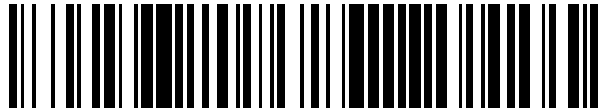


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 565 067**

51 Int. Cl.:

C07D 417/14 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

C07D 211/62 (2006.01)

C07D 419/14 (2006.01)

C07D 261/08 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **21.12.2012 E 12806489 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **16.12.2015 EP 2797899**

54 Título: **Derivados de heteroarilpiperidina y de heteroarilpiperazina como fungicidas**

30 Prioridad:

27.12.2011 EP 11195764

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

31.03.2016

73 Titular/es:

**BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH
(100.0%)
Alfred-Nobel-Strasse 10
40789 Monheim, DE**

72 Inventor/es:

**TSUCHIYA, TOMOKI;
WASNAIRE, PIERRE;
HOFFMANN, SEBASTIAN;
SEITZ, THOMAS;
HILLEBRAND, STEFAN;
BENTING, JÜRGEN;
SCHMIDT, JAN PETER y
CRISTAU, PIERRE**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 565 067 T3

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

DESCRIPCIÓN

Derivados de heteroarilpiperidina y de heteroarilpiperazina como fungicidas

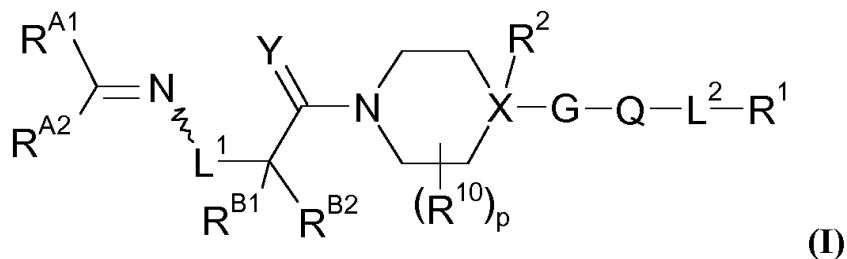
La invención se refiere a derivados de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina, a sus sales de acción agroquímica, a su uso y a procedimientos y agentes para combatir hongos nocivos fitopatógenos en y/o sobre plantas o en y/o sobre semillas de plantas, a procedimientos para la preparación de tales agentes y semillas tratadas, y a su uso para combatir hongos nocivos fitopatógenos en la agricultura, horticultura y silvicultura, en el área veterinaria, en la protección de materiales y en el área del hogar y la higiene. La presente invención se refiere además a un procedimiento para la preparación de derivados de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina.

Ya se conoce que determinados tiazoles sustituidos con heterociclos pueden usarse como agentes de tratamiento de plantas fungicidas (véanse los documentos WO 07/014290, WO 08/013925, WO 08/013622, WO 08/091594, WO 08/091580, WO 09/055514, WO 09/094407, WO 09/094445, WO 09/132785, WO 10/037479, WO 10/065579, WO 11/076510, WO 11/018415, WO 11/018401, WO 11/076699, WO 11/146182, WO 12/055837, WO 12/025557, WO 12/082580). Pero el efecto fungicida de estos compuestos no siempre es suficiente justamente con cantidades reducidas de aplicación.

Puesto que las demandas ecológicas y económicas de los modernos agentes de tratamiento de plantas aumentan constantemente, en particular con respecto al espectro de acción, toxicidad, selectividad, cantidad aplicada, formación de residuos y metodología de producción favorable y también porque se pueden producir, por ejemplo, problemas de resistencia, hay una continua labor para desarrollar nuevos agentes de tratamiento de plantas, especialmente fungicidas, que, al menos en ciertas áreas, presenten ventajas sobre agentes conocidos.

Sorprendentemente se encontró ahora que los presentes derivados de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina solucionan las tareas indicadas al menos en parte y son adecuados como agentes de tratamiento de plantas, especialmente como fungicidas.

La invención proporciona compuestos de la fórmula (I),



en la que las definiciones de restos tienen los siguientes significados:

R^{A1} es hidrógeno, halógeno, ciano, amino, -CHO, -C(=O)OH, -C(=O)NH₂, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, alquilcicloalquilo, cicloalquilalquilo, halocicloalquilalquilo, cicloalquenilo, halocicloalquenilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquilsulfinalalquilo, alquilsulfonalalquilo, alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, haloalquilaminoalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, cicloalcoxycarbonilo, cicloalquilalcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalcoxi, halocicloalcoxi, alquenilo, haloalquenilo, alquinilo, haloalquinilo, alcoxialcoxi, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilamino, dialquilamino, haloalquilamino, halodialquilamino, cicloalquilamino, alquilcarbonilamino, haloalquilcarbonilamino, alquilsulfonilamino o haloalquilsulfonilamino,

R^{A2} es hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio o R^{A2} es un fenilo no sustituido o sustituido, un heterociclo de 5 o 6 miembros sustituido dado el caso benzocondensado, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de la siguiente lista: hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi o

R^{A1} y R^{A2} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo saturado o parcialmente insaturado de tres a siete miembros que contiene dado el caso uno, dos, tres o cuatro heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno, silicio o azufre, estando dado el caso uno, dos o tres miembros de anillo de carbono seleccionados de C(=O) y C(=S) y los miembros de anillo de azufre se seleccionan de $S(=O)_s(=NR^{A3})_f$, y los miembros de anillo de silicio se seleccionan de $SiR^{A4}R^{A5}$, pudiendo el anillo estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de R^{A6} ,

R^{A3} es hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquilamino, dialquilamino, haloalquilamino o fenilo,

R^{A4} y R^{A5} son de manera igual o diferente e independientemente entre sí alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquilcicloalquilo, alquilcicloalquilalquilo, haloalquilo, alcoxi o haloalcoxi,

s es 0, 1 o 2, y

	f	es 0, 1 o 2, y
	s + f	es 0, 1 o 2,
	R ^{A6}	es halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxi o haloalcoxi en los miembros de anillo de carbono y ciano, alquilo o alcoxi en los miembros de anillo de nitrógeno,
5	L ¹	es oxígeno, azufre, -N(R ^{L1})-, -C(R ^{L2}) ₂ -, -OC(R ^{L2}) ₂ -, -SC(R ^{L2}) ₂ -, -N(R ^{L1})-C(R ^{L2}) ₂ -, estando el enlace orientado hacia la izquierda unido con el átomo de nitrógeno de la fórmula I y el enlace orientado hacia la derecha unido con el átomo de nitrógeno de la fórmula I
	R ^{L1}	es hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxi, alquiloalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilsulfonilo o haloalquilsulfonilo o los dos restos R ^{L1} y R ^{A2} forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo parcialmente insaturado de cinco o siete miembros que contiene dado el caso uno, dos o tres heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno o azufre, pudiendo el anillo estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de R ^{A6} ,
10		
	R ^{L2}	es hidrógeno, alquilo o haloalquilo,
15	R ^{B1}	es hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, formilo, alquilo, alqueno, alquino, haloalquilo, haloalqueno, haloalquino, alcoxialquilo, alquiloalquilo, alquilsulfonilalquilo, alquilsulfonilalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo o
20	R ^{B1}	es un resto fenilo, un resto naftalenilo o un resto heteroarilo de 5 o 6 miembros, que puede contener respectivamente 0, 1, 2 o 3 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista: hidrógeno, halógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo,
25	R ^{B2}	es hidrógeno, alquilo o haloalquilo, o los dos restos R ^{B1} y R ^{B2} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo saturado de tres a seis miembros,
	Y	es azufre u oxígeno,
	X	es carbono o nitrógeno,
30	R ²	es hidrógeno, alquilo, alqueno, haloalquilo, alcoxi, halógeno, ciano o hidroxilo,
	R ¹⁰	es de manera igual o diferente e independientemente entre sí hidrógeno, alquilo, alqueno, haloalquilo, alcoxi, halógeno, ciano o hidroxilo,
	p	es 0, 1 o 2,
35	G	es heteroarilo de 5 miembros, que está sustituido con Q y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido,
	Q	es heterociclo de 5 miembros saturado o total o parcialmente insaturado que está sustituido con L ² -R ¹ y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de R ⁵ ,
40	R ⁵	es de manera igual o diferente e independientemente entre sí: <u>unido con carbono del heterociclo de 5 miembros de Q:</u> oxo, tioxo, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, nitro, amino, -CHO, -C(=O)OH, -C(=O)NH ₂ , -NR ³ R ⁴ , alquilo, alqueno, alquino, haloalquilo, haloalqueno, haloalquino, cicloalquilo, halocicloalquilo, alquiloalquilo, cicloalquiloalquilo, alquiloalquiloalquilo, halocicloalquiloalquilo, cicloalquiloalquilo, alcoxialquilo, cicloalcoxialquilo, alcoxialcoxialquilo, alquiloalquilo, alquilsulfonilalquilo, alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, haloalquilaminoalquilo, cicloalquilaminoalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, cicloalcoxycarbonilo, cicloalquilalcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, cicloalquilaminocarbonilo, haloalcoxialquilo, hidroxialquilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalcoxi, halocicloalcoxi, cicloalquilalcoxi, alquenoiloxi, haloalquenoiloxi, alquinoiloxi, haloalquinoiloxi, alcoxialcoxi, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, alquilcarbonilalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, alquilsulfonilalquilo, haloalquilsulfonilalquilo, haloalquilsulfonilalquilo,
45		
50		
55		<u>unido con nitrógeno del heterociclo de 5 miembros de Q:</u> hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, haloalquilo, haloalqueno, haloalquino, cicloalquilo, halocicloalquilo, alquiloalquilo, cicloalquiloalquilo, fenilo, bencilo, alquilsulfonilo, -C(=O)H, alcoxycarbonilo o alquilcarbonilo,
	R ³	es hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo o haloalcoxycarbonilo,
60	R ⁴	es alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, haloalcoxycarbonilo o -L ⁵ R ¹ ,
	L ⁵	es -O-, -C(=O)-, S(=O) _m o CHR ²⁰ ,
	m	es 0, 1 o 2,
	L ²	es un enlace directo, -O-, -C(=O)-, -S(=O) _m -, -CHR ²⁰ - o -NR ²¹ -,
65	R ²⁰	es hidrógeno, alquilo o haloalquilo,
	R ²¹	es hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo o haloalcoxycarbonilo,

1	R ¹	es fenilo, bencilo, naftalenilo, un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido dado el caso benzocondensado, que está sustituido al menos una vez con un sustituyente Z ⁴ y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de Z ⁴ y dado el caso de Z ¹ o
5	R ¹	es un anillo carbocíclico de 5 a 8 miembros no aromático (saturado o bien parcialmente insaturado), es un resto heterociclilo no aromático de 5, 6 o 7 miembros o es un anillo bicíclico heterocíclico o carbocíclico de 8 a 11 miembros, que está sustituido respectivamente al menos una vez con un sustituyente Z ⁴ y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de Z ⁴ y dado el caso de oxo, tioxo o Z ¹ ,
10	Z ¹	es <u>unido con carbono de R¹:</u> hidrógeno, halógeno, hidroxilo, amino, nitro, ciano, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, hidroxialquilo, alcoxialquilo, alquilocicloalquilo, alcoxi, alquilocicloalquialquilo, alquiltio, haloalquiltio, haloalcoxi, alquilcarboniloxi, alquilamino, dialquilamino, cicloalquialquilo, cicloalquilocicloalquilo, alquilcarbonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilsulfonilo, alcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, trialquilsililo, y cicloalquilamino, cicloalquenilo, halocicloalquenilo, cicloalcoxialquilo, halocicloalcoxi, cicloalquiltio, cicloalcoxi, cicloalquialcoxi, cicloalquilamino, halocicloalquialquilo, cicloalquilcarbonilo, cicloalquilsulfonilo o -L ³ Z ³ ,
15		<u>unido con nitrógeno de R¹:</u> alquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo o alcoxi,
20	L ³	es un enlace directo, -C(=O)-, azufre, oxígeno, -NR ²¹ -, -C(=S)-, -S(=O) _m -, -CHR ²⁰ -, -CHR ²⁰ -CHR ²⁰ -, -CR ²⁰ =CR ²⁰ -, -OCHR ²⁰ -, -CHR ²⁰ O-,
25	Z ³	es un resto fenilo, un resto naftalenilo o un resto heteroarilo de 5 o 6 miembros, que puede contener respectivamente 0, 1, 2 o 3 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista: <u>sustituyentes en el carbono:</u> halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, amino, -SH, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, alcoxialquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalcoxi, halocicloalcoxi, alqueniloxi, alquiniloxi, alcoxialcoxi, alquilamino, dialquilamino, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, trisililalquilo o fenilo, <u>sustituyentes en el nitrógeno:</u> hidrógeno, -C(=O)H, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, alquilocicloalquilo, cicloalquialquilo, alcoxialquilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, fenilsulfonilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, haloalcoxycarbonilo, cicloalcoxycarbonilo, -C(=O)NR ¹³ R ¹⁴ , fenilo o bencilo
30		
35	R ¹³ y R ¹⁴	son de manera igual o diferente e independientemente entre sí hidrógeno, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, cicloalquilo, bencilo o fenilo,
40	Z ⁴	es -SH, -C(=O)H, haloalcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquilsulfonilalquilo, alquilaminoalquilo, haloalquilaminoalquilo, cicloalquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, alquilsulfonilalquilo, alqueniloxi, alquiniloxi, haloalqueniloxi, haloalquiniloxi, alcoxialcoxi, haloalquilcarboniloxi, cicloalquilcarboniloxi, alquilsulfonilamino, haloalquilsulfonilamino, alcoxialcoxialquilo, alquilcarbonilalcoxi, cicloalquilaminocarbonilo, cicloalquilalcoxycarbonilo, haloalquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo C ₄ -C ₆ , alcoxi C ₅ -C ₆ , haloalcoxi C ₅ -C ₆ , alquiltio C ₅ -C ₆ , haloalquiltio C ₅ -C ₆ , haloalquilsulfonilo C ₅ -C ₆ , haloalquilsulfonilo C ₅ -C ₆ , -NHCN, -SO ₂ NHCN, -C(=O)OH, -C(=O)NH ₂ , -C(=S)NR ¹³ R ¹⁴ , -C(=O)NHCN, cianoalquilo, alquenilcarboniloxi, alcoxialquiltio, haloalquenilcarboniloxi, alcoxycarbonilalquilo, alcoxialquinilo, alquiniltio, halocicloalquilcarboniloxi, alquenilamino, alquilamino, haloalquilamino, cicloalquialquilamino, alcoxiamino, haloalcoxiamino, alquilcarbonilamino, haloalquilcarbonilamino, alcoxycarbonilamino, alquilcarbonil(alquil)amino, haloalquilcarbonil(alquil)amino, alcoxycarbonil(alquil)amino, -NR ¹³ SO ₂ Z ³ , alqueniltio, haloalcoxycarbonilo, alcoxialquilcarbonilo, -SF ₅ , haloalcoxycarbonilamino, -NHC(=O)H, di(haloalquil)aminoalquilo, halocicloalqueniloxialquilo, alcoxi(alquil)aminocarbonilo, haloalquilsulfonilaminocarbonilo, alcoxycarbonilalcoxi, alquilaminotiocarbonilamino, cicloalquilalquilaminoalquilo, -C(=NOR ⁷)R ⁸ , alquiltiocarbonilo, cicloalqueniloxialquilo, alcoxialcoxycarbonilo, dialquilaminotiocarbonilamino, alquilsulfonilaminocarbonilo, haloalcoxialcoxi, halocicloalcoxialquilo, -N=C(R ⁹) ₂ , dialquilaminocarbonilamino, alcoxialquenilo, alcoxialcoxi, alquiltiocarboniloxi, haloalcoxialcoxi, -OSO ₂ Z ³ , haloalquilsulfoniloxi, alquilsulfoniloxi, alcoxialquilo, di(haloalquil)amino, -SO ₂ NR ³ R ⁴ , -O(C=S)NR ¹³ R ¹⁴ , -O(C=S)SR ⁹ , dialcoxialquilo, alquilaminocarbonilamino, haloalcoxialquilo, alquilaminocarbonilalquilamino, trialquilsililalquilamino, trialquilsililoxi, trialquilsililalquilamino, ciano(alcoxi)alquilo, dialquiltioalquilo, -O(C=O)H, -SCN, alcoxilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, halocicloalcoxycarbonilo, alquilocicloalquilcarbonilo, halocicloalquilcarbonilo, alqueniloxycarbonilo, alquiniloxycarbonilo, cianoalcoxycarbonilo, alquiltioalcoxycarbonilo, alquinilcarboniloxi, haloalquinilcarboniloxi, cianocarboniloxi, cianoalquilcarboniloxi, cicloalquilsulfoniloxi, cicloalquialquilsulfoniloxi, halocicloalquilsulfoniloxi, alquilsulfoniloxi, alquilsulfoniloxi, cianoalquilsulfoniloxi, haloalquilsulfoniloxi, haloalquilsulfoniloxi, alquinilcicloalquilo, cianoalqueniloxi, cianoalquiniloxi, alcoxycarboniloxi, alqueniloxycarboniloxi, alquiniloxycarboniloxi, alcoxialquilcarboniloxi, -OC(=O)NR ¹³ R ¹⁴ , -
45		
50		
55		
60		
65		

- Z^4 $OC(=O)NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$ o $-L^4Z^3$ o es alquilo, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- 5 ciano, alcoxicarbonilo, $-C(=N-R^9)R^8$, $-C(=N-NR^{13}R^{14})R^8$, alquilcarbonilamino, haloalquilcarbonilamino, dialquilcarbonilamino, alquilcarboniloxi, $-C(=O)H$, benciloxi, benzoiloxi, $-C(=O)OH$, alqueniloxi, alquiniloxi, haloalqueniloxi, haloalquiniloxi, halocicloalcoxi, alcoxi-amino, alqueniltio, alquiniltio, cicloalquiltilio, haloalcoxi-amino, haloalquiltilio, alquenilsulfonilo, alquinilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquenilsulfonilo, alquinilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alcoxycarboniloxi, alquilcarboniloxi, cicloalquilcarboniloxi, haloalquilcarboniloxi, haloalquenilcarboniloxi, 10 $-SCN$, alquilaminocarboniloxi, alquilcarbonil(alquil)amino, alcoxicarbonil(alquil)amino, alquilaminocarbonilamino, alquilsulfoniloxi, haloalcoxicarbonilamino, haloalquilcarbonil(alquil)amino, haloalquilsulfoniloxi, alquilsulfonilamino, haloalquilsulfonilamino, alquiltiocarboniloxi, cianoalcoxi, cicloalquilalcoxi, benciloxialcoxi, alcoxihaloalcoxi, alcoxialquiltilio, alcoxialquilsulfonilo, alcoxialquilsulfonilo, alcoxialquilcarboniloxi, cicloalcoxialcoxi, haloalcoxialcoxi, haloalcoxihaloalcoxi, haloalcoxialcoxi, alcoxycarbonilalcoxi, alquilcarbonilalcoxi, alquiltioalcoxi, dialquilaminocarbonilamino, alcoxialcoxialcoxi, trialquilsililoxi, trialquilsililalquiniloxi, alquinilcicloalquilo, cicloalquilalquiniloxi, alcoxycarbonilalquiniloxi, arilalquiniloxi, alquilaminocarbonilalquiniloxi, dialquilaminocarbonilalquiniloxi, alquenilcarboniloxi, alquinilcarboniloxi, haloalquinilcarboniloxi, cianoalquilcarboniloxi, cicloalquilsulfoniloxi, cicloalquilalquilsulfoniloxi, halocicloalquilsulfoniloxi, alquenilsulfoniloxi, alquinilsulfoniloxi, 20 cianoalquilsulfoniloxi, haloalquenilsulfoniloxi, haloalquinilsulfoniloxi, dialquilaminocarboniloxi, haloalquilaminocarboniloxi, N-alquil-N-haloalquilaminocarboniloxi, alqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, haloalquiniloxicarbonilo, cianoalquiloxicarbonilo, alqueniloxisulfonilo, alquiniloxisulfonilo o
- Z^4 es alquenilo, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- 25 trialquilsililo, cicloalquilo, ciclopropilidenilo, alcoxi, trialquilsililoxi, alquilcarboniloxi o
- Z^4 es alquinilo, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- 30 cicloalquilo, ciclopropilidenilo o
- Z^4 es alcoxi, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- 35 alcoxycarbonilo, cicloalcoxi, alquilcarboniloxi, $-O(C=O)H$, alquiltio, hidroxialquilo, trialquilsililo, cicloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, benciloxi, alcoxialcoxi, alquilsulfonilo, ciano o
- Z^4 es alqueniloxi, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista: cicloalquilo, hidroxi, alcoxi, alqueniloxi, alquiniloxi, haloalcoxi, haloalqueniloxi, haloalquiniloxi, cicloalcoxi, ciclohaloalcoxi, alcoxycarbonilo, haloalcoxycarbonilo, cicloalcoxycarbonilo, alqueniloxicarbonilo, haloalqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, haloalquiniloxicarbonilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, ciclohaloalquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, haloalquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, haloalquinilcarbonilo o
- 40 Z^4 es alquiniloxi, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- 45 L^4 cicloalquilo, alcoxycarbonilo, $-Z^3$, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, R^7 es $-C(=O)O-$, $-C(=O)NR^{13}$, $-OC(=O)-$, $-NR^{13}C(=O)-$, $-OCH_2C\equiv C-$ o $-OCH_2CH=CH-$, R^8 es hidrógeno, alquilo, haloalquilo, bencilo o Z^3 , es hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilalquilo, cicloalquilo, alquilcicloalquilo, haloalquilcicloalquilo, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, bencilo o fenilo, R^9 es alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, cicloalquilo, bencilo o fenilo, R^{11} es alquenilo, alquinilo, alcoxialquilo, cianoalquilo, formilo, haloalquilo, fenilo, alquilcarbonilo, cicloalcoxycarbonilo, alcoxycarbonilo, alqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, haloalquilcarbonilo, haloalcoxycarbonilo, cicloalcoxycarbonilo, cicloalquilcarbonilo, dialquilaminocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, R^{12} es alquenilo, alquinilo, alcoxialquilo, cianoalquilo, formilo, hidrógeno, haloalquilo, fenilo, alquilcarbonilo, cicloalcoxycarbonilo, alcoxycarbonilo, alqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, haloalquilcarbonilo, haloalcoxycarbonilo, cicloalcoxycarbonilo, cicloalquilcarbonilo, dialquilaminocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo,

y sales, complejos metálicos y N-óxidos de los compuestos de la fórmula (I).

Otro objeto es el uso de los compuestos de la fórmula (I) como fungicidas.

60 Los derivados de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina de la fórmula (I) de acuerdo con la invención y sus sales, complejos metálicos y N-óxidos son muy adecuados para combatir hongos nocivos fitopatógenos. Los compuestos de la invención antes mencionados muestran ante todo una fuerte acción fungicida y pueden usarse tanto en la protección de plantas, en el área del hogar y la higiene y en la protección de materiales.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden presentarse tanto en forma pura como también como mezclas de

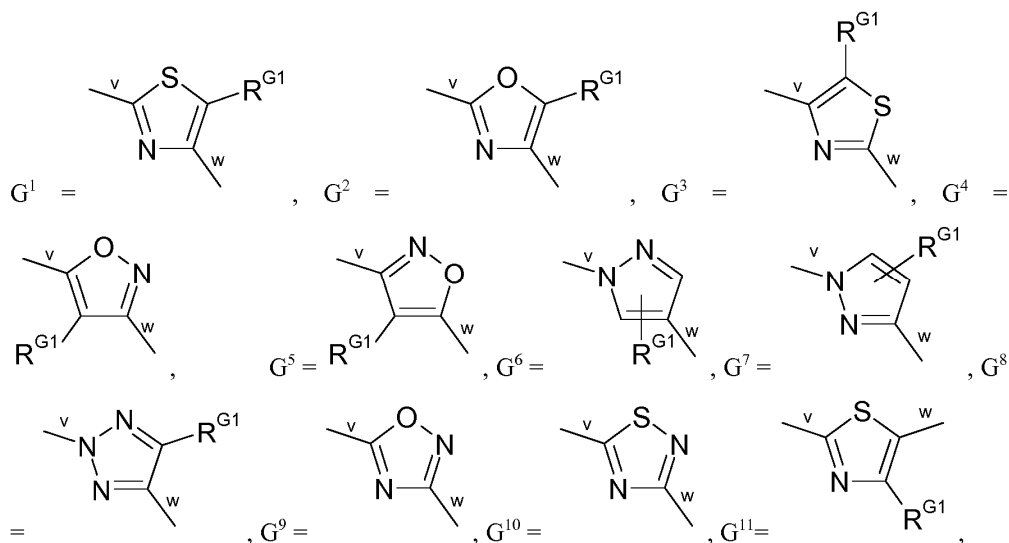
diferentes formas isoméricas posibles, especialmente de estereoisómeros, como isómeros E y Z, isómeros treo y eritro, y también isómeros ópticos, como isómeros R y S o atropiisómeros, sin embargo dado el caso también en forma de tautómeros. Se reivindican los E- y Z-isómeros, los isómeros treo- y eritro, y también los isómeros ópticos, mezclas discretivas de estos isómeros, y las posibles formas tautómeras.

5 Las definiciones de restos de los compuestos de la invención de la fórmula (I) preferentemente, muy preferentemente y de manera muy especialmente preferente tienen las siguientes definiciones:

- 10 R^{A1} preferentemente es hidrógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , haloalquenilo C_2-C_4 , haloalquinilo C_2-C_4 , alcohalquilo C_2-C_4 , alquiltioalquilo C_2-C_4 , alquilcarbonilo C_1-C_3 , haloalquilcarbonilo C_1-C_3 , alcocarbonilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alqueniloxi C_2-C_4 , haloalqueniloxi C_2-C_4 , alquilalquinoxilo C_2-C_4 , haloalquilalquinoxilo C_2-C_4 , alcocalcoxi C_2-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_4 , haloalquilamino C_1-C_4 , halodialquilamino C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 y de manera especialmente preferente es hidrógeno, metilo, etilo, propan-2-ilo, *t*-butilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoximetilo, etoximetilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo o es ciclopropilo,
- 15 R^{A2} preferentemente es hidrógeno, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 o
- R^{A2} preferentemente es un fenilo no sustituido o sustituido, un heterociclilo de 5 o 6 miembros sustituido dado el caso benzocondensado, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de la siguiente lista: hidroxilo, ciano, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 ,
- 20 R^{A2} de manera especialmente preferente es metilo, etilo, propilo, iso-propilo, butilo, *terc*-butilo, *iso*-butilo, 1,3-benzodioxolilo o un fenilo sustituido o no sustituido donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de la siguiente lista: hidroxilo, ciano, flúor, cloro, bromo, metilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoxilo, etoxilo, difluorometoxilo, trifluorometoxilo,
- 25 R^{A1} y R^{A2} preferentemente forman, junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo de tres a seis miembros saturado o parcialmente insaturado que contiene dado el caso uno, dos, tres o cuatro heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno o azufre, donde dado el caso un miembro de anillo de carbono se selecciona de $C(=O)$ y $C(=S)$, pudiendo el anillo contener uno, dos o tres sustituyentes o ninguno, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de R^{A6} ,
- 30 R^{A6} preferentemente es halógeno, ciano, alquilo C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 o haloalcoxi C_1-C_2 en los miembros de anillo de carbono y es ciano, alquilo C_1-C_2 o alcoxi C_1-C_2 en los miembros de anillo de nitrógeno,
- L^1 preferentemente es oxígeno, azufre, $-N(R^{L1})-$,
- 35 R^{L1} preferentemente es hidrógeno, alquilo C_1-C_2 , haloalquilo C_1-C_2 , $-C(=O)CH_3$, $-C(=O)CF_3$, $C(=O)OCH_3$ o los dos restos R^{L1} y R^{A2} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo parcialmente insaturado de cinco o siete miembros que contiene dado el caso uno, dos o tres heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno o azufre, pudiendo el anillo estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de R^{A6} ,
- 40 R^{B1} preferentemente es hidrógeno, ciano, hidroxilo, alquilo C_1-C_3 , alquenilo C_2-C_3 , alquinilo C_2-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , haloalquenilo C_2-C_3 , haloalquinilo C_2-C_3 , alquilcarbonilo C_2-C_3 , haloalquilcarbonilo C_2-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 , alquiltio C_1-C_3 , haloalquiltio C_1-C_3 , alquilcarboniloxi C_1-C_2 , haloalquilcarboniloxi C_1-C_2 o
- R^{B1} preferentemente es un resto fenilo, un resto naftalenilo o un resto heteroarilo de 5 o 6 miembros, que puede contener respectivamente 0, 1, 2 o 3 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista: hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 ,
- 45 R^{B2} preferentemente es hidrógeno o alquilo C_1-C_2 , y de manera especialmente preferente es hidrógeno,
- Y preferentemente es azufre u oxígeno, y de manera especialmente preferente es oxígeno,
- X preferentemente es carbono o nitrógeno, y de manera especialmente preferente es carbono,
- 50 R^2 preferentemente es hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , halógeno, ciano o hidroxilo, y de manera especialmente preferente es hidrógeno, flúor, metoxilo o hidroxilo, y de manera muy especialmente preferente es hidrógeno,
- R^{10} preferentemente es de manera igual o diferente e independientemente entre sí hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_2 , alcoxi C_1-C_2 , halógeno, ciano o hidroxilo, y de manera especialmente preferente es hidrógeno, flúor, metoxilo o hidroxilo,

p preferentemente es 0 a 1, y de manera especialmente preferente es 0,

G preferentemente es

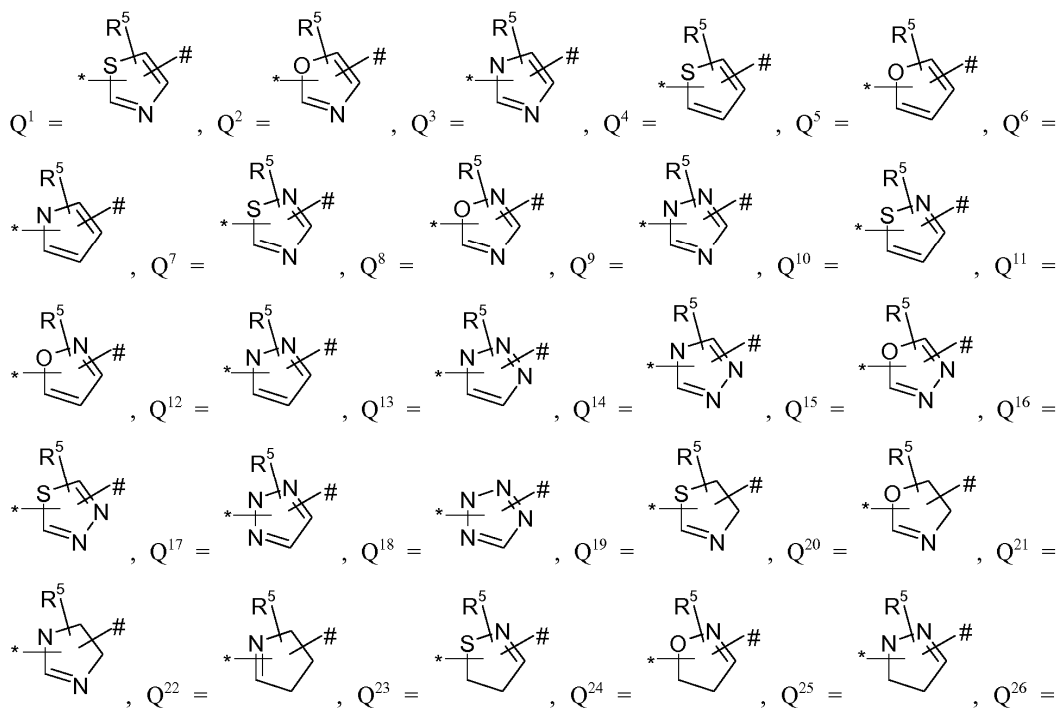


5 donde el enlace que está identificado con "v" está unido directamente con X y donde el enlace que está identificado con "w" está unido directamente con Q,

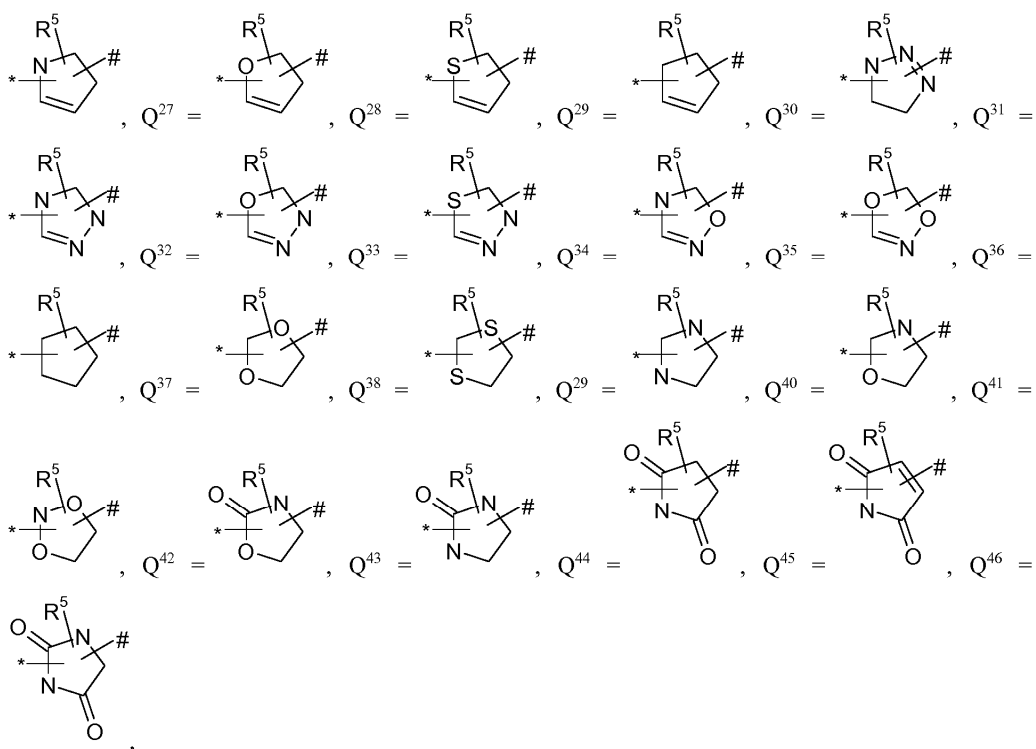
G de manera especialmente preferente es G^1 , G^2 o G^3 , y de manera muy especialmente preferente es G^1 ,

R^{G1} preferentemente es hidrógeno, alquilo C_1 - C_3 o halógeno y de manera especialmente preferente es hidrógeno,

Q preferentemente es



10

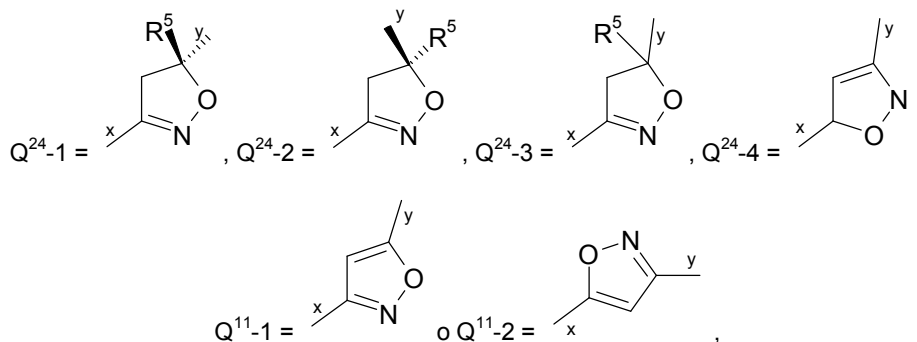


donde el enlace que está identificado con “*” está unido directamente con G o L², y donde el enlace que está identificado con “#” está unido directamente con L² o G o donde el enlace que está identificado con “*” está unido directamente con L², y simultáneamente el enlace que está identificado con “#” está unido directamente con G,

5

Q

de manera especialmente preferente es



donde el enlace que está identificado con “x” está unido directamente con G, y donde el enlace que está identificado con “y” está unido directamente con L²,

10

R⁵

preferentemente es de manera igual o diferente e independientemente entre sí

unido con carbono del heterociclilo de 5 miembros de Q:

hidrógeno, halógeno, ciano, -NR³R⁴, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, halocicloalqueno C₃-C₈, alquil-C₁-C₄-cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquil-C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, cicloalcoxi-C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄-alquil-C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₈, halocicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquil-C₃-C₈-alcoxi C₁-C₄, alqueniloxi C₂-C₆, haloalqueniloxi C₂-C₆, alquiniloxi C₂-C₆, haloalquiniloxi C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alcoxi C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₁-C₆, haloalquilcarboniloxi C₁-C₆, cicloalquilcarboniloxi C₃-C₈, alquilcarbonil-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₈, tri(alquil C₁-C₄)silo,

20

unido con nitrógeno del heterociclilo de 5 miembros de Q: hidrógeno, -C(=O)H, alquilo C₁-C₃, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆ o bencilo,

R⁵

de manera especialmente preferente es hidrógeno, ciano, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o metoximetilo o

- R⁵ de manera muy especialmente preferente es hidrógeno,
- R³ preferentemente es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₄ o haloalcoxicarbonilo C₁-C₄,
- R⁴ preferentemente es alquilo C₁-C₃ o -L⁵R¹,
- 5 L⁵ preferentemente es -C(=O)- o S(=O)₂,
- L² preferentemente es un enlace directo, -O-, -C(=O)-, -S(=O)₂-, -CHR²⁰- o -NR²¹-, y de manera especialmente preferente es un enlace directo, -C(=O)-, -CHR²⁰- o -NR²¹-, y de manera muy especialmente preferente es un enlace directo,
- m preferentemente es 0 o 2,
- 10 R²⁰ preferentemente es hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, y de manera especialmente preferente es hidrógeno, metilo, etilo, trifluorometilo,
- R²¹ preferentemente es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, haloalquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₆ o haloalcoxicarbonilo C₁-C₆, y de manera especialmente preferente es hidrógeno o metilo,
- 15 R¹ preferentemente es cicloalqueno C₅-C₆ o cicloalquilo C₃-C₈, donde el cicloalqueno C₅-C₆ o cicloalquilo C₃-C₈ respectivamente está sustituido al menos una vez con un sustituyente Z⁴ y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de Z⁴ y dado el caso de Z¹⁻¹, y de manera especialmente preferente es ciclopentenilo, ciclohexenilo, ciclopentilo, ciclohexilo o cicloheptilo sustituido que respectivamente pueden contener 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan al menos una vez de Z⁴ y dado el caso de la siguiente lista: metilo, etilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, etinilo, metilcarboniloxi, etilcarboniloxi, metiltio, etiltio o trifluorometiltio o
- 20
- R¹ preferentemente es fenilo, que está sustituido al menos una vez con un sustituyente Z⁴ y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de Z⁴ y dado el caso de Z¹⁻² y de manera especialmente preferente es fenilo que puede contener 1, 2 o 3 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan al menos una vez de Z⁴ y dado el caso de la siguiente lista: flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, *n*-propilo, 1-metiletilo, *n*-butilo, 1,1-dimetiletilo, 1,2-dimetiletilo, etenilo, etinilo, trifluorometilo, difluorometilo, triclorometilo, diclorometilo, ciclopropilo, metoxi, etoxi, *n*-propoxi, 1-metiletoxilo, 1,1-dimetiletoxilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, *n*-propoxicarbonilo, 1-metiletoxicarbonilo, 1,1-dimetiletoxicarbonilo, 1-metilcarboniloxi, metiltio, etiltio, metilsulfonilo o -L³R³, y de manera muy especialmente preferente es fenilo que contiene 1, 2 o 3 sustituyentes, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de la siguiente lista:
- 25
- 30 formilo, metoximetoxi, 2-metoxietoxi, aliloxi, 2-fluoroprop-2-en-1-iloxi, 2-cloroprop-2-en-1-iloxi, 3-cloroprop-2-en-1-iloxi, 2-bromoprop-2-en-1-iloxi, 2-metilprop-2-en-1-iloxi, 3,3-dicloroprop-2-en-1-iloxi, 3,3-dicloro-2-fluoroprop-2-en-1-iloxi, but-2-en-1-iloxi, but-3-en-2-iloxi, but-3-en-1-iloxi, 3-clorobut-2-en-1-iloxi 3-metilbut-2-en-1-iloxi, 4,4,4-trifluorobut-2-en-1-iloxi, prop-2-in-1-iloxi, 3-cloroprop-2-in-1-iloxi, 3-bromoprop-2-in-1-iloxi, but-2-in-1-iloxi, pent-2-in-1-iloxi, 2-fluoro-2-metilpropanoiloxi, 3,3,3-trifluoropropanoiloxi, ciclopropilcarboniloxi, ciclohexilcarboniloxi, (1-clorociclopropil)carboniloxi, but-2-enoiloxi, acriloiloxi, benzoiloxi, 2-fluorobenzoiloxi, 3-fluorobenzoiloxi, 4-fluorobenzoiloxi, cianometoxi, metilsulfoniloxi, etilsulfoniloxi, trifluorometilsulfoniloxi, ciclopropilsulfoniloxi, 2-metoxietoximetilo, aliloximetilo, prop-2-in-1-iloximetilo, metilsulfonilmetilo, metilcarbonilaminometilo, metilsulfonilaminometilo, -C(=NOH)H, -C(=NOCH₃)H, -C(=NOCH₂CH₃)H, -C(=NOCH(CH₃)CH₃)H, -C(=NOH)CH₃, -C(=NOCH₃)CH₃, -C(=NOCH₂CH₃)CH₃, -C(=NOCH(CH₃)CH₃)CH₃, dimetilaminosulfonilo, C(=O)NH₂, etilaminosulfonilo, trimetilsililetinilo, dietilaminosulfonilo, metilaminosulfonilo, trimetilsililoxi, trimetilsililprop-2-in-1-iloxi, trifluorometilamino, dimetilaminocarbonilamino, -C(=O)OH, 1,1-dimetiletilcarbonilamino, clorometilcarbonilamino, trifluorometilcarbonilamino, 1,1-dimetiletoxicarbonilamino, etilcarbonilamino, 1-metiletoxicarbonilamino, trifluorometilcarbonilamino, metilcarbonilamino, metoxicarbonilamino, etoxicarbonilamino, *iso*-propoxicarbonilamino, 1-metiletilcarbonilamino, metilsulfonilamino o fenilsulfonilamino, 3-bromoprop-2-en-1-iloxi, y sustituyentes adicionales seleccionados dado el caso de la siguiente lista: flúor, cloro, metilo, trifluorometilo, metoxi o
- 35
- 40
- 45
- 50
- 55 R¹ preferentemente es naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, indan-1-ilo, indan-2-ilo, indan-3-ilo, indan-4-ilo o indan-5-ilo,

donde estos respectivamente están sustituidos al menos una vez con un sustituyente Z^4 y por lo demás pueden estar sustituidos o no sustituidos, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de Z^4 y dado el caso de Z^{1-3} ,

5 R^1 de manera especialmente preferente es naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, indan-1-ilo, indan-2-ilo, indan-3-ilo, indan-4-ilo o indan-5-ilo, donde estos respectivamente están sustituidos al menos una vez con un sustituyente Z^4 y por lo demás otros sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de Z^4 y dado el caso pueden contener sustituyentes del grupo que se compone de metilo, metoxi, ciano, flúor, cloro, bromo y yodo, donde la variante especialmente preferente contiene como máximo tres sustituyentes en total o

10 R^1 preferentemente es un resto heteroarilo de 5 o 6 miembros, donde este está sustituido al menos una vez con un sustituyente Z^4 y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes en el carbono independientemente entre sí se seleccionan de Z^4 y dado el caso de Z^{1-4} , y los sustituyentes en el nitrógeno independientemente entre sí se seleccionan de Z^2 ,

15 R^1 de manera especialmente preferente es furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, pirrol-1-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-4-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo o pirazin-2-ilo, que respectivamente pueden contener 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan al menos una vez de Z^4 y dado el caso de la siguiente lista:
 20 sustituyentes en el carbono: flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, hidroxilo, amino, metilo, etilo, *n*-propilo, 1-metiletilo, *n*-butilo, 1,1-dimetiletilo, 1,2-dimetiletilo, etenilo, etinilo, trifluorometilo, difluorometilo, triclorometilo, diclorometilo, ciclopropilo, metoxi, etoxi, *n*-propoxi, 1-metiletoxi, 1,1-dimetiletoxi, metilcarbonilo, etilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, *n*-propoxicarbonilo, 1-metiletoxicarbonilo, 1,1-dimetiletoxicarbonilo, metilcarbonilo, metiltio, etiltio o metilsulfonilo,
 25 sustituyentes en el nitrógeno: metilo, etilo, *n*-propilo, -C(=O)H, metilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, clorometilcarbonilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, fenilsulfonilo, fenilo o 2-propinilo o

30 R^1 preferentemente es heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido benzocondensado que está sustituido con al menos un sustituyente Z^4 y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes en el carbono independientemente entre sí se seleccionan de Z^{1-5} , y los sustituyentes en el nitrógeno independientemente entre sí se seleccionan de Z^2 y de manera especialmente preferente son indol-1-ilo, indol-2-ilo, indol-3-ilo, indol-4-ilo, indol-5-ilo, indol-6-ilo, indol-7-ilo, bencimidazol-1-ilo, bencimidazol-2-ilo, bencimidazol-4-ilo, bencimidazol-5-ilo, indazol-1-ilo, indazol-3-ilo, indazol-4-ilo, indazol-5-ilo, indazol-6-ilo, indazol-7-ilo, indazol-2-ilo, 1-benzofuran-2-ilo, 1-benzofuran-3-ilo, 1-benzofuran-4-ilo, 1-benzofuran-5-ilo, 1-benzofuran-6-ilo, 1-benzofuran-7-ilo, 1-benzotiofen-2-ilo, 1-benzotiofen-3-ilo, 1-benzotiofen-4-ilo, 1-benzotiofen-5-ilo, 1-benzotiofen-6-ilo, 1-benzotiofen-7-ilo, 1,3-benzotiazol-2-ilo, 1,3-benzotiazol-4-ilo, 1,3-benzotiazol-5-ilo, 1,3-benzotiazol-6-ilo, 1,3-benzotiazol-7-ilo, 1,3-benzoxazol-2-ilo, 1,3-benzoxazol-4-ilo, 1,3-benzoxazol-5-ilo, 1,3-benzoxazol-6-ilo, 1,3-benzoxazol-7-ilo, quinolin-2-ilo, quinolin-3-ilo, quinolin-4-ilo, quinolin-5-ilo, quinolin-6-ilo, quinolin-7-ilo, quinolin-8-ilo, isoquinolin-1-ilo, isoquinolin-3-ilo, isoquinolin-4-ilo, isoquinolin-5-ilo, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo o isoquinolin-8-ilo, que respectivamente pueden contener hasta dos sustituyentes, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de la siguiente lista:
 35 sustituyentes en el carbono: flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, metoxi,
 40 sustituyentes en el nitrógeno: metilo, etilo, *n*-propilo, -C(=O)H, metilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, clorometilcarbonilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, fenilsulfonilo, fenilo o 2-propinilo o

45 R^1 preferentemente es heterociclilo C_5-C_{15} que en el carbono está sustituido al menos una vez con un sustituyente Z^4 y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes independientemente entre sí dado el caso se seleccionan en el carbono de Z^{1-6} y los sustituyentes en el nitrógeno independientemente entre sí se seleccionan de Z^2 ,

50 R^1 de manera especialmente preferente es piperidin-1-ilo, piperidin-2-ilo, piperidin-3-ilo, piperidin-4-ilo, piperazin-1-ilo, piperazin-2-ilo, piperazin-3-ilo, morfolin-1-ilo, morfolin-2-ilo, morfolin-3-ilo, tetrahidropiran-2-ilo, tetrahidropiran-3-ilo, tetrahidropiran-4-ilo, 1,2,3,4-tetrahidroquinolin-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidroisoquinolin-2-ilo, 1,2,3,4-tetrahidrochinoxalin-1-ilo, indolin-1-ilo, isoindolin-2-ilo, decahidroquinolin-1-ilo o decahidroisoquinolin-2-ilo, que respectivamente pueden contener 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan al menos una vez de Z^4 y dado el caso de la siguiente lista:
 55 sustituyentes en el carbono: flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, metoxi,

60

sustituyentes en el nitrógeno: metilo, etilo, *n*-propilo, -C(=O)H, metilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, clorometilcarbonilo, metilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, fenilsulfonilo, fenilo o 2-propinilo,

- 5 Z^{1-1} son de manera igual o diferente independientemente entre sí hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, hidroxi, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquilcarboniloxi C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆ o haloalquiltio C₁-C₆,
- 10 Z^{1-2} es hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, amino, nitro, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, halocicloalquenilo C₃-C₈, alcoxi-C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₈, halocicloalcoxi C₃-C₈, alcoxicarbonilo C₁-C₆, alcoxí-C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₈, halocicloalcoxi C₃-C₈, alquilcarboniloxi C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, cicloalquilsulfonilo C₃-C₈, tri(alquil C₁-C₄)sililo o -L³Z³,
- 15 Z^{1-3} y Z^{1-5} son de manera igual o diferente independientemente entre sí hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₁-C₆, alquil-C₁-C₆-carboniltio, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ o haloalquilsulfonilo C₁-C₄,
- 20 Z^{1-4} es hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxi, amino, nitro, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, halocicloalquenilo C₃-C₈, alcoxi-C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₈, alcoxicarbonilo C₁-C₆, alcoxí-C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₈, halocicloalcoxi C₃-C₈, alquilcarboniloxi C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆ o cicloalquilsulfonilo C₃-C₈,
- 25 Z^{1-6} son de manera igual o diferente independientemente entre sí hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₆, alquilcarboniloxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆ o fenilo,
- 30 Z^2 es de manera igual o diferente e independientemente entre sí hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, fenilo, bencilo, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₆, haloalcoxicarbonilo C₁-C₆, fenilsulfonilo, alquilsulfonilo C₁-C₄, -C(=O)H, haloalquilcarbonilo C₁-C₃ o alquilcarbonilo C₁-C₃,
- 35 L^3 preferentemente es un enlace directo, -CH₂-, azufre, oxígeno o -(S=O)₂- y de manera especialmente preferente es un enlace directo,
- 40 Z^3 preferentemente es un resto fenilo, naftalenilo o un resto heteroarilo de 5 o 6 miembros, que puede contener hasta dos sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
halógeno, ciano, nitro, hidroxi, amino, -SH, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₆, haloalquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxicarbonilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alqueniloxi C₂-C₆, alquiniloxi C₂-C₆, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄ o alquilamino C₁-C₄, di(alquil-C₁-C₄)amino,
- 45 sustituyentes en el nitrógeno: hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, fenilo, bencilo, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alcoxicarbonilo C₁-C₆, haloalcoxicarbonilo C₁-C₆, fenilsulfonilo, alquilsulfonilo C₁-C₄, -C(=O)H o alquilcarbonilo C₁-C₃, y
- 50 Z^3 de manera especialmente preferente es un resto fenilo, que puede contener hasta dos sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
cloro, bromo, yodo, flúor, ciano, nitro, hidroxi, amino, -SH, metilo, etilo, *n*-propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, etenilo, propen-2-ilo, etinilo, propin-2-ilo, trifluorometilo, difluorometilo, metoximetilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, *n*-propoxicarbonilo, 1-metiletoxicarbonilo, 1,1-dimetiletoxicarbonilo, metoxi, etoxi, *n*-propoxi, 1-metiletoxi, 1,1-dimetiletoxi, trifluorometoxi, eteniloxi, 2-propeniloxi, etiniloxi, 2-propiniloxi, metiltio, etiltio, trifluorometiltio, metilsulfonilo, etilsulfonilo, propiltionilo, 1-metiletiltio, trifluorometilsulfonilo, metilamino, etilamino, *n*-propilamino, 1-metiletilamino, 1,1-dimetiletilamino o dimetilamino o
- 55 Z^3 de manera especialmente preferente es naftalenilo,
- R^{13} y R^{14} preferentemente son de manera igual o diferente independientemente entre sí hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, bencilo o fenilo, y de manera

especialmente preferente son hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, 1-metiletilo, *n*-butilo o 1,1-dimetiletilo,

Z^4 preferentemente es -SH, -C(=O)H, alcoxi-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquiltioalquilo C₁-C₆, alquilsulfinil-C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilsulfonyl-C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₄-C₆, haloalquilcarbonilo C₁-C₆, cicloalcoxycarbonilo C₃-C₆, cicloalquil-C₃-C₆-alcoxycarbonilo C₁-C₆, cicloalquilaminocarbonilo C₃-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₅-C₆, haloalcoxi C₅-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, haloalqueniloxi C₂-C₆, alquiniloxi C₂-C₆, haloalquiniloxi C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆, haloalquilcarboniloxi C₁-C₆, cicloalquilcarboniloxi C₃-C₆, alquilcarbonil-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆, alquiltio C₅-C₆, haloalquiltio C₅-C₆, haloalquilsulfinilo C₅-C₆, haloalquilsulfonilo C₅-C₆, alquilsulfonylamino C₁-C₆, haloalquilsulfonylamino C₁-C₆, -C(=O)OH, -C(=O)NH₂, -C(=S)NR¹³R¹⁴, cianoalquilo C₁-C₆, alquenilcarboniloxi C₂-C₆, alquiniltio C₂-C₆, halocicloalquilcarboniloxi C₃-C₈, alquenilamino C₂-C₆, alquinilamino C₂-C₆, haloalquilamino C₁-C₆, cicloalquil-C₃-C₈-alquilamino C₁-C₆, alcoxiamino C₁-C₆, haloalcoxiamino C₁-C₆, alquilcarbonilamino C₁-C₆, haloalquilcarbonilamino C₁-C₆, alcoxycarbonilamino C₁-C₆, alquilcarbonil-C₁-C₆(alquil-C₁-C₆)amino, haloalquilcarbonil-C₁-C₆(alquil-C₁-C₆)amino, alcoxycarbonil-C₁-C₆(alquil-C₁-C₆)amino, -NR¹³SO₂Z³, alqueniltio C₂-C₆, haloalcoxycarbonilo C₁-C₆, alcoxialquil-C₁-C₆carbonilo C₁-C₄, -SF₅, haloalcoxycarbonilamino C₁-C₆, -NHC(=O)H, alcoxi-C₁-C₆(alquil-C₁-C₄)aminocarbonilo, alcoxycarbonil-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆, -C(=NOR⁷)R⁹, -N=C(R⁹)₂, di(alquil-C₁-C₆)aminocarbonilamino, di(alquil-C₁-C₆)aminosulfonyl, di(haloalquil-C₁-C₆)amino, alquilaminosulfonyl C₁-C₆, alquilaminocarbonilamino C₁-C₆, tri(alquil C₁-C₄)sililoxi, haloalquilsulfonyl C₁-C₆, alquilsulfonyl C₁-C₆, tri(alquil C₁-C₄)silil-alquiniloxi C₂-C₄, tri(alquil C₁-C₄)silil-alquinilo C₂-C₄, alquinilcarboniloxi C₂-C₄, cianoalquilcarboniloxi C₁-C₃, cicloalquilsulfonyl C₃-C₈, halocicloalquilsulfonyl C₃-C₈, alquenilsulfonyl C₂-C₄, alquilaminocarboniloxi C₁-C₃, alquinil-C₂-C₄-cicloalquilo C₃-C₈, cianocarboniloxi, cianoalqueniloxi C₂-C₄, -OC(=O)NR¹³R¹⁴, -NR¹¹R¹², -C(=O)NR¹¹R¹², -SO₂NR¹¹R¹², -O(C=O)H, -SCN, alcoxysulfonyl C₁-C₃, cicloalquilsulfinilo C₃-C₈, ciano(alcoxi C₁-C₃)-alquilo C₁-C₃ o -L⁴Z³ o

Z^4 preferentemente es alquilo C₁-C₃, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
 ciano, -C(=O)H, alqueniloxi C₂-C₄, alquiniloxi C₂-C₄, alqueniltio C₂-C₄, alquiniltio C₂-C₄, haloalquiltio C₁-C₃, alquenilsulfonyl C₂-C₄, alquinilsulfonyl C₂-C₄, haloalquilsulfonyl C₁-C₃, alquenilsulfonyl C₂-C₄, alquinilsulfonyl C₂-C₄, haloalquilsulfonyl C₁-C₃, alquilcarboniloxi C₁-C₃, haloalquilcarboniloxi C₁-C₃, alquilaminocarboniloxi C₁-C₃, alquilcarbonilamino C₁-C₃, alquilaminocarbonilamino C₁-C₃, haloalquilcarbonilamino C₁-C₃, alquilsulfonylamino C₁-C₃, haloalquilsulfonylamino C₁-C₃, alquiltioalquiloxi C₁-C₃, cianoalcoxi C₁-C₃, cicloalquil-C₃-C₈-alcoxi C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃-alquiltio C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃-alquilsulfonyl C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃-alcoxysulfonyl C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃, alquilcarbonil-C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃, alquiltio C₂-C₄-alcoxi C₁-C₃, di(alquil C₁-C₃)aminocarbonilamino, tri(alquil C₁-C₄)sililoxi,
 o

Z^4 preferentemente es alcoxi C₁-C₃, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
 ciano, alquilcarboniloxi C₁-C₃, alcoxycarbonilo C₁-C₃, cicloalcoxi C₃-C₈, alquilcarboniloxi C₁-C₃, -O(C=O)H, alquiltio C₁-C₃, hidroxialquilo C₁-C₃, cicloalquilsulfonyl C₃-C₈, haloalquilsulfonyl C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃, alquilsulfonyl C₁-C₃ o

Z^4 preferentemente es alqueniloxi C₂-C₄, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
 cicloalquilo C₃-C₈, hidroxil, alcoxi C₁-C₃, alcoxycarbonilo C₁-C₃, alquilcarbonilo C₁-C₃ o

Z^4 preferentemente es alquiniloxi C₂-C₄, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista: cicloalquilo C₃-C₈, -Z³,

Z^4 de manera especialmente preferente es - formilo, metoximetoxi, 2-metoxietoxi, aliloxi, 2-fluoroprop-2-en-1-iloxi, 2-cloroprop-2-en-1-iloxi, 3-cloroprop-2-en-1-iloxi, 2-bromoprop-2-en-1-iloxi, 2-metilprop-2-en-1-iloxi, 3,3-dicloroprop-2-en-1-iloxi, 3,3-dicloro-2-fluoroprop-2-en-1-iloxi, but-2-en-1-iloxi, but-3-en-2-iloxi, but-3-en-1-iloxi, 3-clorobut-2-en-1-iloxi, 3-bromoprop-2-en-1-iloxi, 3-metilbut-2-en-1-iloxi, 4,4,4-trifluorobut-2-en-1-iloxi, prop-2-in-1-iloxi, 3-cloroprop-2-in-1-iloxi, 3-bromoprop-2-in-1-iloxi, but-2-in-1-iloxi, pent-2-in-1-iloxi, 2-fluoro-2-metilpropanoiloxi, 3,3,3-trifluoropropanoiloxi, ciclopropilcarboniloxi, ciclohexilcarboniloxi, (1-clorociclopropil)carboniloxi, but-2-enoiloxi, acriloiloxi, cianometoxi, metilsulfonyl, etilsulfonyl, trifluorometilsulfonyl, ciclopropilsulfonyl, 2-metoxietoximetilo, alloximetilo, prop-2-in-1-iloximetilo, metilsulfonylmetilo, metilcarbonilaminometilo, metilsulfonylaminometilo, -C(=NOR⁷)R⁸, dimetilaminosulfonyl, etilaminosulfonyl, trimetilsililetinilo, dietilaminosulfonyl, metilaminosulfonyl, trimetilsililprop-2-in-1-iloxi, trifluorometilamino, dimetilaminocarbonilamino, -C(=O)OH, -NHC(=O)H, -C(=O)NH₂, -C(=S)NR¹³R¹⁴, 1,1-dimetiletetilcarbonilamino, clorometilcarbonilamino, trifluorometilcarbonilamino, 1,1-dimetiletotoxicarbonilamino, etilcarbonilamino, 1-metiletotoxicarbonilamino, trifluorometilcarbonilamino, metilcarbonilamino, metoxicarbonilamino, etoxicarbonilamino, *iso*-propoxicarbonilamino, 1-metiletetilcarbonilamino, metilsulfonylaminometilo o fenilsulfonylaminometilo, 3-bromoprop-2-

en-1-iloxi o -L⁴Z³,

L⁴ preferentemente es -C(=O)O-, -C(=O)NH-, -OC(=O)-, -NHC(=O)- o -OCH₂C≡C-, y de manera especialmente preferente es -OCH₂C≡C- o -C(=O)O-,

5 R⁷ preferentemente es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, bencilo o Z³, de manera especialmente preferente es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, 1-metiletilo, *n*-butilo, 1,1-dimetiletilo o 2-metilpropilo,

R⁸ preferentemente es hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquil-C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₈, alquil-C₁-C₄-cicloalquilo C₃-C₈, haloalquil-C₁-C₄-cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, bencilo o fenilo, de manera especialmente preferente es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, 1-metiletilo, *n*-butilo, 1,1-dimetiletilo o 2-metilpropilo,

10 R⁹ preferentemente es alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, bencilo o fenilo, y de manera especialmente preferente es hidrógeno, metilo, etilo, *n*-propilo, 1-metiletilo, *n*-butilo o 1,1-dimetiletilo,

15 R¹¹ preferentemente es alquenilo C₃-C₄, alquinilo C₃-C₄, cianoalquilo C₁-C₃, formilo, haloalquilo C₁-C₃, bencilo, fenilo, alquilcarbonilo C₁-C₃, cicloalcoxycarbonilo C₃-C₈, alcoxycarbonilo C₁-C₃, alqueniloxycarbonilo C₃-C₄, alquiniloxycarbonilo C₃-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₃, halocicloalquilcarbonilo C₃-C₈, cicloalcoxycarbonilo C₃-C₈, cicloalquilcarbonilo C₃-C₈, di(alquil C₁-C₃)aminocarbonilo,

20 R¹² preferentemente es hidrógeno, alquenilo C₃-C₄, alquinilo C₃-C₄, cianoalquilo C₁-C₃, formilo, haloalquilo C₁-C₃, fenilo, alquilcarbonilo C₁-C₃, cicloalcoxycarbonilo C₃-C₈, alcoxycarbonilo C₁-C₃, alqueniloxycarbonilo C₃-C₄, alquiniloxycarbonilo C₃-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₃, halocicloalquilcarbonilo C₃-C₈, cicloalcoxycarbonilo C₃-C₈, cicloalquilcarbonilo C₃-C₈, di(alquil C₁-C₃)aminocarbonilo.

25 Los derivados de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina que pueden usarse de acuerdo con la invención están definidos en general mediante la fórmula (I). Las definiciones de restos de las definiciones de restos anteriores e indicadas a continuación de la fórmula (I) rigen para los productos finales de la fórmula (I), y también por igual para todos los productos intermedios (véase también a continuación bajo "Explicaciones de los procedimientos y los productos intermedios").

30 Las definiciones y explicaciones de restos enumeradas anteriormente y a continuación, en términos generales o en intervalos de preferencia, también pueden combinarse de cualquier manera entre sí, es decir entre los respectivos intervalos e intervalos de preferencia. Rigen ambas para los productos finales y correspondientemente para los precursores y los productos intermedios. Además se pueden obviar determinadas definiciones.

Son de preferencia aquellos compuestos de la fórmula (I) en la que todos los restos tienen en cada caso las definiciones preferentes antes indicadas.

35 Son especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I) en la que todos los restos tienen en cada caso las definiciones de especial preferencia antes indicadas.

Son muy especialmente preferentes aquellos compuestos de la fórmula (I) en la que todos los restos tienen en cada caso las definiciones de especial preferencia antes indicadas.

Además son preferentes los compuestos de la fórmula (I) y sales de efecto agroquímico, complejos metálicos y N-óxidos de los mismos en los que:

40 R^{A1} es metilo, trifluorometilo o es ciclopropilo,
R^{A2} es metilo o propan-2-ilo,
R^{A2} es 1,3-benzodioxol-5-ilo, 4-etoxifenilo, 3-fluorofenilo, 3,4-dimetilfenilo, 3-(trifluorometoxi)-fenilo, 3,4-dimetilfenilo o 4-etoxifenilo,
45 L¹ es oxígeno,
R^{B1} y R^{B2} son hidrógeno,
Y es oxígeno;
G es G¹;
R^{G1} es hidrógeno;
Q es Q²⁴-3 o Q es Q¹¹-1;
50 R⁵ es hidrógeno o R⁵ es metilo;
L² es un enlace directo;
R¹ es 2,3-dicloro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
R¹ es 2,3-dicloro-4-[(metilsulfonyl)oxi]fenilo o
R¹ es 2,3-difluoro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
55 R¹ es 2,3-difluoro-4-[(metilsulfonyl)oxi]fenilo o

	R ¹ es 2,3-difluoro-4-formilfenilo o
	R ¹ es 2,4-dicloro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2,4-dicloro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
5	R ¹ es 2,4-difluoro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2,4-difluoro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 2,4-difluoro-3-formilfenilo o
	R ¹ es 2,5-dicloro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2,5-dicloro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
10	R ¹ es 2,5-dicloro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2,5-dicloro-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 2,5-difluoro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2,5-difluoro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 2,5-difluoro-3-formilfenilo o
15	R ¹ es 2,5-difluoro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2,5-difluoro-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 2,5-difluoro-4-formilfenilo o
	R ¹ es 2,6-dicloro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2,6-dicloro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
20	R ¹ es 2,6-dicloro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2,6-dicloro-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 2,6-difluoro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2,6-difluoro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 2,6-difluoro-3-formilfenilo o
25	R ¹ es 2,6-difluoro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2,6-difluoro-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 2,6-difluoro-4-formilfenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-3,4-diclorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-3,4-difluorofenilo o
30	R ¹ es 2-(aliloxi)-3,5-diclorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-3,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-3,6-diclorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-3,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-3-clorofenilo o
35	R ¹ es 2-(aliloxi)-3-fluorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-3-metilfenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-4,5-diclorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-4,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-4,6-diclorofenilo o
40	R ¹ es 2-(aliloxi)-4,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-4-clorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-4-fluorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-4-metilfenilo o
45	R ¹ es 2-(aliloxi)-5,6-diclorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-5,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-5-clorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-5-fluorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-5-metilfenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-6-clorofenilo o
50	R ¹ es 2-(aliloxi)-6-fluorofenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)-6-metilfenilo o
	R ¹ es 2-(aliloxi)fenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-3,4-diclorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-3,4-difluorofenilo o
55	R ¹ es 2-(cianometoxi)-3,5-diclorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-3,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-3,6-diclorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-3,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-3-clorofenilo o
60	R ¹ es 2-(cianometoxi)-3-fluorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-3-metilfenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-4,5-diclorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-4,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-4,6-diclorofenilo o
65	R ¹ es 2-(cianometoxi)-4,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-4-clorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-4-fluorofenilo o

	R ¹ es 2-(cianometoxi)-4-metilfenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-5,6-diclorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-5,6-difluorofenilo o
5	R ¹ es 2-(cianometoxi)-5-clorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-5-fluorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-5-metilfenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-6-clorofenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)-6-fluorofenilo o
10	R ¹ es 2-(cianometoxi)-6-metilfenilo o
	R ¹ es 2-(cianometoxi)fenilo o
	R ¹ es 2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2-(prop-2-in-1-iloxi)-4-(trifluorometil)fenilo o
	R ¹ es 2-cloro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
15	R ¹ es 2-cloro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 2-cloro-3-formilfenilo o
	R ¹ es 2-cloro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2-cloro-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 2-cloro-4-formilfenilo o
20	R ¹ es 2-fluoro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2-fluoro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 2-fluoro-3-formilfenilo o
	R ¹ es 2-fluoro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2-fluoro-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
25	R ¹ es 2-fluoro-4-formilfenilo o
	R ¹ es 2-formil-3-metilfenilo o
	R ¹ es 2-formil-4-metilfenilo o
	R ¹ es 2-formil-5-metilfenilo o
	R ¹ es 2-formil-6-metilfenilo o
	R ¹ es 2-formilfenilo o
30	R ¹ es 2-metil-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2-metil-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 2-metil-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 2-metil-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
35	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-3,4-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-3,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-3,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-3-clorofenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-3-fluorofenilo o
40	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-3-metilfenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-4,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-4,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-4-clorofenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-4-fluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-4-metilfenilo o
45	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-5,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-5-clorofenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-5-fluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-5-metilfenilo o
50	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-6-clorofenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-6-fluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]-6-metilfenilo o
	R ¹ es 2-[(hidroxiimino)metil]fenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-3,4-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-3,5-difluorofenilo o
55	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-3,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-3-clorofenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-3-fluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-3-metilfenilo o
60	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-4,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-4,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-4-clorofenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-4-fluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-4-metilfenilo o
65	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-5,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-5-clorofenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-5-fluorofenilo o

	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-5-metilfenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-6-clorofenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-6-fluorofenilo o
5	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]-6-metilfenilo o
	R ¹ es 2-[(metoxiimino)metil]fenilo o
	R ¹ es 2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 2-[(metilsulfonil)oxi]-4-(trifluorometil)fenilo o
	R ¹ es 3,4-dicloro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
10	R ¹ es 3,4-dicloro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 3,4-difluoro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 3,4-difluoro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 3,4-difluoro-2-formilfenilo o
	R ¹ es 3,5-dicloro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
15	R ¹ es 3,5-dicloro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 3,5-dicloro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 3,5-dicloro-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 3,5-difluoro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 3,5-difluoro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
20	R ¹ es 3,5-difluoro-2-formilfenilo o
	R ¹ es 3,5-difluoro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 3,5-difluoro-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 3,5-difluoro-4-formilfenilo o
	R ¹ es 3,6-dicloro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
25	R ¹ es 3,6-dicloro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 3,6-dicloro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 3,6-dicloro-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 3,6-difluoro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 3,6-difluoro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
30	R ¹ es 3,6-difluoro-2-formilfenilo o
	R ¹ es 3,6-difluoro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 3,6-difluoro-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 3,6-difluoro-4-formilfenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-2,4-diclorofenilo o
35	R ¹ es 3-(aliloxi)-2,4-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-2,5-diclorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-2,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-2,6-diclorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-2,6-difluorofenilo o
40	R ¹ es 3-(aliloxi)-2-clorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-2-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-2-metilfenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-4,5-diclorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-4,5-difluorofenilo o
45	R ¹ es 3-(aliloxi)-4,6-diclorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-4,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-4-clorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-4-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-4-metilfenilo o
50	R ¹ es 3-(aliloxi)-5,6-diclorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-5,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-5-clorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-5-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-5-metilfenilo o
55	R ¹ es 3-(aliloxi)-6-clorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-6-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)-6-metilfenilo o
	R ¹ es 3-(aliloxi)fenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-2,4-diclorofenilo o
60	R ¹ es 3-(cianometoxi)-2,4-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-2,5-diclorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-2,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-2,6-diclorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-2,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-2-clorofenilo o
65	R ¹ es 3-(cianometoxi)-2-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-2-metilfenilo o

	R ¹ es 3-(cianometoxi)-4,5-diclorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-4,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-4,6-diclorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-4,6-difluorofenilo o
5	R ¹ es 3-(cianometoxi)-4-clorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-4-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-4-metilfenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-5,6-diclorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-5,6-difluorofenilo o
10	R ¹ es 3-(cianometoxi)-5-clorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-5-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-5-metilfenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-6-clorofenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)-6-fluorofenilo o
15	R ¹ es 3-(cianometoxi)-6-metilfenilo o
	R ¹ es 3-(cianometoxi)fenilo o
	R ¹ es 3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 3-cloro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 3-cloro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
20	R ¹ es 3-cloro-2-formilfenilo o
	R ¹ es 3-cloro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 3-cloro-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 3-cloro-4-formilfenilo o
	R ¹ es 3-fluoro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
25	R ¹ es 3-fluoro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 3-fluoro-2-formilfenilo o
	R ¹ es 3-fluoro-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 3-fluoro-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 3-fluoro-4-formilfenilo o
30	R ¹ es 3-formil-2-metilfenilo o
	R ¹ es 3-formil-4-metilfenilo o
	R ¹ es 3-formil-5-metilfenilo o
	R ¹ es 3-formil-6-metilfenilo o
	R ¹ es 3-formilfenilo o
35	R ¹ es 3-metil-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 3-metil-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 3-metil-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 3-metil-4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-2,4-difluorofenilo o
40	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-2,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-2,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-2-clorofenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-2-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-2-metilfenilo o
45	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-4,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-4,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-4-clorofenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-4-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-4-metilfenilo o
50	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-5,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-5-clorofenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-5-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-5-metilfenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-6-clorofenilo o
55	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-6-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]-6-metilfenilo o
	R ¹ es 3-[(hidroxiimino)metil]fenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-2,4-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-2,5-difluorofenilo o
60	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-2,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-2-clorofenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-2-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-2-metilfenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-4,5-difluorofenilo o
65	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-4,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-4-clorofenilo o

	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-4-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-4-metilfenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-5,6-difluorofenilo o
5	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-5-clorofenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-5-fluorofenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-5-metilfenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-6-clorofenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-6-fluorofenilo o
10	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]-6-metilfenilo o
	R ¹ es 3-[(metoxiimino)metil]fenilo o
	R ¹ es 3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 4,5-dicloro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4,5-dicloro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
15	R ¹ es 4,5-dicloro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4,5-dicloro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 4,5-difluoro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4,5-difluoro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 4,5-difluoro-2-formilfenilo o
20	R ¹ es 4,5-difluoro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4,5-difluoro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 4,5-difluoro-3-formilfenilo o
	R ¹ es 4,6-dicloro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4,6-dicloro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
25	R ¹ es 4,6-dicloro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4,6-dicloro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 4,6-difluoro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4,6-difluoro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 4,6-difluoro-2-formilfenilo o
30	R ¹ es 4,6-difluoro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4,6-difluoro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 4,6-difluoro-3-formilfenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)-2,3-diclorofenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)-2,3-difluorofenilo o
35	R ¹ es 4-(aliloxi)-2,5-diclorofenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)-2,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)-2,6-diclorofenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)-2,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)-2-clorofenilo o
40	R ¹ es 4-(aliloxi)-2-fluorofenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)-2-metilfenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)-3,5-diclorofenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)-3,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)-3,6-diclorofenilo o
45	R ¹ es 4-(aliloxi)-3,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)-3-clorofenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)-3-fluorofenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)-3-metilfenilo o
	R ¹ es 4-(aliloxi)fenilo o
50	R ¹ es 4-(cianometoxi)-2,3-diclorofenilo o
	R ¹ es 4-(cianometoxi)-2,3-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-(cianometoxi)-2,5-diclorofenilo o
	R ¹ es 4-(cianometoxi)-2,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-(cianometoxi)-2,6-diclorofenilo o
55	R ¹ es 4-(cianometoxi)-2,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-(cianometoxi)-2-clorofenilo o
	R ¹ es 4-(cianometoxi)-2-fluorofenilo o
	R ¹ es 4-(cianometoxi)-2-metilfenilo o
	R ¹ es 4-(cianometoxi)-3,5-diclorofenilo o
60	R ¹ es 4-(cianometoxi)-3,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-(cianometoxi)-3,6-diclorofenilo o
	R ¹ es 4-(cianometoxi)-3,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-(cianometoxi)-3-clorofenilo o
	R ¹ es 4-(cianometoxi)-3-fluorofenilo o
	R ¹ es 4-(cianometoxi)-3-metilfenilo o
65	R ¹ es 4-(cianometoxi)fenilo o
	R ¹ es 4-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o

	R ¹ es 4-cloro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4-cloro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 4-cloro-2-formilfenilo o
5	R ¹ es 4-cloro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4-cloro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 4-cloro-3-formilfenilo o
	R ¹ es 4-fluoro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4-fluoro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
10	R ¹ es 4-fluoro-2-formilfenilo o
	R ¹ es 4-fluoro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4-fluoro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 4-fluoro-3-formilfenilo o
	R ¹ es 4-formil-2-metilfenilo o
	R ¹ es 4-formil-3-metilfenilo o
15	R ¹ es 4-formilfenilo o
	R ¹ es 4-metil-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4-metil-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 4-metil-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 4-metil-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
20	R ¹ es 4-[(hidroxiimino)metil]-2,3-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-[(hidroxiimino)metil]-2,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-[(hidroxiimino)metil]-2,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-[(hidroxiimino)metil]-2-clorofenilo o
25	R ¹ es 4-[(hidroxiimino)metil]-2-fluorofenilo o
	R ¹ es 4-[(hidroxiimino)metil]-2-metilfenilo o
	R ¹ es 4-[(hidroxiimino)metil]-3,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-[(hidroxiimino)metil]-3,6-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-[(hidroxiimino)metil]-3-clorofenilo o
	R ¹ es 4-[(hidroxiimino)metil]-3-fluorofenilo o
30	R ¹ es 4-[(hidroxiimino)metil]-3-metilfenilo o
	R ¹ es 4-[(hidroxiimino)metil]fenilo o
	R ¹ es 4-[(metoxiimino)metil]-2,3-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-[(metoxiimino)metil]-2,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-[(metoxiimino)metil]-2,6-difluorofenilo o
35	R ¹ es 4-[(metoxiimino)metil]-2-clorofenilo o
	R ¹ es 4-[(metoxiimino)metil]-2-fluorofenilo o
	R ¹ es 4-[(metoxiimino)metil]-2-metilfenilo o
	R ¹ es 4-[(metoxiimino)metil]-3,5-difluorofenilo o
	R ¹ es 4-[(metoxiimino)metil]-3,6-difluorofenilo o
40	R ¹ es 4-[(metoxiimino)metil]-3-clorofenilo o
	R ¹ es 4-[(metoxiimino)metil]-3-fluorofenilo o
	R ¹ es 4-[(metoxiimino)metil]-3-metilfenilo o
	R ¹ es 4-[(metoxiimino)metil]fenilo o
	R ¹ es 4-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
45	R ¹ es 5,6-dicloro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 5,6-dicloro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 5,6-dicloro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 5,6-dicloro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 5,6-difluoro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
50	R ¹ es 5,6-difluoro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 5,6-difluoro-2-formilfenilo o
	R ¹ es 5,6-difluoro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 5,6-difluoro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 5,6-difluoro-3-formilfenilo o
55	R ¹ es 5-cloro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 5-cloro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 5-cloro-2-formilfenilo o
	R ¹ es 5-cloro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 5-cloro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
60	R ¹ es 5-cloro-3-formilfenilo o
	R ¹ es 5-fluoro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
	R ¹ es 5-fluoro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 5-fluoro-2-formilfenilo o
	R ¹ es 5-fluoro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
65	R ¹ es 5-fluoro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
	R ¹ es 5-fluoro-3-formilfenilo o

- R¹ es 5-metil-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
 R¹ es 5-metil-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
 R¹ es 5-metil-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
 R¹ es 5-metil-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
 5 R¹ es 6-cloro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
 R¹ es 6-cloro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
 R¹ es 6-cloro-2-formilfenilo o
 R¹ es 6-cloro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
 R¹ es 6-cloro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
 10 R¹ es 6-cloro-3-formilfenilo o
 R¹ es 6-fluoro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
 R¹ es 6-fluoro-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
 R¹ es 6-fluoro-2-formilfenilo o
 R¹ es 6-fluoro-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
 15 R¹ es 6-fluoro-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
 R¹ es 6-fluoro-3-formilfenilo o
 R¹ es 6-metil-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
 R¹ es 6-metil-2-[(metilsulfonil)oxi]fenilo o
 R¹ es 6-metil-3-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo o
 20 R¹ es 6-metil-3-[(metilsulfonil)oxi]fenilo.

Las definiciones de restos indicadas anteriormente pueden combinarse entre sí en la forma deseada. Más aún, pueden no ser pertinentes definiciones individuales.

- Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes definidos anteriormente, los compuestos de la fórmula (I) poseen propiedades ácidas o básicas y pueden formar sales, en caso apropiado también sales internas o aductos con ácidos inorgánicos u orgánicos o con bases o con iones metálicos. Si los compuestos de la fórmula (I) portan grupos amino, alquilamino u otros grupos que inducen propiedades básicas, estos compuestos pueden hacerse reaccionar con ácidos para dar sales o se obtienen directamente como sales en la síntesis. Si los compuestos de la fórmula (I) portan grupos hidroxilo, carboxilo u otros grupos que inducen propiedades ácidas, estos compuestos pueden hacerse reaccionar con bases para dar sales. Son bases adecuadas, por ejemplo, hidróxidos, carbonatos, bicarbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos, en particular aquellos de sodio, potasio, magnesio y calcio, además amoníaco, aminas primarias, secundarias y terciarias que presentan grupos alquilo C₁-C₄, mono-, di- y trialcanolaminas de alcoholes C₁-C₄, colinas y también clorocolinas.

Las sales que pueden obtenerse de este modo también presentan propiedades fungidas.

- Son ejemplos de ácidos inorgánicos ácidos hidrohálicos, tales como fluoruro de hidrógeno, cloruro de hidrógeno, bromuro de hidrógeno y yoduro de hidrógeno, ácido sulfúrico, ácido fosfórico y ácido nítrico, y sales ácidas, tales como NaHSO₄ y KHSO₄. Como ácidos orgánicos se tienen en cuenta, por ejemplo, ácido fórmico, ácido carboxílico y ácidos alcanóicos, tales como ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido tricloroacético y ácido propiónico, y también ácido glicólico, ácido tiocianico, ácido láctico, ácido succínico, ácido cítrico, ácido benzoico, ácido cinámico, ácido oxálico, ácidos grasos C₆-C₂₀ saturados o monoinsaturados o doblemente insaturados, monoésteres de ácidos alquilsulfúricos, ácidos alquilsulfónicos (ácidos sulfónicos que presentan restos alquilo de cadena lineal o ramificados de 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilsulfónicos o ácidos arildisulfónicos (restos aromáticos, tales como fenilo y naftilo, que portan uno o dos grupos ácido sulfónico), ácidos alquilfosfónicos (ácidos fosfónicos que presentan restos alquilo de cadena lineal o ramificados de 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilfosfónicos o ácidos arildifosfónicos (restos aromáticos, tal como fenilo y naftilo, que portan uno o dos restos de ácido fosfónico), donde los restos alquilo y arilo pueden portar otros sustituyentes, por ejemplo ácido p-toluensulfónico, ácido salicílico, ácido p-aminosalicílico, ácido 2-fenoxibenzoico, ácido 2-acetoxibenzoico, etc.

- Como iones metálicos se tienen en cuenta en particular los iones de los elementos del segundo grupo principal, en particular calcio y magnesio, del tercer y cuarto grupo principal, en particular aluminio, estaño y plomo, y también del primer al octavo grupo de transición, en particular cromo, manganeso, hierro, cobalto, níquel, cobre, zinc y otros. Se prefieren particularmente los iones metálicos de los elementos del cuarto período. Aquí, los metales pueden estar presentes en diferentes valencias que puedan asumir.

Grupos opcionalmente sustituidos pueden estar mono- o polisustituidos, donde en el caso de la polisustitución los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes.

- En las definiciones de los símbolos indicadas en las fórmulas anteriores, los términos colectivos usados en general son representativos de los siguientes sustituyentes:

Halógeno: flúor, cloro, bromo y yodo, y preferentemente flúor, cloro, bromo y más preferentemente flúor, cloro.

Alquilo: restos hidrocarburo saturados de cadena lineal o ramificados con 1 a 8, preferentemente 1 a 6 y más preferentemente 1 a 3 átomos de carbono, p. ej. (pero sin ser limitante) alquilo C₁-C₆ como metilo, etilo, propilo,

1-metiletilo, butilo, 1-metil-propilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-di-metilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo. Esta definición también rige para alquilo como parte componente de un sustituyente compuesto como p. ej. cicloalquilalquilo, hidroxialquilo etc., en tanto no se haya definido en otro lugar como p. ej. alquiltio, alquilsufinilo, alquilsulfonilo, haloalquilo o bien haloalquiltio. Si el alquilo se ubica al final de un sustituyente compuesto, como p. ej., en el caso de alquilocicloalquilo, el componente ubicado al principio del sustituyente compuesto, p. ej., el cicloalquilo, puede estar mono- o polisustituido, de manera igual o diferente e independientemente entre sí con alquilo. Lo mismo rige también para sustituyentes compuestos en los que se ubican al final otros restos, como p. ej., alquenilo, alquinilo, hidroxilo, halógeno, formilo etc.

Alquenilo: restos hidrocarburo insaturados de cadena lineal o ramificados que presentan 2 a 8, preferentemente 2 a 6, átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, por ejemplo (pero sin ser limitante) alquenilo C₂-C₆ como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metilenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo. Esta definición también rige para alquenilo como componente de un sustituyente compuesto como p. ej. haloalquenilo, etc., en tanto no se haya definido en otro lugar.

Alquinilo: grupos hidrocarburo de cadena lineal o ramificados que presentan 2 a 8, preferentemente 2 a 6, átomos de carbono, y un triple enlace en cualquier posición, por ejemplo (pero sin ser limitante) alquinilo C₂-C₆ como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo. Esta definición también rige para alquinilo como componente de un sustituyente compuesto como p. ej. haloalquinilo etc., en tanto no se haya definido en otro lugar.

Alcoxi: restos alcoxi saturados, de cadena lineal o ramificados que presentan 1 a 8, preferentemente 1 a 6 y más preferentemente 1 a 3 átomos de carbono, p. ej. (pero sin ser limitante) alcoxi-C₁-C₆, como metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletoxi, butoxi, 1-metil-propoxi, 2-metilpropoxi, 1,1-dimetiletoxi, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 2,2-di-metilpropoxi, 1-etilpropoxi, hexoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi y 1-etil-2-metilpropoxi. Esta definición también rige para alcoxi como componente de un sustituyente compuesto como p. ej. haloalcoxi, alquilalcoxi, etc., en tanto no se haya definido en otro lugar;

Alquiltio: restos alquiltio saturados, de cadena lineal o ramificada con 1 a 8 preferentemente 1 a 6 y más preferentemente 1 a 3 átomos de carbono, p. ej. (pero sin ser limitante) alquiltio-C₁-C₆ como metiltio, etiltio, propiltio, 1-metileiltio, butiltio, 1-metil-propiltio, 2-metilpropiltio, 1,1-dimetileiltio, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 2,2-di-metilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metil-pentiltio, 4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2-trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio y 1-etil-2-metil-propiltio. Esta definición también rige para alquiltio como componente de un sustituyente compuesto como p. ej. haloalquiltio, etc., en tanto no se haya definido en otro lugar.

Alcoxicarbonilo: un grupo alcoxi con 1 a 6, preferentemente 1 a 3 átomos de carbono (como se indicó anteriormente), que está unido mediante un grupo carbonilo (-CO-) a la estructura. Esta definición también rige para alcoxicarbonilo como componente de un sustituyente compuesto como p. ej. cicloalquilalcoxicarbonilo, etc., en tanto no se haya definido en otro lugar.

Alquilsufinilo: restos alquilsufinilo saturados, de cadena lineal o ramificada con 1 a 8, preferentemente 1 a 6 y más preferentemente 1 a 3 átomos de carbono, p. ej. (pero sin ser limitante) alquilsufinilo C₁-C₆ como

metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, 1-metiletilsulfonilo, butilsulfonilo, 1-metil-propilsulfonilo, 2-metilpropilsulfonilo, 1,1-dimetiletilsulfonilo, pentilsulfonilo, 1-metilbutilsulfonilo, 2-metilbutilsulfonilo, 3-metilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-etilpropilsulfonilo, hexilsulfonilo, 1,1-dimetilpropilsulfonilo, 1,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentil-sulfonilo, 3-metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilsulfonilo, 1,2-dimetilbutilsulfonilo, 1,3-dimetilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilbutilsulfonilo, 2,3-dimetilbutilsulfonilo, 3,3-dimetilbutilsulfonilo, 1-etilbutilsulfonilo, 2-etilbutilsulfonilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonilo, 1-etil-1-metilpropilsulfonilo y 1-etil-2-metilpropilsulfonilo. Esta definición también rige para alquilsulfonilo como componente de un sustituyente compuesto como p. ej. haloalquilsulfonilo, etc., en tanto no se haya definido en otro lugar.

Alquilsulfonilo: restos alquilsulfonilo saturados, de cadena lineal o ramificada con 1 a 8, preferentemente 1 a 6 y más preferentemente 1 a 3 átomos de carbono, p. ej. (pero sin ser limitante) alquilsulfonilo C₁-C₆ como metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, 1-metiletilsulfonilo, butilsulfonilo, 1-metil-propilsulfonilo, 2-metilpropilsulfonilo, 1,1-dimetiletilsulfonilo, pentilsulfonilo, 1-metilbutilsulfonilo, 2-metilbutilsulfonilo, 3-metilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-etilpropilsulfonilo, hexilsulfonilo, 1,1-dimetilpropilsulfonilo, 1,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentil-sulfonilo, 3-metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilsulfonilo, 1,2-dimetilbutilsulfonilo, 1,3-dimetilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilbutilsulfonilo, 2,3-dimetilbutilsulfonilo, 3,3-dimetilbutilsulfonilo, 1-etilbutilsulfonilo, 2-etilbutilsulfonilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonilo, 1-etil-1-metilpropilsulfonilo y 1-etil-2-metilpropilsulfonilo. Esta definición también rige para alquilsulfonilo como componente de un sustituyente compuesto como p. ej. alquilsulfonilalquilo, etc., en tanto no se haya definido en otro lugar.

Cicloalquilo: grupos hidrocarburo saturados, monocíclicos con 3 a 10 preferentemente 3 a 8 y más preferentemente 3 a 6 miembros de anillo de carbono, p. ej. (pero sin ser limitante) ciclopropilo, ciclopentilo y ciclohexilo. Esta definición también rige para cicloalquilo como componente de un sustituyente compuesto como p. ej. cicloalquilalquilo, etc., en tanto no se haya definido en otro lugar.

Cicloalquenilo: grupos hidrocarburo parcialmente insaturados, monocíclicos con 3 a 10, preferentemente 3 a 8 y más preferentemente 3 a 6 miembros de anillo de carbono, p. ej. (pero sin ser limitante) ciclopropenilo, ciclopentilo y ciclohexenilo. Esta definición también rige para cicloalquenilo como componente de un sustituyente compuesto como p. ej. cicloalquenilalquilo, etc., en tanto no se haya definido en otro lugar.

Cicloalcoxi: restos cicloalquilo saturados, monocíclicos con 3 a 10, preferentemente 3 a 8 y más preferentemente 3 a 6 miembros de anillo de carbono, p. ej. (pero sin ser limitante) ciclopropiloxi, ciclopentiloxi y ciclohexiloxi. Esta definición también rige para cicloalcoxi como componente de un sustituyente compuesto como p. ej. cicloalcoxialquilo, etc., en tanto no se haya definido en otro lugar.

Haloalquilo: grupos alquilo de cadena lineal o ramificada con 1 a 8, preferentemente 1 a 6 y más preferentemente 1 a 3 átomos de carbono (como se indicó anteriormente), donde en estos grupos los átomos de hidrógeno pueden estar parcial o totalmente sustituidos por átomos de halógeno como se indicó anteriormente, p. ej. (pero sin ser limitante) haloalquilo C₁-C₃ como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo. Esta definición también rige para haloalquilo como componente de un sustituyente compuesto como p. ej. haloalquilaminoalquilo, etc., en tanto no se haya definido en otro lugar.

Haloalquenilo y haloalquinilo se definieron de modo análogo al haloalquilo, donde en lugar de grupos alquilo hay grupos alquenilo y alquinilo como componente del sustituyente.

Haloalcoxi: grupos alcoxi de cadena lineal o ramificados con 1 a 8, preferentemente 1 a 6 y más preferentemente 1 a 3 átomos de carbono (como se indicó anteriormente), donde en estos grupos los átomos de hidrógeno pueden estar parcial o totalmente sustituidos por átomos de halógeno como se indicó anteriormente, p. ej. (pero sin ser limitante) haloalcoxi C₁-C₃ como clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoretoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi y 1,1,1-trifluoroprop-2-oxi. Esta definición también rige para haloalcoxi como componente de un sustituyente compuesto como p. ej. haloalcoxialquilo, etc., en tanto no se haya definido en otro lugar.

Haloalquiltio: grupos alquiltio de cadena lineal o ramificados con 1 a 8, preferentemente 1 a 6 y más preferentemente 1 a 3 átomos de carbono (como se indicó anteriormente), donde en estos grupos los átomos de hidrógeno pueden estar parcial o totalmente sustituidos por átomos de halógeno como se indicó anteriormente, p. ej. (pero sin ser limitante) haloalquiltio C₁-C₃ como clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluoro-metiltio, clorodifluorometiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio, pentafluoroetiltio y 1,1,1-trifluoroprop-2-iltio. Esta definición también rige para haloalquiltio como componente de un sustituyente compuesto como p. ej.

haloalquiltioalquilo, etc., en tanto no se haya definido en otro lugar.

Heteroarilo: sistema anular monocíclico de 5 o 6 miembros, totalmente insaturado que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno o azufre, si el anillo contiene varios átomos de oxígeno, estos no son directamente adyacentes;

5 **Heteroarilo de 5 miembros que contiene uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre u oxígeno:** grupos heteroarilo de 5 miembros de anillo que además de átomos de carbono, pueden contener uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre u oxígeno como miembros de anillo, por ejemplo (pero sin estar limitado a ello) 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-isoxazolilo, 4-isoxazolilo, 5-isoxazolilo, 3-isotiazolilo, 4-isotiazolilo, 5-isotiazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y 1,3,4-triazol-2-ilo;

15 **Heteroarilo de 5 miembros que está unido mediante nitrógeno y contiene uno a cuatro átomos de nitrógeno, o un heteroarilo de 5 miembros benzocondensado que está unido mediante nitrógeno y contiene uno a tres átomos de nitrógeno:** grupos heteroarilo de 5 miembros de anillo que, además de átomos de carbono, pueden contener uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno como miembros de anillo y en los que dos miembros de anillo de carbono adyacentes o un miembro de anillo de nitrógeno y un miembro de anillo de carbono adyacente pueden formar un puente con un grupo buta-1,3-dien-1,4-diilo en donde uno o dos átomos de C pueden estar reemplazados por átomos de N, donde estos anillos están unidos a la estructura mediante uno de los miembros de anillo de nitrógeno, por ejemplo (pero sin estar limitado a ello) 1-pirrolilo, 1-pirazolilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, 1-imidazolilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,3,4-triazol-1-ilo;

20 **Heteroarilo de 6 miembros que contiene uno a cuatro átomos de nitrógeno:** grupos heteroarilo de 6 miembros de anillo que, además de átomos de carbono, pueden contener uno a tres o uno a cuatro átomos de nitrógeno como miembros de anillo, por ejemplo (pero sin estar limitado a ello) 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-pirazinilo, 1,3,5-triazin-2-ilo, 1,2,4-triazin-3-ilo y 1,2,4,5-tetrazin-3-ilo;

25 **Heteroarilo de 5 miembros benzocondensado que contiene uno a tres átomos de nitrógeno o un átomo de nitrógeno y un átomo de oxígeno o de azufre:** por ejemplo (pero sin estar limitado a ello) indol-1-ilo, indol-2-ilo, indol-3-ilo, indol-4-ilo, indol-5-ilo, indol-6-ilo, indol-7-ilo, bencimidazol-1-ilo, bencimidazol-2-ilo, bencimidazol-4-ilo, bencimidazol-5-ilo, indazol-1-ilo, indazol-3-ilo, indazol-4-ilo, indazol-5-ilo, indazol-6-ilo, indazol-7-ilo, indazol-2-ilo, 1-benzofuran-2-ilo, 1-benzofuran-3-ilo, 1-benzofuran-4-ilo, 1-benzofuran-5-ilo, 1-benzofuran-6-ilo, 1-benzofuran-7-ilo, 1-benzotiofen-2-ilo, 1-benzotiofen-3-ilo, 1-benzotiofen-4-ilo, 1-benzotiofen-5-ilo, 1-benzotiofen-6-ilo, 1-benzotiofen-7-ilo, 1,3-benzotiazol-2-ilo, 1,3-benzoxazol-4-ilo, 1,3-benzoxazol-5-ilo, 1,3-benzoxazol-6-ilo, 1,3-benzoxazol-7-ilo, 1,3-benzoxazol-2-ilo, 1,3-benzoxazol-4-ilo, 1,3-benzoxazol-5-ilo, 1,3-benzoxazol-6-ilo y 1,3-benzoxazol-7-ilo;

30 **Heteroarilo de 6 miembros benzocondensado que contiene uno a tres átomos de nitrógeno:** por ejemplo (pero sin estar limitado a ello) quinolin-2-ilo, quinolin-3-ilo, quinolin-4-ilo, quinolin-5-ilo, quinolin-6-ilo, quinolin-7-ilo, quinolin-8-ilo, isoquinolin-1-ilo, isoquinolin-3-ilo, isoquinolin-4-ilo, isoquinolin-5-ilo, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo e isoquinolin-8-ilo.

40 Esta definición también rige para heteroarilo como componente de un sustituyente compuesto, como por ejemplo, heteroarilalquilo, etc., salvo que se haya definido en otro lugar.

45 **Heterociclilo:** un heterociclo de tres a quince miembros, preferentemente un heterociclo de tres a nueve miembros, saturado o parcialmente insaturado que contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno y azufre: heterociclos mono-, bi- o tricíclicos que contienen, además de miembros de anillo de carbono, uno a tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o azufre o uno a dos átomos de oxígeno y/o azufre; en caso de que el anillo contenga una pluralidad de átomos de oxígeno, estos no son directamente adyacentes; tal como, por ejemplo (pero sin estar limitado a ello), oxiranilo, aziridinilo, 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrothienilo, 3-tetrahidrothienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo,

4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropirano, 4-tetrahidropirano, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidro-piridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidro-triazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ilo. Esta definición también rige para heterociclilo como componente de un sustituyente compuesto como p. ej., heterociclilalquilo, etc., en tanto no se haya definido en otro lugar.

Grupo saliente: grupo saliente S_{N1} o S_{N2} , por ejemplo cloro, bromo, yodo, alquilsulfonatos (-OSO₂-alquilo, p. ej. -OSO₂CH₃, -OSO₂CF₃) o arilsulfonatos (-OSO₂-arilo, p. ej. -OSO₂Ph, -OSO₂PhMe).

No se incluyen combinaciones que contradigan leyes naturales y que por esa razón habrían sido excluidas por personas expertas en la técnica debido a su conocimiento experto. Están excluidas, por ejemplo, las estructuras de anillo que presentan tres o más átomos de O adyacentes.

Explicación de los procedimientos de preparación y los productos intermedios

Los derivados de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina de la fórmula (I) pueden prepararse de diferentes modos. A continuación los procedimientos posibles se muestran en primer lugar en forma esquemática. Salvo que se haya indicado de otra manera, los restos indicados presentan los significados indicados anteriormente.

Los procedimientos de acuerdo con la invención para la preparación de compuestos de la fórmula (I) dado el caso se realizan usando uno o varios adyuvantes de reacción.

Como adyuvantes de reacción entran en consideración dado el caso bases inorgánicas u orgánicas o aceptores de ácidos. Se incluyen aquí preferentemente hidróxidos, hidruros, hidrogenocarbonatos, carbonatos, amidas, acetatos o alcanolatos de metales alcalinos y alcalinotérreos, como por ejemplo, acetato de sodio, de potasio o de calcio, amida de litio, de sodio, de potasio o de calcio, carbonato de sodio, potasio o calcio, hidrogenocarbonato de sodio, de potasio o de calcio, hidruro de litio, de sodio, de potasio o de calcio, hidróxido de litio, de sodio, de potasio o de calcio, metanolato de sodio, o de potasio, etanolato de sodio o de potasio, n- o i-propanolato de sodio o de potasio, n-, i-, s- o t-butanolato de sodio o de potasio; y además también compuestos de nitrógeno orgánicos básicos, como por ejemplo trimetilamina, trietilamina, tripropilamina, tributilamina, etil-diisopropilamina, N,N-dimetil-ciclohexilamina, dicitclohexilamina, etil-dicitclohexilamina, N,N-dimetil-anilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, 2-metil-, 3-metil-, 4-metil-, 2,4-dimetil-, 2,6-dimetil-, 3,4-dimetil- y 3,5-dimetil-piridina, 5-etil-2-metil-piridina, 4-dimetilamino-piridina, N-metil-piperidina, 1,4-diazabicyclo[2,2,2]-octano (DABCO), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]-non-5-eno (DBN) o 1,8-diazabicyclo[5,4,0]-undec-7-eno (DBU).

Como adyuvantes de reacción entran en consideración dado el caso ácidos inorgánicos u orgánicos. Preferentemente se incluyen ácidos inorgánicos como por ejemplo fluoruro de hidrógeno, cloruro de hidrógeno, bromuro de hidrógeno y yoduro de hidrógeno, ácido sulfúrico, ácido fosfórico y ácido nítrico, y sales ácidas, tales como NaHSO₄ y KHSO₄, o ácidos orgánicos tales como por ejemplo ácido fórmico, ácido carboxílico y ácidos alcanóicos, tales como ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido tricloroacético y ácido propiónico, y también ácido glicólico, ácido tiocianico, ácido láctico, ácido succínico, ácido cítrico, ácido benzoico, ácido cinámico, ácido oxálico, ácidos grasos C₆-C₂₀ saturados o monoinsaturados o doblemente insaturados, monoésteres de ácidos alquilsulfónicos, ácidos alquilsulfónicos (ácidos sulfónicos que presentan restos alquilo de cadena lineal o ramificados de 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilsulfónicos o ácidos arildisulfónicos (restos aromáticos, tales como fenilo y naftilo, que portan uno o dos grupos ácido sulfónico), ácidos alquilfosfónicos (ácidos fosfónicos que presentan restos alquilo de cadena lineal o ramificados de 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilfosfónicos o ácidos arildifosfónicos (restos aromáticos, tal como fenilo y naftilo, que portan uno o dos restos de ácido fosfónico), donde los restos alquilo y arilo pueden portar otros sustituyentes, por ejemplo ácido p-toluensulfónico, ácido salicílico, ácido p-aminosalicílico, ácido 2-fenoxibenzoico, ácido 2-acetoxibenzoico, etc.

Los procedimientos de acuerdo con la invención se realizan dado el caso usando uno o varios diluyentes. Como diluyentes entran en consideración prácticamente todos los disolventes orgánicos inertes. Aquí se incluyen preferentemente los hidrocarburos alifáticos y aromáticos, dado el caso halogenados como pentano, hexano, heptano, ciclohexano, petroléter, bencina, ligroína, benceno, tolueno, xileno, cloruro de metileno, cloruro de etileno, cloroformo, tetraclorocarbono, clorobenceno y o-diclorobenceno, éteres como dietil- y dibutiléter, glicoldimetiléter y diglicoldimetiléter, tetrahidrofurano y dioxano, cetonas como acetona, metil-etil-, metil-isopropil- o metil-isobutilcetona, ésteres como metiléter o etiléter de ácido acético, nitrilos como p. ej., acetonitrilo o propionitrilo, amidas como p. ej., dimetilformamida, dimetilacetamida y N-metil-pirrolidona, así como dimetilsulfóxido, tetrametilsulfona y triamida del ácido hexametilsulfónico y DMPU.

Las temperaturas de reacción pueden variarse en un intervalo más amplio en los procedimientos de acuerdo con la invención. Por lo general se opera a temperaturas entre 0 °C y 250 °C, preferentemente a temperaturas entre 10 °C y 185 °C.

El tiempo de reacción varía en relación con la escala de reacción y la temperatura de reacción, pero en general se

encuentra entre algunos minutos y 48 horas.

Los procedimientos de acuerdo con la invención por lo general se llevan a cabo con presión normal. Pero también es posible operar con una presión elevada o reducida.

- 5 Para llevar a cabo los procedimientos de acuerdo con la invención, las sustancias de salida que se requieren respectivamente por lo general se usan en cantidades aproximadamente equimolares. Pero también es posible usar uno de los componentes respectivamente empleados en una cantidad más excedente.

Procedimiento A

Esquema 1: procedimiento A



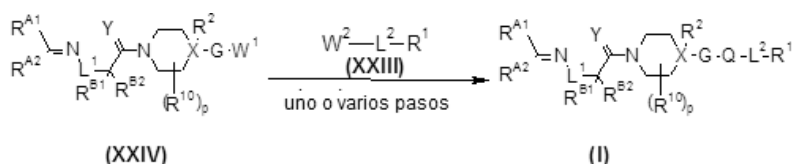
- 10 En las que los símbolos R^{A1} , R^{A2} , R^{B1} , R^{B2} , R^{10} , p , R^2 , X , G , Q , L^1 , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente.

- 15 Las amidas (**Ia**) obtenidas en la realización del *procedimiento A* de acuerdo con la invención (Esquema 1) pueden hacerse reaccionar mediante procedimientos descritos en la literatura dando las correspondientes tioamidas (**Ib**) (p. ej. *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, 2009, 19(2), 462-468). Para ello los compuestos de la fórmula (**Ia**) se hacen reaccionar por lo general con pentasulfuro de fósforo o 2,4-Bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetan-2,4-disulfuro (reactivo de Lawesson) (véase Esquema 7, *procedimiento F*). El *procedimiento A* según la invención preferentemente se realiza usando uno o varios diluyentes. Los disolventes preferentes son tolueno, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano y 1,2-dimetoxietano.

- 20 Después de finalizada la reacción los compuestos (**Ib**) son separados de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación usuales. En caso de ser necesario, los compuestos se purifican mediante recristalización o cromatografía.

Procedimiento B

Esquema 2: procedimiento B



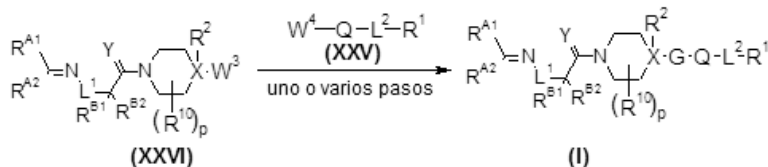
- 25 En las que los símbolos R^{A1} , R^{A2} , R^{B1} , R^{B2} , Y , R^{10} , p , R^2 , X , G , Q , L^1 , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y W^1 y W^2 son grupos funcionales adecuados para la formación del heterociclo deseado **Q**.

- 30 En general es posible preparar compuestos de la fórmula (I) a partir de los correspondientes compuestos (**XXIII**) y (**XXIV**) con grupos funcionales adecuados W^1 y W^2 (**I**) (véase Esquema 2, *procedimiento B*). Los posibles grupos funcionales para W^1 y W^2 son p. ej. aldehídos, cetonas, ésteres, ácidos carboxílicos, amidas, tioamidas, nitrilos, alcoholes, tioles, hidrazinas, oximas, amidinas, amidaoximas, olefinas, acetilenos, haluros, alquilhaluros, metansulfonatos, trifluorometansulfonatos, ácidos borónicos, boronatos, dialquilacetal, quetoximas, etc., que en condiciones de reacción adecuadas pueden formar el heterociclo deseado **Q**. En la literatura se citan numerosos procedimientos para la preparación de heterociclos (véase el documento WO 2008/013622; *Comprehensive Heterocyclic Chemistry Vol. 4-6*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors, Pergamon Press, New York, 1984; *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, Vol 2-4, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. Scriver editors, Pergamon Press, New York, 1996; *The Chemistry of Heterocyclic Compounds*, E. C. Tailor, editor, Wiley, New York; *Rodd's Chemistry of Carbon Compounds*, Vol. 2-4, Elsevier, New York; *Synthesis*, 1982, 6, 508-509; *Tetrahedron*, 2000, 56,

1057-1094).

Procedimiento C

Esquema 3: procedimiento C

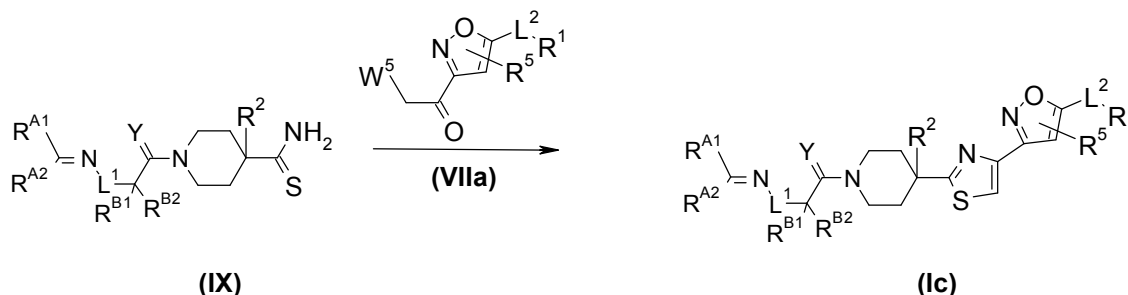


5 En las que los símbolos R^{A1} , R^{A2} , R^{B1} , R^{B2} , Y , R^{10} , p , R^2 , X , G , Q , L^1 , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y W^3 y W^4 son grupos funcionales adecuados para la formación del heterociclo deseado **G**

10 En general es posible preparar los compuestos de la fórmula (I) a partir de los correspondientes compuestos (XXVI) y (XXV) con grupos funcionales adecuados, W^3 y W^4 , (I) (véase Esquema 3, *procedimiento C*). Los posibles grupos funcionales para W^3 y W^4 son p. ej. aldehídos, cetonas, ésteres, ácidos carboxílicos, amidas, tioamidas, nitrilos, alcoholes, tioles, hidrazinas, oximas, amidinas, amidaoximas, olefinas, acetilenos, haluros, alquilhaluros, metansulfonatos, trifluorometansulfonatos, ácido bórico, boronatos etc. En condiciones de reacción adecuadas pueden formar el heterociclo **G** deseado de 5 miembros. En la literatura se encuentran numerosos procedimientos para la preparación de heterociclos (véase el documento WO 2008/013622; *Comprehensive Heterocyclic Chemistry Vol. 4-6*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors, Pergamon Press, New York, 1984; *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, Vol 2-4, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. Scriven editors, Pergamon Press, New York, 1996; *The Chemistry of Heterocyclic Compounds*, E. C. Taylor, editor, Wiley, New York; *Rodd's Chemistry of Carbon Compounds*, Vol. 2-4, Elsevier, New York).

Procedimiento D

Esquema 4: procedimiento D



20 En las que los símbolos R^{A1} , R^{A2} , R^{B1} , R^{B2} , Y , R^5 , R^2 , L^1 , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y W^5 es cloro, bromo, yodo, p-toluenosulfoniloxi, metilsulfoniloxi

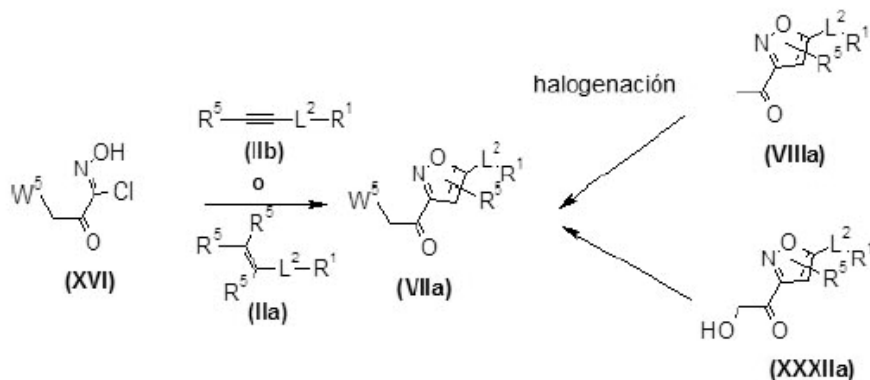
Una determinada posibilidad para la síntesis de compuestos de la fórmula (Ic) a partir de compuestos (IX) con los compuestos (VIIa) se muestran en el Esquema 4 (*procedimiento D*).

25 Las tiocarboxamidas (IX) pueden obtenerse según procedimientos conocidos en la literatura, por ejemplo mediante tionación de la correspondiente carboxamida al usar, p. ej., el reactivo de Lawesson (documento WO2008/013622, *Org. Synth. Vol. 7*, 1990, 372, documento WO2010/065579).

30 Las α -halocetonas o correspondientes equivalentes (p. ej. p-toluenosulfoniloxi o metilsulfoniloxi) (IX) también pueden obtenerse conforme a procedimientos conocidos en la literatura, por ejemplo mediante cicloadición de la correspondiente clorooxima (XVI) con alquenos (IIa) o alquinos (IIb) (documento WO 2008/013622) o mediante halogenación de la correspondiente cetona (VIIa) (p. ej., documentos WO 2011/072207 y WO 2010/065579). Los compuestos (VIIa) pueden prepararse mediante procesos descritos en la literatura (véanse p. ej., los documentos WO 2008/091580; WO 2007/014290; WO 2008/091594; *Journal of Organic Chemistry*, 2011, 728-731; WO 2009/09445; *European Journal of Organic Chemistry*, 2006, 4852-4860; *Synthesis*, 2005, 3541-3548).

35

Esquema 5:



Los tiazoles (**IIc**) se obtienen mediante una síntesis de tiazol de Hantzsch a partir de las tiocarboxamidas (**IX**) y α -halocetonas o los correspondientes equivalentes (**VIIa**) (véase p. ej., "Comprehensive Heterocyclic Chemistry", Pergamon Press, 1984; Vol 6, páginas 235-363, "Comprehensive Heterocyclic Chemistry II", Pergamon Press, 1996; Vol 3, página 373-474 y las referencias allí citadas y el documento WO 07/014290).

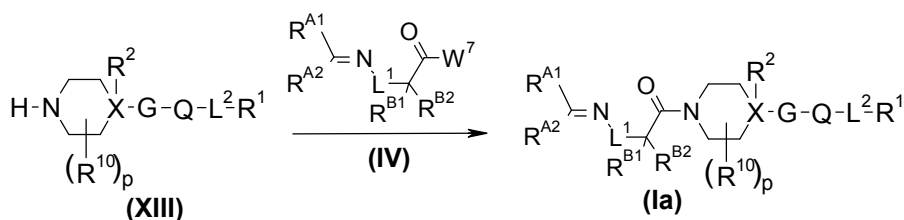
El *procedimiento E* preferentemente se lleva a cabo usando uno o varios diluyentes. Durante la realización del *procedimiento E* preferentemente entran en consideración disolventes orgánicos inertes (como p. ej., N,N-dimetilformamida y etanol).

10 Dado el caso se usa una base auxiliar, como por ejemplo trietilamina.

En caso de ser necesario, los compuestos se purifican mediante recristalización o cromatografía.

Procedimiento E

Esquema 6: procedimiento E



15 En las que los símbolos R^{A1} , R^{A2} , R^{B1} , R^{B2} , R^{10} , p , R^2 , X , G , Q , L^1 , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y W^7 es OH, F, Cl, Br o I.

Una posibilidad de preparar compuestos de la fórmula (**Ia**) a partir de los correspondientes compuestos (**XIII**) con los compuestos (**IV**) se muestra en el Esquema 6 (*procedimiento E*).

20 Los compuestos (**IV**) pueden obtenerse comercialmente o pueden prepararse mediante procedimientos descritos en la literatura (véase p. ej., los documentos WO 2010/065579; WO 2008/156726; *Journal of Organic Chemistry*, 1983, 4567-4571).

25 Un compuesto con la fórmula general (**Ia**) puede sintetizarse análogamente a las instrucciones descritas en la literatura (véase p. ej., el documento WO 2010/065579) mediante una reacción de acoplamiento de un compuesto con la correspondiente fórmula general (**XIII**) con un sustrato de la fórmula general (**IV**), donde W^7 es cloro, flúor, bromo o yodo, dado el caso en presencia de una trampa de ácido / base.

Al menos un equivalente de una trampa de ácido/una base (p. ej. base de Hünig, trietilamina o trampas de ácido poliméricas que pueden adquirirse comercialmente) se usan en relación con el material de partida de la fórmula general (**XIII**). Si el material de partida es una sal, se requieren al menos dos equivalentes de la trampa de ácido.

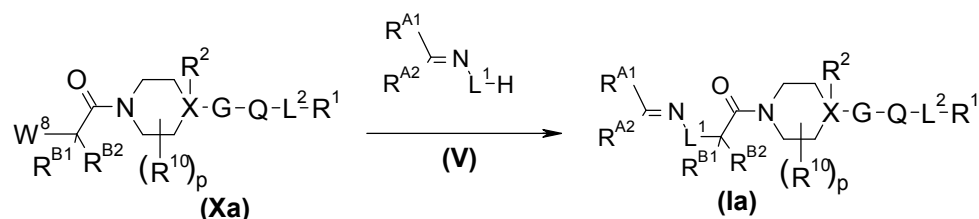
30 En forma alternativa, un compuesto de la fórmula (**Ia**) también puede sintetizarse a partir del correspondiente compuesto de la fórmula (**XIII**) con un sustrato de la fórmula (**IV**), donde W^7 es hidroxilo, en presencia de un reactivo de acoplamiento análogamente a las instrucciones descritas en la literatura (p. ej. *Tetrahedron*, 2005, 61, 10827-10852, y las referencias allí citadas).

Son reactivos de acoplamiento adecuados por ejemplo reactivos de acoplamiento de péptidos, por ejemplo, N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etil-carbodiimida mezclada con 4-dimetilamino-piridina, N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etil-carbodiimida mezclada con 1-hidroxi-benzotriazol, bromo-tripirrolidinofosfonio-hexafluorofosfato, O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluroniohexafluorofosfato o anhídrido de ácido propilfosfónico.

- 5 Después de finalizada la reacción, los compuestos (**la**) son separados de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación usuales. En caso de ser necesario, los compuestos se purifican mediante recristalización o cromatografía.

Procedimiento F

Esquema 7: procedimiento F

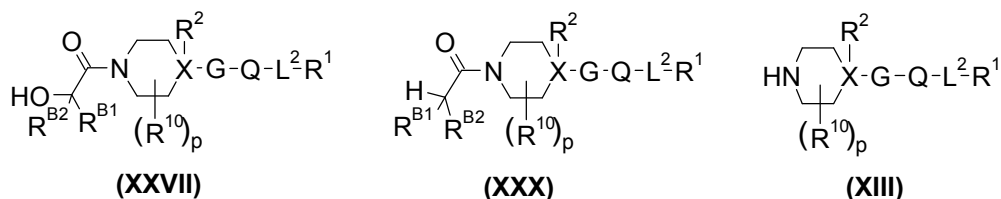


- 10 En las que los símbolos R^{A1} , R^{A2} , R^{B1} , R^{B2} , R^{10} , p , R^2 , X , G , Q , L^1 , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y W^8 es un grupo saliente y L^1 es NR^{L1} , S u O.

Una posibilidad de preparar compuestos de la fórmula (**la**) a partir de los correspondientes compuestos (**Xa**) con los compuestos (**IV**), se muestra en el Esquema 7 (*procedimiento F*).

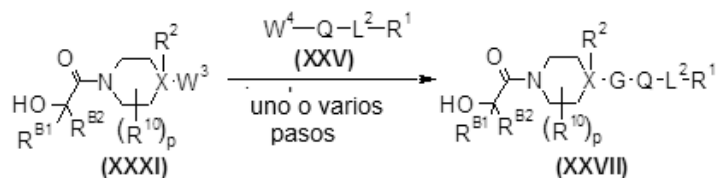
- 15 Los compuestos (**V**) pueden obtenerse comercialmente o pueden prepararse mediante procedimientos descritos en la literatura (véase p. ej., el documento WO 2007/137792; *Synthetic Communications*, 2000, 4255-4262; documento US6307103).

- 20 Las sustancias de partida (**Xa**), donde W^8 es un grupo saliente, pueden prepararse mediante procedimientos descritos en la literatura a partir de los compuestos (**XXVII**), (**XXX**) o (**XIII**) (véase p. ej., mesilación: *Organic Letters*, 2003, 2539-2541; tosilación: documento JP60156601; halogenación: *Australian Journal of Chemistry*, 1983, 2095-2110;). En general, los compuestos de la fórmula (**Xa**, W^8 = cloro) se preparan a partir de una amida de la fórmula (**XIII**) y cloruro de cloroacetilo. Los compuestos (**XXVII**) se preparan análogamente al *procedimiento E* con ácido glicólico o cloruro de hidroxiacetilo a partir de (**XIII**) (véanse p. ej., los documentos WO2007103187, WO2006117521, *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, 2007, 6326-6329).



- 25 Los compuestos (**XXVII**) se preparan análogamente al *procedimiento C* a partir de (**XXXI**) (Esquema 8, véase p. ej., documento WO2008154241).

Esquema 8:



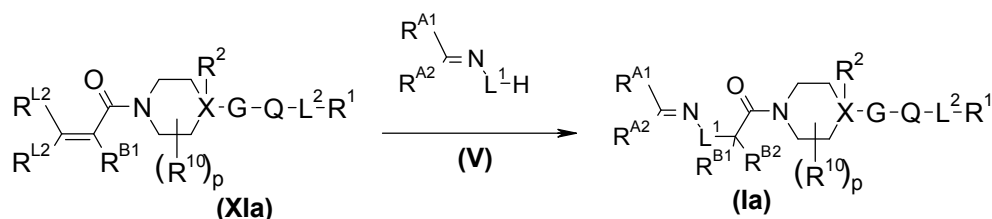
- 30 En las que los símbolos R^{B1} , R^{B2} , R^{10} , p , R^2 , X , G , Q , L^1 , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y W^3 y W^4 son grupos funcionales adecuados para la formación del heterociclo deseado **G**.

Al menos un equivalente de una base (p. ej., hidruro de sodio, carbonato de potasio) se usa en relación con el material de partida de la fórmula general (**Xa**).

Después de finalizada la reacción, los compuestos **(Ia)** son separados de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación usuales. En caso de ser necesario, los compuestos se purifican mediante recristalización o cromatografía.

Procedimiento G

5 **Esquema 9: procedimiento G**



En las que los símbolos R^{L2} , R^{A1} , R^{A2} , R^{B1} , R^{B2} , R^{10} , p , R^2 , X , G , Q , L^1 , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y L^1 es O, S, NR^{L1} y $R^{B2} = H$.

10 Una posibilidad de preparar compuestos de la fórmula **(Ia)** a partir de los correspondientes compuestos **(XIIa)** con los compuestos **(V)**, se muestra en el Esquema 9 (*procedimiento G*).

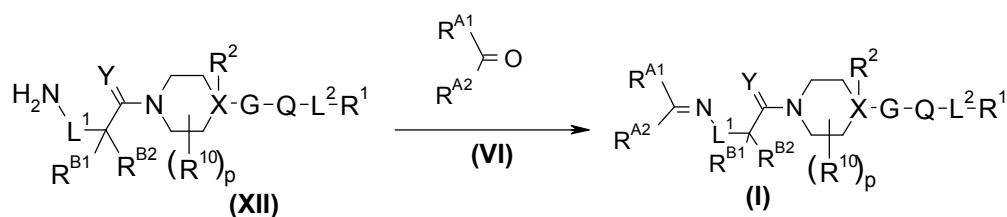
Las sustancias de partida **(XIIa)** se preparan análogamente al *procedimiento E* con ácido acrílico sustituido o no sustituido o cloruro de ácido acrílico sustituido o no sustituido a partir de la amina **(XIII)**.

15 Un compuesto con la fórmula general **(Ia)** puede sintetizarse análogamente a las instrucciones descritas en la literatura mediante una reacción de acoplamiento de un compuesto con la correspondiente fórmula general **(XIIa)** con un sustrato de la fórmula general **(V)** dado el caso en presencia de una base (p. ej., hidróxido de sodio o de potasio, carbonato de potasio) (véase p. ej., el documento WO 2010/065579; *Russian Journal of General Chemistry*, 2005, 915-922; *Journal of Medicinal Chemistry*, 2009, 7397-7409).

20 Después de finalizada la reacción los compuestos **(Ia)** son separados de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación usuales. En caso de ser necesario, los compuestos se purifican mediante recristalización o cromatografía.

Procedimiento H

Esquema 10: procedimiento H



25 En las que los símbolos R^{A1} , R^{A2} , R^{B1} , R^{B2} , R^{10} , p , R^2 , X , G , Q , L^1 , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y L^1 es O, S, NR^{L1} .

Una posibilidad de preparar compuestos de la fórmula **(I)** a partir de los correspondientes compuestos **(XII)** con los compuestos **(VI)**, se muestra en el Esquema 10 (*procedimiento H*).

30 Los compuestos **(VI)** pueden obtenerse comercialmente o pueden prepararse mediante procedimientos descritos en la literatura. Las sustancias de partida **(XII)** se preparan mediante procedimientos descritos en la literatura o análogamente al *procedimiento E* a partir de la amina **(XIII)** (véase p. ej., el documento WO 2010/065579).

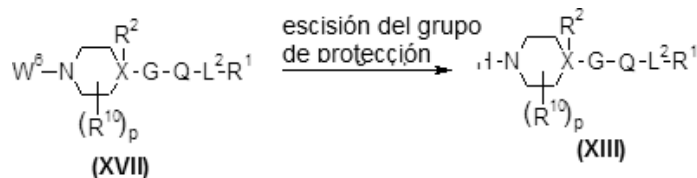
35 Un compuesto con la fórmula general **(Ia)** puede sintetizarse análogamente a las instrucciones descritas en la literatura mediante una reacción de condensación de un compuesto con la correspondiente fórmula general **(XII)** con un sustrato de la fórmula general **(VI)** dado el caso en presencia de una base (p. ej., hidróxido de sodio o de potasio, carbonato de potasio) o en presencia de un ácido (p. ej., ácido acético, ácido sulfúrico o ácido clorhídrico), (véanse p. ej., los documentos WO 2011/020861; WO 2009/105755). Si el material de partida es una sal, se requieren al menos dos equivalentes de la trampa de ácido.

Después de finalizada la reacción, los compuestos **(Ia)** son separados de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación usuales. En caso de ser necesario, los compuestos se purifican mediante recristalización o

cromatografía.

Procedimiento I

Esquema 11: procedimiento I



- 5 En las que los símbolos R^{10} , p , R^2 , X , G , Q , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y W^6 es acetilo, alcóxicarbonilo C_1 - C_4 , bencilo o benciloxycarbonilo.

Una posibilidad de preparar los compuestos de la fórmula (XIII) a partir de los correspondientes compuestos (XVII) se muestra en el Esquema 11 (*procedimiento I*).

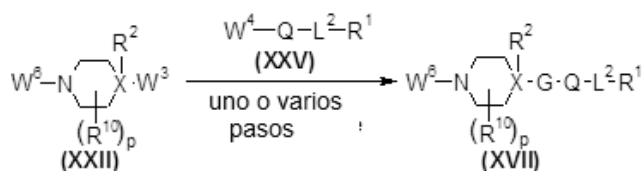
- 10 Un compuesto de la fórmula (XVII) se transforma en un compuesto de la fórmula (XIII) mediante procedimientos adecuados para la escisión de grupos de protección que se han descrito en la literatura ("*Protective Groups in Organic Synthesis*"; Theodora W. Greene, Peter G. M. Wuts; Wiley-Interscience; Third Edition; 1999; 494-653).

- 15 Los grupos de protección *tert*-butoxicarbonilo y benciloxycarbonilo pueden escindirse en el medio ácido (p. ej., con ácido clorhídrico o ácido trifluoroacético). Los grupos de protección acetilo pueden escindirse en condiciones básicas (p. ej. con carbonato de potasio o carbonato de cesio). Los grupos de protección bencílicos pueden escindirse por vía hidrogenolítica con hidrógeno en presencia de un catalizador (p. ej., paladio sobre carbón activado).

- 20 Después de finalizada la reacción, los compuestos (XIII) son separados de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación usuales. En caso de ser necesario, los compuestos se purifican mediante recristalización o cromatografía o, en caso deseado, también pueden usarse en el próximo paso sin purificación anterior. Además es posible aislar los compuestos de la fórmula general (XIII) en forma de sal, p. ej. como sal del ácido clorhídrico o el ácido trifluoroacético.

Procedimiento J

Esquema 12: procedimiento J

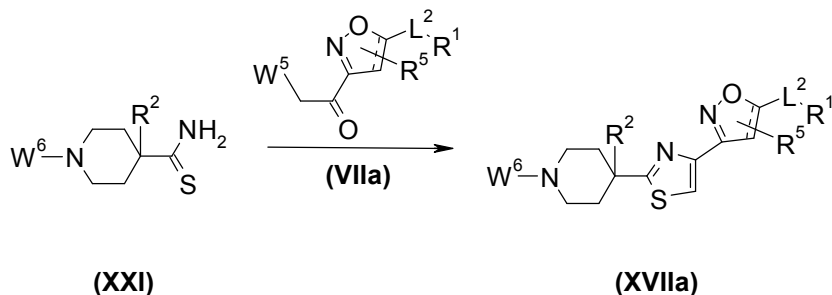


- 25 En las que los símbolos R^{10} , p , R^2 , X , G , Q , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y W^6 es acetilo, alcóxicarbonilo C_1 - C_4 , bencilo o benciloxycarbonilo y W^3 y W^4 son grupos funcionales adecuados para la formación del heterociclo deseado.

En general es posible preparar el intermedio (XVII) a partir de los correspondientes compuestos (XXII) con los compuestos (XXV). El *procedimiento J* (Esquema 12) se lleva a cabo análogamente al *procedimiento C* (Esquema 3).

Procedimiento K

Esquema 13: procedimiento K

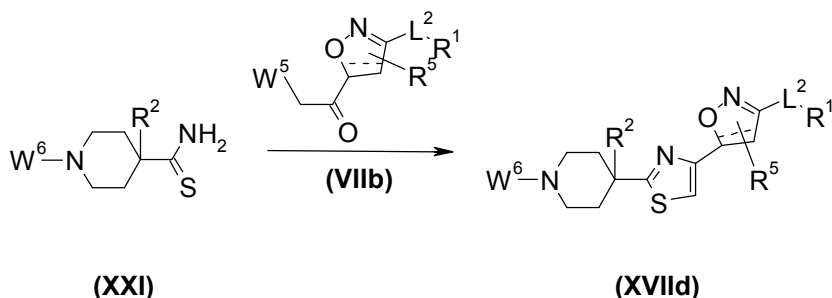


5 En las que los símbolos R^5 , R^2 , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y W^5 es cloro, bromo, yodo, p-toluenosulfonilo, metilsulfonilo y W^6 es acetilo, alcóxicarbonilo C_1-C_4 , bencilo o benciloxycarbonilo.

Otra posibilidad de preparar el intermedio de la fórmula (XVIIId) a partir de los correspondientes compuestos (XXI), se muestra en el Esquema 14 (procedimiento L). Los compuestos (XXI) pueden obtenerse comercialmente o pueden prepararse mediante procedimientos descritos en la literatura (véanse p. ej., los documentos WO 2008/013622 y WO 2007/014290). El procedimiento K se lleva a cabo análogamente el procedimiento D (Esquema 4).

10 Procedimiento L

Esquema 14: procedimiento L

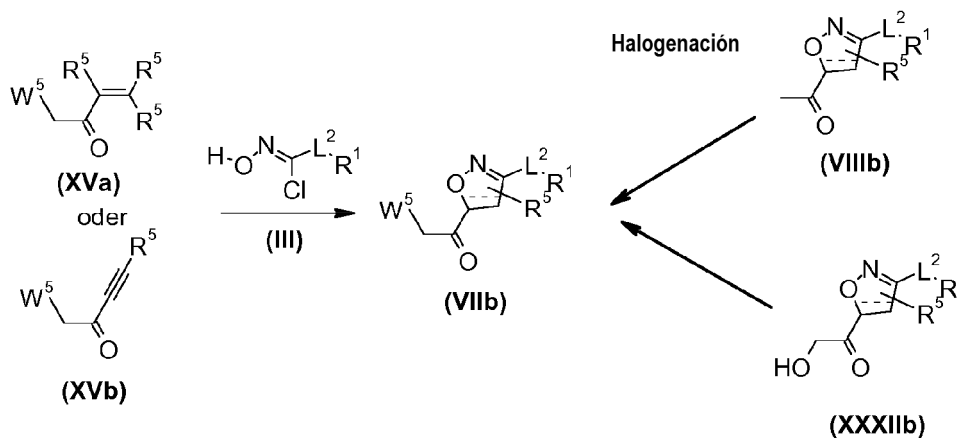


En las que los símbolos R^5 , R^2 , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y W^5 es cloro, bromo, yodo, p-toluenosulfonilo, metilsulfonilo y W^6 es acetilo, alcóxicarbonilo C_1-C_4 , bencilo o benciloxycarbonilo.

15 Otra posibilidad de preparar el intermedio de la fórmula (XVIIId) a partir de los correspondientes compuestos (XXI), se muestra en el Esquema 14 (procedimiento L).

20 Las α -halocetonas o los correspondientes equivalentes (p. ej., p-toluenosulfonilo o metilsulfonilo) (VIIb) pueden prepararse mediante procesos descritos en la literatura (Esquema 15), por ejemplo mediante cicloadición de la correspondiente clorooxima (III) con alquenos (XVa) o alquinos (XVb) o mediante halogenación de la correspondiente cetona (VIIIb) (p. ej. *Journal of Medicinal Chemistry*, 1991, 600-605 y *Journal of Heterocyclic Chemistry*, 1988, 337-342). Los compuestos (VIIb) pueden prepararse mediante procesos descritos en la literatura (véase p. ej., el documento WO 2008/ 091580, WO 2007/014290 y WO 2008/091594).

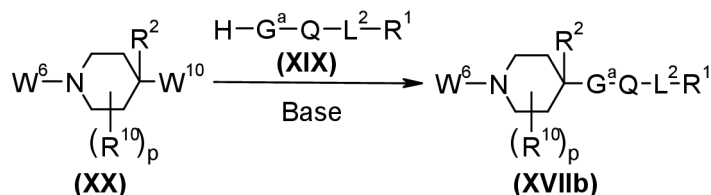
Esquema 15



El procedimiento L se realiza análogamente al procedimiento D (Esquema 4).

Procedimiento M

5 Esquema 16: procedimiento M



En las que los símbolos R^{10} , p , R^2 , Q , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y G^a es un resto piperidina que está unido por medio de átomo de nitrógeno o de carbono, W^6 es acetilo, alcoxicarbonilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, bencilo o benciloxicarbonilo y W^{10} es cloro, bromo, yodo, metilsulfonilo o trifluorometilsulfonilo.

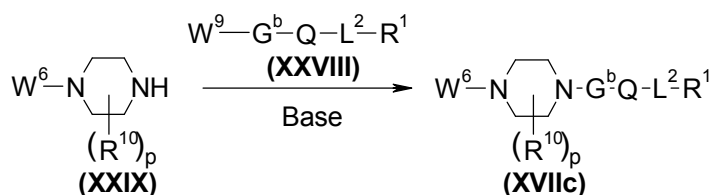
- 10 Un compuesto con la fórmula general (XVIIb) puede sintetizarse análogamente a las instrucciones descritas en la literatura mediante una reacción de acoplamiento de un compuesto con la correspondiente fórmula general (XX) con un sustrato de la fórmula general (XIX) dado el caso en presencia de una base (Esquema 15, procedimiento M), (véase p. ej., para el acoplamiento Zn/Pd: documentos WO2008/147831, WO 2006/106423 (piridina), Shakespeare, W. C. *et al Chem. Biol. Drug Design* 2008, 71, 97-105 (derivados de pirimidina), Pasternak, A. *et al Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2008, 18, 994-998 (diazinas); Coleridge, B. M.; Bello, C. S.; Leitner, A. *Tetrahedron Lett.* 2009, 50, 4475-4477; Bach, T., Heuser, S. *Angew. Chem. Int. Ed.* 2001, 40, 3184-3185. (tiazoles); para sustituciones nucleófilas: documentos WO 2008/104077; WO 2006/084015 (pirazoles con N-sustitución)

Para sustituciones nucleófilas se usa al menos un equivalente de una base (p. ej. hidruro de sodio, carbonato de potasio) en relación con el material de partida de la fórmula general (XX).

- 20 Después de finalizada la reacción, los compuestos (XVIIb) son separados de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación usuales. En caso de ser necesario, los compuestos se purifican mediante recristalización o cromatografía o, en caso deseado, también pueden usarse en el próximo paso sin purificación anterior.

Procedimiento N

Esquema 17: procedimiento N



5 En las que los símbolos R^{10} , p , R^2 , Q , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente; G^b es un anillo de piperazina que está unido por medio de un átomo de carbono y W^6 es acetilo, alcóxicarbonilo C_1 - C_4 , bencilo o benciloxicarbonilo y W^9 es cloro, bromo, yodo, metilsulfonilo o trifluorometilsulfonilo.

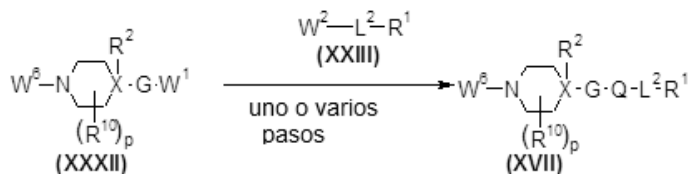
10 Un compuesto con la fórmula general (XVIIc) puede sintetizarse análogamente a las instrucciones descritas en la literatura (véase p. ej., para sustituciones nucleófilas: Li, C. S., Belair, L., Guay, J. *et al Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2009, 19, 5214-5217; documento WO 2008/062276; para acoplamientos de cobre: Yeh, V. S. C.; Wiedeman, P. E. *Tetrahedron Lett.* 2006, 47, 6011-6016; para acoplamiento de paladio: documento WO 2005/061457) mediante una reacción de acoplamiento de un compuesto con la correspondiente fórmula general (XXIX) con un sustrato de la fórmula general (XXVIII) dado el caso en presencia de una base (Esquema 17, procedimiento N).

Al menos un equivalente de una base (p. ej. hidruro de sodio, carbonato de potasio) se usa en relación con el material de partida de la fórmula general (XXIX).

15 Después de finalizada la reacción, los compuestos (XVIIc) son separados de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación usuales. En caso de ser necesario, los compuestos se purifican mediante recristalización o cromatografía o, en caso deseado, también pueden usarse en el próximo paso sin purificación anterior.

Procedimiento O

Esquema 18: procedimiento O

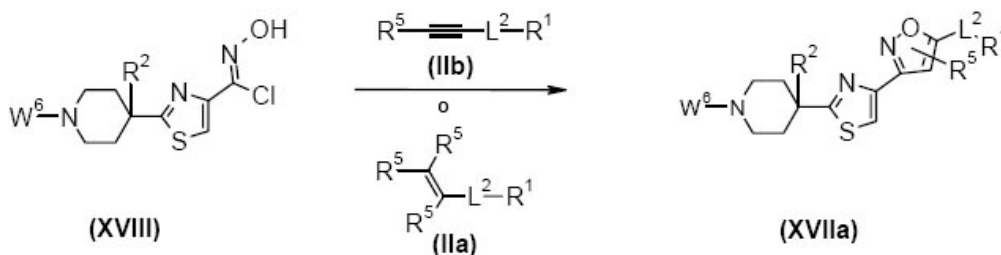


20 En las que los símbolos R^1 , R^{10} , p , R^2 , Q , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y W^6 es acetilo, alcóxicarbonilo C_1 - C_4 , bencilo o benciloxicarbonilo, W^1 y W^2 son grupos funcionales, que son adecuados para la formación del heterociclo deseado **Q**.

25 En general es posible preparar el intermedio (XVII) a partir de los correspondientes compuestos (XXXII) y (XXIII). El procedimiento O (Esquema 18) se lleva a cabo análogamente al procedimiento B (Esquema 2).

Procedimiento P

Esquema 19: procedimiento P



30 En las que los símbolos R^1 , R^2 , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y W^6 es acetilo, alcóxicarbonilo C_1 - C_4 , bencilo o benciloxicarbonilo.

Una determinada posibilidad de preparar los compuestos de la fórmula **(XVIIa)** a partir de los correspondientes compuestos **(XVIII)** mediante la reacción con los compuestos **(IIa)** o **(IIb)**, se muestra en el *procedimiento P* (Esquema 19).

5 Los compuestos **(XVIII)** pueden prepararse mediante procesos descritos en la literatura (véase p. ej., los documentos WO 05/0040159, WO 08/013622 y WO 2011/076699).

Los alquenos y alquinos **(IIa)** y **(IIb)** están disponibles comercialmente o pueden prepararse según instrucciones descritas en la literatura (p. ej., a partir de cetonas o aldehídos mediante una olefinación de Wittig o Horner-Wadsworth-Emmons: *Chem. Rev.* 1989, 89, 863-927 y olefinación de Julia: *Tetrahedron Lett.*, 1973, 14, 4833-4836; olefinación de Peterson: *J. Org. Chem.* 1968, 33, 780; con reactivo de Bestmann-Ohira: *Synthesis* 2004, 1, 59-62).

10 Un compuesto de la fórmula general **(XVIIa)** se obtiene de un alqueno de la fórmula general **(IIa)** o de un alquino de la fórmula **(IIb)** y el compuesto **(XVIII)** mediante una reacción de cicloadición (véase p. ej., documento WO 08/013622 y *Synthesis*, 1987, 11, 998-1001).

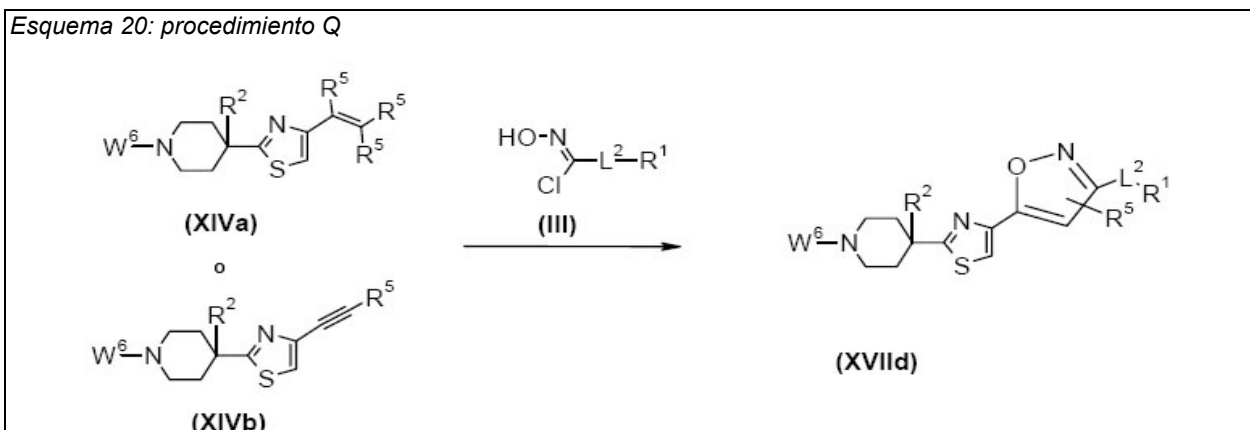
15 El *procedimiento P* se realiza en presencia de una base adecuada. Son bases adecuadas las aminas terciarias (p. ej. trietilamina), carbonatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos (p. ej., carbonato de potasio o de sodio), hidrogenocarbonatos y fosfatos.

El *procedimiento P* se realiza preferentemente empleando uno o varios diluyentes. Durante la realización del *procedimiento P* entran en consideración preferentemente disolventes orgánicos inertes (como p. ej., tolueno y hexano). También se puede usar agua como disolvente. Alternativamente, se puede realizar el *procedimiento P* con un excedente del alqueno **(IIa)** o del alquino **(IIb)**.

20 El procesamiento se efectúa por procedimientos usuales. En caso de ser necesario, los compuestos se purifican mediante recristalización o cromatografía.

Procedimiento Q

Esquema 20: procedimiento Q



25 En las que los símbolos R^1 , R^2 , L^2 y R^1 tienen las definiciones generales indicadas anteriormente y W^6 es acetilo, alcoxycarbonilo C_1 - C_4 , bencilo o benciloxycarbonilo. Una determinada posibilidad de preparar los compuestos de la fórmula **(XVIIId)** a partir de los correspondientes compuestos **(XIVa)** o **(XIVb)** análogamente al *procedimiento P* (Esquema 19) mediante una reacción de cicloadición con los compuestos **(III)**, se muestra en el Esquema 20 (*procedimiento Q*).

30 Los alquenos y alquinos **(XIVa)** y **(XIVb)** pueden prepararse a partir de precursores que pueden obtenerse comercialmente (p. ej., los documentos WO2009/145360; WO2010/037479; WO 2009/055514; WO 2008/013925; WO 2008/013622).

35 Se observa que algunos reactivos y condiciones de reacción que se describieron anteriormente para preparar compuestos de la fórmula **(I)** no pueden ser compatibles con determinadas funcionalidades existentes en los compuestos intermedios. En estos casos ayuda la incorporación de secuencias de protección-desprotección o transformación mutua de grupos funcionales en la síntesis, para obtener los productos deseados. El uso y la elección de los grupos de protección es evidente para el experto en la técnica de síntesis química (véase p. ej., "Protective Groups in Organic Synthesis"; Third Edition; 494-653, y la literatura allí citada). El experto en la técnica podrá reconocer que en algunos casos después de la introducción de un reactivo dado, como se ha mostrado en un esquema individual, puede ser necesario realizar pasos de síntesis rutinarios que no se describen en detalle, para completar la síntesis de compuestos de la fórmula **(I)**. El experto en la técnica también podrá reconocer que puede ser necesario realizar una combinación de los pasos, que se muestran en los esquemas anteriores, en otro orden
 40 que los de la secuencia implicada mostrada especialmente, para preparar los compuestos de la fórmula **(I)**.

El procesamiento se efectúa por procedimientos usuales. En caso de ser necesario, los compuestos se purifican mediante recristalización o cromatografía.

Otro objeto de la invención se refiere a un agente para combatir microorganismos indeseados, que comprende al menos un derivado de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina de acuerdo con la presente invención.

- 5 Además la invención se refiere a un procedimiento no terapéutico para combatir microorganismos indeseados, caracterizado porque los derivados de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina de la invención se aplican sobre los microorganismos y/o en su biotopo.

Por lo demás la invención se refiere a una semilla que se trató con al menos un derivado de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina de acuerdo con la invención.

- 10 Un último objeto de la invención se refiere a un procedimiento para proteger semillas de microorganismos indeseados mediante el uso de una semilla tratada con al menos un derivado de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina de acuerdo con la presente invención.

- 15 Las sustancias de acuerdo con la invención presentan una fuerte acción microbicida y pueden emplearse para combatir microorganismos indeseados, como hongos y bacterias, para la protección de las plantas y la protección de materiales.

Los derivados de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina de acuerdo con la invención de la fórmula (I) poseen muy buenas propiedades fungicidas y pueden emplearse por ejemplo para combatir plasmodioforomicetos, oomicetos, quitridiomycetos, cigomicetos, ascomycetos, basidiomicetos y deuteromicetos.

- 20 Los bactericidas pueden emplearse para la protección de plantas por ejemplo para combatir Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae y Streptomycetaceae.

Los agentes fungicidas de acuerdo con la invención pueden usarse para combatir hongos fitopatógenos en forma curativa o protectora. La invención por lo tanto también se refiere a procedimientos curativos o protectores para combatir hongos fitopatógenos mediante el uso de los principios activos o agentes de la invención que se aplican sobre las semillas, las plantas o partes de plantas, los frutos o el suelo en el que crecen las plantas.

- 25 Los agentes de acuerdo con la invención para combatir hongos fitopatógenos en la protección de plantas comprenden una cantidad efectiva, pero no fitotóxica de los principios activos de la invención. Una "cantidad efectiva, pero no fitotóxica" significa una cantidad del agente de la invención que es suficiente para controlar de manera satisfactoria o eliminar por completo la infestación con hongos de la planta y que simultáneamente no conlleve síntomas significativos de fitotoxicidad. Esa cantidad de aplicación en general puede variar en un intervalo más grande. Depende de varios factores, p. ej., del hongo a combatir, de la planta, de las condiciones climáticas y de las sustancias de contenido de los agentes de la invención.

- 30 De conformidad con la invención, pueden recibir tratamiento todas las plantas y partes de las mismas. Por plantas se entiende según esto todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres, deseables o no deseables o de cultivo (inclusive plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser aquellas obtenidas mediante procedimientos convencionales de cultivo y de optimización o por procedimientos biotecnológicos o genéticos, o mediante combinaciones de estos procedimientos, inclusive las plantas transgénicas y las variedades de plantas susceptibles o no de protección legal. Por partes de plantas se entiende todas las partes u órganos sobre o bajo el suelo de las plantas, como el brote, la hoja, la flor y la raíz, mencionándose a modo de ejemplo hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas, como también raíces, tubérculos y rizomas. También integra las plantas la parte cosechable y el material de reproducción vegetativo o generativo, por ejemplo esquejes, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

- 35 Como plantas que pueden ser tratadas de acuerdo con la invención se citan las siguientes: algodón, lino, vides, frutas, hortalizas, como por ejemplo *Rosaceae sp.* (p. ej., frutos con pepitas como la manzana y la pera, pero también frutos con hueso como albaricoques, cerezas, almendras y melocotones y frutos de baya, como fresas), *Ribesioideae sp.*, *Juglandaceae sp.*, *Betulaceae sp.*, *Anacardiaceae sp.*, *Fagaceae sp.*, *Moraceae sp.*, *Oleaceae sp.*, *Actinidaceae sp.*, *Lauraceae sp.*, *Musaceae sp.* (por ejemplo, árbol bananero o plantaciones) *Rubiaceae sp.* (p. ej., café), *Theaceae sp.*, *Sterculiaceae sp.*, *Rutaceae sp.* (p. ej., limones, naranjas y pomelos); *Solanaceae sp.* (p. ej., tomates), *Liliaceae sp.*, *Asteraceae sp.* (p. ej., lechuga), *Umbelliferae sp.*, *Cruciferae sp.*, *Chenopodiaceae sp.*, *Cucurbitaceae sp.* (p. ej., pepino), *Alliaceae sp.* (p. ej., puerro, cebolla), *Papilionaceae sp.* (por ejemplo guisantes); 40 plantas de cultivos más importantes, tal como *Gramineae sp.* (por ejemplo maíz, césped, cereales, tal como trigo, centeno, arroz, cebada, avena, mijo y triticale), *Asteraceae sp.* (por ejemplo girasol), *Brassicaceae sp.* (por ejemplo repollo blanco, repollo colorado, brócoli, coliflor, repollitos de Bruselas, pak choi, colirrábano, rabanitos así como colza, mostaza, rábano picante y berro), *Fabaceae sp.* (por ejemplo judías, cacahuets), *Papilionaceae sp.* (por ejemplo porotos de soja), *Solanaceae sp.* (por ejemplo patatas), *Chenopodiaceae sp.* (p. ej., remolacha azucarera, remolacha forrajera, acelga, remolacha); plantas de uso y decorativas en jardín y bosques, así como también 55 especies genéticamente modificadas de estas plantas.

A modo de ejemplo, pero sin ser limitativo, se mencionan algunos agentes patógenos de enfermedades fúngicas que pueden tratarse de acuerdo con la invención:

- 5 enfermedades producidas por agentes patógenos del oídio, como p. ej., especies de *Blumeria*, como por ejemplo *Blumeria graminis*; especies de *Podosphaera*, como por ejemplo *Podosphaera leucotricha*; especies de *Sphaerotheca*, como por ejemplo *Sphaerotheca fuliginea*; especies de *Uncinula*, como por ejemplo *Uncinula necator*;
- 10 enfermedades producidas por agentes patógenos de la roya como p. ej., especies de *Gymnosporangium*, como por ejemplo *Gymnosporangium sabinae*; especies de *Hemileia*, como por ejemplo *Hemileia vastatrix*; especies de *Phakopsora*, como por ejemplo *Phakopsora pachyrhizi* o *Phakopsora meibomiae*; especies de *Puccinia*, como por ejemplo *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* o *Puccinia striiformis*; especies de *Uromyces*, como por ejemplo *Uromyces appendiculatus*;
- 15 enfermedades producidas por agentes patógenos del grupo de los oomicetos como p. ej., especies de *Albugo*, como por ejemplo *Albugo candida*; especies de *Bremia*, como por ejemplo *Bremia lactucae*; especies de *Peronospora*, como por ejemplo *Peronospora pisi* o *P. brassicae*; especies de *Phytophthora*, como por ejemplo *Phytophthora infestans*; especies de *Plasmopara*, como por ejemplo *Plasmopara viticola*; especies de *Pseudoperonospora*, como por ejemplo *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*; especies de *Pythium*, como por ejemplo *Pythium ultimum*;
- 20 enfermedades del manchado y marchitado de las hojas, causadas por p. ej., especies de *Alternaria*, como por ejemplo *Alternaria solani*; especies de *Cercospora*, como por ejemplo *Cercospora beticola*; especies de *Cladosporium*, como por ejemplo *Cladosporium cucumerinum*; especies de *Cochliobolus*, como por ejemplo *Cochliobolus sativus* (forma de conidias: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*) o *Cochliobolus miyabeanus*; especies de *Colletotrichum*, como por ejemplo *Colletotrichum lindemuthianum*; especies de *Cycloconium*, como por ejemplo *Cycloconium oleaginum*; especies de *Diaporthe*, como por ejemplo *Diaporthe citri*; especies de *Elsinoe*, como por ejemplo *Elsinoe fawcettii*; especies de *Gloeosporium*, como por ejemplo *Gloeosporium laeticolor*; especies de *Glomerella*, como por ejemplo *Glomerella cingulata*; especies de *Guignardia*, como por ejemplo *Guignardia bidwellii*; especies de *Leptosphaeria* como por ejemplo *Leptosphaeria maculans*; especies de *Magnaporthe*, como por ejemplo *Magnaporthe grisea*; especies de *Microdochium*, como por ejemplo *Microdochium nivale*; especies de *Mycosphaerella*, como por ejemplo *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola* o *Mycosphaerella fijiensis*; especies de *Phaeosphaeria*, como por ejemplo *Phaeosphaeria nodorum*; especies de *Pyrenophora*, como por ejemplo *Pyrenophora teres* o *Pyrenophora tritici repentis*; especies de *Ramularia*, como por ejemplo *Ramularia collo-cygni* o *Ramularia areola*; especies de *Rhynchosporium*, como por ejemplo *Rhynchosporium secalis*; especies de *Septoria*, como por ejemplo *Septoria apii* o *Septoria lycopersici*; especies de *Stagonospora*, como por ejemplo *Stagonospora nodorum*; especies de *Typhula*, como por ejemplo *Typhula incarnata*; especies de *Venturia*, como por ejemplo *Venturia inaequalis*;
- 25 enfermedades de las raíces y los tallos causadas p. ej., por especies de *Corticium*, como por ejemplo *Corticium graminearum*; especies de *Fusarium*, como por ejemplo *Fusarium oxisporum*; especies de *Gaeumannomyces*, como por ejemplo *Gaeumannomyces graminis*; especies de *Plasmodiophora*, como por ejemplo *Plasmodiophora brassicae*; especies de *Rhizoctonia*, como por ejemplo *Rhizoctonia solani*; especies de *Sarocladium*, como por ejemplo *Sarocladium oryzae*; especies de *Sclerotium*, como por ejemplo *Sclerotium oryzae*; especies de *Tapesia*, como por ejemplo *Tapesia acuformis*; especies de *Thielaviopsis*, como por ejemplo *Thielaviopsis basicola*;
- 30 enfermedades de espigas y panículas (inclusive mazorcas de maíz), causadas p.ej., por especies de *Alternaria*, como por ejemplo *Alternaria spp.*; especies de *Aspergillus*, como por ejemplo *Aspergillus flavus*; especies de *Cladosporium*, como por ejemplo *Cladosporium cladosporioides*; especies de *Claviceps*, como por ejemplo *Claviceps purpurea*; especies de *Fusarium*, como por ejemplo *Fusarium culmorum*; especies de *Gibberella*, como por ejemplo *Gibberella zeae*; especies de *Monographella*, como por ejemplo *Monographella nivalis*; especies de *Stagonospora*, como por ejemplo *Stagonospora nodorum*;
- 35 enfermedades causadas por ustilagináceas como p. ej., especies de *Sphacelotheca*, como por ejemplo *Sphacelotheca reiliana*; especies de *Tilletia*, como por ejemplo *Tilletia caries* o *Tilletia controversa*; especies de *Urocystis*, como por ejemplo *Urocystis occulta*; especies de *Ustilago*, como por ejemplo *Ustilago nuda*;
- 40 podredumbre de la fruta causada p. ej., por especies de *Aspergillus*, como por ejemplo *Aspergillus flavus*; especies de *Botrytis*, como por ejemplo *Botrytis cinerea*; especies de *Penicillium*, como por ejemplo *Penicillium expansum* o *Penicillium purpurogenum*; especies de *Rhizopus*, como por ejemplo *Rhizopus stolonifer*; especies de *Sclerotinia*, como por ejemplo *Sclerotinia sclerotiorum*; especies de *Verticillium*, como por ejemplo *Verticillium albo-atrum*;
- 45 podredumbre de semillas y raíces proveniente del suelo y marchitamiento, así como enfermedades de plantas nacidas de semillas, causadas p. ej., por especies de *Alternaria*, tal como, por ejemplo, *Alternaria brassicicola*; especies de *Aphanomyces*, tal como, por ejemplo, *Aphanomyces euteiches*; especies de *Ascochyta*, tal como, por ejemplo, *Ascochyta lentis*; especies de *Aspergillus*, tal como, por ejemplo, *Aspergillus flavus*; especies de

- Cladosporium, tal como, por ejemplo, *Cladosporium herbarum*; especies de Cochliobolus, tal como, por ejemplo, *Cochliobolus sativus* (forma conidia: Drechslera, Bipolaris Syn: Helminthosporium); especies de Colletotrichum, tal como, por ejemplo, *Colletotrichum coccodes*; especies de Fusarium, tal como, por ejemplo, *Fusarium culmorum*; especies de Gibberella, tal como, por ejemplo, *Gibberella zeae*; especies de Macrophomina, tal como, por ejemplo, *Macrophomina phaseolina*; especies de Microdochium, tal como, por ejemplo, *Microdochium nivale*; especies de Monographella, tal como, por ejemplo, *Monographella nivalis*; especies de Penicillium, tal como, por ejemplo, *Penicillium expansum*; especies de Phoma, tal como, por ejemplo, *Phoma lingam*; especies de Phomopsis, tal como, por ejemplo, *Phomopsis sojae*; especies de Phytophthora, tal como, por ejemplo, *Phytophthora cactorum*; especies de Pyrenophora, tal como, por ejemplo, *Pyrenophora gramineae*; especies de Pyricularia, tal como, por ejemplo, *Pyricularia oryzae*; especies de Pythium, tal como, por ejemplo, *Pythium ultimum*; especies de Rhizoctonia, tal como, por ejemplo, *Rhizoctonia solani*; especies de Rhizopus, tal como, por ejemplo, *Rhizopus oryzae*; especies de Sclerotium, tal como, por ejemplo, *Sclerotium rolfsii*; especies de Septoria, tal como, por ejemplo, *Septoria nodorum*; especies de Typhula, tal como, por ejemplo, *Typhula incarnata*; especies de Verticillium, tal como, por ejemplo, *Verticillium dahliae*;
- 5 enfermedades cancerosas, agallas y escobas de bruja, causadas p. ej., por especies de Nectria, como por ejemplo *Nectria galligena*;
- marchitamientos causados p. ej., por especies de Monilinia, como por ejemplo *Monilinia laxa*;
- deformaciones de hojas, flores y frutos, causadas p. ej., por especies de Exobasidium, tal como por ejemplo, *Exobasidium vexans*; especies de Taphrina, como por ejemplo *Taphrina deformans*;
- 10 enfermedades de degeneración de plantas leñosas causadas p. ej., por especies de Esca, como por ejemplo *Phaemoniella clamydospora* y *Phaeoacremonium aleophilum* y *Fomitiporia mediterranea*; especies de Ganoderma, tal como, por ejemplo, *Ganoderma boninense*;
- enfermedades de las flores y las semillas, causadas p. ej., por especies de Botrytis, como por ejemplo *Botrytis cinerea*;
- 25 enfermedades de bulbos de plantas, causadas p. ej., por especies de Rhizoctonia, como por ejemplo *Rhizoctonia solani*; especies de Helminthosporium, como por ejemplo *Helminthosporium solani*;
- enfermedades causadas por agentes bacterianos como p. ej., por especies de Xanthomonas, como por ejemplo *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*; especies de Pseudomonas, como por ejemplo *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*; especies de Erwinia, como por ejemplo *Erwinia amilovorana*.
- 30 Preferentemente se pueden combatir las siguientes enfermedades de la soja:
- enfermedades fúngicas en las hojas, tallos, vainas y semillas causadas por p. ej., *Alternaria leaf spot* (*Alternaria spec. atrans tenuissima*), Anthracnose (*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*), Brown spot (*Septoria glycinis*), Cercospora leaf spot and blight (*Cercospora kikuchii*), Choanephora leaf blight (*Choanephora infundibulifera trisporea* (Syn.)), Dactuliophora leaf spot (*Dactuliophora glycinis*), Downy Mildew (*Peronospora manshurica*), Drechslera blight (*Drechslera glycini*), Frog-eye Leaf spot (*Cercospora sojina*), Leptosphaerulina Leaf Spot (*Leptosphaerulina trifolii*), Phyllosticta Leaf Spot (*Phyllosticta sojaecola*), Pod and Stem Blight (*Phomopsis sojae*), Powdery Mildew (*Microsphaera diffusa*), pirenochaeta Leaf Spot (*Pyrenochaeta glycinis*), Rhizoctonia Aerial, Foliage, and Web Blight (*Rhizoctonia solani*), Rust (*Phakopsora pachyrhizi*, *Phakopsora meibomiae*), Scab (*Sphaceloma glycinis*), Stemphiliium Leaf Blight (*Stemphiliium botryosum*), Target Spot (*Corynespora cassiicola*).
- 35 Enfermedades fúngicas en las raíces y en la base del tallo causadas por p. ej., Black Root Rot (*Calonectria crotalariae*), Charcoal Rot (*Macrophomina phaseolina*), Fusarium Blight or Wilt, Root Rot, and Pod and Collar Rot (*Fusarium oxysporum*, *Fusarium orthoceras*, *Fusarium semitectum*, *Fusarium equiseti*), Mycoleptodiscus Root Rot (*Mycoleptodiscus terrestris*), Neocosmospora (*Neocosmospora vasinfecta*), Pod and Stem Blight (*Diaporthe phaseolorum*), Stem Canker (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*), Phytophthora Rot (*Phytophthora megasperma*), Brown Stem Rot (*Phialophora gregata*), Pythium Rot (*Pythium aphanidermatum*, *Pythium irregulare*, *Pythium debaryanum*, *Pythium myriotilum*, *Pythium ultimum*), Rhizoctonia Root Rot, Stem Decay, and Damping-Off (*Rhizoctonia solani*), Sclerotinia Stem Decay (*Sclerotinia sclerotiorum*), Sclerotinia Southern Blight (*Sclerotinia rolfsii*), Thielaviopsis Root Rot (*Thielaviopsis basicola*).
- 45
- 50 Los principios activos de la invención también presentan una muy buena acción fortificante en las plantas. Por lo tanto, son adecuados para movilizar las defensas propias de la planta contra la infestación de microorganismos indeseados.
- En el presente contexto se debe entender por sustancias fortificantes (inductoras de la resistencia) de la planta aquellas sustancias que tienen la capacidad de estimular el sistema de defensa de las plantas de manera tal que las plantas tratadas en la posterior inoculación con microorganismos indeseados desarrollan una gran resistencia a estos microorganismos.
- 55

- 5 En el presente caso deben entenderse por microorganismos indeseados los hongos fitopatógenos y las bacterias. Las sustancias de la invención, por lo tanto, pueden emplearse para proteger plantas dentro de un período determinado posterior al tratamiento contra la infestación de los agentes patógenos mencionados. El período por el cual se produce la protección, por lo general, es de 1 a 10 días, preferentemente de 1 a 7 días después del tratamiento de las plantas con los principios activos.
- La buena tolerancia en las plantas de los principios activos en las concentraciones necesarias para combatir las enfermedades de las plantas, permite un tratamiento de las partes de las plantas que crecen por encima del suelo, de plantones y de semillas y del suelo.
- 10 Los principios activos de la invención pueden emplearse de manera especialmente exitosa para combatir enfermedades en cultivos de vino, de frutos, de patatas y de hortalizas, como por ejemplo especialmente contra hongos de falso oídio, oomicetos, como por ejemplo de las especies *Phytophthora*, *Plasmopara*, *Pseudoperonospora* y *Pythium*.
- Los principios activos de la invención también son adecuados para aumentar el rendimiento de las cosechas. Además son de baja toxicidad y son bien tolerados por las plantas.
- 15 Los compuestos de acuerdo con la invención dado el caso también pueden usarse en determinadas concentraciones o bien cantidades de aplicación como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, o como microbicidas, por ejemplo como funguicida, antimicótico, bactericida, viricida (incluyendo agentes contra viroides) o como agente contra *MLO* (*Mycoplasma-like-organism*) y *RLO* (*Rickettsia-like-organism*). Éstos pueden emplearse dado el caso también como insecticidas.
- 20 Pueden emplearse dado el caso también como productos intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.
- Con buena tolerancia en plantas, en animales de sangre caliente y de bajo impacto medioambiental, los principios activos de la invención son adecuados para la protección de plantas, órganos de plantas y para aumentar el rendimiento, mejorar la calidad de las cosechas, en la agricultura, en la horticultura, en la cría de animales, en forestaciones, en jardines e instalaciones de tiempo libre, para la protección de productos almacenados y de material, así como en el sector de higiene. Pueden ser empleados preferentemente como pesticidas. Son efectivos tanto contra especies de sensibilidad normal y especies resistentes como también en todas o algunas de las etapas de desarrollo.
- 25 El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los principios activos o bien agentes se realiza directamente o mediante acción sobre su entorno, su biotopo o su lugar de almacenamiento según los procedimientos usuales de tratamiento, p. ej., por inmersión, inyección, rociado, regado, evaporación, pulverización, nebulización, esparcido, espumado, recubrimiento, extensión, empapado, riego por goteo, y en material de reproducción, especialmente en semillas, también mediante desinfección en seco, desinfección en húmedo, desinfección mediante una dispersión, incrustación, recubrimiento mono- o multicapa, etc. Además es posible aplicar los principios activos según los procedimientos Ultra-Low-Volume (volumen ultrabajo) o inyectar el preparado de principio activo o el principio activo mismo en el suelo.
- 30 Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención pueden además usarse para la protección de materiales técnicos ante la infestación y la destrucción debida a microorganismos no deseados, como p. ej., hongos.
- Por materiales técnicos debe entenderse en este contexto los materiales inertes que se fabricaron para ser usados en la técnica. Pueden ser materiales técnicos que deben protegerse mediante los principios activos de la invención de la alteración microbiana o de la destrucción por ejemplo, adhesivos, pegamentos, papeles y cartón, productos textiles, cuero, madera, pinturas y artículos de plástico, lubricantes refrigerantes y otros materiales que pueden ser infestados o destruidos por microorganismos. En el marco de los materiales a proteger también pueden indicarse partes de instalaciones de producción, p. ej., circuitos de agua refrigerante, que pueden ser afectados por la multiplicación de microorganismos. En el marco de la presente invención se indican como materiales técnicos preferentemente adhesivos, pegamentos, papeles y cartulinas, cuero, madera, pinturas, lubricantes refrigerantes y líquidos para transmisión de calor, de especial preferencia madera. Los principios activos o agentes de la invención pueden evitar efectos desventajosos como putrefacción, descomposición, teñido, decoloración o enmohecimiento.
- 40 El procedimiento de la invención para combatir hongos no deseados también puede usarse para la protección de los así denominados productos de acopio -Storage Goods-. Se entiende por "Storage Goods" sustancias naturales de origen vegetal o animal o sus productos de elaboración de origen natural para las que se desea una protección de largo plazo. Los Storage Goods de origen vegetal como p. ej., plantas o partes de plantas, como tallos, hojas, bulbos, semillas, frutos, granos, pueden protegerse inmediatamente después de la cosecha o después del procesamiento mediante (pre-)secado, humectación, picado, molido, prensado o tostado. En los Storage Goods también se incluye la madera, ya sea sin procesar, como madera para obra, postes de luz y barreras, o como productos terminados, como muebles. Los Storage Goods de origen animal son por ejemplo: pellejos, cueros, pieles y pelos. Los principios activos de la invención pueden evitar efectos desventajosos como putrefacción, descomposición, teñido, decoloración o enmohecimiento.
- 50
- 55

Como microorganismos que pueden producir una degradación o una modificación de los materiales técnicos, se indican por ejemplo bacterias, hongos, levaduras, algas y organismos mucosos. Preferentemente, los principios activos de la invención actúan contra hongos, especialmente los hongos del moho, los hongos que decoloran y destruyen la madera (Basidiomyceten) así como contra organismos mucosos y contra algas. Se indican por ejemplo microorganismos de las siguientes clases: *Alternaria*, como *Alternaria tenuis*; *Aspergillus*, como *Aspergillus niger*; *Chaetomium*, como *Chaetomium globosum*; *Coniophora*, como *Coniophora puetana*; *Lentinus*, como *Lentinus tigrinus*; *Penicillium*, como *Penicillium glaucum*; *Polyporus*, como *Polyporus versicolor*; *Aureobasidium*, como *Aureobasidium pullulans*; *Sclerophoma*, como *Sclerophoma ptyophila*; *Trichoderma*, como *Trichoderma viride*; *Escherichia*, como *Escherichia coli*; *Pseudomonas*, como *Pseudomonas aeruginosa*; *Staphylococcus*, como *Staphylococcus aureus*.

La presente invención además se refiere a un agente para combatir microorganismos indeseados que comprende al menos uno de los derivados de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina de acuerdo con la invención. Preferentemente se trata de agentes fungicidas que contienen adyuvantes, disolventes, vehículos, sustancias tensioactivas o diluyentes de uso agropecuario.

De acuerdo con la invención, un vehículo es una sustancia natural o sintética, orgánica o inorgánica, con la cual están mezclados o unidos los principios activos para su mejor aplicabilidad, ante todo para la aplicación sobre plantas o partes de plantas o semillas. El vehículo, que puede ser sólido o líquido, por lo general es inerte y debería ser apto para su uso en la agricultura.

Como vehículos sólidos o líquidos se indican: p. ej., sales de amonio y harinas minerales naturales, como caolín, arcillas, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorilonita o tierra diatomea y harinas de rocas sintéticas, como ácido silícico de alta dispersión, óxido de aluminio, silicatos, como vehículos sólidos para granulados se indican: p. ej., rocas naturales fraccionadas o trituradas, como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita así como granulados sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como granulados de material orgánico como papel, aserrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes y/o espumantes se indican: p. ej., emulsionantes no ionógenos y aniónicos, como éster de ácido graso de polioxietileno, éter de alcohol graso de polioxietileno, p. ej. alquilaril-poliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos así como hidrolizados de albúmina; como dispersantes se indican sustancias no iónicas y/o iónicas, p. ej., de las clases de alcohol-POE-éter y/o POP-éter, éster de ácido y/o POP-éster y POE-éster, alquil-ariléter y/o POP-POE-éter, aductos grasos y/o aductos de POP-POE, derivados de polioles de POE y/o POP, aductos de POE y/o POP-sorbitano o de azúcar, alquil- o arilsulfatos, sulfonatos y fosfatos o los correspondientes aductos de PO-éter. Además oligómeros y polímeros adecuados, p. ej., a partir de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO y/o PO solos o en un compuesto con p. ej. (poli-)alcoholes o (poli-)aminas. Además pueden emplearse la lignina y sus derivados de ácido sulfónico, celulosas simples y modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos así como sus aductos con formaldehído.

Los principios activos pueden trasladarse a las formulaciones habituales, como soluciones, emulsiones, polvos espolvoreables, suspensiones sobre la base de agua, suspensiones sobre la base de aceite, polvos, agentes de pulverización, pastas, polvos solubles, granulados solubles, granulados de espolvoreo, concentrados en suspensión-emulsión, sustancias naturales impregnadas con principio activo, sustancias sintéticas impregnadas con principio activo, fertilizantes así como encapsulados finos en sustancias poliméricas.

Los principios activos pueden usarse como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de uso preparadas a partir de estas, como soluciones listas para usar, emulsiones, suspensiones sobre la base de agua, suspensiones sobre la base de aceite, polvos, polvos de pulverización, pastas, polvos solubles, agentes de pulverización, granulados solubles, granulados de espolvoreo, concentrados en suspensión-emulsión, sustancias naturales impregnadas con principio activo, sustancias sintéticas impregnadas con principio activo, fertilizantes así como encapsulados finos en sustancias poliméricas. La aplicación se realiza de la manera habitual, p. ej., regado, rociado, pulverización, nebulización, esparcido, espolvoreado, espumado, recubrimiento, etc. Además es posible aplicar los principios activos según los procedimientos Ultra-Low-Volume (volumen ultrabajo) o inyectar el preparado de principio activo o el principio activo mismo en el suelo. También se puede tratar las semillas de las plantas.

Las formulaciones mencionadas se pueden preparar de manera en sí conocida, p. ej., mezclando los principios activos con al menos un agente extensor usual, un disolvente o bien diluyente, emulsionante, un agente de dispersión y/o ligante o fijador, agentes humectantes, repelentes de agua, dado el caso desecantes y estabilizadores-UV y dado el caso colorantes y pigmentos, antiespumantes, agentes conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas, así como otros coadyuvantes de procesamiento.

La presente invención no solo comprende formulaciones que ya están listas para usar y pueden aplicarse con el dispositivo adecuado sobre la planta o las semillas, sino también concentrados comerciales que antes de su uso deben ser diluidos con agua.

Los principios activos de acuerdo con la invención pueden usarse como tales o en sus formulaciones (usuales en el mercado) así como en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones mezclados con otros principios activos (conocidos), como insecticidas, cebos, agentes esterilizadores, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, herbicidas, fertilizantes, protectores o bien sustancias semioquímicas.

Como coadyuvantes se pueden usar tales sustancias que son adecuadas para proporcionar al agente mismo y/o a preparaciones derivadas del mismo (p. ej., caldos de pulverización, decapantes de semillas) propiedades especiales, como determinadas propiedades técnicas y/o también propiedades biológicas especiales. Como coadyuvantes típicos se indican: diluyentes, disolventes y vehículos.

5 Como diluyentes son adecuados, p. ej., agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, p. ej., de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), de los alcoholes y polioles (que dado el caso también pueden estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), de las cetonas (como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli)éteres, de las aminas simples y sustituidas, las amidas, lactamas (como N-alquilpirrolidonas) y lactonas, de las sulfonas y sulfóxidos (como dimetilsulfóxido).

10 Como diluyentes o vehículos gaseosos licuados se indican aquellos líquidos que a temperatura normal y bajo presión normal son gaseosos, p. ej., gases propulsores de aerosol, como hidrocarburos halogenados, así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

15 En las formulaciones pueden usarse agentes adherentes como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos, en polvo, granulados o en forma látex, como goma arábica, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales, como cefalinas y lecitinas, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

20 En caso de usarse agua como diluyente, también pueden p. ej., usarse disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos se incluyen esencialmente: compuestos aromáticos, como xileno, tolueno o alquilnaftaleno, compuestos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados, como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, como ciclohexano o parafinas, p. ej., fracciones de petróleo, alcoholes, como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas, como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes muy polares, como dimetilformamida o sulfóxido de dimetilo, así como agua.

25 Los agentes de acuerdo con la invención pueden contener adicionalmente otros componentes, como p. ej., sustancias tensioactivas. Como sustancias tensioactivas se indican agentes que producen emulsión y/o espuma, agentes de dispersión o agentes humectantes con propiedades iónicas o no iónicas o mezclas de estas sustancias tensioactivas. Son ejemplos de ellos sales de poli(ácido acrílico), sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o de ácido naftalensulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres del ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (preferentemente alquiltauratos), ésteres del ácido fosfórico de alcoholes o fenoles polioxetilados, ésteres de ácido graso de polioles, y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, p. ej., alquilarilpoliglicoléteres, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, hidrolizados de proteína, lejías de lignin-sulfito y metilcelulosa. Se necesita la presencia de una sustancia tensioactiva cuando uno de los principios activos y/o uno de los vehículos inertes no es soluble en agua y cuando la aplicación se realiza en agua. La proporción de sustancias tensioactivas se ubica entre el 5 y el 40 por ciento en peso de agente de acuerdo con la invención.

35 Además pueden usarse colorantes, como pigmentos inorgánicos, p. ej., óxido de hierro, óxido de titanio, azul de Prusia y colorantes orgánicos, como colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálica y oligonutrientes como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

40 Otros aditivos pueden ser aromatizantes, aceites minerales o vegetales dado el caso modificados, ceras y nutrientes (también oligonutrientes), como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Además pueden estar contenidos estabilizadores como estabilizadores de frío, conservantes, antioxidantes, fotoprotectores, u otros agentes que incrementan la estabilidad química y/o física.

45 Dado el caso también pueden estar contenidos otros componentes adicionales, p. ej., coloides protectores, ligantes, adhesivos, espesantes, sustancias tixotrópicas, adyuvantes de penetración, estabilizadores, secuestrantes, formadores de complejos. Por lo general, los principios activos pueden combinarse con cualquier aditivo sólido o líquido que se usa habitualmente a los fines de la formulación.

50 Las formulaciones por lo general contienen entre el 0,05 y el 99 % en peso, el 0,01 y el 98 % en peso, preferentemente entre el 0,1 y el 95 % en peso, especialmente preferente entre el 0,5 y el 90 % de principio activo, muy especialmente preferente entre el 10 y el 70 por ciento en peso.

Las formulaciones antes descritas pueden usarse en un procedimiento de acuerdo con la invención para combatir microorganismos indeseados en el que los derivados de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina de acuerdo con la invención se aplican sobre los microorganismos y/o en su biotopo.

55 Los principios activos de la invención pueden usarse como tales o en sus formulaciones también mezclados con fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas o insecticidas conocidos, para así, p. ej., ampliar el espectro de acción o prevenir que se desarrollen resistencias.

Como asociados de mezcla entran en consideración, por ejemplo, fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas o también bactericidas conocidos (véase también Pesticide Manual, 14^a ed.).

También es factible una mezcla con otros principios activos conocidos, como herbicidas o con fertilizantes y reguladores de crecimiento, protectores o bien semioquímicos.

- 5 La aplicación se efectúa de una manera habitual adecuada a una de las formas de aplicación.

La invención además comprende un procedimiento para el tratamiento de semillas.

- 10 Otro aspecto de la presente invención se refiere especialmente a una semilla que se trató con el menos uno de los derivados de heteroarilpiperidina y heteroarilpiperazina de acuerdo con la invención. Las semillas de acuerdo con la invención se usan en procedimientos para proteger semillas de hongos nocivos fitopatógenos. Aquí se usan semillas tratadas con al menos un principio activo de acuerdo con la invención.

- 15 Los principios activos de la invención o bien los agentes también son adecuados para el tratamiento de semillas. Una gran parte del daño producido por los organismos nocivos en plantas de cultivo es generada por la infestación de las semillas durante el almacenamiento o después de la siembra, así como durante y después de la germinación de la planta. Esta fase es especialmente crítica, porque las raíces y los brotes de la planta en crecimiento son especialmente sensibles y un daño aunque sea pequeño puede producir el secado de la planta. Por lo tanto existe gran interés en proteger las semillas y la planta en etapa de germinación mediante la aplicación de agentes adecuados.

- 20 Ya se conoce desde hace tiempo la lucha contra los hongos fitopatógenos mediante el tratamiento de las semillas de plantas y es objeto de continuas mejoras. Pero a pesar de ello, se producen una serie de dificultades durante el tratamiento de semillas que no siempre pueden ser solucionadas de manera satisfactoria. Así, se pretende desarrollar procedimientos para la protección de las semillas y de la planta en etapa de germinación que eviten la aplicación adicional de agentes fitoprotectores después de la siembra o después de la emergencia de las plantas o al menos la reduzcan notoriamente. Además se debe tratar de optimizar la cantidad del principio activo usado de manera tal que las semillas y la planta en etapa de germinación reciban la mejor protección posible de la infestación con hongos fitopatógenos, pero sin dañar la planta misma por el principio activo usado. Los procedimientos para el tratamiento de semillas especialmente también deberían considerar las propiedades fungicidas intrínsecas de plantas transgénicas a fin de lograr una protección óptima de las semillas y de la planta en etapa de germinación con un dispendio mínimo de agentes fitoprotectores.

- 30 La presente invención por lo tanto también se refiere a un procedimiento para la protección de semillas y de plantas en etapa de germinación antes de la infestación con plagas animales y/o hongos fitopatógenos, en el que las semillas se tratan con un agente de acuerdo con la invención. La invención también se refiere al uso de los agentes de la invención para el tratamiento de semillas para la protección de las semillas y de la planta en etapa de germinación ante hongos fitopatógenos. La invención se refiere además a semillas, que fueron tratadas con un agente de la invención para la protección ante hongos fitopatógenos.

- 35 La eliminación de plagas animales y/u hongos fitopatógenos que dañan a las plantas después de la emergencia, se realiza en primera instancia mediante el tratamiento del suelo y de las partes de plantas por encima del suelo con agentes fitoprotectores. Debido a las consideraciones respecto de una posible influencia de los agentes fitoprotectores sobre el entorno y la salud de humanos y animales, se realizan intentos de reducir la cantidad de los principios activos aplicados.

- 40 Una de las ventajas de la presente invención es que debido a las propiedades sistémicas especiales de los agentes de acuerdo con la invención para el tratamiento de las semillas con estos agentes no solamente se protegen las semillas mismas, sino también las plantas que surjan de éstas después de la emergencia ante plagas animales y/o hongos fitopatógenos. De este modo se puede prescindir del tratamiento inmediato del cultivo al momento de la siembra o poco después.

- 45 Además debe considerarse ventajoso que los principios activos o bien los agentes de la invención pueden usarse especialmente también en semillas transgénicas, teniendo la planta que surge de esta semilla la capacidad de expresar una proteína que actúa contra parásitos. Mediante el tratamiento de tales semillas con los principios activos o bien agentes de acuerdo con la invención ya se pueden combatir determinados parásitos mediante la expresión de la proteína, por ejemplo insecticida. Sorprendentemente se puede observar además otro efecto sinérgico, que además aumenta la efectividad de la protección contra la infestación por parásitos.

- 50 Los agentes de acuerdo con la invención son apropiados para la protección de semillas de cualquier tipo de plantas que se usan en la agricultura, en el invernadero, en forestaciones o la horticultura. Especialmente se trata aquí de semillas de cereales (como trigo, cebada, centeno, triticale, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, patatas, girasol, judías, café, rábano (p. ej., remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuete, hortalizas (como tomate, pepino, cebollas y lechuga), césped y plantas ornamentales. Especial importancia tiene el tratamiento de las semillas de cereales (como trigo, cebada, centeno, triticale y avena), maíz y arroz.

- Como también se ha descrito más abajo, el tratamiento de semillas transgénicas con los principios activos o bien agentes de acuerdo con la invención es de especial importancia. Esto se refiere a semillas de plantas que contienen al menos un gen heterólogo que permite la expresión de un polipéptido o una proteína con propiedades insecticidas. El gen heterólogo en semillas transgénicas puede provenir p. ej., de microorganismos de las especies *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. Preferentemente este gen heterólogo proviene de *Bacillus* sp., y el producto génico desarrolla un efecto contra el barrenador del maíz (European corn borer) y/o contra Western Corn Rootworm. De preferencia especial, gen heterólogo proviene de *Bacillus thuringiensis*.
- En el marco de la presente invención el agente de la invención se aplica solo o en una formulación adecuada sobre las semillas. Preferentemente se trata la semilla en un estado en el cual sean tan estables que no se produzcan daños durante el tratamiento. En general el tratamiento de la semilla puede realizarse en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Usualmente se usa la semilla que se separa de la planta y que se ha limpiado de mazorca, cáscara, tallo, vaina, lana o pulpa. Así, por ejemplo, puede usarse la semilla cosechada, limpiada y secada hasta un contenido de humedad menor al 15 % en peso. En forma alternativa, también puede usarse la semilla que tras el secado se trató, por ejemplo, con agua y que luego nuevamente se secó.
- En general, en el tratamiento de la semilla debe cuidarse que la cantidad de agente de acuerdo a la invención y/u otros aditivos aplicados a la semilla se elija de modo que no se perturbe la germinación de la semilla o bien que no se dañe la planta que surja de ella. Esto se debe cuidar sobre todo en los principios activos que en determinadas cantidades de aplicación pueden mostrar efectos fitotóxicos.
- Los agentes de acuerdo con la invención pueden aplicarse directamente, esto es, sin contener otros componentes y sin haberse diluido. Por lo general es preferente aplicar los agentes en forma de una formulación adecuada sobre las semillas. El especialista conoce las formulaciones adecuadas y los procedimientos para el tratamiento de la semilla y se describen, por ejemplo en los siguientes documentos: US 4.272.417, US 4.245.432, US 4.808.430, US 5.876.739, US 2003/0176428, WO 2002/080675, WO 2002/028186.
- Los principios activos aplicables de acuerdo con la invención pueden trasladarse a las formulaciones habituales de decapantes, como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, dispersiones u otras masas envolventes para semillas, así como formulaciones de tipo ULV.
- Estas formulaciones se producen de manera conocida, mezclando los principios activos o combinaciones de principios activos con sustancias adicionales habituales, como por ejemplo los diluyentes habituales como disolventes o diluyentes, colorantes, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, aglutinantes, giberelinas y también agua.
- Como colorantes que pueden contener las formulaciones aplicables de decapantes de acuerdo con la invención, se indican todos los colorantes habituales para el dicho fin. En este sentido son aplicables tanto los pigmentos poco solubles en agua, como así también los colorantes solubles en agua. Como ejemplo se mencionan los colorantes conocidos bajo las denominaciones rodamina B, C.I. pigmento rojo 112 y C.I. disolvente rojo 1.
- Como agentes humectantes que pueden contener las formulaciones aplicables de decapantes de acuerdo con la invención vienen al caso todas las sustancias que favorecen la humectación usuales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferentemente son aplicables los alquilnaftaleno-sulfonatos, como diisopropilnaftaleno-sulfonato o diisobutilnaftaleno-sulfonato.
- Como dispersantes y/o emulsionantes que pueden contener estas formulaciones de decapantes aplicables de acuerdo con la invención, se indican todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Son preferentemente aplicables los dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Como dispersantes no iónicos adecuados pueden mencionarse especialmente los polímeros de bloque óxido de etileno-óxido de propileno, éteres alquilfenolpoliglicólicos así como éteres trisilfenolpoliglicólicos y sus derivados fosfatados o sulfatados. Son dispersantes aniónicos adecuados especialmente los sulfonatos de lignina, las sales de poli(ácido acrílico) y los productos de condensación de arilsulfonato y formaldehído.
- Como antiespumantes, las formulaciones de decapantes que se pueden usar de acuerdo con la invención pueden contener todas las sustancias inhibidoras de espuma habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Preferentemente son aplicables los antiespumantes de silicona y el estearato de magnesio.
- Como conservantes pueden estar presentes en las formulaciones de decapantes que se pueden usar de acuerdo con la invención todas las sustancias aplicables en los agentes agroquímicos para tal fin. Como ejemplo se tienen el diclorofeno y el hemiformal de alcohol bencílico.
- Como espesantes secundarios que pueden estar contenidos en las formulaciones de decapantes que se pueden usar de acuerdo con la invención, se indican todas las sustancias empleables en agentes agroquímicos para tal fin. Preferentemente entran en consideración los derivados de la celulosa, los derivados del ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y ácidos silícicos altamente dispersos.

Como aglutinantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de decapantes que se pueden usar de acuerdo con la invención, se indican todas las sustancias aglutinantes usuales empleables en decapantes. Preferentemente pueden nombrarse polivinilpirrolidona, poli(acetato de vinilo), poli(alcohol vinílico) y tilosa.

5 Como giberelinas que pueden contener las formulaciones de decapantes que se pueden usar de acuerdo con la invención, se indican preferentemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberelínico), A4 y A7, se usa preferentemente el ácido giberelínico. Las giberelinas son conocidas (véase R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", Tomo 2, Springer Verlag, 1970, páginas 401-412).

10 Se pueden emplear las formulaciones de decapantes que se pueden usar de acuerdo con la invención ya sea en forma directa o luego de la previa dilución con agua para el tratamiento de las semillas de los más variados modos. Así, los concentrados o las preparaciones que pueden prepararse con estos mediante la dilución con agua, pueden usarse para el decapado de semillas de cereales, como trigo, cebada, centeno, avena y triticale, así como de las semillas de maíz, arroz, colza, guisantes, judías, algodón, girasol y rábano o también de semillas de hortalizas de tipos muy diferentes. Las formulaciones de decapantes que pueden usarse de acuerdo con la invención o sus preparaciones diluidas también pueden usarse para el decapado de semillas de plantas transgénicas. En este sentido pueden surgir también efectos sinérgicos adicionales en la acción conjunta con las sustancias formadas por expresión.

15 Para el tratamiento de semillas con las formulaciones de decapantes que se pueden usar de acuerdo con la invención o con los preparados resultantes producidos con adición de agua, entran en consideración todos los dispositivos usuales de mezcla que se pueden usar para el decapado. En particular, para la desinfección se procede de modo que se coloca la semilla en un mezclador, se añade la cantidad respectivamente deseada de formulaciones de decapante o como tal o luego de la previa dilución con agua y se mezcla hasta la distribución uniforme de la formulación sobre la semilla. Dado el caso se añade un proceso de secado.

20 La cantidad de aplicación de las formulaciones de decapantes que pueden usarse de acuerdo con la invención puede variarse dentro de un intervalo más amplio. Se rige por el respectivo contenido de principios activos en las formulaciones y por las semillas. Las cantidades de aplicación de la combinación de principio activo por lo general se encuentran entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, preferentemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

25 Además, los compuestos de la fórmula (I) de la invención también presentan muy buenos efectos antimicóticos. Poseen un amplio espectro antimicótico, especialmente contra dermatofitos y hongos cormófitos, moho y hongos difásicos (p. ej., contra especies de *Candida* como *Candida albicans*, *Candida glabrata*) así como *Epidermophyton floccosum*, especies de *Aspergillus* como *Aspergillus niger* y *Aspergillus fumigatus*, especies de *Trichophyton* como *Trichophyton mentagrophytes*, especies de *Microsporon* como *Microsporon canis* y *audouinii*. La enumeración de estos hongos de ninguna manera representa una limitación del espectro micótico tangible, sino que solamente es de carácter enunciativo.

30 Los principios activos de la fórmula (I) de la invención por lo tanto se pueden usar tanto en el área médica como también en usos no medicinales.

35 Los principios activos pueden usarse como tales, en forma de sus formulaciones o de las formas de uso preparadas a partir de estas, como soluciones listas para usar, emulsiones, suspensiones, polvos rociables, pastas, polvos solubles, agentes de pulverización y granulados. La aplicación se realiza de la manera habitual, p. ej., regado, rociado, pulverización, nebulización, esparcido, espolvoreado, espumado, recubrimiento, etc. Además es posible aplicar los principios activos según el procedimiento Ultra-Low-Volume (volumen ultrabajo) o inyectar el preparado de principio activo o el principio activo mismo en el suelo. También se puede tratar las semillas de las plantas.

40 Al usar los principios activos de acuerdo con la invención como fungicidas pueden variarse las cantidades de aplicación en un amplio intervalo según el tipo de aplicación. La cantidad aplicada de los principios activos de la invención es:

- 45
- para el tratamiento de partes de plantas, p. ej., hojas: de 0,1 a 10.000 g/ha, preferentemente de 10 a 1.000 g/ha, de especial preferencia de 50 a 300 g/ha (en la aplicación por regado o goteo incluso se puede reducir la cantidad aplicada, ante todo cuando se usan sustratos inertes como lana mineral o perlita);
 - para el tratamiento de semillas: de 2 a 200 g por 100 kg de semillas, preferentemente de 3 a 150 g por 100 kg de semillas, de especial preferencia de 2,5 a 25 g por 100 kg de semillas, de preferencia muy especial de 2,5 a 12,5 g por 100 kg de semillas;
 - para el tratamiento del suelo: de 0,1 a 10.000 g/ha, preferentemente de 1 a 5.000 g/ha.
- 50

Estas cantidades de aplicación se indican solamente a modo de ejemplo y no son limitantes en el sentido de la invención.

55 En general, los principios activos de acuerdo con la invención en el sector veterinario y en la tenencia de animales pueden aplicarse mediante administración enteral, por ejemplo, en forma de comprimidos, cápsulas, brebajes, rociados, granulados, pastas, bolos, del procedimiento de alimentación directa, de supositorios, mediante administración parenteral, como por ejemplo, en forma de inyecciones (intramuscular, subcutánea, intravenosa,

intraperitoneal e.o.), implantes, mediante aplicación nasal, mediante aplicación dérmica, por ejemplo en forma de inmersión o baño (*dipping*), rociado (*spray*), preparados para vertido (*pour-on* y *spot-on*), lavado, espolvoreo así como con ayuda de elementos conformados que contienen principio activo, como collares, marcas en orejas, marcas en la cola, cintas para las extremidades, bozales, dispositivos de marcación, etc.

5 En la aplicación para ganado, aves, mascotas, etc., se pueden usar los principios activos de la fórmula (I) como formulaciones (por ejemplo polvo, emulsiones, agentes fluidos) que contienen los principios activos en una cantidad del 1 al 80 % en peso, directamente o después de una dilución de 100 a 10.000 veces pueden usarse como baño químico.

10 Los agentes listos para usarse dado el caso además pueden contener otros insecticidas y dado el caso pueden contener además uno o varios fungicidas.

Con respecto a posibles asociados de mezcla adicionales se hace referencia a los insecticidas y fungicidas antes mencionados.

15 Además los compuestos de acuerdo con la invención pueden usarse para la protección ante el crecimiento de vegetación sobre objetos, especialmente de cascos de barcos, tamices, redes, edificios, muelles y dispositivos señalizados que tienen contacto con agua de mar o salobre.

Además los compuestos de la invención pueden usarse solos o en combinación con otros principios activos como agentes para prevenir la descomposición (*antifouling*).

20 El procedimiento de tratamiento de la invención puede usarse para el tratamiento de organismos genéticamente modificados (GMO), por ejemplo plantas o semillas. Las plantas genéticamente modificadas (o plantas transgénicas) son aquellas a las que fue incorporado un gen heterólogo en forma estable en el genoma. El término "gen heterólogo" hace referencia esencialmente a un gen que fue preparado o ensamblado fuera de la planta y que le otorga propiedades agronómicas o de otro tipo, nuevas o mejoradas, mediante su inserción en el genoma nuclear, cloroplástico o mitocondrial, de modo que expresa una proteína o polipéptido específico o que regula por disminución o desconecta otro gen u otros genes contenidos en la planta (por ejemplo mediante la tecnología antisentido, de cosupresión, o tecnología ARNi [ARN interferencia]). Un gen heterólogo existente en el genoma también es llamado transgén. Un transgén que se define mediante su presencia específica en el genoma de una planta, se denomina evento transgénico o evento de transformación.

30 Dependiendo del tipo o variedad de planta, su ubicación y condiciones de crecimiento (suelo, clima, época de crecimiento, alimentación), el tratamiento de la invención puede acarrear efectos superaditivos (o sinérgicos). Por ejemplo, son posibles los efectos que se detallan a continuación y que exceden los esperados: cantidad menor requerida y/o espectro de acción amplificado y/o efecto aumentado de los principios activos y composiciones, que pueden ser usados de acuerdo a la invención, crecimiento mejorado de la planta, tolerancia aumentada a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada a la sequía, al contenido de agua o sal del suelo, floración mayor, facilidad de cosecha, aceleración de la maduración, mayor rendimiento de la cosecha, frutos de mayor tamaño, mayor altura de la planta, coloración verde de la hoja más intensa, floración anticipada, mayor calidad y/o valor nutritivo mayor de los productos cosechados, concentración mayor de azúcar en los frutos, mejor capacidad de almacenamiento o de procesamiento del producto de cosecha.

40 En determinadas dosis de aplicación, las combinaciones de principios activos de acuerdo con la invención pueden tener un efecto mayor. Son adecuadas por tanto para activar el sistema inmune de las mismas contra el ataque de hongos fitopatógenos indeseados y/o microorganismos y/o virus. Esta podría ser dado el caso una de las razones para una eficacia elevada de las combinaciones de acuerdo con la invención, por ejemplo contra hongos. Sustancias reforzantes de la resistencia de las plantas (que inducen a la resistencia) deben significar asimismo, en este contexto, sustancias o combinaciones de sustancias capaces de estimular el sistema inmune de modo tal que las plantas tratadas, inoculadas en forma posterior con hongos fitopatógenos indeseados y/o microorganismos y/o virus, desarrollen un grado de resistencia considerable contra dichos hongos fitopatógenos indeseados y/o microorganismos y/o virus. En el presente caso por hongos fitopatógenos indeseados y/o microorganismos y/o virus se entiende hongos fitopatógenos, bacterias y virus. Por ello, las sustancias de acuerdo con la invención pueden ser usadas para la protección de plantas contra el ataque de los patógenos mencionados dentro de un determinado lapso de tiempo después del tratamiento. El período de tiempo que abarca el efecto de protección se extiende por lo general de 1 a 10 días, preferentemente entre 1 a 7 días después de finalizado el tratamiento de la planta con las sustancias activas.

Entre las plantas y variedades de plantas que se tratan preferentemente de acuerdo con la invención, se encuentran todas las plantas que disponen de un material genético que les proporcione propiedades particularmente ventajosas y útiles (independientemente de si se obtuvo mediante el cultivo y/o la biotecnología).

55 Las plantas y variedades de plantas que asimismo se tratan preferentemente de acuerdo con la invención son resistentes contra uno o más factores de estrés bióticos, es decir que estas plantas presentan una defensa mejorada contra patógenos de origen animal o microbiano como nematodos, insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias, virus y/o viroides.

Las plantas y variedades de plantas que pueden ser tratadas igualmente de acuerdo con la invención son aquellas resistentes a algunos de los factores de estrés abióticos. Entre ellos se encuentran sequía, condiciones de frío y de calor, estrés osmótico, agua estancada, mayor salinidad del suelo, mayor exposición a minerales, niveles de ozono, condiciones de luz intensa, disponibilidad limitada de nutrientes con contenido de nitrógeno o de fósforo y falta de sombra.

Las plantas y especies de plantas que también pueden ser tratadas de acuerdo con la invención son tales caracterizadas por presentar un rendimiento más elevado. Un rendimiento más elevado en estas plantas puede deberse por ejemplo a una fisiología mejorada, un mejor crecimiento y desarrollo de la planta, como la eficiencia de aprovechamiento y de retención del agua, un mejor aprovechamiento de nitrógeno, una mayor asimilación de carbono, una mejorada fotosíntesis, una fuerza intensificada de germinación y una maduración acelerada. El rendimiento además puede ser influenciado mediante una mejorada estructura de las plantas (en condiciones de estrés y sin estrés), entre ellos una floración temprana, el control de la floración para la producción de semillas híbridas, el crecimiento de plantas germinadas, el tamaño de plantas, el número y la distancia entre internodios, el crecimiento de las raíces, el tamaño de las semillas, el tamaño de los frutos, de las vainas, el número de vainas o espigas, la cantidad de semillas por vaina o espiga, el volumen de la semilla, el mayor llenado de la semilla, menor caída de semillas, menor reventón de vainas así como la resistencia de los tallos. En otras características del rendimiento se incluyen la composición del grano, como el contenido de hidratos de carbono, el contenido de proteínas, el contenido y la composición del aceite, el valor nutricional, la reducción de los compuestos perjudiciales para la nutrición, una mejor capacidad de procesamiento y de almacenamiento.

Las plantas que pueden ser tratadas de acuerdo con la invención son plantas híbridas, que ya expresan las propiedades de la heterosis o bien del efecto de hibridación, lo que en general produce un mayor rendimiento, un mayor tamaño, una mejor salud y resistencia a factores bióticos y abióticos de estrés. Tales plantas usualmente se producen al cruzar una línea precursora consanguínea estéril del polen (la parte femenina del cruzamiento) con otra línea precursora consanguínea fértil del polen (la parte masculina del cruzamiento). Las semillas híbridas normalmente se cosechan de plantas estériles del polen y se venden a los productores. En ocasiones se pueden producir (p. ej., en el maíz) plantas estériles del polen mediante despendonación (es decir, eliminación mecánica de los órganos reproductores masculinos o bien de las flores masculinas); pero es más usual que la esterilidad del polen se deba a determinantes genéticos en el genoma de la planta. En este caso, especialmente cuando el producto deseado que se desea cosechar de las plantas híbridas son las semillas, por lo general es favorable asegurarse que se restaura por completo la fertilidad del polen en plantas híbridas que contienen los determinantes genéticos que producen la fertilidad del polen. Se puede lograr esto, al asegurarse que las partes masculinas del cruzamiento posean los correspondientes genes restauradores de la fertilidad que tienen la capacidad de restaurar la fertilidad del polen en plantas híbridas que contienen los determinantes genéticos responsables de la esterilidad del polen. Los determinantes genéticos para la esterilidad del polen pueden estar ubicados en el citoplasma. Los ejemplos de esterilidad citoplasmática del polen (CMS) se describieron por ejemplo para especies Brassica. Pero los determinantes genéticos para la esterilidad del polen también pueden estar localizados en el genoma del núcleo celular. Las plantas de polen estéril también pueden obtenerse mediante procedimientos de biotecnología vegetal, como la ingeniería genética. Un agente especialmente apto para producir plantas con polen estéril se describió en el documento WO 89/10396, en el que por ejemplo se expresa una ribonucleasa como una barnasa selectivamente en las células de la capa del tapetum en el androceo. La fertilidad puede entonces restaurarse mediante la expresión de un inhibidor de la ribonucleasa como Barstar en las células del tapetum.

Las plantas o variedades de plantas (que se obtienen mediante procedimientos de la biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que se pueden tratar de acuerdo con la invención, son plantas tolerantes a herbicidas, es decir, plantas, en las que se produjo una tolerancia a uno o más herbicidas predeterminados. Tales plantas pueden obtenerse ya sea por transformación genética o mediante la selección de plantas que contienen una mutación que produce una tolerancia a herbicidas de ese tipo.

Las plantas tolerantes a herbicidas son por ejemplo plantas tolerantes a glifosato, es decir, plantas, en las que se produjo una tolerancia al herbicida glifosato o a sus sales. Así, por ejemplo, se pueden obtener plantas tolerantes a glifosato mediante la transformación de la planta con un gen que codifica la enzima 5-enolpiruvilshikimat-3-fosfatsintasa (EPSPS). Los ejemplos de tales genes EPSPS son el gen AroA (Mutante CT7) de la bacteria *Salmonella typhimurium*, el gen CP4 de la bacteria *Agrobacterium sp.*, los genes que codifican para una EPSPS proveniente de la petunia, para una EPSPS proveniente del tomate o para una EPSPS proveniente de eleusina. También puede tratarse de una EPSPS mutada. También se pueden obtener plantas tolerantes a glifosato al expresar un gen que codifica una enzima glifosato-oxidoreductasa. Las plantas tolerantes a glifosato asimismo pueden obtenerse al expresar un gen que codifica para una enzima glifosato-acetiltransferasa. También se pueden obtener plantas tolerantes a glifosato seleccionando plantas que presentan de modo natural las mutaciones de los genes antes mencionados.

Otras plantas resistentes a herbicidas, por ejemplo son plantas en las que se logró la tolerancia a herbicidas que inhiben la enzima glutamina sintasa, como bialafos, fosfinotricina o glufosinato. Tales plantas pueden obtenerse expresando una enzima que desintoxica el herbicida o un mutante de la enzima glutamina sintasa que es resistente a la inhibición. Una enzima de este tipo de acción desintoxicante es por ejemplo una enzima que codifica una fosfinotricina-acetiltransferasa (como por ejemplo, la proteína bar- o pat- de las especies *Streptomyces*). Se han

descrito plantas que expresan una fosfinotricina-acetiltransferasa exógena.

Otras plantas con tolerancia a herbicidas también son plantas en las que se produjo la tolerancia frente a herbicidas que inhiben la enzima hidroxifenilpiruvatodioxigenasa (HPPD). Las hidroxifenilpiruvatodioxigenasas son enzimas que catalizan la reacción en la que se convierte el para-hidroxifenilpiruvato (HPP) en homogeneizado. Las plantas que son tolerantes frente a inhibidores de HPPD pueden ser transformadas con un gen que codifica una enzima HPPD natural o con un gen que codifica una enzima HPPD mutada. También se puede lograr una tolerancia frente a inhibidores de HPPD transformando plantas con genes que codifican determinadas enzimas que permiten la formación de homogeneizado a pesar de la inhibición de la enzima HPPD nativa mediante el inhibidor de HPPD. La tolerancia de plantas frente a los inhibidores de HPPD también puede mejorarse al transformar plantas con un gen que codifica una enzima tolerante para HPPD, y adicionalmente con un gen que codifica para una enzima prefenatodeshidrogenasa.

Otras plantas resistentes a herbicidas son plantas en las que se produjo la tolerancia a los inhibidores de acetolactatosintasa (ALS). Los inhibidores ALS conocidos incluyen, por ejemplo, sulfonilurea, imidazolinona, triazolopirimidinas, pirimidiniloxi(tio)benzoatos y/o herbicidas de sulfonilaminocarboniltriazolinona. Se sabe que diversas mutaciones en la enzima ALS (conocida también como acetohidroxiácido-sintasa, AHAS) confieren una tolerancia a diferentes herbicidas o bien grupos de herbicidas. Se describe la producción de plantas tolerantes a sulfonilurea y de plantas tolerantes a imidazolinona en el documento internacional WO 1996/033270. Además también se describen otras plantas tolerantes a sulfonilurea y a imidazolinona, por ejemplo en el documento WO 2007/024782.

Otras plantas que son tolerantes a imidazolinona y/o sulfonilurea pueden obtenerse mediante mutagénesis inducida, selección en cultivos de células en presencia del herbicida o mediante cultivo con mutación.

Plantas o variedades de plantas (que se obtuvieron por procedimientos de la biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que también pueden ser tratadas de acuerdo con la invención son plantas transgénicas resistentes a insectos, es decir, plantas que se volvieron resistentes a la infestación con determinados insectos objetivo. Tales plantas se pueden obtener mediante transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que otorga una resistencia tal a insectos.

El concepto "planta transgénica resistente a insectos" comprende en el presente contexto cualquier planta que contiene al menos un transgén que incluye una secuencia de codificación que codifica lo siguiente:

1) una proteína cristalina insecticida proveniente de *Bacillus thuringiensis* o una parte insecticida de la misma, como las proteínas cristalinas insecticidas, enumeradas online en: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/, o partes insecticidas de la misma, p. ej., proteínas de las clases de proteínas Cry, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae, o Cry3Bb o partes insecticidas de las mismas; o

2) una proteína cristalina proveniente de *Bacillus thuringiensis* o una parte de la misma, que en presencia de una segunda proteína cristalina distinta de *Bacillus thuringiensis* o de una parte de la misma, presenta efecto insecticida, como la toxina binaria que se compone de las proteínas cristalinas Cy34 y Cy35; o

3) una proteína insecticida híbrida que incluye partes de dos diferentes proteínas cristalinas insecticidas provenientes de *Bacillus thuringiensis*, como por ejemplo un híbrido de las proteínas de 1) antes mencionadas o un híbrido proveniente de las proteínas de 2) antes mencionadas, p. ej. la proteína Cry1A.105, que es producida a partir del evento MON98034 del maíz (documento WO 2007/027777); o

4) una proteína de acuerdo con uno cualquiera de los puntos 1) a 3) antes indicados en la que se sustituyeron algunos, especialmente 1 a 10, aminoácidos con otro aminoácido, para lograr una mayor efectividad insecticida frente a una especie de insectos objetivo y/o para ampliar el espectro de las correspondientes especies de insectos objetivo y/o debido a modificaciones que se indujeron en el ADN codificador durante la clonación o transformación, como la proteína Cry3Bb1 en eventos MON863 o MON88017 de maíz o la proteína Cry3A en el evento MIR 604 del maíz;

5) una proteína insecticida segregada proveniente de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, o una parte insecticida de las mismas, como las proteínas tóxicas para insectos de acción vegetativa (vegetative insecticidal proteins, VIP), que se indican en http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, p. ej., proteínas de la clase de proteínas VIP3Aa; o

6) una proteína insecticida segregada proveniente de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, que desarrolla efecto insecticida en presencia de una segunda proteína segregada proveniente de *Bacillus thuringiensis* o *B. cereus*, como la toxina binaria que se compone de las proteínas VIP1A y VIP2A;

7) una proteína híbrida insecticida que comprende partes de diferentes proteínas segregadas de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, como un híbrido de las proteínas de 1) o un híbrido de las proteínas de 2) antes mencionada; o

8) una proteína según uno de los puntos 1) a 3) antes mencionados, en la que se sustituyeron algunos, especialmente 1 a 10, aminoácidos por otro aminoácido, para lograr una mayor efectividad insecticida frente a una especie de insectos objetivo y/o para ampliar el espectro de las correspondientes especies de insectos objetivo y/o debido a modificaciones que se indujeron en el ADN codificador durante la clonación o transformación, (manteniéndose la codificación para una proteína insecticida), como la proteína VIP3Aa en el evento COT 102 del algodón.

Naturalmente también se incluye en las plantas transgénicas resistentes a insectos en el presente contexto cualquier planta que comprenda una combinación de genes que codifiquen para las proteínas de una de las clases 1 a 8 antes mencionadas. En una forma de realización, una planta resistente a insectos contiene más de un transgén que codifica una proteína de acuerdo con una de las antes mencionadas 1 a 8 para ampliar el espectro de las correspondientes especies de insecto objetivo o para retardar el desarrollo de una resistencia de los insectos a las plantas al usar diferentes proteínas que son insecticidas para la misma especie objetivo de insectos, pero presentan una diferente forma de acción, como ser un enlace con diferentes puntos de enlace del receptor en el insecto.

Las plantas o variedades de plantas (que se obtuvieron por procedimientos de la biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que también pueden ser tratadas de acuerdo con la invención son tolerantes frente a factores de estrés abióticos. Tales plantas se pueden obtener mediante transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que otorga una resistencia tal al estrés. Las plantas especialmente útiles con tolerancia al estrés incluyen las siguientes:

a. plantas que contienen un transgén que es capaz de reducir la expresión y/ actividad del gen para la poli(ADP-ribosa)polimerasa (PARP) en las células de las plantas o en las plantas.

b. plantas que contienen un transgén que potencia la tolerancia al estrés, que es capaz de reducir la expresión y/o actividad de los genes que codifican para PARG de las plantas o las células de las plantas;

c. plantas que contienen un transgén que potencia la tolerancia al estrés que codifica una enzima funcional en plantas de la ruta de biosíntesis de dinucleótido de nicotinamidadenina natural, entre ellos nicotinamidasas, nicotinatofosforribosiltransferasa, mononucleótido del ácido nicotínico adeniltransferasa, dinucleótido de nicotinamidadenina sintetasa o nicotinamidafosforribosil transferasa.

Plantas o variedades de plantas (que se obtuvieron por procedimientos de la biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que también pueden ser tratadas de acuerdo con la invención presentan una cantidad, calidad y/o capacidad de almacenamiento modificadas del producto de cosecha y/o propiedades modificadas de determinados componentes del producto de cosecha, como por ejemplo:

1) plantas transgénicas que sintetizan un almidón modificado que está modificado con respecto a sus propiedades físico-químicas, especialmente del contenido de amilosa o de la proporción amilosa/amilopectina, del grado de ramificación, de la longitud promedio de la cadena, de la distribución de las cadenas laterales, del comportamiento de la viscosidad, de la resistencia a la gelificación, el tamaño y/o la morfología del grano de almidón en comparación con el almidón sintetizado en células o en plantas de tipo salvaje, de modo que este almidón modificado es más adecuado para determinados usos.

2) Plantas transgénicas que sintetizan polímeros de hidratos de carbono que no son almidón, o polímeros de hidratos de carbono que no son de almidón cuyas propiedades son diferentes en comparación con plantas de tipo natural, sin haber sido modificadas genéticamente. Son ejemplos plantas que producen polifruktosa, especialmente del tipo inulina y levano, plantas que producen alfa-1,4-glucanos, plantas que producen alfa-1,4-glucanos ramificados en alfa-1,6 y plantas que producen alternano.

3) Plantas transgénicas que producen hialuronano.

Plantas o variedades de plantas (que se obtuvieron por procedimientos de la biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que también pueden ser tratadas de acuerdo con la invención son plantas como plantas de algodón con propiedades de fibras modificadas. Tales plantas se pueden obtener mediante transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que otorga tales propiedades de fibra modificadas; se incluyen aquí:

a) plantas como plantas de algodón que contienen una forma modificada de genes de celulosa sintasa,

b) plantas como plantas de algodón que contienen una forma modificada de ácidos nucleicos homólogos con rsw2 o rsw3,

c) plantas, como plantas de algodón con una mayor expresión de una sacarosafosfato sintasa;

d) plantas, como plantas de algodón con una expresión elevada de la sacarosa sintasa;

e) plantas, como plantas de algodón, en las que se modificó el momento del control del paso de los plasmodesmos en la base de la célula de la fibra, p. ej. mediante regulación por reducción de la β -1,3-glucanasa

selectiva de fibras;

f) plantas como plantas de algodón con fibras con reactividad modificada, p. ej. mediante la expresión del gen de la N-acetilglucosamintransferasa, entre ellos también nodC, y de los genes de la quitina sintasa.

5 Plantas o variedades de plantas (que se obtuvieron mediante procedimientos de biotecnología vegetal, como la ingeniería genética) que también pueden ser tratadas de acuerdo con la invención son plantas como colza o plantas Brassica relacionadas con propiedades modificadas de la composición del aceite. Tales plantas se pueden obtener mediante transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que otorga tales propiedades modificadas del aceite; se incluyen aquí:

a) plantas, como plantas de colza que producen aceite con un elevado contenido de ácido oleico;

10 b) plantas, como plantas de colza que producen aceite con un bajo contenido de ácido linolénico.

c) plantas, como plantas de colza que producen aceite con un bajo contenido de ácidos grasos saturados.

15 Son plantas transgénicas especialmente útiles que pueden ser tratadas de acuerdo con la invención, plantas con uno o más genes que codifican una o más toxinas, son las plantas transgénicas que se ofrecen bajo las siguientes denominaciones comerciales: YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), BiteGard® (por ejemplo, maíz), BT-Xtra® (por ejemplo, Maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y Nucotn 33B® (algodón), NatureGard® (por ejemplo, maíz), Protecta® y NewLeaf® (patata). Como ejemplo de plantas tolerantes a herbicidas se pueden mencionar las variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan bajo las siguientes denominaciones comerciales: Roundup Ready® (tolerancia a glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia a fosfotricina, por ejemplo, colza), IMI® (tolerancia a imidazolinona) y STS® (tolerancia a sulfonilurea), por ejemplo, maíz. Como plantas resistentes a herbicidas (plantas cultivadas en forma convencional con tolerancia a los herbicidas) se mencionan también las variedades comercializadas bajo la denominación comercial Clearfield® (por ejemplo, maíz).

20 Son plantas transgénicas especialmente útiles que pueden tratarse de acuerdo con la invención plantas que contienen resultados de transformaciones (*transformation events*) o una combinación de resultados de transformación y que están por ejemplo catalogadas en las bases de datos de diversas autoridades de registro nacionales o regionales (véase por ejemplo http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx y <http://www.agbios.com/dbase.php>).

25 Las plantas indicadas pueden tratarse de manera especialmente ventajosa de acuerdo con la invención con los compuestos de la fórmula general (I) o bien las mezclas de principios activos de acuerdo con la invención. Las áreas ventajosas indicadas en los principios activos o bien las mezclas también rigen para el tratamiento de estas plantas. Se desea destacar especialmente el tratamiento de las plantas con los compuestos o bien las mezclas especialmente mencionados en el presente texto.

30 Los principios activos de la invención o bien los agentes por lo tanto se pueden usar para proteger las plantas dentro de un determinado período después del tratamiento de la infestación de los agentes nocivos mencionados. El período en el cual se produce su protección, por lo general se extiende de 1 a 28 días, preferentemente de 1 a 14 días, especialmente preferente de 1 a 10 días, de manera especialmente preferente de 1 a 7 días después del tratamiento de las plantas con los principios activos o bien hasta 200 días después de un tratamiento de las semillas.

La preparación y el uso de los principios activos de las fórmulas (I) de acuerdo con la invención surgen de los siguientes ejemplos. Aunque la invención no se limita a estos ejemplos.

40 **Ejemplos de preparación**

Generalidades: salvo que se indique lo contrario se realizan todos los pasos de purificación cromatográfica o bien de separación en gel de sílice y con un gradiente de disolvente de 0:100 etiléster de ácido acético/ciclohexano respecto de 100:0 etiléster de ácido acético/ciclohexano.

Preparación de compuestos de la fórmula (I)

45 **2-{3-[2-(1-[(Propan-2-ilidenamino)oxi]acetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-1,2-oxazol-5-il}benzaldehído (I-8)**

50 A una solución de 4-{4-[5-(2-formilfenil)-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (2,20 g) en 1,4-dioxano se añadió gota a gota a 0 °C una solución 4 molar de cloruro de hidrógeno (12 ml) en 1,4-dioxano. La mezcla de reacción se agitó a 0 °C y después se calentó lentamente a temperatura ambiente. Después de agitar durante la noche se eliminó el disolvente y el exceso de cloruro de hidrógeno. Se obtuvo cloruro de 4-{4-[5-(2-formilfenil)-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidinio (**XIIIa-99**, 2,0 g).

A una solución de ácido [(propan-2-ilidenamino)oxi]acético (185 mg) en diclorometano (10 ml) se añadió a 0 °C cloruro de oxalilo (168 µl) y una gota de N,N-dimetilformamida. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 120 minutos. Después se eliminó el disolvente y el exceso de reactivo bajo presión reducida. El residuo sólido se

disolvió de nuevo en diclorometano y a 0 °C se añadió gota a gota a una solución de cloruro de 4-{4-[5-(2-formilfenil)-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidinio (484 mg) y trietilamina (357 µl) en diclorometano (10 ml). La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. A continuación se añadió una solución concentrada de hidrogenocarbonato de sodio, se separó la fase acuosa y se extrajo con etiléster de ácido acético. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentró. Después de la purificación mediante cromatografía en columna se obtuvo 2-{3-[2-(1-[[propan-2-ilidenamino]oxi]acetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-1,2-oxazol-5-il}benzaldehído (150 mg).

2-{3-[2-(1-[[Propan-2-ilidenamino]oxi]acetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenilmetansulfonato (I-12)

A una solución de acetonaoxima (9,3 mg) en N,N-dimetilformamida (0,28 ml) se adicionó a temperatura ambiente 3Å criba molecular y se agitó durante 2 horas a esta temperatura. A ello se añadió después 2-(3-[2-[1-(cloroacetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenilmetansulfonato (50 mg) y carbonato de cesio (64 mg) y se agitó durante 18 horas a temperatura ambiente. A continuación se filtró la mezcla y se extrajo la mezcla dos veces con etiléster de ácido acético. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron. Después de la purificación mediante cromatografía en columna se obtuvo 2-{3-[2-(1-[[propan-2-ilidenamino]oxi]acetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenilmetansulfonato (5 mg, 10 %).

Preparación de compuestos de la fórmula (IV)

Ácido [[propan-2-ilidenamino]oxi]acético (IV-1)

Una mezcla de hemiclóridato de ácido (aminoxi)acético (2,51 g) y acetona (6,0 g) se agitó a temperatura ambiente durante 64 horas. A continuación se añadió diclorometano (10 ml) a la mezcla. Después se eliminó el disolvente y el exceso de reactivo bajo presión reducida. Se obtuvo ácido [[propan-2-ilidenamino]oxi]acético (3,1 g) que se continuó haciendo reaccionar sin otra purificación.

Ácido ([[1-(4-fluorofenil)etiliden]amino]oxi)acético (IV-2)

Etapa 1:

Una mezcla de 1-(4-fluorofenil)etanonoxima (8,00 g) y carbonato de cesio (20,4 g) en acetonitrilo se agitó durante 30 minutos a 20 °C. Después se adicionó bromacetato de etilo (12,2 g) y yoduro de potasio (8,7 g) y se agitó durante 3 horas a 82 °C. Después se filtró la mezcla de reacción. Del filtrado se eliminó el disolvente bajo presión reducida. Después de la purificación mediante cromatografía en columna se obtuvo ([[1-(4-fluorofenil)etiliden]-amino]oxi)acetato de etilo (8,7 g).

Etapa 2:

A una solución de ([[1-(4-fluorofenil)etiliden]amino]oxi)acetato de etilo (8,7 g) en una mezcla de 50 ml de tetrahidrofurano y 10 ml de agua se añadió a 20 °C hidróxido de litio-monohidrato (2,3 g) y se agitó durante 18 horas a esta temperatura. A continuación se agitó la mezcla en ácido clorhídrico helado al 10 % y se extrajo la mezcla dos veces con etiléster de ácido acético (respectivamente 50 ml). Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron. Después de la purificación por cromatografía en columna en gel de sílice con un gradiente de disolvente de 0:100 metanol/diclorometano respecto de 60:0 metanol/diclorometano se obtuvo ácido ([[1-(4-fluorofenil)etiliden]amino]oxi)acético (2,9 g).

Preparación de compuestos de la fórmula (X)

2-(3-[2-[1-(N,N-dimetilglicil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenilmetansulfonato (X-1)

A cloruro de 4-[4-(5-[2-[(metilsulfonil)oxi]fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (500 mg) en dimetilformamida (6 ml) se añadió bajo atmósfera de argón N,N-dimetilglicina (122 mg), diisopropiletilamina (582 mg) y tetrafluoroborato de O-(benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (TBTU, 542 mg). La mezcla de reacción se agitó durante 18 horas a temperatura ambiente. Después se añadió una solución helada de hidrogenocarbonato de sodio, se filtró, se separó la fase acuosa y se extrajo con etiléster de ácido acético. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron. Se obtuvo 2-(3-[2-[1-(N,N-dimetilglicil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}fenilmetansulfonato (310 mg, 55 %).

LogP (pH2.7): 1,48

2-(3-{2-[1-({terc-Butil(dimetil)silil}oxi)acetil]piperidin-4-il}-1,3-tiazol-4-il)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il)fenilmetansulfonato (X-2)

5 A cloruro de 4-[4-(5-{2-[(metilsulfonil)oxi]fenil}-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (500 mg) en dimetilformamida (6 ml) se añadió bajo atmósfera de argón ácido {[terc-butil(dimetil)silil]oxi}acético (225 mg), diisopropiletilamina (582 mg) y tetrafluoroborato de O-(benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (TBTU, 542 mg). La mezcla de reacción se agitó durante 18 horas a temperatura ambiente. Después se añadió una solución helada de hidrogenocarbonato de sodio, se filtró, se separó la fase acuosa y se extrajo con etiléster de ácido acético. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron. Después de la purificación mediante cromatografía en columna se obtuvo 2-(3-{2-[1-({terc-butil(dimetil)silil}oxi)acetil]piperidin-4-il}-1,3-tiazol-4-il)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il)-fenilmetansulfonato (150 mg, 22 %).

LogP (pH2.7): 4,14

2-{4-[4-(5-{2-[(Metilsulfonil)oxi]fenil}-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}-2-oxoetilacetato (X-3)

15 A cloruro de 4-[4-(5-{2-[(metilsulfonil)oxi]fenil}-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (500 mg) en diclorometano (6 ml) se añadieron bajo atmósfera de argón 2-cloro-2-oxoetilacetato (154 mg) y trietilamina (342 mg). La mezcla de reacción se agitó durante 18 horas a temperatura ambiente. A continuación se añadió agua, se filtró, se secó y se concentró. Después de la purificación mediante cromatografía en columna se obtuvo 2-{4-[4-(5-{2-[(metilsulfonil)oxi]fenil}-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il}-2-oxoetilacetato (170 mg, 30 %).

LogP (pH2.7): 2,18

2-(3-{2-[1-(Cloroacetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il)fenilmetansulfonato (Xc-a-142)

20 A una solución de cloruro de ácido cloroacético (22 mg) se añadió a 0 °C una solución de cloruro de 4-[4-(5-{2-[(metilsulfonil)oxi]fenil}-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (87 mg) y trietilamina (41 mg) en diclorometano (1 ml). La mezcla de reacción se agitó durante 15 minutos a 0 °C y se continuó agitando durante 18 horas a temperatura ambiente. A continuación se añadió agua, se separó la fase acuosa y se extrajo con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron. Después de la purificación mediante cromatografía en columna se obtuvo 2-(3-{2-[1-(cloroacetil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il)fenilmetansulfonato (60 mg, 60 %).

LogP (pH2.7): 2,42

30 ¹H NMR (250 MHz, CDCl₃): δ_{ppm} : 1.7-2.0 (m, 2H), 2.15-2.35 (m, 2H), 2.80-2.95 (m, 1H), 3.05-3.20 (m, 1H), 3.30 (s, 3H), 3.27-3.38 (m, 1H), 3.39-3.50 (dd, 1H), 3.85-3.97 (dd, 1H), 3.90-4.10 (m, 1H), 4.20 (s, 2H), 4.55-4.66 (m, 1H), 5.98-6.06 (dd, 1H), 7.30-7.42 (m, 3H), 7.55-7.62 (m, 1H), 7.62 (s, 1H)

Preparación de compuestos de la fórmula (XXVIIa)**2-{3-[2-(1-Glicoloilpiperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il)fenilmetansulfonato (XXVIIa-142)**

35 A cloruro de 4-[4-(5-{2-[(metilsulfonil)oxi]fenil}-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (110 mg) en dimetilformamida (2,6 ml) se añadieron bajo atmósfera de argón ácido glicólico (19 mg), diisopropiletilamina (32 mg) y tetrafluoroborato de O-(benzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio (TBTU, 159 mg). Después se añadió nuevamente diisopropiletilamina (64 mg) a la mezcla de reacción. La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Después se añadió una solución helada de hidrogenocarbonato de sodio, se filtró, se separó la fase acuosa y se extrajo con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron. Después de la purificación mediante cromatografía en columna se obtuvo 2-{3-[2-(1-glicoloilpiperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il)fenilmetansulfonato (15 mg, 12 %).

LogP (pH2.7): 1,88

45 ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃): δ_{ppm} : 1.7-1.9 (m, 2H), 2.15-2.25 (m, 2H), 2.88-3.00 (m, 1H), 3.10-3.20 (m, 1H), 3.27 (s, 3H), 3.27-3.38 (m, 1H), 3.39-3.47 (dd, 1H), 3.62 (m, 1H), 3.89-3.97 (dd, 1H), 4.20 (s, 2H), 4.60-4.66 (m, 1H), 5.98-6.06 (dd, 1H), 7.30-7.40 (m, 3H), 7.55-7.60 (m, 1H), 7.61 (s, 1H)

Preparación de compuestos de la fórmula (XVI)**4-[4-(5-{2-[(Metilsulfonil)oxi]-4-(trifluorometil)fenil}-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de terc-butilo (XVI-143)**

50 A una solución de 2-[3-(cloroacetil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-5-(trifluorometil)-fenilmetansulfonato (200 mg) y 4-carbamotioilpiperidin-1-carboxilato de terc-butilo (108 mg) en tetrahidrofurano (2 ml) se añadió bromuro de tetrabutilamonio a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se agitó durante 12 horas a temperatura ambiente. A continuación se añadió agua, se separó la fase acuosa y se extrajo con etiléster de ácido acético. Las fases orgánicas

combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron. Después de la purificación mediante cromatografía en columna se obtuvo 4-[4-(5-(2-[(metilsulfonyl)oxi]-4-(trifluorometil)fenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-carboxilato de *tert*-butilo (168 mg, 56 %).

LogP (pH2.7): 4,36

5 Preparación de compuestos de la fórmula (VIIa)

2-[3-(Cloroacetil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-5-(trifluorometil)-fenilmetansulfonato (VIIa-a-143)

10 A una solución de 5-(trifluorometil)-2-vinilfenilmetansulfonato (1,05 g) en acetonitrilo (10 ml) se añadieron hidrogenocarbonato de sodio (2,55 g) y cloruro de 3-cloro-N-hidroxi-2-oxopropanimidoilo (0,60 g) a temperatura ambiente bajo atmósfera de argón. La mezcla de reacción se agitó durante una hora a temperatura ambiente. El sólido se retiró por aspersión y el filtrado se concentró al vacío. El residuo se mezcló con heptano y se obtuvo 2-[3-(cloroacetil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-5-(trifluorometil)fenilmetansulfonato (1,33 g, 86 % pureza, 75 %).

LogP (pH2.7): 3,25

Preparación de compuestos de la fórmula (VIII)

1-[5-(2-[[Prop-2-in-1-il]oxi]fenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]etanona (VIIIa-a-81)

15 **Etapa 1:**

A una solución de 3,3-dimetoxibutan-2-ona (1,00 g) en etanol (10 ml) se añadió hidroxilamina (50 % en agua, 0,23 ml) a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se agitó a 50 °C durante 4 horas. Después se añadió agua, se separó la fase acuosa y se extrajo con etiléster de ácido acético. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron. Se obtuvo 3,3-dimetoxibutan-2-onoxima (800 mg, 72 %).

20 **Etapa 2:**

25 A una solución de 3,3-dimetoxibutan-2-onoxima (270 mg) en tetrahydrofurano (2,7 ml) se añadió gota a gota a 0 °C bajo argón *n*-butillitio (2 M en tetrahydrofurano, 1,83 ml). Después de continuar agitando durante 5 minutos se añadió a la mezcla de reacción gota a gota una solución de 2-[[3-(trimetilsilil)prop-2-in-1-il]oxi]benzaldehído (232 mg) en tetrahydrofurano (1 ml), y se continuó agitando durante 1 hora más. A continuación se añadió a la mezcla de reacción una solución concentrada de cloruro de amonio, se separó la fase acuosa y se extrajo con etiléster de ácido acético. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron. Después de la purificación mediante cromatografía en columna se obtuvo 1-hidroxi-4,4-dimetoxi-1-(2-[[3-(trimetilsilil)prop-2-in-1-il]oxi]fenil)pentan-3-onoxima (482 mg, 69 %).

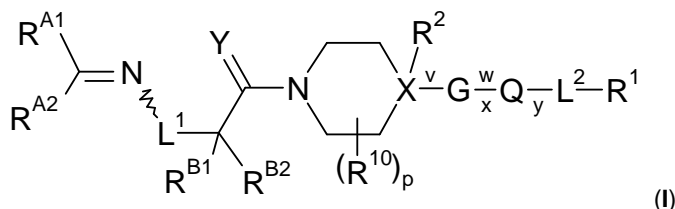
LogP (pH2.7): 3,19

30 **Etapa 3:**

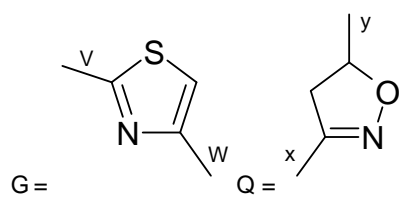
35 Una solución de ácido clorhídrico (4 M en dioxano, 3,80 ml) se añadió a 1-hidroxi-4,4-dimetoxi-1-(2-[[3-(trimetilsilil)prop-2-in-1-il]oxi]fenil)pentan-3-onoxima. Después de continuar agitando durante 15 minutos, se añadió a la mezcla de reacción solución concentrada de hidrogenocarbonato de sodio, se separó la fase acuosa y se extrajo con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron. Se obtuvo 1-[5-(2-[[prop-2-in-1-il]oxi]fenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]etanona (315 mg, 99 %).

LogP (pH2.7): 4,41

Ejemplos de compuestos



Los elementos estructurales G y Q enunciados en la Tabla 1 se definen de la siguiente manera:



Para todos los compuestos indicados en la Tabla 1, $p=0$ y L^2 = enlace directo.

Tabla 1:

Ej.	R ^{A1}	R ^{AZ}	L ¹	R ^{B1}	R ^{B2}	Y	X	R ²	R ¹	Log P
I-1	CH ₃	1,3-benzodioxol-5-ilo	O	H	H	O	C	H	2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo	3,29 ^[a] ; 3,28 ^[b]
I-2	propan-2-ilo	4-etoxifenilo	O	H	H	O	C	H	2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo	4,19 ^[a] ; 4,21 ^[b]
I-3	CH ₃	3-fluorofenilo	O	H	H	O	C	H	2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo	3,48 ^[a] ; 3,51 ^[b] [b]
I-4	CH ₃	3,4-dimetilfenilo	O	H	H	O	C	H	2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo	3,93 ^[a] ; 3,94 ^[b]
I-5	CH ₃	3-(trifluoro-metoxi)-fenilo	O	H	H	O	C	H	2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo	4,01 ^[a] ; 4,01 ^[b]
I-6	CH ₃	3,4-dimetilfenilo	O	H	H	O	C	H	5-fluoro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo	4,18 ^[a] ; 4,19 ^[b]
I-7	propan-2-ilo	4-etoxifenilo	O	H	H	O	C	H	5-fluoro-2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo	4,42 ^[a] ; 4,42 ^[b]
I-8	CH ₃	CH ₃	O	H	H	O	C	H	2-formilfenilo	2,45 ^[a]
I-9	CH ₃	trifluorometilo	O	H	H	O	C	H	2-fluoro-6-[(metilsulfoni)oxi]fenilo	2,91 ^[a]
I-10	CH ₃	trifluorometilo	O	H	H	O	C	H	2-[(metilsulfoni)oxi]fenilo	2,94 ^[a]
I-11	CH ₃	CH ₃	O	H	H	O	C	H	2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo	2,75 ^[a]
I-12	CH ₃	CH ₃	O	H	H	O	C	H	2-[(metilsulfoni)oxi]fenilo	2,36 ^[a]
I-13	CH ₃	CH ₃	O	H	H	O	C	H	2-fluoro-6-[(metilsulfoni)oxi]fenilo	2,34 ^[a]
I-14	CH ₃	1,1-dimetiletilo	O	H	H	O	C	H	2-[(metilsulfoni)oxi]fenilo	3,42 ^[a]

La **medición de los valores logP** se realizó de acuerdo con la Directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 mediante HPLC (Cromatografía Líquida de alto rendimiento) en columnas de fase inversa (C 18), según los procedimientos siguientes:

5 ^[a] la determinación por CL-EM en la zona ácida se realiza al valor de pH 2,7 con ácido fórmico acuoso al 0,1 % y acetonitrilo (contiene un 0,1 % de ácido fórmico) como eluyentes; gradiente lineal del 10 % de acetonitrilo al 95 % de acetonitrilo

^[b] La determinación por CL-EM en la zona neutra se realiza a un valor de pH 7,8 con solución acuosa 0,001 molar de hidrogenocarbonato de amonio y acetonitrilo como eluyentes; gradiente lineal del 10 % de acetonitrilo al 95 % de acetonitrilo.

10 La calibración se realiza con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono), cuyos valores logP se conocen (determinación de los valores logP mediante los tiempos de retención por interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los valores lambda-max se determinaron mediante espectros UV de 200 nm a 400 nm en los valores máximos de las señales cromatográficas.

15 **Datos RMN de ejemplos seleccionados**

Procedimiento de listas de picos de RMN

Los datos RMN de ¹H de ejemplos seleccionados se registraron en forma de listas de picos RMN de ¹H. Para cada pico de señal se indica primero el valor δ en ppm y después la intensidad de señal entre paréntesis. El valor δ - pares de números de intensidad de señal para diferentes picos de señal se indican con la separación uno de otro por punto y coma.

Por lo tanto la lista de picos para un ejemplo toma la forma de:

δ_1 (intensidad₁); δ_2 (intensidad₂);; δ_i (intensidad_i);; δ_n (intensidad_n)

Ej. I-1, disolvente: DMSO-d6, espectrómetro: 399,95 MHz

25 7.9545 (3.60); 7.4134 (0.43); 7.3965 (0.44); 7.1822 (0.83); 7.1782 (1.01); 7.1516 (0.33); 7.1314 (0.39); 7.0088 (0.67); 6.9876 (0.60); 6.9104 (0.58); 6.8890 (0.39); 6.8848 (0.41); 6.0411 (1.73); 6.0305 (0.76); 4.8750 (0.67); 4.8476 (0.96); 4.8430 (1.60); 4.8377 (1.51); 3.5424 (0.37); 3.5368 (0.73); 3.5312 (0.35); 3.3287 (11.63); 2.8904 (16.00); 2.7310 (13.61); 2.6890 (0.37); 2.5110 (4.13); 2.5066 (8.51); 2.5021 (11.46); 2.4976 (8.43); 2.4933 (4.16); 2.1951 (4.61); 2.0941 (0.33); 2.0668 (0.35); -0.0002 (1.94)

Ej. I-2, disolvente: DMSO-d6, espectrómetro: 399,95 MHz

30 8.7704 (0.40); 7.9674 (7.50); 7.9568 (14.86); 7.4320 (2.09); 7.4148 (2.86); 7.4110 (4.55); 7.3941 (4.71); 7.3901 (3.04); 7.3731 (2.52); 7.3581 (4.38); 7.3361 (5.35); 7.3250 (10.03); 7.3031 (10.99); 7.0071 (6.19); 6.9860 (5.62); 6.9292 (5.16); 6.9241 (2.51); 6.9113 (10.58); 6.9073 (11.20); 6.8896 (8.88); 6.8594 (2.99); 6.0694 (0.97); 6.0558 (1.97); 6.0472 (1.41); 6.0337 (2.54); 6.0256 (2.36); 6.0168 (1.28); 6.0031 (1.97); 4.8896 (0.32); 4.8834 (0.74); 4.8772 (0.76); 4.8656 (1.59); 4.8492 (4.59); 4.8436 (12.06); 4.8381 (14.93); 4.8323 (10.43); 4.8048 (0.62); 4.7986 (0.99); 35 4.7923 (0.83); 4.7709 (3.30); 4.7542 (0.83); 4.7321 (1.79); 4.6953 (1.81); 4.6238 (1.78); 4.5884 (0.76); 4.4207 (1.52); 4.4000 (1.80); 4.3934 (1.73); 4.0553 (0.87); 4.0376 (3.47); 4.0330 (2.34); 4.0245 (7.36); 4.0200 (5.20); 4.0159 (5.42); 4.0073 (7.33); 3.9985 (5.23); 3.9898 (3.31); 3.9811 (2.74); 3.9477 (1.45); 3.8563 (0.63); 3.8236 (0.70); 3.8067 (0.86); 3.7756 (1.65); 3.7647 (1.16); 3.7337 (2.17); 3.7023 (1.19); 3.5447 (2.02); 3.5394 (5.22); 3.5351 (8.28); 3.5292 (3.52); 3.5185 (1.34); 3.4974 (2.51); 3.4824 (3.33); 3.4765 (2.53); 3.4648 (4.49); 3.4535 (2.24); 3.4470 (3.58); 3.4292 (1.81); 40 3.4119 (0.33); 3.4007 (0.64); 3.3917 (1.11); 3.3816 (0.83); 3.3719 (1.35); 3.3629 (2.44); 3.3537 (1.84); 3.3270 (73.42); 3.3064 (0.72); 3.2965 (0.67); 3.2873 (0.41); 3.2150 (0.97); 3.1832 (1.71); 3.1539 (1.00); 3.1259 (0.53); 3.0951 (0.78); 3.0660 (0.44); 2.9458 (0.50); 2.8589 (0.43); 2.8419 (1.16); 2.8248 (1.83); 2.8184 (1.23); 2.8078 (2.05); 2.7794 (2.09); 2.7501 (1.64); 2.7210 (0.51); 2.6754 (0.60); 2.6709 (0.81); 2.6663 (0.59); 2.5411 (0.32); 2.5241 (2.86); 2.5107 (45.32); 2.5063 (87.61); 2.5018 (114.13); 2.4973 (83.01); 2.4929 (40.26); 2.3373 (0.35); 2.3330 (0.64); 2.3286 45 (0.84); 2.3241 (0.63); 2.0941 (2.96); 2.0679 (3.61); 1.9892 (9.12); 1.9618 (0.66); 1.7451 (0.50); 1.7164 (1.15); 1.6926 (1.08); 1.6868 (1.06); 1.6630 (0.48); 1.5840 (0.92); 1.5537 (1.64); 1.5224 (1.55); 1.4918 (0.83); 1.3970 (7.54); 1.3356 (7.58); 1.3299 (6.61); 1.3183 (14.57); 1.3126 (11.93); 1.3009 (7.37); 1.2952 (5.52); 1.2490 (0.42); 1.1921 (2.98); 1.1745 (12.90); 1.1567 (16.00); 1.1374 (7.43); 1.0126 (11.42); 0.9956 (11.25); 0.0079 (1.26); -0.0002 (27.88); -0.0085 (1.05)

50 Ej. I-3, disolvente: DMSO-d6, espectrómetro: 399,95 MHz

7.9542 (6.35); 7.5019 (0.97); 7.4823 (2.04); 7.4638 (0.97); 7.4485 (2.11); 7.4441 (2.24); 7.4361 (1.00); 7.4282 (2.01); 7.4200 (1.99); 7.4158 (2.15); 7.4097 (0.92); 7.3982 (1.43); 7.3944 (0.97); 7.3773 (0.73); 7.2380 (0.71); 7.2200 (0.68); 7.0109 (2.14); 6.9897 (1.93); 6.9118 (1.09); 6.8863 (1.32); 6.8649 (1.02); 6.0571 (0.93); 6.0347 (1.14); 6.0267 (1.10);

ES 2 565 067 T3

6.0041 (0.97); 4.9751 (0.54); 4.9393 (2.21); 4.8987 (2.15); 4.8847 (0.37); 4.8619 (0.69); 4.8500 (3.18); 4.8452 (4.90); 4.8404 (3.23); 4.4223 (0.59); 4.3898 (0.64); 4.0557 (1.11); 4.0379 (3.38); 4.0201 (3.44); 4.0023 (1.19); 3.9716 (0.57); 3.9378 (0.63); 3.7681 (0.61); 3.7375 (0.70); 3.7262 (0.86); 3.6955 (0.76); 3.5451 (1.35); 3.5393 (2.76); 3.5337 (1.30); 3.4808 (0.60); 3.4595 (0.60); 3.4396 (0.46); 3.4174 (0.45); 3.3913 (0.47); 3.3817 (0.33); 3.3721 (0.55); 3.3626 (0.96); 5 3.3535 (0.61); 3.3283 (18.68); 3.2282 (0.43); 3.1978 (0.77); 3.1681 (0.44); 2.8255 (0.39); 2.8204 (0.41); 2.7906 (0.75); 2.7627 (0.42); 2.5111 (12.72); 2.5069 (24.81); 2.5024 (32.41); 2.4980 (24.08); 2.2501 (16.00); 2.0863 (1.06); 2.0698 (1.09); 1.9895 (14.31); 1.7192 (0.49); 1.6894 (0.48); 1.5510 (0.51); 1.5202 (0.48); 1.1924 (3.91); 1.1745 (7.74); 1.1568 (3.84); -0.0002 (5.50)

Ej. I-4, disolvente: DMSO-d6, espectrómetro: 399,95 MHz

10 7.9541 (4.56); 7.4349 (0.46); 7.4130 (2.11); 7.3972 (1.13); 7.3933 (0.72); 7.3762 (0.52); 7.3518 (0.76); 7.3325 (0.92); 7.1471 (0.94); 7.1284 (0.78); 7.0095 (1.47); 6.9883 (1.33); 6.9105 (0.74); 6.8852 (0.91); 6.8637 (0.69); 6.0562 (0.54); 6.0339 (0.68); 6.0262 (0.65); 6.0034 (0.56); 5.7593 (2.88); 4.9251 (0.42); 4.8892 (1.54); 4.8423 (4.60); 4.8048 (0.46); 4.4214 (0.40); 4.3913 (0.45); 4.0553 (0.49); 4.0375 (1.49); 4.0197 (1.55); 4.0019 (0.81); 3.9619 (0.44); 3.7305 (0.47); 3.5436 (0.89); 3.5378 (1.80); 3.5321 (0.84); 3.4860 (0.65); 3.4635 (0.65); 3.4431 (0.50); 3.4211 (0.49); 3.3685 (0.39); 15 3.3592 (0.66); 3.3498 (0.42); 3.3270 (13.45); 3.1941 (0.53); 2.8901 (1.43); 2.7854 (0.52); 2.7310 (1.19); 2.5105 (11.52); 2.5063 (22.30); 2.5018 (29.06); 2.4973 (21.43); 2.4931 (10.72); 2.2184 (10.46); 2.2101 (16.00); 2.0946 (0.80); 2.0695 (0.81); 1.9892 (6.42); 1.7172 (0.34); 1.6895 (0.33); 1.5506 (0.35); 1.5203 (0.34); 1.1921 (1.74); 1.1743 (3.47); 1.1565 (1.71); -0.0002 (6.69)

Ej. I-5, disolvente: DMSO-d6, espectrómetro: 399,95 MHz

20 7.9523 (6.32); 7.6893 (1.32); 7.6698 (1.71); 7.5807 (2.39); 7.5613 (1.28); 7.5412 (2.22); 7.5213 (1.15); 7.4361 (0.74); 7.4188 (1.57); 7.4151 (2.00); 7.3983 (2.20); 7.3774 (1.00); 7.0114 (2.15); 6.9902 (1.94); 6.9109 (1.08); 6.8854 (1.35); 6.8640 (1.02); 6.0567 (0.92); 6.0343 (1.13); 6.0264 (1.10); 6.0037 (0.96); 5.7598 (1.88); 4.9935 (0.58); 4.9577 (2.20); 4.9145 (2.12); 4.8908 (0.35); 4.8797 (0.65); 4.8505 (3.16); 4.8457 (4.91); 4.8408 (3.18); 4.4224 (0.61); 4.3902 (0.67); 4.0560 (0.79); 4.0382 (2.41); 4.0204 (2.45); 4.0026 (0.85); 3.9687 (0.59); 3.9353 (0.66); 3.7654 (0.64); 3.7334 (0.72); 25 3.7233 (0.90); 3.6918 (0.79); 3.5457 (1.30); 3.5399 (2.71); 3.5342 (1.28); 3.4790 (0.55); 3.4564 (0.55); 3.4410 (0.42); 3.4139 (0.41); 3.3912 (0.48); 3.3814 (0.36); 3.3717 (0.57); 3.3623 (0.97); 3.3532 (0.61); 3.3429 (0.45); 3.3286 (11.09); 3.2288 (0.44); 3.1983 (0.80); 3.1689 (0.44); 2.8263 (0.47); 2.8214 (0.43); 2.7907 (0.79); 2.7622 (0.44); 2.5251 (0.45); 2.5073 (19.73); 2.5028 (25.92); 2.4984 (19.39); 2.2689 (16.00); 2.1042 (1.05); 2.0709 (1.17); 1.9897 (10.36); 1.7171 (0.52); 1.6895 (0.50); 1.5492 (0.53); 1.5205 (0.50); 1.3969 (2.38); 1.1926 (2.89); 1.1748 (5.76); 30 1.1570 (2.84); -0.0002 (6.56); -0.0084 (0.35)

Ej. I-6, disolvente: DMSO-d6, espectrómetro: 399,95 MHz

8.7705 (0.42); 8.0099 (3.69); 7.4036 (1.92); 7.3536 (0.94); 7.3499 (0.82); 7.3340 (1.13); 7.3301 (1.00); 7.1772 (2.14); 7.1651 (2.47); 7.1611 (2.22); 7.1538 (1.50); 7.1340 (1.17); 7.0888 (0.77); 7.0667 (0.89); 5.8531 (0.60); 5.8355 (0.71); 5.8255 (0.74); 5.8078 (0.62); 4.9178 (0.40); 4.8774 (4.12); 4.8717 (4.06); 4.8408 (1.59); 4.8165 (0.33); 4.8050 (0.44); 35 4.4103 (0.40); 4.3795 (0.46); 4.0558 (0.43); 4.0380 (1.31); 4.0202 (1.34); 4.0023 (0.51); 3.9802 (0.41); 3.9468 (0.46); 3.9011 (0.54); 3.8735 (0.56); 3.8579 (0.65); 3.8304 (0.54); 3.6078 (0.75); 3.6020 (1.51); 3.5968 (0.75); 3.3502 (0.40); 3.3408 (0.75); 3.3282 (13.10); 3.3124 (0.41); 3.2678 (0.69); 3.2503 (0.67); 3.2245 (0.70); 3.2073 (0.72); 3.1835 (0.56); 3.1533 (0.35); 2.7724 (0.55); 2.7438 (0.35); 2.5246 (0.64); 2.5112 (11.67); 2.5070 (22.74); 2.5025 (29.67); 2.4982 (21.87); 2.2281 (3.23); 2.2182 (16.00); 2.2074 (13.09); 2.1996 (2.30); 2.1902 (0.67); 2.0916 (0.70); 2.0820 40 (0.72); 2.0499 (0.83); 1.9897 (5.58); 1.9092 (1.42); 1.7042 (0.33); 1.6968 (0.34); 1.6732 (0.34); 1.5307 (0.33); 1.5202 (0.35); 1.5001 (0.34); 1.4907 (0.34); 1.3969 (4.19); 1.1925 (1.54); 1.1747 (3.02); 1.1569 (1.51); -0.0002 (6.53)

Ej. I-7, disolvente: DMSO-d6, espectrómetro: 399,95 MHz

12.9922 (0.38); 8.7715 (0.37); 8.6617 (1.17); 8.0222 (3.57); 8.0128 (9.56); 7.9937 (0.35); 7.3508 (1.87); 7.3231 45 (7.08); 7.3012 (7.21); 7.1746 (6.71); 7.1621 (7.00); 7.1585 (6.15); 7.0890 (2.56); 7.0861 (2.56); 7.0636 (2.71); 6.9204 (3.70); 6.9137 (6.26); 6.8981 (4.17); 6.8921 (5.48); 5.8648 (0.63); 5.8525 (1.65); 5.8357 (2.26); 5.8251 (1.92); 5.8076 (1.59); 4.8718 (11.07); 4.8662 (10.08); 4.8259 (3.15); 4.8014 (0.46); 4.7948 (0.36); 4.7674 (3.06); 4.7309 (1.39); 4.6919 (1.12); 4.6139 (1.01); 4.5791 (0.47); 4.4126 (1.20); 4.4035 (1.23); 4.3825 (1.37); 4.0563 (0.82); 4.0470 (1.50); 4.0386 (2.60); 4.0305 (4.26); 4.0211 (3.54); 4.0130 (4.45); 4.0056 (3.60); 3.9955 (1.88); 3.9881 (2.69); 3.9706 (1.68); 3.9259 (1.56); 3.9044 (1.84); 3.8977 (1.24); 3.8820 (1.30); 3.8765 (1.96); 3.8611 (2.11); 3.8552 (1.16); 3.8334 (1.85); 50 3.8136 (0.48); 3.6065 (2.67); 3.6008 (5.18); 3.5953 (2.56); 3.5802 (0.39); 3.4978 (0.71); 3.4801 (1.85); 3.4623 (2.60); 3.4445 (2.00); 3.4340 (0.43); 3.4268 (0.82); 3.3819 (0.51); 3.3731 (0.82); 3.3635 (0.69); 3.3535 (1.10); 3.3442 (2.07); 3.3304 (20.08); 3.3156 (1.38); 3.3057 (1.23); 3.2835 (1.13); 3.2674 (2.56); 3.2501 (1.95); 3.2403 (0.91); 3.2242 (2.21); 3.2069 (2.25); 3.1709 (1.36); 3.1419 (0.82); 3.1111 (0.45); 3.0754 (0.71); 3.0483 (0.44); 3.0138 (0.53); 2.9472 (0.39); 2.8372 (0.51); 2.8205 (0.92); 2.8016 (1.01); 2.7648 (1.65); 2.7342 (1.22); 2.7036 (0.40); 2.6771 (0.33); 2.6724 55 (0.45); 2.5080 (36.63); 2.5036 (46.90); 2.4992 (34.39); 2.3305 (0.33); 2.0721 (2.16); 2.0460 (2.77); 1.9904 (5.45); 1.9584 (0.71); 1.9316 (0.42); 1.7294 (0.39); 1.7003 (0.88); 1.6773 (0.85); 1.6485 (0.39); 1.5890 (0.35); 1.5595 (0.97); 1.5289 (1.45); 1.4981 (1.32); 1.4631 (0.69); 1.4041 (11.07); 1.3961 (3.74); 1.3397 (7.11); 1.3224 (16.00); 1.3052 (11.20); 1.2880 (2.43); 1.2491 (0.35); 1.2342 (0.35); 1.1932 (1.83); 1.1753 (10.41); 1.1572 (12.78); 1.1348 (7.30); 1.0097 (5.45); 0.9929 (5.28); 0.0079 (0.57); -0.0002 (12.39); -0.0085 (0.54)

Ej. I-8, disolvente: CD3CN, espectrómetro: 399,95 MHz

10.1384 (4.87); 7.9635 (1.51); 7.9450 (1.44); 7.6833 (2.36); 7.6811 (2.86); 7.6714 (3.22); 7.6684 (1.83); 7.6487 (5.99); 7.5976 (0.76); 7.5861 (1.11); 7.5783 (0.82); 7.5664 (0.76); 7.5568 (0.48); 6.4608 (1.02); 6.4443 (1.03); 6.4329 (1.06); 6.4162 (1.04); 4.6285 (2.33); 4.6116 (2.40); 4.4785 (0.38); 4.4512 (0.39); 4.3267 (0.42); 4.0990 (1.23); 4.0864 (0.94); 4.0686 (2.80); 4.0554 (1.49); 4.0507 (2.75); 4.0329 (0.94); 4.0275 (1.36); 3.9830 (0.37); 3.9498 (0.40); 3.3104 (0.47); 3.2908 (0.48); 3.2811 (0.95); 3.2712 (0.51); 3.2524 (0.50); 3.1672 (1.48); 3.1505 (1.74); 3.1236 (1.53); 3.1069 (1.36); 2.7614 (0.48); 2.1913 (0.46); 2.1898 (0.51); 2.1692 (146.43); 2.1651 (275.77); 2.1639 (218.61); 2.1469 (1.17); 2.1323 (0.61); 2.1199 (0.97); 2.1139 (1.36); 2.1076 (1.38); 2.1015 (1.04); 2.0954 (0.76); 2.0812 (0.94); 1.9721 (12.09); 1.9645 (14.96); 1.9584 (2.42); 1.9526 (40.42); 1.9464 (79.16); 1.9402 (115.91); 1.9340 (78.66); 1.9279 (39.79); 1.9150 (0.58); 1.8888 (0.58); 1.8536 (15.08); 1.8373 (0.55); 1.8175 (0.82); 1.8083 (16.00); 1.7748 (0.55); 1.7686 (0.77); 1.7623 (0.56); 1.7565 (0.44); 1.7305 (0.37); 1.6986 (0.38); 1.6154 (0.35); 1.5913 (0.33); 1.5812 (0.32); 1.3349 (0.33); 1.2218 (3.22); 1.2040 (6.45); 1.1861 (3.15); -0.0002 (1.13)

Ej. I-9, disolvente: DMSO-d6, espectrómetro: 399,95 MHz

8.0327 (6.22); 7.5906 (0.54); 7.5747 (0.64); 7.5696 (1.15); 7.5538 (1.19); 7.5487 (0.76); 7.5329 (0.70); 7.3481 (0.81); 7.3300 (2.48); 7.3238 (1.11); 7.3092 (1.66); 7.3025 (0.75); 6.0465 (0.62); 6.0230 (0.78); 6.0166 (0.74); 5.9930 (0.65); 5.0844 (0.38); 5.0466 (1.73); 5.0071 (1.67); 4.9696 (0.39); 4.3987 (0.40); 4.3659 (0.43); 4.0380 (0.51); 4.0202 (0.52); 3.8983 (0.43); 3.8942 (0.40); 3.8679 (0.49); 3.8636 (0.49); 3.8550 (0.59); 3.8506 (0.60); 3.8242 (0.85); 3.8205 (0.87); 3.7880 (0.43); 3.5470 (16.00); 3.5275 (0.76); 3.5040 (0.72); 3.4826 (0.57); 3.4598 (0.56); 3.3900 (0.34); 3.3702 (0.45); 3.3613 (0.73); 3.3519 (0.42); 3.3245 (11.87); 3.1663 (0.53); 2.7902 (0.52); 2.5245 (0.41); 2.5197 (0.70); 2.5112 (8.64); 2.5067 (17.31); 2.5021 (22.66); 2.4974 (16.20); 2.4929 (7.58); 2.0999 (0.80); 2.0945 (0.84); 2.0629 (15.57); 1.9891 (2.31); 1.7285 (0.35); 1.6980 (0.32); 1.5563 (0.33); 1.5271 (0.32); 1.2496 (0.35); 1.1924 (0.64); 1.1746 (1.29); 1.1568 (0.62); 0.0080 (0.52); -0.0002 (14.82); -0.0086 (0.44)

Ej. I-10, disolvente: DMSO-d6, espectrómetro: 399,95 MHz

8.0469 (5.74); 7.5142 (0.80); 7.5100 (0.92); 7.4931 (1.33); 7.4682 (0.81); 7.4637 (0.99); 7.4529 (2.98); 7.4486 (3.63); 7.4345 (0.58); 7.4232 (1.09); 7.4170 (0.76); 7.4070 (0.65); 7.4046 (0.79); 7.4015 (0.59); 7.3979 (0.57); 7.3893 (0.39); 7.3827 (0.36); 6.0059 (0.79); 5.9865 (0.93); 5.9780 (0.90); 5.9586 (0.81); 5.0803 (0.36); 5.0426 (1.65); 5.0030 (1.60); 4.9651 (0.36); 4.3930 (0.37); 4.3602 (0.40); 4.0381 (0.64); 4.0203 (0.65); 3.9914 (0.81); 3.9634 (0.95); 3.9479 (1.06); 3.9200 (0.87); 3.8135 (0.36); 3.7798 (0.40); 3.5526 (16.00); 3.3767 (0.36); 3.3561 (1.28); 3.3483 (0.78); 3.3367 (1.27); 3.3240 (8.73); 3.3126 (1.08); 3.2932 (0.91); 3.1569 (0.50); 2.7799 (0.48); 2.5247 (0.40); 2.5199 (0.61); 2.5113 (8.66); 2.5067 (17.70); 2.5021 (23.44); 2.4975 (16.86); 2.4930 (7.97); 2.0767 (0.90); 2.0611 (14.17); 2.0522 (1.34); 1.9892 (2.84); 1.2495 (0.33); 1.1927 (0.79); 1.1749 (1.58); 1.1571 (0.78); 0.0080 (0.43); -0.0002 (14.15); -0.0085 (0.45)

Ej. I-11, disolvente: DMSO-d6, espectrómetro: 399,95 MHz

7.9982 (5.94); 7.3449 (0.52); 7.3407 (0.70); 7.3199 (1.87); 7.3060 (0.69); 7.3018 (1.61); 7.2985 (1.84); 7.1486 (1.75); 7.1285 (1.48); 7.0156 (0.96); 6.9981 (1.67); 6.9795 (0.77); 5.8806 (0.85); 5.8628 (0.97); 5.8529 (0.94); 5.8350 (0.86); 5.7577 (1.13); 4.8781 (4.66); 4.8722 (4.67); 4.6666 (2.44); 4.6483 (2.43); 4.5951 (0.67); 4.3878 (0.43); 4.3549 (0.47); 4.0557 (0.38); 4.0379 (1.14); 4.0201 (1.16); 4.0023 (0.39); 3.9284 (0.41); 3.8900 (1.26); 3.8621 (1.05); 3.8470 (1.15); 3.8192 (0.96); 3.5879 (1.22); 3.5821 (2.71); 3.5762 (1.21); 3.3571 (0.39); 3.3375 (0.56); 3.3240 (19.15); 3.3094 (0.40); 3.2993 (0.51); 3.2588 (1.16); 3.2409 (1.12); 3.2158 (1.04); 3.1981 (1.00); 3.1408 (0.57); 2.7458 (0.55); 2.5243 (0.43); 2.5194 (0.75); 2.5108 (10.95); 2.5064 (22.13); 2.5018 (29.24); 2.4973 (21.30); 2.4928 (10.34); 2.0607 (0.89); 2.0308 (1.05); 1.9891 (5.09); 1.8288 (15.58); 1.8235 (1.85); 1.8196 (1.01); 1.7932 (16.00); 1.7823 (0.95); 1.6664 (0.46); 1.6433 (0.37); 1.6320 (0.39); 1.5163 (0.36); 1.5084 (0.38); 1.4872 (0.37); 1.4792 (0.35); 1.1924 (1.33); 1.1746 (2.66); 1.1568 (1.31); -0.0002 (2.35)

Ej. I-12, disolvente: DMSO-d6, espectrómetro: 399,95 MHz

8.0416 (5.69); 7.5142 (0.85); 7.5102 (0.98); 7.4930 (1.44); 7.4727 (0.34); 7.4683 (0.84); 7.4638 (1.03); 7.4530 (3.23); 7.4486 (3.86); 7.4344 (0.68); 7.4234 (1.18); 7.4173 (0.86); 7.4048 (0.89); 7.4018 (0.70); 7.3983 (0.66); 7.3896 (0.45); 7.3830 (0.41); 6.0049 (0.84); 5.9855 (1.01); 5.9772 (0.97); 5.9577 (0.88); 5.7581 (0.70); 4.6691 (2.29); 4.6515 (2.34); 4.3911 (0.40); 4.3593 (0.44); 4.0558 (0.32); 4.0380 (0.93); 4.0202 (0.95); 4.0024 (0.35); 3.9909 (0.84); 3.9629 (1.00); 3.9474 (1.24); 3.9323 (0.43); 3.9196 (1.13); 3.8993 (0.45); 3.5533 (16.00); 3.3691 (0.43); 3.3555 (1.19); 3.3501 (0.58); 3.3360 (1.53); 3.3254 (14.63); 3.3120 (1.37); 3.2927 (0.98); 3.1461 (0.53); 2.7512 (0.53); 2.5247 (0.41); 2.5198 (0.67); 2.5113 (7.79); 2.5068 (15.48); 2.5023 (20.20); 2.4977 (14.58); 2.4932 (6.96); 2.0677 (0.85); 2.0372 (0.99); 1.9893 (4.12); 1.8296 (14.61); 1.8187 (0.70); 1.7936 (15.22); 1.7815 (0.68); 1.6721 (0.35); 1.6676 (0.35); 1.6494 (0.33); 1.6417 (0.33); 1.5159 (0.35); 1.4932 (0.33); 1.1925 (1.10); 1.1747 (2.18); 1.1569 (1.07); -0.0002 (1.61)

Ej. I-13, disolvente: DMSO-d6, espectrómetro: 399,95 MHz

8.0271 (6.25); 7.5903 (0.53); 7.5745 (0.62); 7.5694 (1.14); 7.5535 (1.18); 7.5484 (0.76); 7.5326 (0.69); 7.3484 (0.80); 7.3297 (2.54); 7.3243 (1.19); 7.3088 (1.66); 7.3029 (0.80); 6.0454 (0.63); 6.0220 (0.78); 6.0155 (0.75); 5.9920 (0.66); 4.6725 (2.29); 4.6557 (2.27); 4.3964 (0.39); 4.3649 (0.42); 4.0379 (0.66); 4.0201 (0.66); 3.9404 (0.38); 3.8978 (0.69);

3.8939 (0.59); 3.8672 (0.49); 3.8630 (0.49); 3.8543 (0.58); 3.8499 (0.59); 3.8238 (0.49); 3.8197 (0.51); 3.5471 (16.00); 3.5264 (0.76); 3.5028 (0.73); 3.4818 (0.56); 3.4586 (0.56); 3.3817 (0.36); 3.3623 (0.42); 3.3528 (0.77); 3.3433 (0.46); 3.3250 (15.50); 3.1551 (0.51); 2.7608 (0.50); 2.5245 (0.34); 2.5197 (0.56); 2.5111 (7.41); 2.5066 (14.97); 2.5020 (19.76); 2.4974 (14.25); 2.4929 (6.74); 2.0859 (0.82); 2.0555 (0.94); 1.9891 (2.95); 1.8325 (15.49); 1.7955 (15.54); 1.6908 (0.33); 1.6698 (0.34); 1.6620 (0.32); 1.5326 (0.33); 1.1924 (0.80); 1.1745 (1.59); 1.1568 (0.78); -0.0002 (1.73)

Ej. I-14, disolvente: CDCl₃, espectrómetro: 250,13 MHz

7.6093 (1.70); 7.5932 (0.43); 7.5684 (0.47); 7.5599 (0.47); 7.4024 (0.76); 7.3874 (1.25); 7.3561 (0.38); 7.3447 (0.46); 7.2658 (5.88); 7.2635 (5.81); 6.0595 (0.34); 6.0271 (0.40); 6.0145 (0.39); 5.9817 (0.38); 5.3038 (3.98); 5.3015 (3.99); 4.7093 (1.76); 4.7048 (1.79); 3.9822 (0.33); 3.9378 (0.34); 3.9131 (0.46); 3.8680 (0.42); 3.4797 (0.45); 3.4464 (0.43); 3.4092 (0.35); 3.3769 (0.35); 3.2957 (0.33); 3.2640 (5.71); 3.2621 (5.51); 2.8063 (0.39); 2.1921 (0.35); 2.1471 (0.46); 1.8761 (0.37); 1.8514 (5.47); 1.8494 (5.40); 1.7818 (0.42); 1.7665 (0.44); 1.7310 (0.37); 1.7150 (0.36); 1.6003 (5.45); 1.2560 (0.32); 1.0915 (16.00); 1.0898 (15.63); 0.0020 (3.70); -0.0002 (3.83)

La intensidad de señales fuertes es correlativa con la altura de las señales en un ejemplo impreso de un espectro de RMN en cm y muestra las verdaderas relaciones de las intensidades de señal. En señales anchas se pueden mostrar varios picos o el centro de la señal y su intensidad relativa en comparación con la señal más intensiva en el espectro.

Para la calibración del desplazamiento químico de espectros de RMN de ¹H usamos tetrametilsilano y/o el desplazamiento químico del disolvente, especialmente en el caso de espectros que se miden en DMSO. Por lo tanto, en las listas de picos de RMN puede presentarse, pero no necesariamente, el pico de tetrametilsilano.

Las listas de los picos de RMN de ¹H son similares a las impresiones de RMN de ¹H clásicas y por lo tanto en general incluyen todos los picos que se indican en una interpretación clásica de RMN.

Además, como impresiones de RMN de ¹H clásicas pueden mostrar señales de disolventes, señales de estereoisómeros de los compuestos objetivo que también son objeto de la invención y/o picos de impurezas.

Al indicar señales de compuestos en el intervalo delta de disolventes y/o de agua, en nuestras listas de picos de RMN de ¹H se muestran los picos usuales de disolventes, por ejemplo, los picos de DMSO en DMSO-d₆ y el pico de agua que por lo general presentan en promedio una elevada intensidad.

Los picos de estereoisómeros de los compuestos objetivo y/o los picos de impurezas por lo general presentan en promedio una menor intensidad que los picos de los compuestos objetivo (por ejemplo con una pureza de >90 %).

Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del respectivo procedimiento de preparación. Sus picos por lo tanto cumplen la función de ayudar a reconocer la reproducción del procedimiento de preparación por medio de "huellas digitales del producto secundario".

Un especialista que calcula los picos de los compuestos objetivo con procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también con valores esperados evaluados en forma empírica) puede, según necesidad, aislar los picos de los compuestos objetivo, para lo cual en su caso se usan filtros de intensidad adicionales. Ese aislamiento sería similar a la correspondiente selección de picos (Peak-Picking) en la interpretación clásica de RMN de ¹H.

Otros detalles con respecto a las listas de picos de RMN de ¹H pueden deducirse de Research Disclosure Database Number 564025.

Ejemplos de uso

Ensayo con *Phytophthora* (tomate) / protección

Disolvente:	49	partes en peso de N,N-dimetilformamida
Emulsionante:	1	parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante, y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

Para analizar la actividad preventiva, se rocían plantas jóvenes de tomate con la preparación del compuesto activo en la dosis indicada de aplicación. 1 día después de este tratamiento, se inoculan las plantas con una suspensión de esporas de *Phytophthora infestans* y se dejan reposar 24 h a una temperatura de 22 °C y una humedad relativa del 100 %. Después las plantas se colocan en una cabina de incubación a aproximadamente una humedad relativa del 96 % y a una temperatura de aproximadamente 20 °C.

ES 2 565 067 T3

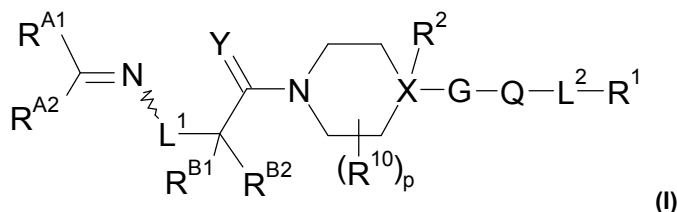
7 días después de la inoculación se realiza la evaluación. A este respecto, el 0 % significa un grado de acción que corresponde a aquel del control, mientras que un grado de acción del 100 % significa que no se observa ninguna infestación.

5 En este ensayo los siguientes compuestos de acuerdo con la invención muestran un grado de acción del 70 % o más con una concentración de 100 ppm de principio activo:

Ejemplo	% de efecto
I-1	94
I-2	89
I-3	83
I-4	78
I-8	89

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de la fórmula (I),



en la que las definiciones de restos tienen los siguientes significados:

- 5 R^{A1} representa hidrógeno, halógeno, ciano, amino, $-CHO$, $-C(=O)OH$, $-C(=O)NH_2$, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, alquilocicloalquilo, cicloalquilalquilo, halocicloalquilalquilo, cicloalquenilo, halocicloalquenilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquilsulfinilalquilo, alquilsulfonilalquilo, alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, haloalquilaminoalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, alcocixarbonilo, cicloalcoxycarbonilo, cicloalquilalcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalcoxi, halocicloalcoxi, alqueniloxi, haloalqueniloxi, alquiniloxi, haloalquiniloxi, alcoxialcoxi, alquilcarboniloxi, haloalquilcarboniloxi, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilamino, dialquilamino, haloalquilamino, halodialquilamino, cicloalquilamino, alquilcarbonilamino, haloalquilcarbonilamino, alquilsulfonilamino o haloalquilsulfonilamino,
- 10 R^{A2} representa hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio o R^{A2} representa un fenilo no sustituido o sustituido, un heterocicli de 5 o 6 miembros sustituido dado el caso benzocondensado, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de la siguiente lista: hidroxilo, ciano, halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi o R^{A1} y R^{A2} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo saturado o parcialmente insaturado de tres a siete miembros que contiene dado el caso uno, dos, tres o cuatro heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno, silicio o azufre, estando dado el caso uno, dos o tres miembros de anillo de carbono seleccionados de $C(=O)$ y $C(=S)$ y los miembros de anillo de azufre se seleccionan de $S(=O)_s(=NR^{A3})_f$, y los miembros de anillo de silicio se seleccionan de $SiR^{A4}R^{A5}$, pudiendo el anillo estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de R^{A6} ,
- 15 R^{A3} representa hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquilamino, dialquilamino, haloalquilamino o fenilo, R^{A4} y R^{A5} representan de manera igual o diferente e independientemente entre sí alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquilocicloalquilo, alquilocicloalquilalquilo, haloalquilo, alcoxi o haloalcoxi,
- 20 s representa 0, 1 o 2, y f representa 0, 1 o 2, y s + f representa 0, 1 o 2, R^{A6} representa halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxi o haloalcoxi en los miembros de anillo de carbono y representa ciano, alquilo o alcoxi en los miembros de anillo de nitrógeno, L^1 representa oxígeno, azufre, $-N(R^{L1})-$, $-C(R^{L2})_2-$, $-OC(R^{L2})_2-$, $-SC(R^{L2})_2-$, $-N(R^{L1})-C(R^{L2})_2-$, estando el enlace orientado hacia la izquierda unido al átomo de nitrógeno de la fórmula I y el enlace orientado hacia la derecha unido al átomo de nitrógeno de la fórmula I
- 25 R^{L1} representa hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcocixarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilsulfonilo o haloalquilsulfonilo o los dos restos R^{L1} y R^{L2} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo parcialmente insaturado de cinco o siete miembros que contiene dado el caso uno, dos o tres heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno o azufre, pudiendo el anillo estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de R^{A6} , R^{L2} representa hidrógeno, alquilo o haloalquilo, R^{B1} representa hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, formilo, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquilsulfinilalquilo, alquilsulfonilalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcocixarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, haloalquilcarboniloxi, alcocixarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, dialquilaminocarboniloxi o R^{B1} representa un resto fenilo, un resto naftalenilo o un resto heteroarilo de 5 o 6 miembros, que puede contener respectivamente 0, 1, 2 o 3 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista: hidrógeno, halógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquilcarboniloxi, haloalquilcarboniloxi,
- 30 R^{B2} representa hidrógeno, alquilo o haloalquilo, o los dos restos R^{B1} y R^{B2} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo saturado de tres a seis miembros, Y representa azufre u oxígeno,
- 35 R^{L1} representa hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcocixarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilsulfonilo o haloalquilsulfonilo o los dos restos R^{L1} y R^{L2} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo parcialmente insaturado de cinco o siete miembros que contiene dado el caso uno, dos o tres heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno o azufre, pudiendo el anillo estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de R^{A6} , R^{L2} representa hidrógeno, alquilo o haloalquilo, R^{B1} representa hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, formilo, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquilsulfinilalquilo, alquilsulfonilalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcocixarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, haloalquilcarboniloxi, alcocixarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, dialquilaminocarboniloxi o R^{B1} representa un resto fenilo, un resto naftalenilo o un resto heteroarilo de 5 o 6 miembros, que puede contener respectivamente 0, 1, 2 o 3 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista: hidrógeno, halógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquilcarboniloxi, haloalquilcarboniloxi,
- 40 R^{B2} representa hidrógeno, alquilo o haloalquilo, o los dos restos R^{B1} y R^{B2} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo saturado de tres a seis miembros, Y representa azufre u oxígeno,
- 45 R^{L1} representa hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcocixarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilsulfonilo o haloalquilsulfonilo o los dos restos R^{L1} y R^{L2} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo parcialmente insaturado de cinco o siete miembros que contiene dado el caso uno, dos o tres heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno o azufre, pudiendo el anillo estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de R^{A6} , R^{L2} representa hidrógeno, alquilo o haloalquilo, R^{B1} representa hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, formilo, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquilsulfinilalquilo, alquilsulfonilalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcocixarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilcarboniloxi, haloalquilcarboniloxi, alcocixarboniloxi, alquilaminocarboniloxi, dialquilaminocarboniloxi o R^{B1} representa un resto fenilo, un resto naftalenilo o un resto heteroarilo de 5 o 6 miembros, que puede contener respectivamente 0, 1, 2 o 3 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista: hidrógeno, halógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquilcarboniloxi, haloalquilcarboniloxi,
- 50 R^{B2} representa hidrógeno, alquilo o haloalquilo, o los dos restos R^{B1} y R^{B2} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo saturado de tres a seis miembros, Y representa azufre u oxígeno,
- 55 Y representa azufre u oxígeno,

- X representa carbono o nitrógeno,
 R^2 representa hidrógeno, alquilo, alquenilo, haloalquilo, alcoxi, halógeno, ciano o hidroxilo,
 R^{10} representa de manera igual o diferente e independientemente entre sí hidrógeno, alquilo, alquenilo, haloalquilo, alcoxi, halógeno, ciano o hidroxilo,
- 5 p representa 0, 1 o 2,
 G representa heteroarilo de 5 miembros, que está sustituido con Q y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido,
 Q representa heterociclilo de 5 miembros saturado o total o parcialmente insaturado, que está sustituido con L^2 - R^1 y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de R^5 ,
- 10 R^5 representa de manera igual o diferente e independientemente entre sí:
unido con carbono del heterociclilo de 5 miembros de Q:
 oxo, tioxo, hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxilo, nitro, amino, -CHO, -C(=O)OH, -C(=O)NH₂, -NR³R⁴, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, alquilocicloalquilo, cicloalquilalquilo, cicloalquilocicloalquilo, halocicloalquilalquilo, alquilocicloalquilalquilo, cicloalqueno, halocicloalqueno, alcoxialquilo, cicloalcoxialquilo, alcoxialcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquilsulfinalquilo, alquilsulfonalquilo, alquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, haloalquilaminoalquilo, cicloalquilaminoalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, cicloalcoxycarbonilo, cicloalquilalcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, cicloalquilaminocarbonilo, haloalcoxialquilo, hidroxialquilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalcoxi, halocicloalcoxi, cicloalquilalcoxi, alqueniloxi, haloalqueniloxi, alquiniloxi, haloalquiniloxi, alcoxialcoxi, alquilcarboniloxi, haloalquilcarboniloxi, cicloalquilcarboniloxi, alquilcarbonilalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alquilsulfino, haloalquilsulfino, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, alquilsulfonilamino, haloalquilsulfonilamino, alquilsulfonilo, -C(=O)H, alcoxycarbonilo o alquilcarbonilo,
- 15 R^3 representa hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo o haloalcoxycarbonilo,
 R^4 representa alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, haloalcoxycarbonilo o -L⁵R¹,
 L^5 representa -O-, -C(=O)-, S(=O)_m o CHR²⁰,
 m representa 0, 1 o 2,
 L^2 representa un enlace directo, -O-, -C(=O)-, -S(=O)_m-, -CHR²⁰- o -NR²¹-,
- 20 R^{20} representa hidrógeno, alquilo o haloalquilo,
 R^{21} representa hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo o haloalcoxycarbonilo,
 R^1 representa fenilo, bencilo, naftalenilo, un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido dado el caso benzocondensado, que está sustituido al menos una vez con un sustituyente Z⁴ y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de Z⁴ y dado el caso de Z¹ o
- 25 R^1 representa un anillo carbocíclico de 5 a 8 miembros no aromático (saturado o bien parcialmente saturado), representa un resto heterociclilo no aromático de 5, 6 o 7 miembros o representa un anillo bicíclico heterocíclico o carbocíclico de 8 a 11 miembros, que está sustituido respectivamente al menos una vez con un sustituyente Z⁴ y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de Z⁴ y dado el caso de oxo, tioxo o Z¹,
 Z¹ representa
unido con carbono de R¹:
 hidrógeno, halógeno, hidroxilo, amino, nitro, amino, ciano, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, hidroxialquilo, alcoxialquilo, alquilocicloalquilo, alcoxi, alquilocicloalquilalquilo, alquiltio, haloalquiltio, haloalcoxi, alquilcarboniloxi, alquilamino, dialquilamino, cicloalquilalquilo, cicloalquilocicloalquilo, alquilcarboniltio, alquilsulfino, haloalquilsulfino, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, alquilsulfonilamino, cicloalqueno, halocicloalqueno, cicloalcoxialquilo, halocicloalcoxi, cicloalquiltio, cicloalcoxi, cicloalquilalcoxi, cicloalquilamino, halocicloalquilalquilo, cicloalquilcarbonilo, cicloalquilsulfonilo o -L³Z³,
- 30 unido con nitrógeno de R¹:
 alquilo, alquilcarbonilo, alcoxycarbonilo o alcoxi,
 L^3 representa un enlace directo, -C(=O)-, azufre, oxígeno, -NR²¹-, -C(=S)-, -S(=O)_m-, -CHR²⁰-, -CHR²⁰-CHR²⁰-, -CR²⁰=CR²⁰-, -OCHR²⁰-, -CHR²⁰O-,
 Z^3 representa un resto fenilo, un resto naftalenilo o un resto heteroarilo de 5 o 6 miembros, que puede contener respectivamente 0, 1, 2 o 3 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
sustituyentes en el carbono: halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, amino, -SH, alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, haloalquenilo, haloalquinilo, cicloalquilo, halocicloalquilo, alcoxialquilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, alcoxi, haloalcoxi, cicloalcoxi, halocicloalcoxi, alqueniloxi, alquiniloxi, alcoxialcoxi, alquilamino, dialquilamino, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfino, haloalquilsulfino, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, trisililalquilo o fenilo,
- 35
40
45
50
55
60
65

- sustituyentes en el nitrógeno: hidrógeno, $-C(=O)H$, alquilo, alqueno, alquino, haloalquilo, haloalqueno, haloalquino, cicloalquilo, halocicloalquilo, alquicicloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxialquilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, fenilsulfonilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, alcoxycarbonilo, haloalcoxycarbonilo, cicloalcoxycarbonilo, $-C(=O)NR^{13}R^{14}$, fenilo o bencilo,
- 5 R^{13} y R^{14} representan de manera igual o diferente e independientemente entre sí hidrógeno, alquilo, alqueno, alquino, haloalquilo, cicloalquilo, bencilo o fenilo,
- Z^4 representa $-SH$, $-C(=O)H$, haloalcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquilsulfonilalquilo, alquilaminoalquilo, haloalquilaminoalquilo, cicloalquilaminoalquilo, dialquilaminoalquilo, alquilsulfonilalquilo, alquenoiloxi, alquinoiloxi,
- 10 haloalquenoiloxi, haloalquinoiloxi, alcoxialcoxi, haloalquilcarboniloxi, cicloalquilcarboniloxi, alquilsulfonilamino, haloalquilsulfonilamino, alcoxialcoxialquilo, alquilcarbonilalcoxi, cicloalquilaminocarbonilo, cicloalquilalcoxycarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalcoxycarbonilo, alquilcarbonilo C_4-C_6 , alcoxi C_5-C_6 , haloalcoxi C_5-C_6 , alquiltio C_5-C_6 , haloalquiltio C_5-C_6 , haloalquilsulfonilo C_5-C_6 , haloalquilsulfonilo C_5-C_6 , $-NHCN$, $-SO_2NHCN$, $-C(=O)OH$, $-C(=O)NH_2$, $-C(=S)NR^{13}R^{14}$, $-C(=O)NHCN$, cianoalquilo, alquenoilcarboniloxi, alcoxialquiltio, haloalquenoilcarboniloxi, alcoxycarbonilalquilo, alcoxialquino, alquinoiltio, halocicloalquilcarboniloxi, alquenoilamino,
- 15 alquinoilamino, haloalquilamino, cicloalquilalquilamino, alcoxiamino, haloalcoxiamino, alquilcarbonilamino, haloalquilcarbonilamino, alcoxycarbonilamino, alquilcarbonil(alquil)amino, haloalquilcarbonil(alquil)amino, alcoxycarbonil(alquil)amino, $-NR^{13}SO_2Z^3$, alquenoiltio, haloalcoxycarbonilo, alcoxialquilcarbonilo, $-SF_5$, haloalcoxycarbonilamino, $-NHC(=O)H$, di(haloalquil)aminoalquilo, halocicloalquenoiloxialquilo, alcoxi(alquil)aminocarbonilo, haloalquilsulfonilaminocarbonilo, alcoxycarbonilalcoxi, alquilaminotiocarbonilamino,
- 20 cicloalquilalquilaminoalquilo, $-C(=NOR^7)R^8$, alquiltiocarbonilo, cicloalquenoiloxialquilo, alcoxialcoxycarbonilo, dialquilaminotiocarbonilamino, alquilsulfonilaminocarbonilo, haloalcoxihaloalcoxi, halocicloalcoxialquilo, $-N=C(R^9)_2$, dialquilaminocarbonilamino, alcoxialqueno, alcoxialhalcoxi, alquiltiocarboniloxi, haloalcoxialcoxi, $-OSO_2Z^3$, haloalquilsulfoniloxi, alquilsulfoniloxi, alcoxihaloalquilo, di(haloalquil)amino, $-SO_2NR^{13}R^{14}$, $-O(C=S)NR^{13}R^{14}$, $-O(C=S)SR^9$, dialcoxialquilo, alquilaminocarbonilamino, haloalcoxihaloalquilo, alquilaminocarbonilalquilamino,
- 25 trialquilsililalquinoiloxi, trialquilsililoxi, trialquilsililalquino, ciano(alcoxi)alquilo, dialquiltioalquilo, $-O(C=O)H$, $-SCN$, alcoxisulfonilo, cicloalquilsulfonilo, halocicloalcoxycarbonilo, alquilcicloalquilcarbonilo, halocicloalquilcarbonilo, alquenoiloxycarbonilo, alquinoiloxycarbonilo, cianoalcoxycarbonilo, alquiltioalcoxycarbonilo, alquinoilcarboniloxi, haloalquinoilcarboniloxi, cianocarboniloxi, cianoalquilcarboniloxi, cicloalquilsulfoniloxi, cicloalquilalquilsulfoniloxi, halocicloalquilsulfoniloxi, alquenoilcarboniloxi, alquinoilcarboniloxi, alquinoilcarboniloxi, cianoalquilsulfoniloxi, haloalquilsulfoniloxi, haloalquinoilcarboniloxi, alquinoilcicloalquiloiloxi, cianoalquenoiloxi, cianoalquinoiloxi, alcoxycarboniloxi, alquenoiloxycarboniloxi, alquinoiloxycarboniloxi, alcoxialquilcarboniloxi, $-OC(=O)NR^{13}R^{14}$, $-OC(=O)NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$ o $-L^4Z^3$ o
- 30 Z^4 representa alquilo, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- 35 ciano, alcoxycarbonilo, $-C(=N-R^9)R^8$, $-C(=N-NR^{13}R^{14})R^8$, alquilcarbonilamino, haloalquilcarbonilamino, dialquilcarbonilamino, alquilcarboniloxi, $-C(=O)H$, benciloxi, benzoiloxi, $-C(=O)OH$, alquenoiloxi, alquinoiloxi, haloalquenoiloxi, haloalquinoiloxi, halocicloalcoxi, alcoxiamino, alquenoiltio, alquinoiltio, cicloalquiltio, haloalcoxiamino, haloalquiltio, alquenoilsulfonilo, alquinoilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alquenoilsulfonilo, alquinoilsulfonilo, cicloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, alcoxycarboniloxi, alquilcarboniloxi, cicloalquilcarboniloxi,
- 40 haloalquilcarboniloxi, haloalquenoilcarboniloxi, $-SCN$, alquilaminocarboniloxi, alquilcarbonil(alquil)amino, alcoxycarbonil(alquil)amino, alquilaminocarbonilamino, alquilsulfoniloxi, haloalcoxycarbonilamino, haloalquilcarbonil(alquil)amino, haloalquilsulfoniloxi, alquilsulfonilamino, haloalquilsulfonilamino, alquiltiocarboniloxi, cianoalcoxi, cicloalquilalcoxi, benciloxialcoxi, alcoxihaloalcoxi, alcoxialquiltio, alcoxialquilsulfonilo, alcoxialquilsulfonilo, alcoxialquilcarboniloxi, cicloalcoxialcoxi, haloalcoxialcoxi,
- 45 haloalcoxihaloalcoxi, alcoxycarbonilalcoxi, alquilcarbonilalcoxi, alquiltioalcoxi, dialquilaminocarbonilamino, alcoxialcoxialcoxi, trialquilsililoxi, trialquilsililalquinoiloxi, alquinoilcicloalquiloiloxi, cicloalquilalquinoiloxi, alcoxycarbonilalquinoiloxi, arilalquinoiloxi, alquilaminocarbonilalquinoiloxi, dialquilaminocarbonilalquinoiloxi, alquenoilcarboniloxi, alquinoilcarboniloxi, haloalquinoilcarboniloxi, cianoalquilcarboniloxi, cicloalquilsulfoniloxi, cicloalquilalquilsulfoniloxi, halocicloalquilsulfoniloxi, alquenoilsulfoniloxi, alquinoilsulfoniloxi, cianoalquilsulfoniloxi,
- 50 haloalquenoilsulfoniloxi, haloalquinoilsulfoniloxi, dialquilaminocarboniloxi, haloalquilaminocarboniloxi, N-alquil-N-haloalquilaminocarboniloxi, alquenoiloxycarbonilo, alquinoiloxycarbonilo, haloalquinoiloxycarbonilo, cianoalquiloiloxycarbonilo, alquenoiloxisulfonilo, alquinoiloxisulfonilo o
- Z^4 representa alqueno, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- 55 trialquilsililo, cicloalquilo, ciclopropilidenilo, alcoxi, trialquilsililoxi, alquilcarboniloxi o
- Z^4 representa alquino, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- 60 cicloalquilo, ciclopropilidenilo o
- Z^4 representa alcoxi, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- 65 alcoxycarbonilo, cicloalcoxi, alquilcarboniloxi, $-O(C=O)H$, alquiltio, hidroxialquilo, trialquilsililo, cicloalquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, benciloxi, alcoxialcoxi, alquilsulfonilo, ciano o
- Z^4 representa alquenoiloxi, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:

haloalqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, haloalquiniloxicarbonilo, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, ciclohaloalquilcarbonilo, alquenilcarbonilo, haloalquenilcarbonilo, alquinilcarbonilo, haloalquinilcarbonilo o

Z⁴ representa alquiniloxi, que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:

cicloalquilo, alcoxicarbonilo, -Z³, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo,

L⁴ representa -C(=O)O-, -C(=O)NR¹³-, -OC(=O)-, -NR¹³C(=O)-, -OCH₂C≡C- o -OCH₂CH=CH-,

R⁷ representa hidrógeno, alquilo, haloalquilo, bencilo o Z³,

R⁸ representa hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilalquilo, cicloalquilo, alquilcicloalquilo, haloalquilcicloalquilo, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, bencilo o fenilo,

R⁹ representa alquilo, alquenilo, alquinilo, haloalquilo, cicloalquilo, bencilo o fenilo,

R¹¹ representa alquenilo, alquinilo, alcoxialquilo, cianoalquilo, formilo, haloalquilo, fenilo, alquilcarbonilo, cicloalcoxicarbonilo, alcoxicarbonilo, alqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, haloalquilcarbonilo, halocicloalquilcarbonilo, cicloalcoxicarbonilo, cicloalquilcarbonilo, dialquilaminocarbonilo,

dialquilaminotiocarbonilo,

R¹² representa alquenilo, alquinilo, alcoxialquilo, cianoalquilo, formilo, hidrógeno, haloalquilo, fenilo, alquilcarbonilo, cicloalcoxicarbonilo, alcoxicarbonilo, alqueniloxicarbonilo, alquiniloxicarbonilo, haloalquilcarbonilo, halocicloalquilcarbonilo, cicloalcoxicarbonilo, cicloalquilcarbonilo, dialquilaminocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, así como sales, complejos metálicos y N-óxidos de los compuestos de la fórmula (I).

2. Compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizados porque** las definiciones de los restos tienen los siguientes significados:

R^{A1} representa hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, haloalquinilo C₂-C₄, alcoxialquilo C₂-C₄, alquiltioalquilo C₂-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₃, haloalquilcarbonilo C₁-C₃, alcoxicarbonilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alqueniloxi C₂-C₄, haloalqueniloxi C₂-C₄, alquiniloxi C₂-C₄, haloalquiniloxi C₂-C₄, alcoxialcoxi C₂-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₄, haloalquilamino C₁-C₄, halodialquilamino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ y de manera especialmente preferente representa hidrógeno, metilo, etilo, propan-2-ilo, *t*-butilo, difluorometilo, trifluorometilo, metoximetilo, etoximetilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo o representa ciclopropilo,

R^{A2} representa hidrógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o

R^{A2} representa un fenilo no sustituido o sustituido, un heterocicli de 5 o 6 miembros sustituido dado el caso benzocondensado, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de la siguiente lista: hidroxilo, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ o

R^{A1} y R^{A2} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo de tres a seis miembros saturado o parcialmente insaturado que contiene dado el caso uno, dos, tres o cuatro heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno o azufre, donde dado el caso un miembro de anillo de carbono se selecciona de C(=O) y C(=S), pudiendo el anillo contener uno, dos o tres sustituyentes o ninguno, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de R^{A6},

R^{A6} representa halógeno, ciano, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂ en los miembros de anillo de carbono y representa ciano, alquilo C₁-C₂ o alcoxi C₁-C₂ en los miembros de anillo de nitrógeno,

L¹ representa oxígeno, azufre, -N(R^{L1})-,

R^{L1} representa hidrógeno, alquilo C₁-C₂, haloalquilo C₁-C₂, -C(=O)CH₃, -C(=O)CF₃, C(=O)OCH₃ o los dos restos R^{L1} y R^{A2} forman junto con el átomo de carbono al que están unidos, un anillo parcialmente insaturado de cinco o siete miembros que contiene dado el caso uno, dos o tres heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno o azufre, pudiendo el anillo estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes se seleccionan independientemente entre sí de R^{A6},

R^{B1} representa hidrógeno, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₃, alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, haloalquilo C₁-C₃, haloalquenilo C₂-C₃, haloalquinilo C₂-C₃, alquilcarbonilo C₂-C₃, haloalquilcarbonilo C₂-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃, alquiltio C₁-C₃, haloalquiltio C₁-C₃, alquilcarboniloxi C₁-C₂, haloalquilcarboniloxi C₁-C₂ o

R^{B1} representa un resto fenilo, un resto naftalenilo o un resto heteroarilo de 5 o 6 miembros, que puede contener respectivamente 0, 1, 2 o 3 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:

hidrógeno, flúor, cloro, bromo, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃,

R^{B2} representa hidrógeno o alquilo C₁-C₂,

Y representa azufre u oxígeno,

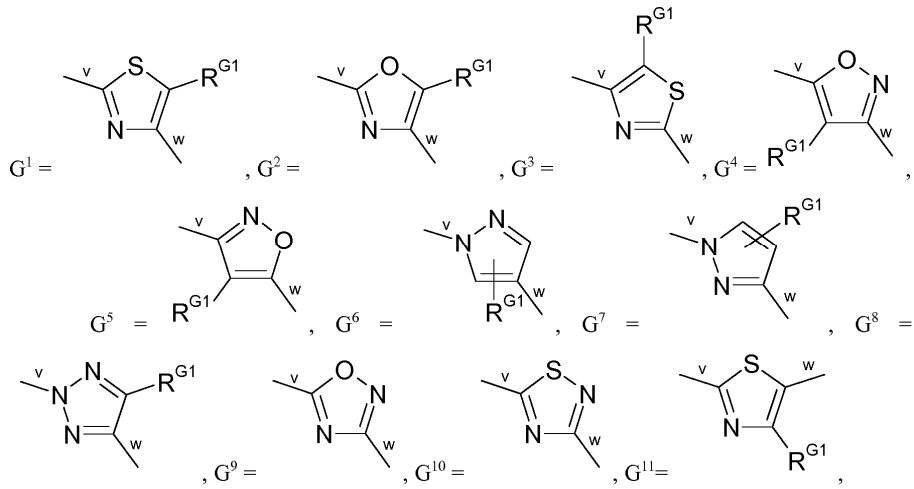
X representa carbono o nitrógeno,

R^Z representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, halógeno, ciano o hidroxilo,

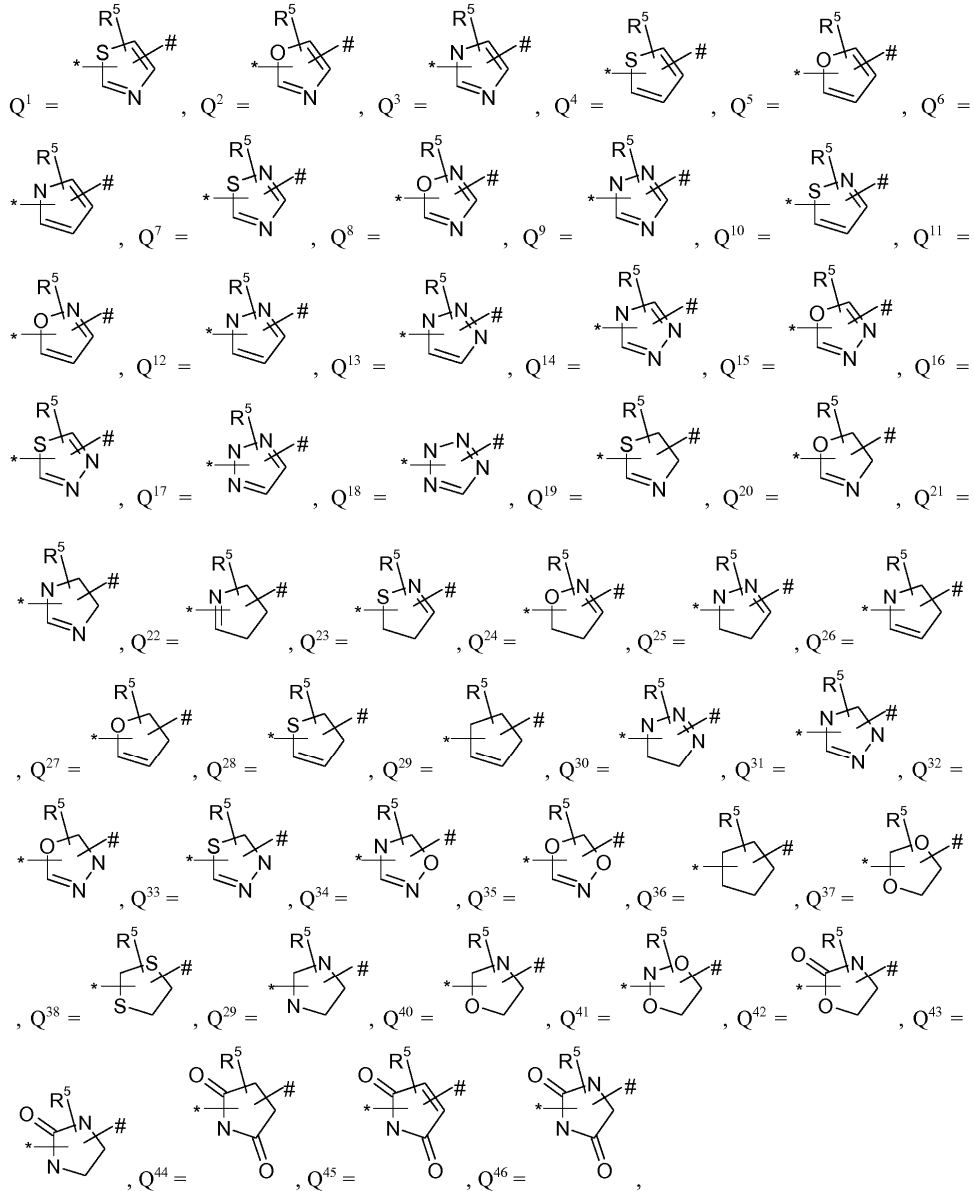
R¹⁰ representa de manera igual o diferente e independientemente entre sí hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₂, alcoxi C₁-C₂, halógeno, ciano o hidroxilo,

p representa 0 a 1,

G representa



R^{G1} representa hidrógeno, alquilo C_1-C_3 o halógeno,
 Q representa



R⁵ representa de manera igual o diferente e independientemente entre sí

unido con carbono del heterociclilo de 5 miembros de Q:

hidrógeno, halógeno, ciano, -NR³R⁴, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alquil-C₁-C₄-cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquil-C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, cicloalcoxi-C₃-C₈-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alcoxi-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquiltio-C₁-C₄-alquil C₁-C₄, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₈, halocicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquil-C₃-C₈-alcoxi C₁-C₄, alqueniloxi C₂-C₆, haloalqueniloxi C₂-C₆, alquiniloxi C₂-C₆, haloalquiniloxi C₂-C₆, alcoxilquilo C₁-C₄, alcoxilquilo C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₁-C₆, haloalquilcarboniloxi C₁-C₆, cicloalquilcarboniloxi C₃-C₈, alquilcarbonil-C₁-C₆-alcoxi-C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₈, tri(alquil C₁-C₄)sililo,

unido con nitrógeno del heterociclilo de 5 miembros de Q:

hidrógeno, -C(=O)H, alquilo C₁-C₃, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆ o bencilo,

R³ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alquilcarbonilo C₁-C₄, haloalquilcarbonilo C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄ o haloalcoxycarbonilo C₁-C₄,

R⁴ representa alquilo C₁-C₃ o -L⁵R¹,

L⁵ representa -C(=O)-o S(=O)₂,

m representa 0 o 2,

L² representa un enlace directo, -O-, -C(=O)-, -S(=O)₂-, -CHR²⁰- o -NR²¹-,

R²⁰ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄,

R²¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, haloalquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆ o haloalcoxycarbonilo C₁-C₆,

R1 representa cicloalquenilo C₅-C₆ o cicloalquilo C₃-C₈, donde el cicloalquenilo C₅-C₆ o el cicloalquilo C₃-C₈ respectivamente están sustituidos al menos una vez con un sustituyente Z⁴ y por lo demás pueden estar sustituidos o no sustituidos, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de Z⁴ y dado el caso de Z¹⁻¹ o

R1 representa fenilo, que está sustituido al menos una vez con un sustituyente Z⁴ y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de Z⁴ y dado el caso de Z¹⁻² o

R1 representa naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 2,3-dihidro-1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, indan-1-ilo, indan-2-ilo, indan-3-ilo, indan-4-ilo o indan-5-ilo,

donde estos respectivamente están sustituidos al menos una vez con un sustituyente Z⁴ y por lo demás pueden estar sustituidos o no sustituidos, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de Z⁴ y dado el caso de Z¹⁻³ o

R1 representa heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido benzocondensado, que está sustituido con al menos un sustituyente Z⁴ y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido, donde los sustituyentes en el carbono independientemente entre sí se seleccionan de Z¹⁻⁵, y los sustituyentes en el nitrógeno independientemente entre sí se seleccionan de Z² o

R1 representa un heterociclilo C₅-C₁₅ que en el carbono está sustituido al menos una vez con un sustituyente Z⁴ y por lo demás puede estar sustituido o no sustituido donde los sustituyentes en el carbono independientemente entre sí se seleccionan de Z¹⁻⁶ y los sustituyentes en el nitrógeno independientemente entre sí se seleccionan de Z²,

Z¹⁻¹ representan de manera igual o diferente independientemente entre sí hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, hidroxil, alcoxi-C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquilcarboniloxi C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆ o haloalquiltio C₁-C₆,

Z¹⁻² representa hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxil, amino, nitro, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, halocicloalquenilo C₃-C₈, alcoxilquilo C₁-C₆, alcoxilquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₈, halocicloalcoxi C₃-C₈, alquilcarboniloxi C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₈, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, cicloalquilsulfonilo C₃-C₈, tri(alquil C₁-C₄)sililo o -L³Z³,

Z¹⁻³ y Z¹⁻⁵ representan de manera igual o diferente independientemente entre sí hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxi-C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₁-C₆, alquil-C₁-C₆-carboniltio, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄ o haloalquilsulfonilo C₁-C₄,

Z¹⁻⁴ representa hidrógeno, halógeno, ciano, hidroxil, amino, nitro, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, halocicloalquenilo C₃-C₈, alcoxilquilo C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, cicloalquilcarbonilo C₃-C₈, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alcoxilquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₈, halocicloalcoxi C₃-C₈, alquilcarboniloxi C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆ o cicloalquilsulfonilo C₃-C₈,

Z¹⁻⁶ representan de manera igual o diferente independientemente entre sí hidrógeno, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, alcoxilquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio-C₁-C₆, alquilcarbonilo C₁-C₆, alcoxycarbonilo C₁-C₆, alquilcarboniloxi C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆ o fenilo,

- Z^2 representa de manera igual o diferente e independientemente entre sí hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , alcoxi- C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , fenilo, bencilo, haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alcoxycarbonilo C_1-C_6 , haloalcoxycarbonilo C_1-C_6 , fenilsulfonilo, alquilsulfonilo C_1-C_4 , $-C(=O)H$, haloalquilcarbonilo C_1-C_3 o alquilcarbonilo C_1-C_3 ,
- 5 L^3 representa un enlace directo, $-CH_2-$, azufre, oxígeno o $-(S=O)_2-$
- Z^3 representa un resto fenilo, naftalenilo o un resto heteroarilo de 5 o 6 miembros, que puede contener hasta dos sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, amino, $-SH$, alquilo C_1-C_4 , alqueno C_2-C_4 , alquino C_2-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , haloalqueno C_2-C_4 , haloalquino C_2-C_4 , alcoxialquilo C_2-C_4 , alquilcarbonilo C_1-C_6 , haloalquilcarbonilo C_1-C_6 , alcoxycarbonilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquenoiloxi C_2-C_6 , alquinoiloxi C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 o alquilamino C_1-C_4 , di(alquil- C_1-C_4)amino,
- 10 sustituyentes en el nitrógeno: hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , alcoxi- C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , fenilo, bencilo, haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alcoxycarbonilo C_1-C_6 , haloalcoxycarbonilo C_1-C_6 , fenilsulfonilo, alquilsulfonilo C_1-C_4 , $-C(=O)H$ o alquilcarbonilo C_1-C_3 ,
- 15 R^{13} y R^{14} representan de manera igual o diferente independientemente entre sí hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , bencilo o fenilo,
- Z^4 representa $-SH$, $-C(=O)H$, alcoxi- C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alquiltioalquilo C_1-C_6 , alquilsulfonil- C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alquilsulfonil- C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alquilcarbonilo C_4-C_6 , haloalquilcarbonilo C_1-C_6 , cicloalcoxycarbonilo C_3-C_6 , cicloalquil- C_3-C_6 -alcoxycarbonilo C_1-C_6 , cicloalquilaminocarbonilo C_3-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_5-C_6 , haloalcoxi C_5-C_6 , alquenoiloxi C_2-C_6 , haloalquenoiloxi C_2-C_6 , alquinoiloxi C_2-C_6 , haloalquinoiloxi C_2-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 , haloalquilcarboniloxi C_1-C_6 , cicloalquilcarboniloxi C_3-C_6 , alquilcarbonil- C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 , alquiltio C_5-C_6 , haloalquiltio C_5-C_6 , haloalquilsulfonilo C_5-C_6 , alquilsulfonilamino C_1-C_6 , haloalquilsulfonilamino C_1-C_6 , $-C(=O)OH$, $-C(=O)NH_2$, $-C(=S)NR^{13}R^{14}$, cianoalquilo C_1-C_6 , alquenoilcarboniloxi C_2-C_6 , alquinoiloxi C_2-C_6 , halocicloalquilcarboniloxi C_3-C_8 , alquenoilamino C_2-C_6 , alquinoilamino C_2-C_6 , haloalquilamino C_1-C_6 , cicloalquil- C_3-C_8 -alquilamino C_1-C_6 , alcoxiamino C_1-C_6 , haloalcoxiamino C_1-C_6 , alquilcarbonilamino C_1-C_6 , haloalquilcarbonilamino C_1-C_6 , alcoxycarbonilamino C_1-C_6 , alquilcarbonil- C_1-C_6 (alquil- C_1-C_6)amino, haloalquilcarbonil- C_1-C_6 (alquil- C_1-C_6)amino, alcoxycarbonil- C_1-C_6 (alquil- C_1-C_6)amino, $-NR^{13}SO_2Z^3$, alquenoiloxi C_2-C_6 , haloalcoxycarbonilo C_1-C_6 , alcoxi- C_1-C_6 -alcoxi- C_1-C_6 -alquilcarbonilo C_1-C_4 , $-SF_5$, haloalcoxycarbonilamino C_1-C_6 , $-NHC(=O)H$, alcoxi- C_1-C_6 (alquil- C_1-C_4)aminocarbonilo, alcoxycarbonil- C_1-C_6 -alcoxi C_1-C_6 , $-C(=NOR^7)R^8$, $-N=C(R^9)_2$, di(alquil- C_1-C_6)aminocarbonilamino, di(alquil- C_1-C_6)aminosulfonilo, di(haloalquil- C_1-C_6)amino, alquilaminosulfonilo C_1-C_6 , alquilaminocarbonilamino C_1-C_6 , tri(alquil C_1-C_4)sililoxi, haloalquilsulfoniloxi C_1-C_6 , alquilsulfoniloxi C_1-C_6 , tri(alquil C_1-C_4)silil-alquinoiloxi C_2-C_4 , tri(alquil C_1-C_4)silil-alquenoiloxi C_2-C_4 , alquenoilcarboniloxi C_2-C_4 , cianoalquilcarboniloxi C_1-C_3 , cicloalquilsulfoniloxi C_3-C_8 , halocicloalquilsulfoniloxi C_3-C_8 , alquenoilsulfoniloxi C_2-C_4 , alquilaminocarboniloxi C_1-C_3 , alquinoil- C_2-C_4 -cicloalquilo C_3-C_8 , cianoalquenoiloxi C_2-C_4 , $-OC(=O)NR^{13}R^{14}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-SO_2NR^{11}R^{12}$, $-O(C=O)H$, $-SCN$, alcoxilsulfonilo C_1-C_3 , cicloalquilsulfonilo C_3-C_8 , ciano(alcoxi C_1-C_3)-alquilo C_1-C_3 o $-L^4Z^3$ o
- 20 Z^4 representa alquilo C_1-C_3 , que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- ciano, $-C(=O)H$, alquenoiloxi C_2-C_4 , alquinoiloxi C_2-C_4 , alquenoiltio C_2-C_4 , alquinoiltio C_2-C_4 , haloalquiltio C_1-C_3 , alquenoilsulfonilo C_2-C_4 , alquinoilsulfonilo C_2-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_3 , alquenoilsulfonilo C_2-C_4 , alquinoilsulfonilo C_2-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_3 , alquilcarboniloxi C_1-C_3 , haloalquilcarboniloxi C_1-C_3 , alquilaminocarboniloxi C_1-C_3 , alquilcarbonilamino C_1-C_3 , alquilaminocarbonilamino C_1-C_3 , haloalquilcarbonilamino C_1-C_3 , haloalquilaminocarbonilamino C_1-C_3 , alquiltiocarboniloxi C_1-C_3 , cianoalcoxi C_1-C_3 , cicloalquil- C_3-C_8 -alcoxi C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 -alquiltio C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 -alquilsulfonilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 -alquilsulfonilo C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 -alcoxi C_1-C_3 , alquilcarbonil- C_1-C_3 -alcoxi C_1-C_3 , alquiltio C_2-C_4 -alcoxi C_1-C_3 , di(alquil C_1-C_3)aminocarbonilamino, tri(alquil C_1-C_4)sililoxi o
- 25 Z^4 representa alcoxi C_1-C_3 , que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- ciano, alquilcarboniloxi C_1-C_3 , alcoxycarbonilo C_1-C_3 , cicloalcoxi C_3-C_8 , alquilcarboniloxi C_1-C_3 , $-O(C=O)H$, alquiltio C_1-C_3 , hidroxilo-alquilo C_1-C_3 , cicloalquilsulfonilo C_3-C_8 , haloalquilsulfonilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_3 -alcoxi C_1-C_3 , alquilsulfonilo C_1-C_3 o
- 30 Z^4 representa alquenoiloxi C_2-C_4 , que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- cicloalquilo C_3-C_8 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_3 , alcoxycarbonilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_1-C_3 o
- 35 Z^4 representa alquinoiloxi C_2-C_4 , que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- cicloalquilo C_3-C_8 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_3 , alcoxycarbonilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_1-C_3 o
- 40 Z^4 representa alquinoiloxi C_2-C_4 , que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- cicloalquilo C_3-C_8 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_3 , alcoxycarbonilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_1-C_3 o
- 45 Z^4 representa alquinoiloxi C_2-C_4 , que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- cicloalquilo C_3-C_8 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_3 , alcoxycarbonilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_1-C_3 o
- 50 Z^4 representa alquinoiloxi C_2-C_4 , que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- cicloalquilo C_3-C_8 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_3 , alcoxycarbonilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_1-C_3 o
- 55 Z^4 representa alquinoiloxi C_2-C_4 , que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- cicloalquilo C_3-C_8 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_3 , alcoxycarbonilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_1-C_3 o
- 60 Z^4 representa alquinoiloxi C_2-C_4 , que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- cicloalquilo C_3-C_8 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_3 , alcoxycarbonilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_1-C_3 o
- 65 Z^4 representa alquinoiloxi C_2-C_4 , que contiene 1 o 2 sustituyentes, donde los sustituyentes independientemente entre sí se seleccionan de la siguiente lista:
- cicloalquilo C_3-C_8 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_3 , alcoxycarbonilo C_1-C_3 , alquilcarbonilo C_1-C_3 o
- L^4 representa $-C(=O)O-$, $-C(=O)NH-$, $-OC(=O)-$, $-NHC(=O)-$ o $-OCH_2C\equiv C-$,
- R^7 representa hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , bencilo o Z^3
- R^8 representa hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquil- C_3-C_8 -alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_8 , alquil- C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_8 , haloalquil- C_1-C_4 -cicloalquilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , haloalcoxi- C_1-C_4 -alquilo C_1-C_4 , bencilo o fenilo,
- R^9 representa alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , bencilo o fenilo,
- R^{11} representa alqueno C_3-C_4 , alquino C_3-C_4 , cianoalquilo C_1-C_3 , formilo, haloalquilo C_1-C_3 , bencilo, fenilo, alquilcarbonilo C_1-C_3 , cicloalcoxycarbonilo C_3-C_8 , alcoxycarbonilo C_1-C_3 , alquenoiloxycarbonilo C_3-C_4 ,

alquinoxiloxycarbonilo C₃-C₄, haloalquilarbonilo C₁-C₃, halocicloalquilarbonilo C₃-C₈, cicloalcoxycarbonilo C₃-C₈, cicloalquilarbonilo C₃-C₈, di(alquilarbonilo C₁-C₃)aminocarbonilo, R¹² representa hidrógeno, alquilarbonilo C₃-C₄, alquilarbonilo C₃-C₄, cianoalquilarbonilo C₁-C₃, formilo, haloalquilarbonilo C₁-C₃, fenilo, alquilarbonilo C₁-C₃, cicloalcoxycarbonilo C₃-C₈, alcoxycarbonilo C₁-C₃, alquinoxiloxycarbonilo C₃-C₄, alquinoxiloxycarbonilo C₃-C₄, haloalquilarbonilo C₁-C₃, halocicloalquilarbonilo C₃-C₈, cicloalcoxycarbonilo C₃-C₈, cicloalquilarbonilo C₃-C₈, di(alquilarbonilo C₁-C₃)aminocarbonilo,

5

así como sales, complejos metálicos y N-óxidos de los compuestos de la fórmula (I).

3. Procedimiento para combatir microorganismos indeseados, **caracterizado porque** se aplican compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 sobre los hongos nocivos fitopatógenos y/o su biotopo.

10

4. Procedimiento de acuerdo con la reivindicación 3, **caracterizado porque** los microorganismos son hongos o bacterias.

5. Agentes para combatir microorganismos indeseados, **caracterizados por** un contenido de al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2.

15

6. Uso no terapéutico de derivados de bis(difluorometil)pirazol de la fórmula (I), de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 para combatir microorganismos indeseados.

7. Uso no terapéutico de acuerdo con la reivindicación 6, **caracterizado porque** los microorganismos son Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae y Streptomycetaceae.

20

8. Procedimiento para combatir hongos fitopatógenos mediante el uso de los compuestos de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 o de agentes de acuerdo con la reivindicación 5 que se aplican sobre la semilla, las plantas o partes de plantas, los frutos o el suelo en el que crecen las plantas.

9. Semilla que se trató con al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2.

10. Uso de compuestos de la fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 para el tratamiento de plantas transgénicas.