plagas de invertebrados. La cuarta columna de la Tabla D1 enumera realización(ones) de intervalos de relaciones de peso para tasas a las que el agente de control de plagas de invertebrados se aplica típicamente respecto al Compuesto 22 solo o en combinación con componente (b) fungicida (por ejemplo, "50:1 a 1:50" de abamectina respecto al Componente 22 en peso). Así, por ejemplo, la primera línea de la Tabla D1 describe específicamente la combinación de Compuesto 22 con abamectina se aplica típicamente en una relación en peso entre 50:1 a 1:50. Las líneas restantes de la Tabla D1 se van a construir de forma similar.

Tabla D1

Componente (a)	Agente de control de plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso típica
Compuesto 22	Abamectina	Lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:50
Compuesto 22	Acetamiprid	Neonicotinoides	150:1 a 1:200

ES 2 562 178 T3

Componente (a)	Agente de control de plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso típica
Compuesto 22	Amitraz	Ligandos de receptor de octapamina	200:1 a 1:100
Compuesto 22	Avermectina	Lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:50
Compuesto 22	Azadiractina	Agonistas de ecdisona	100:1 a 1:120
Compuesto 22	Beta-ciflutrina	Moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Bifentrina	Moduladores del canal de sodio	100:1 a 1:10
Compuesto 22	Buprofezina	Inhibidores de síntesis de quitina	500:1 a 1:50
Compuesto 22	Cartap	Análogos de nereistoxina	100:1 a 1:200
Compuesto 22	Clorantraniliprol	Ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Compuesto 22	Clorfenapir	Inhibidores del transporte electrónico mitocondrial	300:1 a 1:200
Compuesto 22	Clorpirifos	Inhibidores de colinesterasa	500:1 a 1:200
Compuesto 22	Clotianidina	Neonicotinoides	100:1 a 1:400
Compuesto 22	Ciantraniliprol	Ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Compuesto 22	Ciflutrina	Moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Cihalotrina	Moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Cipermetrina	Moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Ciromazina	Inhibidores de la síntesis de quitina	400:1 a 1:50
Compuesto 22	Deltametrina	Moduladores del canal de sodio	50:1 a 1:400
Compuesto 22	Dieldrina	Insecticidas de ciclodieno	200:1 a 1:100
Compuesto 22	Dinotefurano	Neonicotinoides	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Diofenolano	Inhibidor de moho	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Emamectina	Lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:10
Compuesto 22	Endosulfano	Insecticidas de ciclodieno	200:1 a 1:100
Compuesto 22	Esfenvalerato	Moduladores de canal de sodio	100:1 a 1:400
Compuesto 22	Etiprol	Bloqueantes del canal de cloruro regulado por GABA	200:1 a 1:100
Compuesto 22	Fenotiocarb		150:1 a 1:200
Compuesto 22	Fenoxicarb	miméticos de la hormona juvenil	500:1 a 1:100
Compuesto 22	Fenvalerato	Moduladores del canal de sodio	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Fipronilo	Bloqueantes del canal de cloruro regulado por GABA	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Flonicamid		200:1 a 1:100
Compuesto 22	Flubendiamida	Ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Compuesto 22	Flufenoxurona	Inhibidores de síntesis de quitina	200:1 a 1:100
Compuesto 22	Hexaflumurona	Inhibidores de síntesis de quitina	300:1 a 1:50
Compuesto 22	Hidrametilnona	Inhibidores de transporte electrónico mitocondrial	150:1 a 1:250
Compuesto 22	Imidacloprid	Neonicotinoides	1000:1 a 1:1000
Compuesto 22	Indoxacarb	Moduladores del canal de sodio	200:1 a 1:50
Compuesto 22	Lambda-cihalotrina	Moduladores del canal de sodio	50:1 a 1:250

ES 2 562 178 T3

Componente (a)	Agente de control de plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso típica
Compuesto 22	Lufenurona	Inhibidores de síntesis de quitina	500:1 a 1:250
Compuesto 22	Meperflutrina	Moduladores de canal de sodio	100:1 a 1:400
Compuesto 22	Metaflumizona		200:1 a 1:200
Compuesto 22	Metomilo	Inhibidores de colinesterasa	500:1 a 1:100
Compuesto 22	Metopreno	Miméticos de hormona juvenil	500:1 a 1:100
Compuesto 22	Metoxifenozida	Agonistas de ecdisona	50:1 a 1:50
Compuesto 22	Nitenpiram	Neonicotinoides	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Nitiazina	Neonicotinoides	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Novalurona	Inhibidores de síntesis de quitina	500:1 a 1:150

Componente (a)	Agente de control de plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso típica
Compuesto 22	Oxamilo	Inhibidores de colinesterasa	200:1 a 1:200
Compuesto 22	Pimetrozina		200:1 a 1:100
Compuesto 22	Piretrina	Moduladores del canal de sodio	100:1 a 1:10
Compuesto 22	Piridabeno	Inhibidores del transporte electrónico mitocondrial	200:1 a 1:100
Compuesto 22	Piridalilo		200:1 a 1:100
Compuesto 22	Piriproxifeno	Miméticos de hormona juvenil	500:1 a 1:100
Compuesto 22	Rianodina	Ligandos del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Compuesto 22	Espinetoram	Lactonas macrocíclicas	150:1 a 1:100
Compuesto 22	Espinosad	Lactonas macrocíclicas	500:1 a 1:10
Compuesto 22	Espirodiclofeno	Inhibidores de biosíntesis de lípidos	200:1 a 1:200
Compuesto 22	Espiromesifeno	Inhibidores de biosíntesis de lípidos	200:1 a 1:200
Compuesto 22	Sulfoxaflor		200:1 a 1:200
Compuesto 22	Tebufenozida	Agonistas de ecdisona	500:1 a 1:250
Compuesto 22	Tetrametilflutrina	Moduladores del canal de sodio	100:1 a 1:400
Compuesto 22	Tiaclopid	Neonicotinoides	100:1 a 1:200
Compuesto 22	Tiametoxam	Neonicotinoides	1250:1 a 1:1000
Compuesto 22	Tiodicarb	Inhibidores de colinesterasa	500:1 a 1:400
Compuesto 22	Tiosultap-sodio		150:1 a 1:100
Compuesto 22	Tralometrina	Moduladores de canal sodio	150:1 a 1:200
Compuesto 22	Triazamato	Inhibidores de colinesterasa	250:1 a 1:100
Compuesto 22	Triflumurona	Inhibidores de síntesis de quitina	200:1 a 1:100
Compuesto 22	<i>Bacillus thuringiensis</i>	Agentes biológicos	50:1 a 1:10
Compuesto 22	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>	Agentes biológicos	50:1 a 1:10
Compuesto 22	NPV (por ejemplo, Gemstar)	Agentes biológicos	50:1 a 1:10

Las Tablas D2 a D54 se construyen cada una igual que la Tabla D1 anterior excepto que las entradas debajo del encabezado de columna "Componente (a)" se sustituyen con la respectiva Entrada de Columna Componente (a) mostrada a continuación. Así, por ejemplo, en la Tabla D2 las entradas debajo del encabezado de columna "Componente (a)" enumeran todas "Compuesto 18", y la primera línea debajo de los encabezados de la columna en la Tabla D2 describe específicamente una mezcla de Compuesto 18 con abamectina. Las Tablas D3 a D54 se construyen de forma similar.

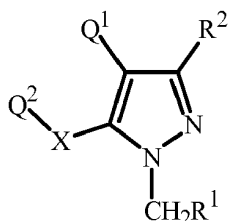
Número de tabla	Entradas de columna componente (a)	Número de tabla	Entradas de columna componente (a)
D2	Compuesto 18	D31	Compuesto 357
D3	Compuesto 23	D32	Compuesto 358
D4	Compuesto 24	D33	Compuesto 360
D5	Compuesto 36	D34	Compuesto 361
D6	Compuesto 41	D35	Compuesto 364
D7	Compuesto 45	D36	Compuesto 365
D8	Compuesto 87	D37	Compuesto 367
D9	Compuesto 91	D38	Compuesto 368
D10	Compuesto 118	D39	Compuesto 369
D11	Compuesto 139	D40	Compuesto 372
D12	Compuesto 148	D41	Compuesto 373
D13	Compuesto 172	D42	Compuesto 374
D14	Compuesto 175	D43	Compuesto 375
D15	Compuesto 193	D44	Compuesto 376
D16	Compuesto 232	D45	Compuesto 377
D17	Compuesto 265	D46	Compuesto 378
D18	Compuesto 266	D47	Compuesto 379
D19	Compuesto 284	D48	Compuesto 380
D20	Compuesto 286	D50	Compuesto 382
D21	Compuesto 287	D51	Compuesto 383
D22	Compuesto 292		
D23	Compuesto 297		
D24	Compuesto 332		
D25	Compuesto 336		
D26	Compuesto 343		
D27	Compuesto 346		
D28	Compuesto 349		

Una realización de agentes de control de plagas de invertebrados (por ejemplo, insecticidas y acaricidas) para mezclar con compuestos de Fórmula 1 (y *N*-óxidos y sales de los mismos) incluyen moduladores del canal de sodio tales como bifentrina, cipermetrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, deltametrina, dimeflutrina, esfenvalerato, fenvalerato, indoxacarb, metoflutrina, proflutrina, piretrina y tralometrina; inhibidores de colinesterasa tales como clorpirifos, metomilo, oxamilo, tiodicarb y triazamato; neonicotinoides tales como acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, nitiazina, tiacloprid y tiametoxam, lactonas macrocíclicas insecticidas tales como espinetoram, espinosad, abamectina, avermectina y emamectina; bloqueantes del canal cloruro regulados por GABA (ácido γ -aminobutírico) tales como endosulfano, etiprol y fipronilo; inhibidores de síntesis de quitina tales como buprofezina, ciromazina, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona y triflumurona; miméticos de la hormona juvenil tales como diofenolano, fenoxicarb, metopreno y piriproxifeno; ligandos de receptor de octapamina tales como amitraz; agonistas de ecdisona tales como azadiractina, metoxifenozida y tebufenozida; ligandos del receptor de rianodina tales como rianodina, diamidas antranílicas tal como clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida; análogos de nereistoxina tal como cartap; inhibidores del transporte electrónico mitocondrial tal como clorfenapir, hidrametilnona y piridabeno; inhibidores de la

- 5 biosíntesis de lípidos tal como espirodiclofeno y espiromesifeno; insecticidas de ciclodieno tal como dieldrina; ciflumetofeno; fenotiocarb; flonicamid; metaflumizona; pirafuprol; piridalilo; piriprol; pimetozina; espirotetramat; y tiosultap-sodio. Una realización de agentes biológicos para mezclar con compuestos de componente (a) incluyen nucleopoliedrovirus tales como HzNPV y AfNPV; *Bacillus thuringiensis* y delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* tales como Cellcap, MPV y PMVII; además de insecticidas virales que se dan de forma natural y modificados genéticamente que incluyen miembros de la familia Baculoviridae además de hongos entomófagos. Es digno de mención una composición que comprende componente (a) y al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional seleccionado de los Agentes de control de plagas de invertebrados enumerado en la Tabla D1 anterior.
- 10 Los siguientes ENSAYOS demuestran la eficacia de control de los compuestos de esta invención en patógenos específicos. La protección de control de patógeno proporcionada por los compuestos no está limitada, sin embargo, a estas especies. Véase la Tabla de Índice A para descripciones de compuestos. Las siguientes abreviaturas se usan en las tablas de índice que siguen: Me es metilo, Ph es fenilo, OMe es metoxi, -CN es ciano, -NO₂ es nitro.
- 15 También, "piridin-2-ilo" es sinónimo con "2-piridinilo", "piridin-3-ilo" es sinónimo con "3-piridinilo", y "pirimidin-5-ilo" es sinónimo con "5-pirimidinilo". La abreviatura "Ej." representa "Ejemplo" y va seguida por un número que indica en qué ejemplo se prepara el compuesto. "Comp. Núm." significa número de compuesto. Los espectros de masas (MS) se presentan como el peso molecular del ión padre de mayor abundancia isotópica (M+1) formado por adición de H⁺ (peso molecular de 1) a la molécula, observado por espectrometría de masas usando ionización química a presión atmosférica (AP⁺).

20

Tabla de índice A



Comp. Núm.	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
1 (Ej. 1)	H	Me	2,4-di-F-Ph	3-Cl-Ph	NH	**
2	H	Me	2,4-di-F-Ph	3,5-di-OMe-Ph	NH	360
3	H	Me	2,4-di-F-Ph	3-Cl-Ph	NMe	*
4	H	Me	4-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	334
5	H	Me	4-Cl-Ph	3,5-di-F-Ph	NH	334
6	H	Me	4-Cl-Ph	3,5-di-F-Ph	NMe	348
7	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3-Cl-4-F-Ph	NH	369
8	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3-F-Ph	NH	334
9	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-di-F-Ph	NH	352
10	H	Me	4-Cl-Ph	2,3,5-tri-F-Ph	NH	352
11	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-Ph	NH	334
12	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-Ph	NH	334
13	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	352
14	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-F-4-Cl-Ph	NH	370
15	H	Me	2-F-4-OMe-Ph	4-Cl-Ph	O	347
16	H	Me	3,5-di-OMe-Ph	4-Cl-Ph	O	359
17 (Ej. 2)	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	**
18	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	370
19	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-Ph	NH	350

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
21	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-OMe-Ph	O	365
22	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-Ph	NH	364
23	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	366
24 (Ej. 3)	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	**
25	H	Me	3-Cl-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	364
26	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-NO ₂ -Ph	O	364
27	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-Ph	O	353
28	H	Me	4-Cl-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	352
29	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	364
30	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-Cl-4-CF ₃ -Ph	O	455
31	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	380
33	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	334
34	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	6-Cl-piridin-3-ilo	NH	365
35	H	Me	3,4-di-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	354
36	H	Me	3,4-di-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	366
37	H	Me	2,6-di-F-Ph	3,5-di-OMe-Ph	NH	360
38	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	O	387
39	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	5-Cl-piridin-2-ilo	O	354
40	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-Cl-Ph	O	399
41	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	354
42	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	366
43	H	Me	3-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	344
44	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	360
45 (Ej. 4)	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	**
46	H	Me	2-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	374
47	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	5-Cl-piridin-2-ilo	O	366
48	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3,4-di-F-Ph	NH	366
49	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-F-4-Cl-Ph	NH	382
50	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Me-Ph	NH	344
51	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-OMe-Ph	NH	390
55	H	Me	4-Me-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	O	343
56	H	Me	4-Cl-Ph	4-OMe-Ph	NH	328
57	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,4-di-OMe-Ph	NH	392
58 (Ej. 10)	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-Cl-Ph	O	**
59	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,4-di-OMe-6-Cl-Ph	NH	424
60	H	Me	4-Cl-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	362
61	Me	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	348

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
62	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	398
63	Me	Me	2,6-di-F-Ph	3,5-di-OMe-Ph	NH	374
64	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-ilo	O	388
66	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	5-Me-piridin-2-ilo	NH	345
67	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	5-CN-piridin-2-ilo	NH	342
69 (Ej. 5)	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	**
70	Me	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	382
71	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-(NHC(O)Me)-Ph	O	392
72	H	Me	2,4-di-F-Ph	3,4-di-OMe-Ph	NH	360
73	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-ilo	NH	387
74	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	3,4-di-OMe-Ph	NH	392
75	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	386
76	H	Me	2,4-di-F-Ph	6-Cl-piridin-3-ilo	NH	331
77	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-NH ₂ -Ph	O	382
78	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	384
79	H	Me	4-Me-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	332
80	H	Me	4-Me-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	344
81	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	5-Cl-2,4-di-OMe-Ph	NH	424
82	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	391
83	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	396
84	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-Ph	O	367
85	H	Me	3,5-di-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	386
86	H	Me	6-Cl-piridin-3-ilo	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	361
87	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	382
88	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-F-2-Me-Ph	NH	362
89	H	Me	4-F-2-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	374
90	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	O	447
91	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	377
92	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	379
93	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,4-di-OMe-Ph	NH	378
94	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	6-OMe-piridin-3-ilo	NH	349
95	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	6-OMe-piridin-3-ilo	NH	361
96	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	362
97	H	Me	4-F-2-Me-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	358
98	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	378
99	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,5-di-F-4-CN-Ph	O	380
100	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	5-Cl-2,4-di-OMe-Ph	NH	412

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
101	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-ilo	NH	386
102	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-ilo	NH	398
103	H	Me	2,6-di-F-4-OH-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	352
104	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	382
105	H	Me	2,6-di-F-4-OS(O) ₂ CF ₃	2,4-di-F-Ph	NH	484
106	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	361
107	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-Cl-piridin-3-ilo	NH	386
108	H	c-Pr	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	378
109	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,5-di-F-piridin-2-ilo	NH	355
110	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-Cl-Ph	NH	***
111	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-F-Ph	NH	***
112	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***
113	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3-F-4-OMe-Ph	NH	***
114	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3,4-di-F-Ph	NH	***
115	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3-Cl-Ph	NH	***
116	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3-F-5-CN-Ph	O	360
117	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	NH	389
118	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	360
120	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	NH	361
123	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3,4-di-Cl-Ph	NH	***
124	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-Me-Ph	NH	***
125	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-Cl-3-F-Ph	NH	***
126	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-OMe-Ph	NH	***
127	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-F-3-OMe-Ph	NH	373
128	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3,5-di-F-piridin-2-ilo	NH	367
129	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-3-F-Ph	O	***
130	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Br-3-F-Ph	O	***
132	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,4,5-tri-F-Ph	NH	370
133	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	***
134	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	***
136	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3-F-Ph	NH	***
137	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	***
138	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,4,5-tri-F-Ph	NH	***
139	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	376
140	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	392
141	H	Me	2,6-di-F-4-OEt-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	380
142	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	5-Cl-2-F-Ph	NH	***

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
143	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	4-Cl-2-F-Ph	NH	***
144	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	3-Cl-4-F-Ph	NH	***
145	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,3-di-F-Ph	NH	***
146	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,5-di-Cl-Ph	NH	***
147	H	Me	2,6-di-F-4-CN-Ph	2,3-di-Cl-Ph	NH	***
148	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,5-di-F-4-CN-Ph	O	378
149	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-2-CN-Ph	O	360
150	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,5-di-CN-Ph	O	401
152	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-F-Ph	O	383
153	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-F-Ph	O	429
154	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-di-F-piridin-2-ilo	NH	353
155	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	390
157	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-3-Me-Ph	O	***
158	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NEt	410
159	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NCH ₂ CH= CH ₂	422
160	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	364
161	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	364
162	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	NH	375
163	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2-Cl-4,5-di-CN-Ph	O	403
164	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-3-OMe-Ph	O	***
165	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Br-3-Me-Ph	O	***
166	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Br-3-OMe-Ph	O	429
167	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,3,5-tri-F-Ph	O	373
168	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,4-di-CN-Ph	O	367
169	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,4-di-CN-Ph	O	369
170	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	362
171	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,3,6-tri-F-Ph	NH	370
172	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	352
173	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	352
174	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,3,6-tri-F-Ph	NH	382
175	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	368
176	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	364
177	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	352
178	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	***
179	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	***
180	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-F-4-OMe-Ph	NH	***

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
181	H	Me	2-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	318
182	H	Me	2-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	336
183	H	Me	2-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	348
184	H	Me	2-F-Ph	4-F-Ph	NH	300
185	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-Me-Ph	O	379
186	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-Me-Ph	O	***
187	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-F-4-Me-Ph	O	***
188	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-F-4-Me_Ph	O	363
189	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	3,5-di-F-piridin-2-ilo	O	354
190	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	382
191	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	369
192	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	377
193	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	368
194	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-F-Ph	NH	***
195	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Cl-Ph	NH	***
196	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	NH	343
197	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	***
198	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,3-di-F-Ph	NH	***
199	H	Me	2,6-di-F-Ph	4-F-2-OMe-Ph	NH	***
200	H	Me	2,6-di-F-Ph	3-OMe-Ph	NH	***
201	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	***
202	H	Me	2,3-di-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	336
203	H	Me	2,3-di-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	354
204	H	Me	2,3-di-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	366
205	H	Me	2,3-di-F-Ph	4-F-Ph	NH	318
206	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-Ph	O	365
207	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***
209	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3,4-di-Me-Ph	O	***
210	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3,4-di-Me-Ph	O	***
211	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-OMe-Ph	O	***
212	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-OMe-Ph	O	***
213	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-OMe-Ph	O	349
214	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,3-di-F-Ph	NH	***
215	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-5-OMe-Ph	NH	***
216	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-F-5-OMe-Ph	NH	***
217	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-OMe-4-Me-Ph	O	***
218	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Cl-3-CN-Ph	O	***

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
219	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-Me-Ph	O	333
220	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-Me-Ph	O	345
221	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-OMe-Ph	O	361
222	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-CN-Ph	O	344
223	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-CN-Ph	O	356
224	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Cl-3-CN-Ph	O	***
225	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	4-Br-3-CN-Ph	O	***
226	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,5-di-F-Ph	NH	***
227	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-5-OMe-Ph	NH	***
228	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-4-OMe-Ph	NH	***
229	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4,5-tri-F-Ph	NH	***
230	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	336
231	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,3-di-Cl-Ph	NH	***
232	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	423
233	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,5-di-F-4-CN-Ph	O	423
234	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-F-3-CN-Ph	NH	359
235	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-5-CN-Ph	NH	375
236	H	Me	2-CF ₃ -Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	384
237	H	Me	2-CF ₃ -Ph	4-F-Ph	NH	350
238	H	Me	2-CF ₃ -Ph	2,4-di-F-Ph	NH	368
239	H	Me	2-CF ₃ -Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	386
240	H	Me	2-CF ₃ -Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	398
241	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-Cl-piridin-2-ilo	NH	353
242	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	***
243	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	***
244	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-5-OMe-Ph	NH	***
245	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,5-di-Cl-Ph	NH	***
246	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	NH	***
247	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	***
248	H	Me	2-Br-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	398
249	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-OMe-4-Me-Ph	O	***
250	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	3-CN-4-Me-Ph	O	***
251	H	Me	2-CF ₃ -Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-ilo	NH	401
252	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-ilo	NH	387
253	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	402
254	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	4-F-Ph	NH	368
255	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	2,4-di-F-Ph	NH	368

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
256	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	***
257	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	***
258	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	4-Br-3-CN-Ph	O	***
259	H	Me	2,6-di-F-4-OMe-Ph	3-CN-4-Me-Ph	O	***
260	H	Me	2-Br-4-F-Ph	3-F-5-CF ₃ -piridin-2-ilo	O	449
261	H	Me	2-Br-4-F-Ph	3-Cl-5-CF ₃ -piridin-2-ilo	O	465
262	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	404
263	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	2,6-di-F-4-OMe-Ph	NH	416
264	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	3,5-di-F-piridin-2-ilo	NH	387
265	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	413
266	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	415
267	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-ilo	NH	399
268	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-pirimidin-5-ilo	NH	***
269	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Me-pirimidin-5-ilo	NH	***
270	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	pirimidin-5-ilo	NH	***
271	H	Me	2-Cl-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
272	H	Me	2-Br-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
273	H	Me	2,3-di-Cl-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
274	H	Me	2,3-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
275	H	Me	2,5-di-Cl-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
276	H	Me	2-Cl-5-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
277	H	Me	2-Cl-5-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
278	H	Me	2-F-5-OMe-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
279	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	3,5-di-F-piridin-2-ilo	NH	353
280	H	Me	2-CF ₃ -Ph	3,5-di-F-piridin-2-ilo	NH	369
281	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-3-OMe-Ph	NH	***
282	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	397
283	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	386
284	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	406
285	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	422
286	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	386
287	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	386
288	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-OMe-Ph	NH	346
289	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-3-OMe-Ph	NH	***
290	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	***
291	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-5-CN-Ph	NH	***
292	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	431

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
293	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NMe	***
294	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NEt	***
295	H	Me	2-Br-4-F-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-ilo	NH	430
296	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-Cl-4-OMe-Ph	NH	413
297	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	370
298	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	386
299	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	383
300	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NH	***
301	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	***
302	H	Me	2,3-di-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	368
303	H	Me	2,3-di-Cl-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-ilo	NH	400
304	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NS(O) ₂ Me	***
305	H	Me	2-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
306	H	Me	2-CF ₃ -Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
307	H	Me	2-Cl-5-CF ₃ -Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
308	H	Me	2-Cl-piridin-3-ilo	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***
309	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NCH ₂ OMe	***
310	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	372
311	H	Me	2-Cl-4-OMe-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	388
312	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	398
313	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	458
314	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	414
315	H	Me	2-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	334
316	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	448
317	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-OMe-Ph	NH	392
318	H	Me	2-Br-4-OMe-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	433
319	H	Me	2-Br-4-OMe-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	418
320	H	Me	2-Cl-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-ilo	NH	368
321	H	Me	2,6-di-F-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-ilo	NH	369
322	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	380
323	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,6-di-Cl-4-OMe-Ph	NH	459
324	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2-Cl-4-OMe-Ph	NH	425
325	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4-OEt-Ph	NH	394
326	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-F-Ph	NCH ₂ CN	409
327	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2,4-di-Cl-Ph	NH	***
328	H	Me	2,4-di-F-Ph	3,5-di-Cl-piridin-2-ilo	NH	369
329	H	Me	2,5-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	O	***

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
330	H	Me	2-Cl-4,6-di-F-Ph	2,6-di-F-4-CN-Ph	NH	395
331	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	359
332	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	393
333	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	4-OMe-Ph	NH	***
334	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***
335	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	359
336	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	393
337	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	4-F-Ph	NH	***
338	H	Me	2-Cl-4-CN-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	375
339	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	***
340	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	***
341	H	Me	2,6-di-Cl-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	***
342	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	360
343	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	369
346	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4-F-Ph	NH	398
347	H	Me	4-Cl-2-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	360
348	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-6-Cl-4-F-Ph	NH	432
349	H	Me	2,6-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	370
353	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	***
354	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2-Cl-4-F-Ph	NH	***
355	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	4-OMe-Ph	NH	***
357	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	370
358	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	360
359	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	376
360	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	432
361	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	344
362	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	394
363	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	***
364	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	NH	416
365	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	NH	432
366	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2-F-Ph	NH	414
367	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-Cl-6-F-Ph	NH	402
368	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	
369	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	
371 (Ej. 9)	H	Me	2,4,6-tri-F-Ph	2,6-di-F-4-NH ₂ -Ph	O	**
372	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4-CN-Ph	O	
373	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Cl-4-CN-Ph	O	

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
374	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4-di-Cl-6-F-Ph	NH	386
375	H	Me	2,6-di-F-Ph	2,6-di-Cl-4-F-Ph	NH	
376	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	416
377	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	432
378	H	Me	2,6-di-F-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	NH	
379	H	Me	2,6-di-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	
380	H	Me	2-Cl-6-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	
382	H	Me	2-F-4-CN-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	
383	H	Me	2-F-4-CN-Ph	2,6-di-F-4-Cl-Ph	NH	
387	H	Me	2-Cl-4-OH-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	350
388	H	Me	2-Cl-4-OCH ₂ CN-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	389
389	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Br-4-F-Ph	NH	396
390	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Br-2,6-di-Cl-Ph	NH	448
391	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	2-Cl-4,6-di-F-Ph	NH	***
392	H	Me	2,4-di-Cl-Ph	4-Cl-2,6-di-F-Ph	NH	***
393	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-OEt	NH	360
394	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2-F	O	369
395	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	344
396	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Cl-2-F-Ph	NH	352
397	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4-di-Cl-6-F-Ph	NH	386
398	H	Me	2,6-di-F-Ph	4-Cl-2-F-Ph	NH	352
399	H	Me	2,6-di-F-4- (OCH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂)-Ph	2-F-4-CN-Ph	O	445
400	H	Me	4-Cl-Ph	2,6-di-F-Ph	NH	334
401	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2,5-di-F-Ph	NH	386
402	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2,6-di-F-Ph	NH	474
403	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2,6-di-Cl-Ph	NH	464
404	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,5-di-F-Ph	NH	386
405	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4,6-tri-Cl-Ph	NH	404
406	H	Me	2,4-di-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	416
407	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Br-2-Cl-Ph	NH	414
408	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2,6-di-Cl-Ph	NH	508
409	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2-F-Ph	NH	458
410	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2,4,6-tri-Cl-Ph	NH	420
411	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Br-4,6-di-F-Ph	NH	432
412	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Br-2-Cl-Ph	NH	430
413	H	Me	2-Br-4-F-Ph	4-Br-2-Cl-Ph	NH	474

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	R ¹	R ²	Q ¹	Q ²	X	M.S
414	H	Me	2-Br-4-F-Ph	2,4,6-tri-Cl-Ph	NH	464
415	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-F-2-I-Ph	NH	444
416	H	Me	2,4-di-F-Ph	2,4,6-tri-Me-Ph	NH	342
417	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	4-Cl-2,5-di-F-Ph	NH	386
418	H	Me	2-Cl-4-F-Ph	2-Cl-4,5-di-F-Ph	NH	386
424	H	Me	2,4-di-F-Ph	4-Cl-2-F-6-I-Ph	NH	478
425	H	Me	2-Cl-4- (OCH ₂ CH ₂ CH ₂ NHMe)-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	421
426	H	Me	2-Cl-4- (OCH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe)-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	422
427	H	Et	2-Cl-4-F-Ph	2,4-di-F-Ph	NH	366

* los datos de ¹H NMR se encuentran en la Tabla de índice B

** los datos de AP⁺ o ¹H NMR se encuentran en los Ejemplos de Síntesis

*** los datos de MP se encuentran en la Tabla de índice C

Tabla de índice B

Comp. Núm.	Datos de ¹ H RMN (disolución de CDCl ₃ a menos que se indique otra cosa) ^a
3	δ 7,11 (m, 1H), 6,99 (m, 1H), 6,75-6,85 (m, 3H), 6,58 (m, 1H), 6,40 (m, 1H), 3,58 (s, 3H), 3,07 (s, 3H), 2,21 (s, 3H).

^aLos datos de ¹H RMN están en ppm campo abajo de tetrametilsilano. Los acoplamientos se designan por (s)-singlete y (m)-multiplete

Tabla de índice C

Comp. Núm.	Punto de fusión ^b	Comp. Núm.	Punto de fusión	Comp. Núm.	Punto de fusión
110	85-87	197	115-117	271	132-135
111	165-167	198	106-108	272	132-134
112	80-82	199	134-136	273	152-153
113	135-137	200	139-141	274	141-143
114	147-149	201	109-111	275	168-171
115	168-170	207	57-59	276	115-117
123	171-173	209	92-96	277	131-134
124	135-137	210	73-77	278	112-114
125	138-140	211	110-114	281	49-52
126	142-144	212	130-134	289	148-150
129	127-130	214	105-107	290	181-183
130	129-131	215	90-92	291	146-149
133	160-162	216	152-154	293	116-118
134	228-230	217	72-76	294	113-115
136	152-154	218	112-117	300	178-180

137	165-167	224	132-135	301	168-170
138	171-173	225	123-126	304	186-191
142	186-188	226	139-141	305	101-105
143	93-95	227	99-102	306	134-138
144	176-178	228	133-135	307	161-166
145	142-144	229	144-146	308	142-145
146	145-147	231	108-110	309	118-123
147	60-62	242	91-93	327	118-120
157	96-101	243	82-84	329	98-100
164	106-110	244	95-97	333	177-179
165	111-113	245	73-75	334	117-119
178	110-112	246	182-184	337	186-188
179	105-107	247	156-158	339	135-136
180	130-132	249	83-87	340	137-139
186	78-84	250	126-129	341	151-153
187	107-113	256	171-173	353	169-171
194	133-135	257	172-174	354	111-113
195	98-100	258	121-124	355	90-92
		259	97-100	363	229-231
		268	178-180	391	181-183
		269	80-85	392	155-157
		270	172-176		

^b los datos de los puntos de fusión están en °C

Ejemplos biológicos de la invención

Protocolo general para preparar suspensiones de ensayo para los Ensayos A-J: los compuestos de ensayo se disolvieron primero en acetona en una cantidad igual a 3% del volumen final y después se suspendieron a la concentración deseada (en ppm) en acetona y agua purificada (mezcla 50/50 en volumen) que contenía 250 ppm del tensioactivo Trem[®] 014 (ésteres de alcohol polihídrico). Las suspensiones de ensayo resultantes se usaron entonces en los Ensayos A-J. Pulverizar una suspensión de ensayo de 200 ppm al punto de escorrentía de las plantas de ensayo era el equivalente de una tasa de 500 g/ha. A menos que se indique otra cosa, los valores de clasificación indican que se usó una suspensión de ensayo de 200 ppm. (Un asterisco "*" al lado del valor de clasificación indica que se usó una suspensión de ensayo de 40 ppm).

10 Ensayo A

Plántulas de viña se inocularon con una suspensión de espora de *Plasmopara viticola* (el agente causal de mildiú de la uva) y se incubó en una atmósfera saturada a 20°C durante 24h. Después de un corto periodo de secado, la suspensión de ensayo se pulverizó al punto de escorrentía en las plántulas de viña y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 4 días, después de lo cual las unidades de ensayo se colocaron de nuevo en una atmósfera saturada a 20°C durante 24 h. En la eliminación, se hicieron clasificaciones visuales de la enfermedad.

Ensayo B

La suspensión de ensayo se pulverizó al punto de escorrentía en plántulas de tomate. Al día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Botrytis cinerea* (el agente causal de la podredumbre gris del tomate) y se incubaron en atmósfera saturada a 20°C durante 48 h, y después se movieron a una cámara de

crecimiento a 24°C durante 3 días adicionales, después lo cual se hicieron clasificaciones visuales de la enfermedad en el tiempo.

Ensayo C

- 5 La suspensión de ensayo se pulverizó al punto de escorrentía en plántulas de tomate. Al día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Alternaria solani* (el agente causal del tizón temprano del tomate) y se incubaron en una atmósfera saturada a 27°C durante 48 h, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 5 días, después de lo cual se hicieron clasificaciones visuales de enfermedad en el tiempo.

Ensayo D

- 10 La suspensión de ensayo se pulverizó al punto de escorrentía en plántulas de tomate. Al día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Phytophthora infestans* (el agente causal del mildiú del tomate) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20°C durante 24 h, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 5 días, después de lo cual se hicieron clasificaciones visuales de la enfermedad en el tiempo.

Ensayo E

- 15 La suspensión de ensayo se pulverizó al punto de escorrentía en plántulas de agrostis trepadora (*Agrostis* sp.). Al día siguiente las plántulas se inocularon con una lechada de salvado y micelas de *Rhizoctonia solani* (el agente causal de parches marrones del césped) y se incubaron en una atmósfera saturada a 27°C durante 48 h, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 27°C durante 3 días, después de lo cual se hicieron clasificaciones de enfermedad en el tiempo.

Ensayo F

- 20 La suspensión de ensayo se pulverizó al punto de escorrentía en plántulas de trigo. Al día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Septoria nodorum* (el agente causal de la septoriasis del trigo) y se incubaron en una atmósfera saturada a 24°C durante 48 h, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 6 días, después de lo cual se hicieron clasificaciones visuales de enfermedad en el tiempo.

Ensayo G

- 25 La suspensión de ensayo se pulverizó al punto de escorrentía en plántulas de trigo. Al día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Septoria tritici* (el agente causal de la mancha de la hoja de trigo) y se incubaron en atmósfera saturada a 24°C durante 48 h, y después las plántulas se movieron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 19 días adicionales, después de lo cual se hicieron clasificaciones visuales de enfermedad en el tiempo.

- 30 Ensayo H

- 35 Las plántulas de trigo se inocularon con una suspensión de esporas de *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (el agente causal de la roya parda del trigo) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20°C durante 24 h, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 2 días. Al final de este tiempo la suspensión de ensayo se pulverizó al punto de escorrentía, y después las plántulas se movieron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 6 días después de lo cual se hicieron clasificaciones visuales de enfermedad en el tiempo.

Ensayo I

- 40 La suspensión de ensayo se pulverizó al punto de escorrentía en plántulas de trigo. Al día siguiente las plántulas se inocularon con una suspensión de esporas de *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* (el agente causal de la roya parda de trigo) y se incubaron en una atmósfera saturada a 20°C durante 24 h, y después se movieron a una cámara de crecimiento a 20°C durante 7 días, después de lo cual se hicieron clasificaciones visuales de enfermedad en el tiempo.

Ensayo J

- 45 La suspensión de ensayo se pulverizó al punto de escorrentía en plántulas de trigo. Al día siguiente las plántulas se inocularon con un polvo de esporas de *Erysiphe graminis* f. sp. *tritici* (el agente causal del moho pulverulento de trigo) y se incubaron en una cámara de crecimiento a 20°C durante 8 días, después de lo cual se hicieron clasificaciones visuales de enfermedad en el tiempo.

Los resultados para los Ensayos A-J se dan en la Tabla A. En la Tabla, una clasificación de 100 indica 100% de control de enfermedad y una clasificación de 0 indica que no hay control de enfermedad (respecto a los controles). Un guión (-) indica que no hay resultados de ensayo.

- 50

ES 2 562 178 T3

Tabla A

Comp. Núm.	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J
1	0	99	0	0	47	0	99	-	0	98
2	8	1	0	0	0	0	0	0	0	0
3	6	0	25	9	0	0	13	-	0	99
4	29	87	46	0	0	0	98	-	53	97
5	36	0	25	0	0	0	0	-	0	0
6	65	10	23	0	0	0	0	-	0	93
7	29	99	0	0	63	0	100	-	74	92
8	55	99	54	0	99	0	100	-	97	99
9	-	99	0	0	55	0	100	-	98	97
10	-	47	0	0	0	0	0	-	0	0
11	-	99	99	0	99	0	100	-	99	100
12	-	99	93	0	99	0	100	-	99	100
13	-	99	100	0	98	64	100	-	100	99
14	-	98	0	-	-	0	99	-	99	98
15	-	99	67	-	-	73	99	-	98	99
16	-	60	0	-	-	0	47	48	28	0
17	-	100	100	-	-	93	97	96	100	100
18	-	99	100	-	-	99	95	99	100	100
19	-	100	85	-	-	0	96	0	92	98
21	-	98	100	-	-	97	-	-	100	99
22	-	90	85	-	-	90	94	9	94	100
23	-	98	100	-	-	99	93	92	100	100
24	-	98	100	-	-	0	94	9	97	100
25	-	100	0	-	-	0	100	0	94	79
26	-	99	83	-	-	0	100	0	99	100
27	-	99	88	-	-	0	95	0	25	87
28	-	99	0	-	-	0	96	7	91	0
29	-	94	0	-	-	0	98	0	46	0
30	-	7	0	-	-	0	41	0	79	0
31	-	99*	98*	-	-	0*	47*	15*	79*	60*
33	-	0	0	-	-	0	5	0	18	0
34	-	100*	97*	-	-	0*	96*	0*	76*	0*
35	-	100	0	-	-	0	95	0	97	100
36	-	100	0	-	-	0	96	0	96	98
37	0	0	0	0	0	0	3	-	0	0

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J
38	-	99	9	-	-	0	97	0	99	99
39	-	100	99	-	-	0	99	99	99	99
40	-	99	0	-	-	0	94	92	99	99
41	-	100	99	-	-	90	94	0	100	99
42	-	100	0	-	-	0	93	0	94	82
43	-	76	0	-	-	0	97	66	82	99
44	-	82	0	-	-	0	96	7	9	0
45	-	100	100	-	-	100	100	7	100	100
46	-	99	100	-	-	99	100	37	100	99
47	-	100*	87*	-	-	0*	99*	37*	96*	99*
48	-	100	78	-	-	0	99	0	98	98
49	-	100	17	-	-	35	99	0	89	79
50	-	99	57	-	-	0	100	0	98	99
51	-	100	0	-	-	0	100	0	89	78
55	-	6	0	-	-	0	98	0	41	73
56	-	43	0	-	-	0	99	0	28	64
57	-	98	0	-	-	0	94	85	85	0
58	-	98	100	-	-	89	98	82	100	100
59	-	94	0	-	-	0	88	0	68	0
60	-	75	0	-	-	0	97	59	79	0
61	-	97	0	-	-	0	99	0	38	73
62	-	99	98	-	-	84	98	98	99	99
63	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0
64	-	97	80	-	-	0	100	0	95	98
66	-	100	99	-	-	0	100	6	100	99
67	-	95	0	-	-	0	99	24	95	86
69	-	100	73	-	-	60	99	91	99	100
70	-	99	0	-	-	0	99	41	85	98
71	-	93	0	-	-	0	96	0	91	67
72	-	0	0	-	-	0	0	59	0	0
73	-	100	99	-	-	64	100	88	100	99
74	-	0	0	-	-	0	25	4	0	0
75	-	100	98	-	-	98	99	95	99	97
76	-	100	0	-	-	0	98	6	0	0
77	-	99	0	-	-	0	95	6	97	0
78	-	99	82	-	-	0	98	0	89	91

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J
79	-	99	0	-	-	0	99	0	55	0
80	-	100	0	-	-	0	99	18	86	89
81	-	97	0	-	-	0	0	0	27	0
82	-	100	100	-	-	40	99	0	68	13
83	-	100	100	-	-	89	99	99	96	94
84	-	100	100	-	-	78	100	98	100	99
85	-	0	0	-	-	0	17	0	19	0
86	-	0	0	-	-	0	48	0	0	0
87	-	100	100	-	-	95	98	85	99	100
88	-	100	100	-	-	99	98	95	99	100
89	-	99	0	-	-	0	99	0	0	97
90	-	99	95	-	-	84	100	0	98	100
91	-	100	99	-	-	95	99	0	100	100
92	-	100	100	-	-	99	100	41	99	100
93	-	41	0	-	-	0	77	0	9	0
94	-	99	70	-	-	29	98	0	9	0
95	-	99	16	-	-	0	97	0	0	0
96	-	99	99	-	-	99	100	9	99	100
97	-	100	99	-	-	95	100	0	99	99
98	-	100	17	-	-	69	100	26	99	99
99	-	100	99	-	-	100	99	40	100	100
100	-	38	0	-	-	0	48	0	41	0
101	-	100	99	-	-	100	100	99	99	100
102	-	100	100	-	-	98	99	0	100	98
103	-	100	64	-	-	0	95	0	91	0
104	-	100	99	-	-	97	99	99	99	100
105	-	23	0	-	-	0	73	9	0	72
106	-	100	99	-	-	90	100	82	99	100
107	-	99*	0*	-	-	0*	99*	8*	24*	0*
108	-	97	0	-	-	0	98	0	16	97
109	-	100	99	-	-	97	100	99	100	100
110	-	99	66	-	-	98	99	0	97	94
111	-	99	75	-	-	90	99	0	97	99
112	-	100	98	-	-	99	99	53	100	100
113	-	99	47	-	-	0	100	8	95	48
114	-	99	24	-	-	69	99	8	99	84

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J
115	-	99	0	-	-	0	100	0	91	0
116	-	100	94	-	-	73	100	16	97	99
117	-	99	97	-	-	82	100	11	98	97
118	-	100	100	-	-	98	100	99	100	99
120	-	100	99	-	-	94	100	0	99	99
123	-	99	0	-	-	40	99	-	80	0
124	-	100	78	-	-	60	99	-	96	94
125	-	100	67	-	-	60	99	-	92	0
126	-	99	96	-	-	60	100	0	94	0
127	-	70	0	-	-	0	99	0	68	0
128	-	100	100	-	-	97	99	66	100	100
129	-	99	0	-	-	0	96	0	0	0
130	-	97	0	-	-	0	99	0	19	0
132	-	99	0	-	-	0	100	0	94	92
133	-	100	100	-	-	60	99	0	100	94
134	-	99	0	-	-	0	99	0	41	0
136	-	99	71	-	-	86	99	0	99	100
137	-	96	97	-	-	78	99	8	100	100
138	-	99	96	-	-	84	99	38	100	98
139	-	100	86	-	-	100	100	69	99	100
140	-	99	94	-	-	87	99	0	96	97
141	-	99	99	-	-	98	100	0	99	100
142	-	33	13	-	-	20	99	0	95	90
143	-	99	99	-	-	100	100	63	100	100
144	-	99	9	-	-	40	99	0	98	91
145	-	96	98	-	-	100	100	88	100	100
146	-	99	0	-	-	0	99	0	97	56
147	-	99	88	-	-	100	100	0	98	92
148	-	99	99	-	-	100	100	61	100	99
149	-	100	98	-	-	100	100	99	100	100
150	-	19	0	-	-	60	7	0	74	50
152	-	100	82	-	-	87	99	9	97	99
153	-	100	0	-	-	73	100	0	96	98
154	-	99	99	-	-	97	100	41	100	100
155	-	100	99	-	-	100	100	92	100	99
157	-	0	0	-	-	0	0	0	54	73

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J
158	-	100	0	-	-	0	99	18	99	98
159	-	99	0	-	-	0	100	74	99	100
160	-	98	99	-	-	0	99	8	100	100
161	-	98	100	-	-	0	100	95	100	98
162	-	99	0	-	-	0	99	8	98	94
163	-	0	9	-	-	0	83	0	88	0
164	-	49	57	-	-	0	99	15	9	97
165	-	0	0	-	-	0	52	8	0	99
166	-	0	0	-	-	0	97	0	68	96
167	-	75	0	-	-	0	0	0	0	0
168	-	14	0	-	-	0	33	0	0	0
169	-	24	0	-	-	0	85	0	0	0
170	-	100	99	-	-	99	98	0	100	99
171	-	100	97	-	-	0	97	68	99	100
172	-	100	100	-	-	87	100	0	99	100
173	-	100	86	-	-	0	98	0	83	100
174	-	100	99	-	-	0	96	0	97	99
175	-	100	99	-	-	82	96	93	99	100
176	-	100	71	-	-	0	96	0	68	100
177	-	100	100	-	-	73	98	0	83	100
178	-	100	100	-	-	80	98	0	83	100
179	-	100	99	-	-	73	95	0	93	100
180	-	100	99	-	-	0	98	0	68	100
181	-	94	44	-	-	0	100	0	60	98
182	-	97	99	-	-	87	100	0	95	99
183	-	97	100	-	-	67	99	27	94	99
184	-	97	0	-	-	0	99	0	82	98
185	-	0	0	-	-	0	100	0	74	98
186	-	0	0	-	-	0	99	0	54	93
187	-	33	0	-	-	0	20	0	9	13
188	-	87	0	-	-	0	100	0	97	97
189	-	99	100	-	-	80	100	99	99	98
190	-	99	99	-	-	80	100	94	100	99
191	-	98	100	-	-	0	100	0	97	99
192	-	97	100	-	-	73	100	0	99	99
193	-	99	100	-	-	0	100	32	99	100

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J
194	-	97	86	-	-	0	99	0	91	99
195	-	100	97	-	-	60	100	0	98	97
196	-	99	94	-	-	73	100	9	98	98
197	-	97	0	-	-	95	99	0	79	96
198	-	97	68	-	-	0	100	0	94	97
199	-	99	86	-	-	0	99	0	68	98
200	-	82	0	-	-	0	97	0	0	94
201	-	99	97	-	-	20	100	18	97	99
202	-	99	0	-	-	0	99	0	28	99
203	-	99	0	-	-	0	98	0	96	100
204	-	100*	77*	-	-	0*	99*	0*	86*	99*
205	-	100	17	-	-	0	99	0	91	100
206	-	99	99	-	-	84	99	41	99	100
207	-	100	93	-	-	64	100	0	99	100
209	-	0	0	-	-	0	0	0	0	97
210	-	0	0	-	-	0	100	99	94	99
211	-	77	0	-	-	0	99	0	17	96
212	-	0	17	-	-	-	98	0	-	-
213	-	97	30	-	-	0	85	94	96	100
214	-	98	51	-	-	0	100	9	99	100
215	-	89	0	-	-	0	98	0	94	99
216	-	96	0	-	-	0	76	0	26	99
217	-	75	0	-	-	0	83	40	79	99
218	-	94	0	-	-	0	99	17	92	87
219	-	70	0	-	-	0	0	17	0	0
220	-	98	97	-	-	40	98	40	99	100
221	-	98	94	-	-	82	100	17	99	100
222	-	99	99	-	-	0	100	88	99	100
223	-	96	9	-	-	99	100	0	100	100
224	-	99	51	-	-	0	100	17	91	100
225	-	65	0	-	-	0	99	0	79	98
226	-	99	0	-	-	0	96	28	91	100
227	-	87	0	-	-	0	99	0	74	98
228	-	99	99	-	-	0	99	0	80	99
229	-	99	17	-	-	0	99	0	91	98
230	-	99	99	-	-	0	100	0	97	100

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J
231	-	98	34	-	-	0	100	0	86	100
232	-	100	99	-	-	99	100	0	100	100
233	-	100	99	-	-	99	100	0	100	100
234	-	99	0	-	-	0	99	0	92	84
235	-	84	0	-	-	0	17	0	0	79
236	-	97	0	-	-	0	96	0	68	97
237	-	99	0	-	-	0	97	0	68	97
238	-	99	0	-	-	0	0	53	9	43
239	-	99	95	-	-	0	67	0	68	100
240	-	100	99	-	-	0	99	0	99	100
241	-	99	99	-	-	0	100	97	100	100
242	-	99	37	-	-	0	100	0	91	100
243	-	100	64	-	-	0	100	0	97	100
244	-	82	0	-	-	0	91	0	0	96
245	-	90	0	-	-	0	97	0	68	93
246	-	99	51	-	-	0	100	0	80	100
247	-	100	99	-	-	60	100	0	99	100
248	-	99	26	-	-	73	100	0	99	100
249	-	40	0	-	-	0	99	0	96	100
250	-	98	0	-	-	0	77	0	86	100
251	-	99	0	-	-	0	98	0	86	100
252	-	100	97	-	-	0	100	0	100	100
253	-	99	0	-	-	0	0	0	0	76
254	-	100	0	-	-	0	84	0	0	64
255	-	100	0	-	-	0	0	0	0	39
256	-	99	99	-	-	96	100	0	99	100
257	-	100	99	-	-	0	100	0	97	98
258	-	41	9	-	-	0	89	0	68	90
259	-	98	9	-	-	0	100	0	86	97
260	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0
261	-	0	0	-	-	0	0	0	0	47
262	-	99	51	-	-	0	0	0	68	99
263	-	100	98	-	-	0	100	0	98	100
264	-	100	98	-	-	0	92	0	99	98
265	-	100	99	-	-	78	100	90	100	100
266	-	100	100	-	-	98	100	0	100	100

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J
267	-	100	79	-	-	60	100	0	96	93
268	-	95	93	-	-	0	99	0	74	0
269	-	80	0	-	-	0	67	8	0	0
270	-	92	86	-	-	0	91	8	0	81
271	-	100	99	-	-	99	100	0	99	98
272	-	100	97	-	-	99	99	0	99	99
273	-	0	0	-	-	0	72	0	27	43
274	-	8	0	-	-	0	96	8	0	69
275	-	97	46	-	-	0	99	8	97	99
276	-	100	99	-	-	98	100	31	100	100
277	-	100	0	-	-	0	100	0	96	98
278	-	99	0	-	-	0	99	0	82	100
279	-	100	99	-	-	0	100	8	98	100
280	-	99	0	-	-	0	96	8	18	87
281	-	98	44	-	-	0	-	0	94	98
282	-	99	98	-	-	0	-	0	99	100
283	-	99	65	-	-	0	-	9	99	100
284	-	99	99	-	-	100	-	28	100	100
285	-	98	0	-	-	60	-	9	99	99
286	-	98*	85*	-	-	60*	-	100*	100*	100*
288	9	99	52	0	92	0	-	-	74	92
289	-	100	0	-	-	0	99	0	96	97
290	-	100	99	-	-	87	100	0	100	100
291	-	99	0	-	-	0	98	0	85	43
292	-	100	99	-	-	96	100	92	100	100
293	0	97	47	0	99	0	-	-	94	99
294	0	98	0	0	80	0	-	-	0	84
296	-	99	0	-	-	0	100	0	99	-
297	-	100	99	-	-	90	100	0	100	100
298	-	100	93	-	-	87	100	0	100	100
299	-	100	95	-	-	51		41	100	100
300	-	100	99	-	-	82	100	9	99	100
301	-	99	87	-	-	87	100	0	98	99
302	-	99*	0*	-	-	0*	99*	0*	18*	97*
303	-	99	0	-	-	0	98	0	92	71
304	-	0	0	-	0	0	16	-	0	0

ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J
305	-	99	99	-	-	94	100	0	99	99
306	-	7	0	-	-	0	93	0	28	64
307	-	0	0	-	-	0	0	0	0	0
308	-	81	0	-	-	0	98	9	100	0
309	-	97	61	-	92	60	100	-	0	99
310	-	100	99	-	-	99	100	0	99	96
311	-	100	0	-	-	60	100	0	99	91
313	-	100	97	-	-	51	100	91	100	100
314	-	100	95	-	-	0	100	94	100	100
315	-	99	99	-	-	0	100	0	96	100
316	-	99	0	-	-	0	-	9	99	96
318	-	99	0	-	-	0	100	0	97	89
319	-	92	88	-	-	100	100	0	99	95
320	-	99	67	-	-	0	100	0	99	98
321	-	100	99	-	-	78	100	9	99	100
322	-	100	93	-	-	0	100	99	100	100
323	-	98	0	-	-	0	98	0	94	-
324	-	99	83	-	-	0	100	63	99	99
325	-	100	0	-	-	0	100	0	97	99
326	8	99	99	0	99	73	100	-	99	94
327	-	99	0	-	-	0	100	0	96	99
328	-	100	86	-	-	0	100	0	98	100
329	-	100	99	-	-	69	100	0	100	100
331	-	100	80	-	-	73	100	8	100	97
333	-	100	0	-	-	0	100	9	74	0
334	-	100	0	-	-	0	100	0	97	100
336	-	100	97	-	-	95	100	94	100	99
337	-	99	0	-	-	0	99	9	41	98
338	-	100	37	-	-	40	100	8	100	99
339	-	100	0	-	-	0	100	0	98	100
340	-	99	0	-	-	0	100	0	91	100
341	-	99	0	-	-	0	99	0	99	93
342	-	100	33	-	-	99	100	0	100	100
343	-	100	100	-	-	97	100	91	100	100
348	-	100	80	-	-	94	100	19	100	100
353	-	97	17	-	-	0	99	3	99	99

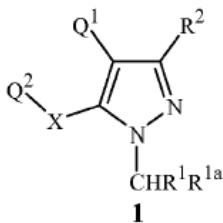
ES 2 562 178 T3

Comp. Núm.	Ensayo A	Ensayo B	Ensayo C	Ensayo D	Ensayo E	Ensayo F	Ensayo G	Ensayo H	Ensayo I	Ensayo J
354	-	99	0	-	-	0	100	82	98	100
355	-	99	0	-	-	0	100	3	91	0
357	-	100	86	-	-	87	100	0	99	100
358	-	99	0	-	-	0	100	0	97	97
359	-	100	99	-	-	97	100	0	100	99
360	-	100	97	-	-	95	100	79	100	100
361	-	100	90	-	-	0	100	0	100	100
362	-	100	0	-	-	0	100	0	96	96
363	-	65	0	-	-	0	99	0	96	43
364	-	99	97	-	-	88	100	0	99	100
365	-	100	99	-	-	64	100	74	100	100
366	-	100	58	-	-	0	100	9	99	100
367	-	100	100	-	-	100	-	100	100	100
369	-	100	66	-	-	0	-	17	100	99
389	-	100	9	-	-	0	-	68	98	99
391	-	100	99	-	-	73	-	31	99	99
403	-	99	0	-	-	0	-	99	100	99

"Comp. Núm." significa número de compuesto y se refiere a los mismos números de compuesto que en la Tabla de índice A

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto seleccionado de la Fórmula 1, *N*-óxidos y sales del mismo,



en donde

5 Q^1 es un anillo fenilo o un sistema anular naftalenilo, cada anillo o sistema anular opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; o un anillo heterocíclico totalmente insaturado de 5 a 6 miembros o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros, conteniendo cada anillo o sistema anular miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 3 miembros anulares de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S), y los miembros anulares de átomo de azufre se seleccionan independientemente de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, cada anillo o sistema anular opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 en miembros anulares de átomo de carbono y seleccionados de ciano, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_6 , alquil C_2-C_6 carbonilo, alcoxi C_2-C_6 carbonilo, alquilaminoalquilo C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo C_3-C_6 en miembros anulares de átomo de nitrógeno;

15 Q^2 es un anillo fenilo o sistema anular naftalenilo, cada anillo o sistema anular opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; o un anillo heterocíclico totalmente insaturado, parcialmente insaturado o saturado de 5 a 6 miembros o un sistema anular bicíclico heteroaromático de 8 a 10 miembros, conteniendo cada anillo o sistema anular miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente de hasta 2 átomos de O, hasta 2 átomos de S y hasta 4 átomos de N, en donde hasta 3 miembros anulares de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S), y los miembros anulares de átomo de azufre se seleccionan independientemente de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, cada anillo o sistema anular opcionalmente sustituidos con hasta 5 sustituyentes independientemente seleccionados de R^3 en miembros anulares de átomo de carbono y seleccionados de ciano, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_6 , alquil C_2-C_6 carbonilo, alcoxi C_2-C_6 carbonilo, alquilaminoalquilo C_2-C_6 y dialquilaminoalquilo C_3-C_6 en miembros anulares de átomo de nitrógeno; o alquilo C_1-C_{12} , alquenilo C_2-C_{12} , alquinilo C_2-C_{12} , cicloalquilo C_3-C_{12} o cicloalquenilo C_3-C_{12} , cada uno opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ;

X es O, $S(O)_m$ o NR^4 ;

20 R^1 es H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_7 , CO_2R^5 , $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 o alcoxialquilo C_2-C_5 ; o

R^1 es un fenilo opcionalmente sustituido con hasta 3 R^8 ; o un heterociclo aromático que contiene nitrógeno de cinco o seis miembros opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R^{9a} en miembros anulares de átomo de carbono y R^{9b} en miembros anulares de átomo de nitrógeno;

25 R^{1a} es H; o

R^{1a} y R^1 se toman juntos con el átomo de carbono al que están unidos para formar un anillo ciclopropilo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno y metilo;

R^2 es CH_3 , CH_2CH_3 , halógeno, ciano, cianometilo, halometilo, hidroximetilo, metoxi o metiltio; o ciclopropilo opcionalmente sustituido con hasta 2 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno y metilo;

30 cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, amino, metilamino, dimetilamino, formilamino, alquil C_2-C_3 carbonilamino, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 tio, haloalquil C_1-C_3 tio, alquil C_1-C_3 sulfinilo, haloalquil C_1-C_3 sulfinilo, alquil C_1-C_3 sulfonilo, haloalquil C_1-C_3 sulfonilo, alquil C_1-C_2 sulfonilo, haloalquil C_1-C_2 sulfonilo, cicloalquilo C_3-C_4 , cicloalcoxi C_3-C_7 , alquilcicloalquilo C_4-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_7 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , hidroxilo, formilo, alquil C_2-C_3 carbonilo, alquil C_2-C_3 carbonilo, $-SF_5$, $-SCN$, $C(=S)NR^{19}R^{20}$ y $-U-V-T$;

35 R^4 es H, formilo, alquenilo C_2-C_5 , alquinilo C_3-C_5 , cicloalquilo C_3-C_7 , $-SO_3^-M^+$, $-S(=O)_tR^{10}$, $-(C=W)R^{11}$, NH_2 u OR^{21} ; o alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 , cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 R^{12} ;

- R^5 es H, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆;
- R^6 y R^7 se seleccionan independientemente de H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₈ y alquilocicloalquilo C₄-C₈; o
- 5 R^6 y R^7 se toman juntos con el átomo de nitrógeno al que están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contiene miembros anulares, además del átomo de nitrógeno anular de conexión, seleccionado de átomos de carbono y opcionalmente hasta un miembro anular seleccionado de O, S(O)_n y NR¹³;
- cada R^8 , R^{9a} y R^{9b} se selecciona independientemente de halógeno, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ haloalcoxi C₁-C₂, ciano, nitro SCH₃, S(O)CH₃ y S(O)₂CH₃;
- 10 R^{10} es alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆;
- R^{11} es alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxialquilo C₂-C₇, alquilaminoalquilo C₂-C₇, dialquilaminoalquilo C₃-C₈, alquil C₁-C₆ tio o alquiltioalquilo C₂-C₇;
- cada R^{12} es independientemente cicloalquilo C₃-C₇, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄ tio, alquil C₁-C₄ sulfinilo, alquil C₁-C₄ sulfonilo o ciano;
- 15 R^{13} es H, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₂-C₃;
- cada R^{14} es independientemente H, ciano, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃;
- cada R^{19} y R^{20} es independientemente H o CH₃;
- R^{21} es H, formilo, cicloalquilo C₃-C₇, SO₃M⁺ o -(C=W)R¹¹; o alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 R¹²;
- 20 cada U es independientemente O, S(=O)_w, NR²² o un enlace directo;
- cada V es independientemente alquilenilo C₁-C₆, alquenileno C₂-C₆, alquinileno C₃-C₆, cicloalquileno C₃-C₆ o cicloalquenileno C₃-C₆, en donde hasta 3 átomos de carbono se seleccionan independientemente de C(=O), cada uno sustituido opcionalmente con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆;
- 25 cada T es independientemente ciano, NR^{23a}R^{23b}, OR²⁴ o S(=O)_yR²⁵;
- cada R²² es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquil C₂-C₆ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ carbonilo, (alquiltio) C₂-C₆ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ (tiocarbonilo), cicloalquil C₄-C₈ carbonilo, cicloalcoxi C₄-C₈ carbonilo, (cicloalquiltio) C₄-C₈ carbonilo o cicloalcoxi C₄-C₈ (tiocarbonilo);
- 30 cada R^{23a} y R^{23b} es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquil C₂-C₆ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ carbonilo, (alquiltio) C₂-C₆ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ (tiocarbonilo), cicloalquil C₄-C₈ carbonilo, cicloalcoxi C₄-C₈ carbonilo, (cicloalquiltio) C₄-C₈ carbonilo o cicloalcoxi C₄-C₈ (tiocarbonilo); o
- 35 un par de R^{23a} y R^{23b} unidos al mismo átomo de nitrógeno se toman juntos con el átomo de nitrógeno para formar un anillo heterocíclico de 3 a 6 miembros, el anillo opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R²⁶;
- cada R²⁴ y R²⁵ es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquil C₂-C₆ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ carbonilo, (alquiltio) C₂-C₆ carbonilo, alcoxi C₂-C₆ (tiocarbonilo), cicloalquil C₄-C₈ carbonilo, cicloalcoxi C₄-C₈ carbonilo, (cicloalquiltio) C₄-C₈ carbonilo o cicloalcoxi C₄-C₈ (tiocarbonilo);
- 40 cada R²⁶ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ o alcoxi C₁-C₆;
- W es O o S;
- M⁺ es un catión;
- m es 0, 1, o 2;
- n es 0, 1 o 2;
- 45 t es 0, 1 o 2;

cada u y v son independientemente 0, 1 o 2 en cada ejemplo de $S(=O)_u(=NR^{14})_v$, con tal que la suma de u y v sea 0, 1 o 2;

cada w es independientemente 0, 1 o 2; y

cada y es independientemente 0, 1 o 2;

5 con tal que:

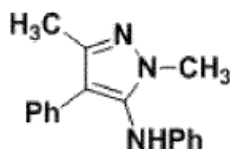
cuando Q^2 es un anillo fenilo sustituido en al menos una posición orto con un sustituyente seleccionado de $-U-V-T$ en donde U es un enlace directo, V es $C(=O)$ y T es $NR^{23a}R^{23b}$ u OR^{24} , entonces X es distinto de NR^4 ;

y con tal que el compuesto de Fórmula 1 sea distinto de:

(a) 2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenol;

10 (b) 2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenol;

(c)



(d) HCl de 2-(1,3-dimetil-4-fenilpirazolil)amino-2-imidazolina;

(e) (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[4-(isoxazol-3-il)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo;

15 (f) ácido (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[4-(isoxazol-3-il)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico;

(g) (2S)-2-[2,4-dicloro-5-({4-[5-(hidroximetil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il]oxi)fenoxi]propionato de metilo;

(h) ácido (2S)-2-[2,4-dicloro-5-({4-[5-(hidroximetil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il]oxi)fenoxi]propiónico;

(i) (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metilisoxazol-3-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo

(j) ácido (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metilisoxazol-3-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico

20 (k) (2S)-2-[2,4-dicloro-5-({4-[5-(1-hidroxi-1-metiletil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il]oxi)fenoxi]propionato de metilo

(l) ácido (2S)-2-[2,4-dicloro-5-({4-[5-(1-hidroxi-1-metiletil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-il]oxi)fenoxi]propiónico

(m) ácido (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico

(n) (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo

25 (o) ácido (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico; o

(p) (2S)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1H-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo.

2. Un compuesto según la reivindicación 1 en donde

30 Q^1 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo, cada uno sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; con tal que cuando un sustituyente R^3 está situado en una posición meta, entonces dicho sustituyente R^3 se selecciona de F, Cl, Br y ciano;

Q^2 es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; con tal que cuando un sustituyente R^3 está situado en una posición meta, entonces dicho sustituyente R^3 se selecciona de F, Cl, Br y ciano;

X es O o NR^4 ;

35 R^1 es H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , CO_2R^5 , $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 o alcoxialquilo C_2-C_5 ;

R^{1a} es H;

R^2 es CH_3 , CH_2CH_3 , Cl o Br;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 tio, haloalquil C_1-C_3 tio, alquil C_1-C_3 sulfinilo, haloalquil C_1-C_3 sulfinilo, alquil C_1-C_3 sulfonilo, haloalquil C_1-C_3 sulfonilo, cicloalquilo C_3-C_4 , $C(=S)NH_2$ y $-U-V-T$;

- 5 R^4 es H, formilo, cicloalquilo C_3-C_7 o $-SR^{10}$; o alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 , cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 R^{12} ;

R^5 es alquilo C_1-C_6 ;

R^6 es H o alquilo C_1-C_6 ;

R^7 es H, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , o alquilcicloalquilo C_4-C_8 ; o

- 10 R^6 y R^7 se toman juntos con el átomo de nitrógeno al que están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contiene miembros anulares, además del átomo de nitrógeno de conexión, seleccionados de átomos de carbono y hasta un miembro anular seleccionado de O y NR^{13} ;

cada R^{12} es independientemente cicloalquilo C_3-C_7 , alcoxi C_1-C_4 o ciano; y

R^{13} es H o CH_3 .

- 15 3. Un compuesto según la reivindicación 2 en donde

Q^1 es fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ;

Q^2 es fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ;

R^1 es H, halógeno o alquilo C_1-C_6 ;

R^2 es CH_3 , Cl o Br;

- 20 cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 y $-U-V-T$;

R^4 es H, formilo, cicloalquilo C_3-C_7 o $-SR^{10}$; o alquilo C_1-C_6 sustituido con un R^{12} ; R^{12} es ciclopropilo, $-OCH_3$ o ciano;

cada U es independientemente O o NH;

cada V es independientemente alquileno C_2-C_4 ;

- 25 cada T es independientemente $NR^{23a}R^{23b}$ u OR^{24} ;

cada R^{23a} y R^{23b} es independientemente H, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 ; y cada R^{24} es independientemente H, alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 .

4. Un compuesto según la reivindicación 3 en donde

al menos uno de Q^1 y Q^2 es fenilo sustituido con 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ;

- 30 R^1 es H o CH_3 ;

R^2 es CH_3 ;

R^4 es H;

cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 y haloalcoxi C_1-C_3 .

- 35 5. Un compuesto según la reivindicación 4 en donde

Q^1 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ;

- 40 Q^2 es fenilo sustituido en las posiciones 2, 4 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ; o fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ;

R^1 es H; y

cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, alquilo C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 y haloalcoxi C_1-C_2 .

6. Un compuesto según la reivindicación 5 en donde

cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano, metilo, alcoxi C_1-C_2 y fluorometoxi.

5 7. Un compuesto según la reivindicación 6 en donde

X es O o NH; y

cada R^3 se selecciona independientemente de F, Cl, Br, ciano y metoxi.

8. Un compuesto según la reivindicación 1 en donde

R^{1a} es H;

10 Q^1 y Q^2 son independientemente fenilo, tienilo, piridinilo, piridazinilo, pirazinilo o pirimidinilo, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 5 sustituyentes seleccionados independientemente de R^3 ;

X es O, $S(O)_m$, o NR^4 ;

R^1 es H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_7 , CO_2R^5 , $C(O)NR^6R^7$, ciano, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 o alcoxialquilo C_2-C_5 ; o

15 R^1 es fenilo opcionalmente sustituido con hasta 3 R^8 ; o un heterociclo aromático que contiene nitrógeno de cinco o seis miembros opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R^{9a} en miembros anulares de átomo de carbono y R^{9b} en miembros anulares de átomo de nitrógeno;

R^2 es CH_3 , CH_2CH_3 , ciclopropilo o halógeno;

20 cada R^3 se selecciona independientemente de halógeno, ciano, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , alquil C_1-C_3 tio, haloalquil C_1-C_3 tio, alquil C_1-C_3 sulfínico, haloalquil C_1-C_3 sulfínico, alquil C_1-C_3 sulfonilo, haloalquil C_1-C_3 sulfonilo, cicloalquilo C_3-C_4 , cicloalcoxi C_3-C_7 , alquilocicloalquilo C_4-C_6 , cicloalquilalquilo C_4-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_7 , alquenilo C_2-C_4 y alquinilo C_2-C_4 ;

R^4 es H, formilo, cicloalquilo C_3-C_7 , $-SO_3^+M^+$, $-SR^{10}$ o $-(C=W)R^{11}$ o alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 , cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 R^{12} ;

25 R^5 es H, alquil C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 ,

R^6 y R^7 se seleccionan independientemente de H, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_7 , cicloalquilalquilo C_4-C_8 y alquilocicloalquilo C_4-C_8 ; o

30 R^6 y R^7 se toman juntos con el átomo de nitrógeno al que están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contiene miembros anulares, además del átomo de nitrógeno anular de conexión, seleccionado de átomos de carbono y opcionalmente hasta un miembro anular seleccionado de O, $S(O)_n$ y NR^{13} ;

cada R^8 , R^{9a} y R^{9b} se selecciona independientemente de halógeno, alquilo C_1-C_2 o haloalquilo C_1-C_2 ; alcoxi C_1-C_2 , haloalcoxi C_1-C_2 , ciano, nitro, SCH_3 , $S(O)CH_3$ y $S(O)_2CH_3$;

R^{10} es alquilo C_1-C_6 o haloalquilo C_1-C_6 ,

35 R^{11} es alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alcoxialquilo C_2-C_7 , alquilaminoalquilo C_2-C_7 , dialquilaminoalquilo C_3-C_8 , alquil C_1-C_6 tio o alquiltioalquilo C_2-C_7 ;

cada R^{12} es independientemente cicloalquilo C_3-C_7 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquil C_1-C_4 tio, alquil C_1-C_4 sulfínico o alquil C_1-C_4 sulfonilo;

R^{13} es H, alquilo C_1-C_3 o haloalquilo C_2-C_3 ;

40 W es O o S;

M^+ es un catión;

m es 0, 1 o 2; y

n es 0, 1 o 2.

9. Un compuesto según la reivindicación 8 en donde

- Q¹ es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo, cada uno sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R³;
- Q² es fenilo, piridinilo, pirimidinilo, pirazinilo o piridazinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R³
- 5 X es O o NR⁴;
- R¹ es H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, CO₂R⁵, C(O)NR⁶R⁷, ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o alcoxialquilo C₂-C₅; o
- R¹ es un heterociclo aromático que contiene nitrógeno de cinco o seis miembros opcionalmente sustituido con hasta 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R^{9a} en miembros anulares de átomo de carbono y R^{9b} en miembros anulares de átomo de nitrógeno;
- 10 R² es CH₃, CH₂CH₃, Cl o Br;
- cada R³ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, amino, metilamino, dimetilamino, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquil C₁-C₃ tio, haloalquil C₁-C₃ tio, alquil C₁-C₃ sulfinito, haloalquil C₁-C₃ sulfinito, alquil C₁-C₃ sulfonilo, haloalquil C₁-C₃ sulfonilo y cicloalquilo C₃-C₄;
- 15 R⁴ es H, formilo, cicloalquilo C₃-C₇ o -SR¹⁰; o alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆, cada uno opcionalmente sustituido con hasta 2 R¹²;
- R⁵ es H o alquilo C₁-C₆;
- R⁶ es H o alquilo C₁-C₆;
- R⁷ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, o alquilcicloalquilo C₄-C₈; o
- 20 R⁶ y R⁷ se toman juntos con el átomo de nitrógeno al que están conectados para formar un anillo heterocíclico no aromático de cuatro a siete miembros que contienen miembros anulares, además del átomo de nitrógeno de conexión, seleccionados de átomos de carbono y hasta un miembro anular seleccionado de O y NR¹³;
- cada R^{9a} se selecciona independientemente de halógeno, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, haloalcoxi C₁-C₂, ciano y nitro;
- 25 cada R^{9b} es alquilo C₁-C₂;
- R¹⁰ es CH₃, CH₂CH₃, CF₃ o CF₂CF₃;
- cada R¹² es independientemente cicloalquilo C₃-C₇ o alcoxi C₁-C₄; y
- R¹³ es H o CH₃.
10. Un compuesto según la reivindicación 8 o 9 en donde
- 30 Q¹ es fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R³;
- Q² es fenilo o piridinilo, cada uno sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes independientemente seleccionados de R³;
- X es NR⁴;
- R¹ es H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, ciano, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆;
- R² es CH₃;
- 35 cada R³ se selecciona independientemente de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₃ y haloalcoxi C₁-C₃;
- R⁴ es H, formilo, cicloalquilo C₃-C₇ o -SR¹⁰; o alquilo C₁-C₆ sustituido con un R¹²; R¹⁰ es CH₃; y
- R¹² es ciclopropilo o -OCH₃.
11. Un compuesto según la reivindicación 1 en donde
- 40 Q¹ es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 4 con sustituyentes independientemente seleccionados de R³;
- Q² es fenilo sustituido en las posiciones 2 y 6 con sustituyentes independientemente seleccionados de R³;
- X es NR⁴;

R¹ es H;

R^{1a} es H;

R² es CH₃;

cada R³ se selecciona independientemente de F, Cl, Br y ciano; y

5 R⁴ es H.

12. El compuesto según la reivindicación 1 que se selecciona del grupo:

4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-*N*-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

10 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-(3,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina,

4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluorobenzonitrilo,

4-[[4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3-fluorobenzonitrilo,

15 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3-fluorobenzonitrilo,

3-cloro-4-[[4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo,

N,4-bis(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(2-cloro-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

20 *N*-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

3-cloro-4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo,

25 4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]amino]-3,5-difluoro-benzonitrilo,

4-[[4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-2,5-difluoro-benzonitrilo,

N-(2-cloro-4-fluorofenil)-4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

N-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

30 *N*-(2,6-dicloro-4-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

3-cloro-4-[5-[(2-cloro-4,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]-benzonitrilo,

3-cloro-4-[5-[(4-cloro-2,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]-benzonitrilo,

N-(2-bromo-4-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

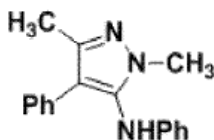
4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,4-dicloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

35 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-*N*-(2,6-dicloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

4-[[4-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3-fluorobenzonitrilo,

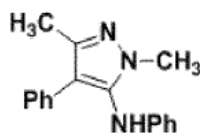
N-(2-bromo-4-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,

- 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina,
N-(4-bromo-2,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
 4-[[4-(2-bromo-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]-3,5-difluoro-benzonitrilo,
 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-*N*-(2-cloro-4,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
 5 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-*N*-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
N-(4-bromo-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
 3-bromo-4-[[4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo,
 3-cloro-4-[[4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]benzonitrilo,
N-(2,4-dicloro-6-fluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
 10 *N*-(2,6-dicloro-4-fluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2,4-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
N-(4-bromo-2,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
N-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
 15 *N*-(2-bromo-4,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-amina,
 4-[5-[(2-cloro-4,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]-3-fluorobenzonitrilo, y
 4-[5-[(4-cloro-2,6-difluorofenil)amino]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-il]-3-fluorobenzonitrilo.
13. El compuesto según la reivindicación 1 que es 4-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-1,3-dimetil-*N*-(2,4,6-trifluorofenil)-1*H*-pirazol-5-amina.
- 20 14. Una composición fungicida que comprende (a) un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13 o un compuesto seleccionado de 2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenol; 2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenol;



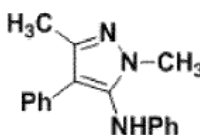
- HCl de 2-(1,3-dimetil-4-fenilpirazolil)amino-2-imidazolina; (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[4-(isoxazol-3-il)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[4-(isoxazol-3-il)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico; (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-({4-[5-(hidroximetil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi)fenoxi]propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-({4-[5-(hidroximetil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi)fenoxi]propiónico; (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metilisoxazol-3-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metilisoxazol-3-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico; (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-({4-[5-(1-hidroxi-1-metiletil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi)fenoxi]propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-({4-[5-(1-hidroxi-1-metiletil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi)fenoxi]propiónico; ácido (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico; (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico; y (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo y (b) al menos un fungicida distinto.
15. La composición según la reivindicación 14 en donde el componente (b) se selecciona de protioconazol, metconazol, pentiopirad y clorotalonilo.
16. Una composición fungicida que comprende: (a) un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13; y (b) al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.

17. Un método para controlar las enfermedades de las plantas provocadas por patógenos de plantas fúngicos que comprende aplicar a la planta o a parte de la misma, o a la semilla de la planta, una cantidad fúngicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13 o un compuesto seleccionado de 2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenol; 2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenol;



HCl de 2-(1,3-dimetil-4-fenilpirazolil)amino-2-imidazolina; (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[4-(isoxazol-3-il)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[4-(isoxazol-3-il)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico; (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-[[4-[5-(hidroximetil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi]propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-[[4-[5-(hidroximetil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi]propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metilisoxazol-3-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi]propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-[[4-[5-(1-hidroxi-1-metiletil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi]propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-[[4-[5-(1-hidroxi-1-metiletil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi]propiónico; ácido (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico; (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico; y (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo.

18. Una composición que comprende un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13 o un compuesto seleccionado de 2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenol; 2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenol;



HCl de 2-(1,3-dimetil-4-fenilpirazolil)amino-2-imidazolina; (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[4-(isoxazol-3-il)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[4-(isoxazol-3-il)-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico; (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-[[4-[5-(hidroximetil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi]propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-[[4-[5-(hidroximetil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi]propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metilisoxazol-3-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi]propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-[[4-[5-(1-hidroxi-1-metiletil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi]propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-[2,4-dicloro-5-[[4-[5-(1-hidroxi-1-metiletil)isoxazol-3-il]-1,3-dimetil-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi]propiónico; ácido (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico; (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo; ácido (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propiónico; y (2*S*)-2-(2,4-dicloro-5-[[1,3-dimetil-4-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1*H*-pirazol-5-il]oxi]fenoxi)propionato de metilo y al menos un compuesto o agente de control de plagas de invertebrados.