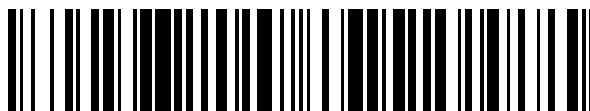


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 588 330**

51 Int. Cl.:

C07D 231/12 (2006.01)

C07D 401/04 (2006.01)

C07D 401/06 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

C07D 401/14 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **06.08.2010 PCT/EP2010/061464**

87 Fecha y número de publicación internacional: **17.02.2011 WO11018415**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.08.2010 E 10739639 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **25.05.2016 EP 2464630**

54 Título: **Heterociclos microbiocidas**

30 Prioridad:

12.08.2009 EP 09167741

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

02.11.2016

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**SULZER-MOSSE, SARAH;
LAMBERTH, CLEMENS;
QUARANTA, LAURA y
RESPONDEK, MATHIAS STEPHAN**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 588 330 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).

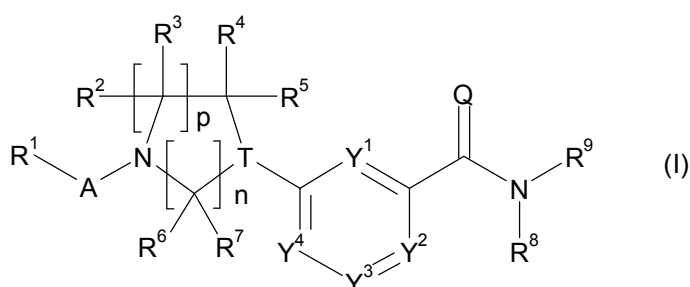
DESCRIPCIÓN

Heterociclos microbiocidas

La presente invención se refiere a heterociclos, p. ej., como principios activos, que tienen actividad microbiocida, en particular, actividad fungicida. La invención se refiere además a la preparación de estos heterociclos, a derivados heterocíclicos utilizados como intermedios en la preparación de estos heterociclos, a la preparación de estos intermedios, a composiciones agroquímicas que comprenden al menos uno de los heterociclos, a la preparación de estas composiciones y al uso de los heterociclos o las composiciones en agricultura u horticultura para controlar o prevenir la infestación de plantas, cultivos alimentarios recolectados, semillas o materiales inertes por parte de microorganismos fitopatógenos, preferentemente hongos.

- Ciertos heterociclos para su uso como fungicidas se describen en los documentos WO 2007/014290, WO 2008/013622, WO 2008/013925, WO 2008/091580, WO 2008/091594 y WO 2009/055514.

La presente invención proporciona compuestos de fórmula I:



donde

- A es $x\text{-C(R}^{10}\text{R}^{11})\text{-C(=O)-}$, $x\text{-C(R}^{12}\text{R}^{13})\text{-C(=S)-}$, $x\text{-O-C(=O)-}$, $x\text{-O-C(=S)-}$, $x\text{-N(R}^{14})\text{-C(=O)-}$, $x\text{-N(R}^{15})\text{-C(=S)-}$, $x\text{-C(R}^{16}\text{R}^{17})\text{-SO}_2\text{-}$ o $x\text{-N=C(R}^{30})\text{-}$, en cada caso x indica el enlace que está conectado a R¹;

T es CR¹⁸ o N;

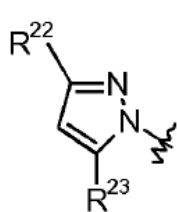
Y¹, Y², Y³ e Y⁴ son independientemente CR¹⁹ o N;

Q es O o S;

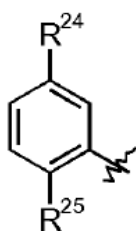
- n es 1 o 2;

p es 1 o 2, siempre que cuando n sea 2, p sea 1;

R¹ se selecciona del grupo (c) o (d):



(c)



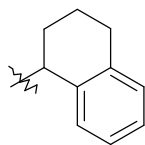
(d)

donde R²², R²³, R²⁴ y R²⁵ se seleccionan independientemente entre hidrógeno, halógeno, metilo y halometilo;

- R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹ y R³⁰ son cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

R⁸, R¹⁴ y R¹⁵ son cada uno independientemente hidrógeno o alquilo C₁-C₄; y

R⁹ es fenilo, bencilo o un grupo (a):



(a)

donde el fenilo, bencilo y grupo (a) están sustituidos cada uno opcionalmente con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, halógeno, ciano, hidroxi y amino;

- 5 o una de sus sales o *N*-óxidos.

Cuando se indique que los sustituyentes están opcionalmente sustituidos, esto quiere decir que pueden tener uno o más sustituyentes idénticos o diferentes, o que pueden no tenerlos. Normalmente, no habrá más de tres de estos sustituyentes opcionales presentes a la vez.

El término "halógeno" se refiere a flúor, cloro, bromo o yodo.

- 10 El término "amino" se refiere a -NH₂.

Los sustituyentes alquilo, alqueno o alquino pueden ser de cadena lineal o ramificada. El término "alquilo" solo o formando parte de otro sustituyente es, dependiendo del número de átomos de carbono mencionado, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-butilo, *n*-pentilo, *n*-hexilo y sus isómeros, por ejemplo, isopropilo, isobutilo, *sec*-butilo, *tert*-butilo, isoamilo o pivaloilo.

- 15 Un grupo haloalquilo puede contener uno o más átomos halógenos idénticos o diferentes y, por ejemplo, puede referirse a CH₂Cl, CHCl₂, CCl₃, CH₂F, CHF₂, CF₃, CF₃CH₂, CH₃CF₂, CF₃CF₂ o CCl₃CCl₂.

La presencia de uno o más átomos de carbono asimétricos posibles en un compuesto de fórmula I quiere decir que los compuestos pueden existir en formas ópticamente isoméricas, es decir, formas enantioméricas o diastereoméricas. Como resultado de la presencia de un posible doble enlace C=C alifático, puede existir isomería, es decir, isomería *cis-trans* o (*E*)-(*Z*). También pueden existir atropoisómeros como resultado de la rotación restringida de un enlace sencillo. Se pretende que la fórmula I incluya todas estas formas isoméricas posibles y sus mezclas. La presente invención incluye todas estas formas isoméricas posibles y sus mezclas para un compuesto de fórmula I. Asimismo, se pretende que la fórmula I incluya todos los tautómeros posibles. La presente invención incluye todas las formas tautoméricas posibles para un compuesto de fórmula I.

- 25 En cada caso, los compuestos de fórmula I de acuerdo con la invención están en forma libre, en forma oxidada como un *N*-óxido o en forma salina, p. ej., una forma salina útil desde un punto de vista agronómico.

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

- 30 Las sales adecuadas de los compuestos de fórmula I incluyen aquellas resultantes de la adición de ácido tales como las obtenidas con un ácido mineral inorgánico, p. ej., ácido clorhídrico, bromhídrico, sulfúrico, nítrico o fosfórico, o un ácido carboxílico orgánico, p. ej., ácido oxálico, tartárico, láctico, butírico, toluico, hexanoico o ftálico, o un ácido sulfónico, p. ej., ácido metano-, benceno- o toluenosulfónico.

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

- 35 A es x-CR¹⁰R¹¹-C(=O)-, x-O-C(=O)- o x-CR¹⁶R¹⁷-SO₂-, en cada caso x indica el enlace que está conectado a R¹;

T es CR¹⁸;

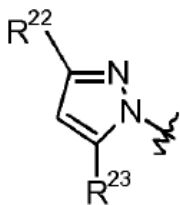
Y¹, Y², Y³ e Y⁴ son independientemente CR¹⁹ o N, siempre que al menos 2 de los grupos Y¹, Y², Y³ e Y⁴ sean CR¹⁹ y siempre que no haya enlaces N-N en el anillo que contiene Y¹, Y², Y³ e Y⁴;

Q es O o S;

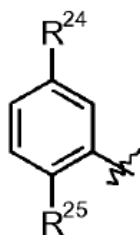
- 40 n es 1 o 2;

p es 1;

R¹ se selecciona del grupo (c) o (d):



(c)



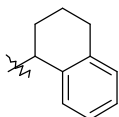
(d)

donde R^{22} , R^{23} , R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente entre hidrógeno, halógeno, metilo y halometilo;

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 , son cada uno hidrógeno;

R^8 es hidrógeno o metilo; y

- 5 R^9 es fenilo, bencilo o un grupo (a)



(a)

donde el fenilo, bencilo y grupo (a) están sustituidos cada uno opcionalmente con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , hidroxi y halógeno.

- 10 Preferentemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto en el que:

A es $x-CH_2-C(=O)-$, $x-O-C(=O)-$ o $x-CH_2-SO_2-$, en cada caso x indica el enlace que está conectado a R^1 ;

T es CH;

Y^1 , Y^2 , Y^3 e Y^4 son independientemente CH o N, siempre que al menos 2 de los grupos Y^1 , Y^2 , Y^3 e Y^4 sean CH y siempre que no haya enlaces N-N en el anillo que contiene Y^1 , Y^2 , Y^3 e Y^4 ;

- 15 Q es O;

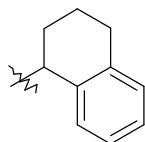
n es 1 o 2;

p es 1;

R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son cada uno hidrógeno;

R^8 es hidrógeno o metilo; y

- 20 R^9 es fenilo, bencilo o un grupo (a)



(a)

donde el fenilo, bencilo y grupo (a) están sustituidos cada uno opcionalmente con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , hidroxi y halógeno.

- 25 Preferentemente, el compuesto de fórmula I es un compuesto en el que:

A es $x-CH_2-C(=O)-$ donde x indica el enlace que está conectado a R^1 ;

T es CH;

Y^1, Y^2, Y^3 e Y^4 son independientemente CH;

Q es O;

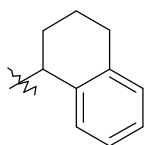
n es 2;

p es 1;

5 R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 y R^7 son cada uno hidrógeno;

R^8 es hidrógeno o metilo; y

R^9 es fenilo, bencilo o un grupo (a)



(a)

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

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

A es $x-CH_2-C(=O)-$, $x-CH_2C(=S)-$, $x-OC(=O)-$, $x-CH_2SO_2-$, siendo x en cada caso el enlace con R^1 ;

T es CH o N;

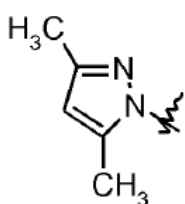
15 Y^1, Y^2, Y^3 e Y^4 son independientemente CH o N, siempre que al menos 2 de los grupos Y^1, Y^2, Y^3 e Y^4 sean CH y siempre que no haya enlaces N-N en el anillo que contiene Y^1, Y^2, Y^3 ;

Q es O o S;

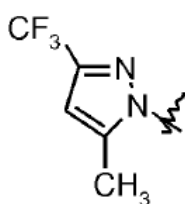
n es 1 o 2;

p es 1 o 2, siempre que cuando n sea 2, p sea 1;

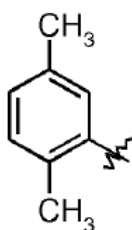
20 R^1 es un grupo (e), (f), (g) o (h):



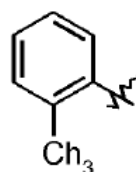
(e)



(f)



(g)

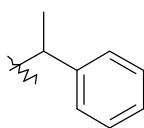


(h)

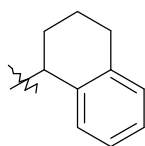
R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 y R^7 son cada uno hidrógeno;

R^8 es hidrógeno o metilo;

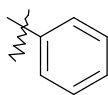
R^9 es un grupo (i), (j) o (k):



(i)



(j)



(k)

La siguiente lista proporciona definiciones, incluidas las definiciones preferidas, para los sustituyentes A, T, Y¹, Y², Y³, Y⁴, Q, n, p, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸, R¹⁹, R²², R²³, R²⁴, R²⁵ y R³⁰ haciendo referencia a los compuestos de fórmula I. Para cualquiera de estos sustituyentes, cualquiera de las definiciones que se presentan a continuación se puede combinar con cualquier definición de cualquiera de los demás sustituyentes que se presentan a continuación. La invención incluye compuestos de fórmula que contenga todas las combinaciones posibles de definiciones de sustituyentes que se presentan a continuación o en otra parte de este documento. En general, en este documento cualquier definición de un sustituyente se puede combinar con cualquier otra definición de un sustituyente.

A es x-C(R¹⁰R¹¹)-C(=O)-, x-C(R¹²R¹³)-C(=S)-, x-O-C(=O)-, x-O-C(=S)-, x-N(R¹⁴)-C(=O)-, x-N(R¹⁵)-C(=S)- o x-C(R¹⁶R¹⁷)-SO₂-, en cada caso x indica el enlace que está conectado a R¹. Preferentemente, A es x-C(R¹⁰R¹¹)-C(=O)-, x-C(R¹²R¹³)-C(=S)-, x-O-C(=O)-, x-O-C(=S)- o x-C(R¹⁶R¹⁷)-SO₂-, en cada caso x indica el enlace que está conectado a R¹. Más preferentemente, A es x-CR¹⁰R¹¹-C(=O)-, x-O-C(=O)- o x-CR¹⁶R¹⁷-SO₂-, en cada caso x indica el enlace que está conectado a R¹. Aún más preferentemente, A es x-CH₂-C(=O)-, x-CH₂-C(=S)-, x-OC(=O)-, x-CH₂SO₂-, en cada caso x indica el enlace que está conectado a R¹. Incluso más preferentemente, A es x-CH₂-C(=O)-, x-O-C(=O)- o x-CH₂-SO₂-, en cada caso x indica el enlace que está conectado a R¹. De la forma más preferida, A es x-CH₂-C(=O)-, donde x indica el enlace que está conectado a R¹.

T es CR¹⁸ o N. Preferentemente, T es CH o N. De la forma más preferida, T es CH.

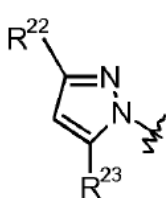
n es 1 o 2. Preferentemente, n es 2.

p es 1 o 2, siempre que cuando n sea 2, p sea 1. Preferentemente, p es 1.

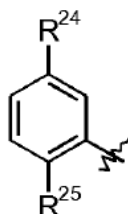
Y¹, Y², Y³ e Y⁴ son independientemente CR¹⁹ o N, p. ej., Y¹, Y², Y³ e Y⁴ pueden ser independientemente CH o N. Más preferentemente, Y¹, Y², Y³ e Y⁴ son independientemente CR¹⁹ o N, siempre que al menos 2 de los grupos Y¹, Y², Y³ e Y⁴ sean CR¹⁹. Aún más preferentemente, Y¹, Y², Y³ e Y⁴ son independientemente CR¹⁹ o N, siempre que al menos 2 de los grupos Y¹, Y², Y³ e Y⁴ sean CR¹⁹ y siempre que no haya enlaces N-N en el anillo que contiene Y¹, Y², Y³ e Y⁴. Incluso más preferentemente, Y¹, Y², Y³ e Y⁴ son independientemente CH o N, siempre que al menos 2 de los grupos Y¹, Y², Y³ e Y⁴ sean CH y siempre que no haya enlaces N-N en el anillo que contiene Y¹, Y², Y³ e Y⁴.

Q es O o S. Preferentemente, Q es O.

R¹ se selecciona del grupo (c) o (d):



(c)



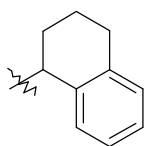
(d)

donde R²², R²³, R²⁴ y R²⁵ se seleccionan independientemente entre hidrógeno, halógeno, metilo y halometilo;

R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ y R¹⁹ son cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄. Más preferentemente, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ y R¹⁹ son cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄. Aún más preferentemente, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹⁰, R¹¹, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ y R¹⁹ son cada uno independientemente hidrógeno, fluoro o metilo. Incluso más preferentemente, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹⁰, R¹¹, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ y R¹⁹ son cada uno hidrógeno.

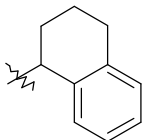
R⁸, R¹⁴ y R¹⁵ son cada uno independientemente hidrógeno o alquilo C₁-C₄. Preferentemente, R⁸, R¹⁴ y R¹⁵ son cada uno independientemente hidrógeno o metilo. Preferentemente, R⁸, R¹⁴ y R¹⁵ son cada uno hidrógeno.

R⁹ es fenilo, bencilo o un grupo (a):



(a)

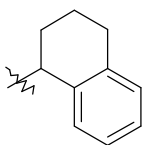
donde el fenilo, bencilo y grupo (a) están sustituidos cada uno opcionalmente con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, halógeno, ciano, hidroxi y amino. Preferentemente, R⁹ es fenilo, bencilo o un grupo (a):



5 (a)

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

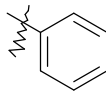
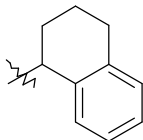
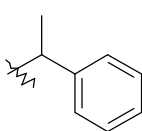
Más preferentemente, R⁹ es fenilo, bencilo o un grupo (a):



10 (a)

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

En un grupo de compuestos, R⁹ es (i), (j) o (k):



15 (i) (j) (k)

Preferentemente, R²² es hidrógeno o CF₃. Preferentemente, R²³, R²⁴ y R²⁵ son independientemente hidrógeno o metilo.

R³⁰ es hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄. Preferentemente, R³⁰ es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄. Preferentemente, R³⁰ es hidrógeno, fluoro o metilo. Más preferentemente, R³⁰ es hidrógeno.

20 En un grupo de compuestos, al menos dos de los grupos Y¹, Y², Y³ e Y⁴ son CH y los demás grupos Y¹, Y², Y³ y Y⁴ son CH o N.

En un grupo de compuestos, al menos tres de los grupos Y¹, Y², Y³ e Y⁴ son CH y el otro grupo Y¹, Y², Y³ o Y⁴ es CH o N.

En un grupo de compuestos, Y¹ e Y⁴ son CH, uno de los grupos Y² e Y³ es CH y el otro grupo Y² o Y³ es CH o N.

25 En un grupo de compuestos, Y¹, Y² e Y⁴ son CH, e Y³ es N.

En un grupo de compuestos, Y¹, Y³ e Y⁴ son CH, e Y² es N.

En un grupo de compuestos, Y¹, Y², Y³ e Y⁴ son CH.

En un grupo de compuestos, Y² es N.

En un grupo de compuestos, Y³ es N.

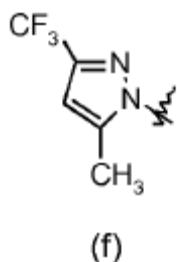
30 En un grupo de compuestos, p es 1 y n es 2.

En un grupo de compuestos, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ son H.

En un grupo de compuestos, Q es O.

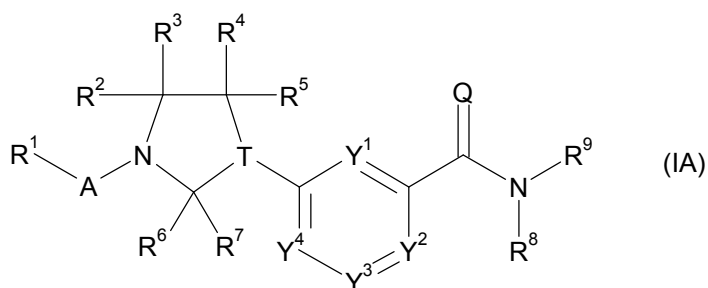
En un grupo de compuestos, A es $x\text{-CH}_2\text{-C(=O)-}$, donde x representa el enlace que está conectado a R^1 .

En un grupo de compuestos, R^1 es un grupo (f)



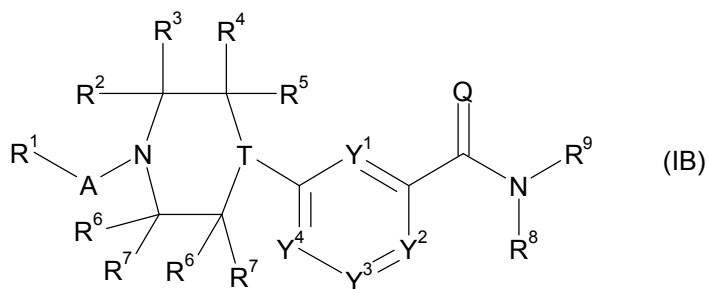
En un grupo de compuestos, R^8 es hidrógeno.

- 5 Para no dar lugar a dudas, cuando n es 1 y p es 1, los compuestos de fórmula I tienen la fórmula de acuerdo con la fórmula IA:



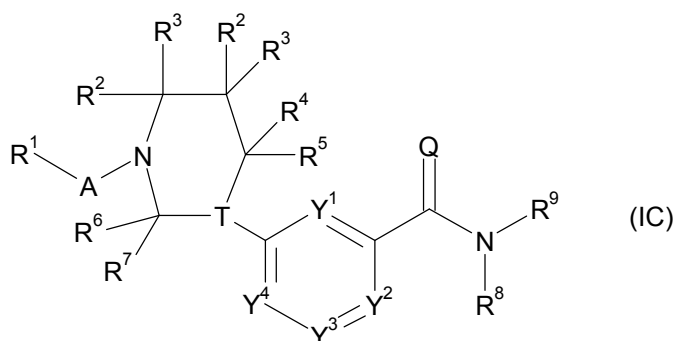
donde A, T, Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , Q, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I.

- 10 Cuando n es 2 y p es 1, los compuestos de fórmula I tienen la fórmula de acuerdo con la fórmula IB:



donde A, T, G, Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , Q, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I.

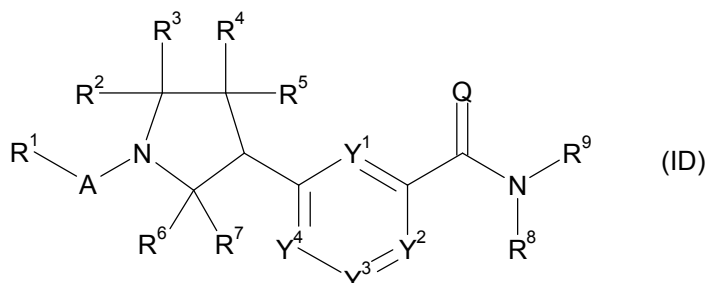
Cuando n es 1 y p es 2, los compuestos de fórmula I tienen la fórmula de acuerdo con la fórmula IC:



donde A, T, G, Y¹, Y², Y³, Y⁴, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I.

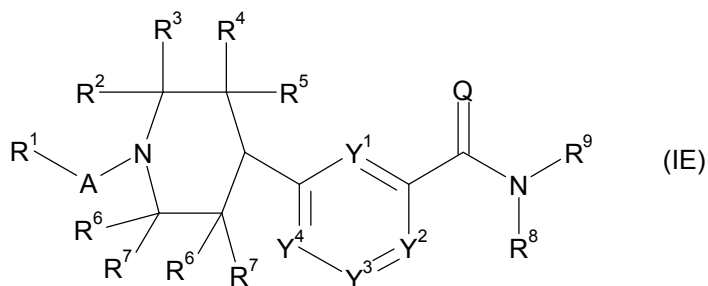
La invención también se refiere a compuestos de fórmula IA, fórmula IB y fórmula IC, según se ha mostrado anteriormente.

5 La invención también se refiere a compuestos de fórmula ID:



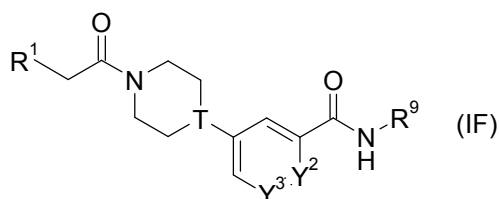
donde Y¹, Y², Y³, Y⁴, A, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I. Las definiciones preferidas de Y¹, Y², Y³, Y⁴, A, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son como se han definido anteriormente.

10 La invención también se refiere a compuestos de fórmula IE:



donde Y¹, Y², Y³, Y⁴, A, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I. Las definiciones preferidas de Y¹, Y², Y³, Y⁴, A, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ son como se han definido anteriormente.

15 La invención también se refiere a un compuesto de fórmula IF:

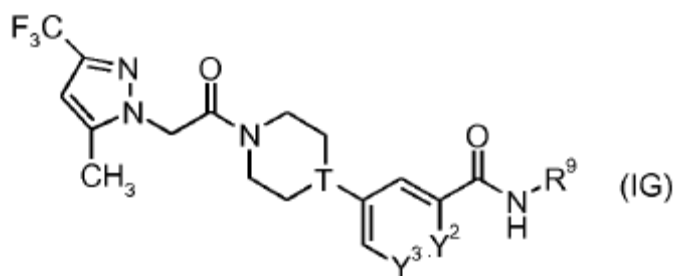


donde T es N o CH;

Y² e Y³ son ambos CH, o uno de los grupos Y³ e Y² es N y el otro es CH; y

20 R¹ y R⁹ son como se han descrito para un compuesto de fórmula I, según se ha definido anteriormente. Las definiciones preferidas de R¹ y R⁹ son como se han definido anteriormente.

La invención también se refiere a un compuesto de fórmula IG:

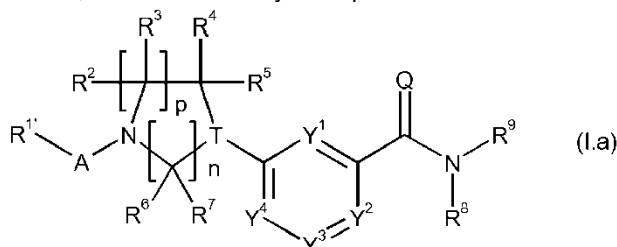


donde T es N o CH;

Y^2 e Y^3 son ambos CH, o uno de los grupos Y^3 e Y^2 es N y el otro es CH; y

R^9 es como se ha descrito para un compuesto de fórmula I, según se ha definido anteriormente. Las definiciones preferidas de R^9 son como se han definido anteriormente.

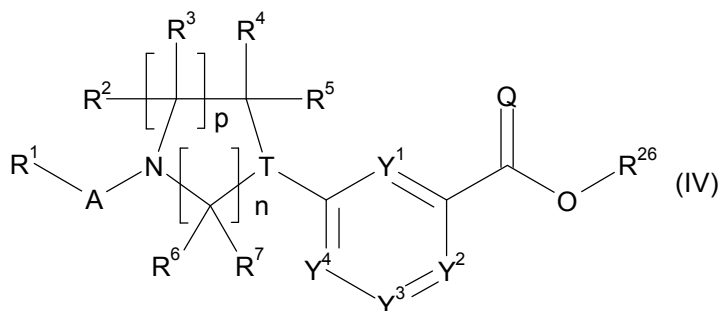
La invención también incluye compuestos de fórmula I en los que R^1 es un grupo protector, tal como un grupo alquilo. En consecuencia, la invención incluye compuestos de fórmula I.a:



donde R^1 es alquilo C_1 - C_8 , p. ej., alquilo C_1 - C_4 , preferentemente *tert*-butilo, y Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , A, Q, T, n, p, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I, según se ha definido anteriormente. Las definiciones preferidas de Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , A, Q, T, n, p, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 son como se han definido anteriormente.

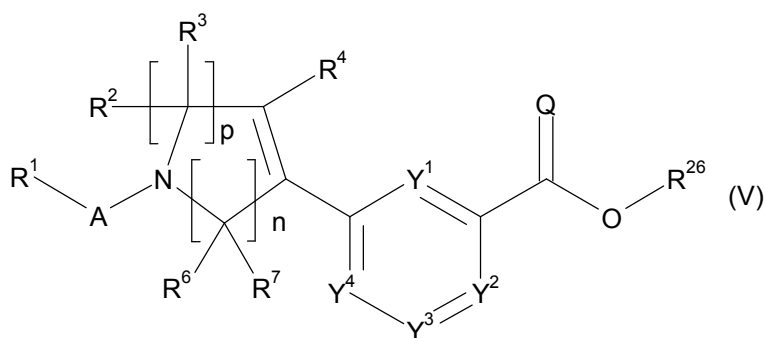
La invención también se refiere a otros intermedios útiles en la preparación de compuestos de fórmula I.

La invención se refiere a un compuesto de fórmula IV:



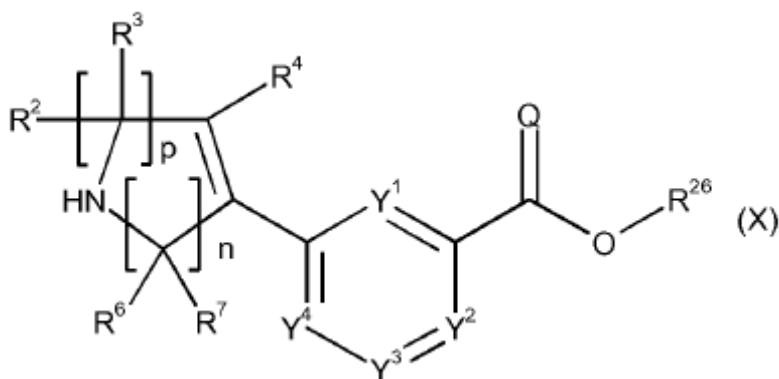
donde Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , A, Q, T, n, p, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I, según se define anteriormente, y las definiciones preferidas de Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , A, Q, T, n, p, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son como se han definido anteriormente; y R^{26} es alquilo C_1 - C_6 o arilo opcionalmente sustituido. Preferentemente, R^{26} es alquilo C_1 - C_6 o fenilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 , hidroxilo, amino, ciano y halógeno.

La invención se refiere a un compuesto de fórmula V:



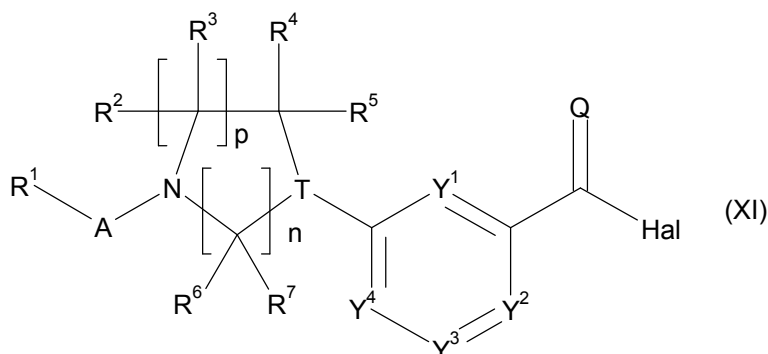
donde Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , A, Q, n, p, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 y R^7 tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I, según se ha definido anteriormente, y las definiciones preferidas de Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , A, Q, n, p, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 y R^7 son como se han definido anteriormente; y R^{26} es alquilo C₁-C₆ o arilo opcionalmente sustituido. Preferentemente, R^{26} es alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, hidroxilo, amino, ciano y halógeno.

La invención se refiere a un compuesto de fórmula X:



donde Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , Q, n, p, R^2 , R^3 , R^4 , R^6 y R^7 tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I, según se define anteriormente, y las definiciones preferidas de Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , Q, n, p, R^2 , R^3 , R^4 , R^6 y R^7 son como se han definido anteriormente; y R^{26} es alquilo C₁-C₆ o arilo opcionalmente sustituido. Preferentemente, R^{26} es alquilo C₁-C₆ o fenilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, hidroxilo, amino, ciano y halógeno.

La invención se refiere a un compuesto de fórmula XI:



donde Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , A, Q, n, p, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I, según se define anteriormente, y las definiciones preferidas de Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , A, Q, n, p, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son como se han definido anteriormente; Hal se refiere a halógeno.

Los compuestos individuales preferidos son:

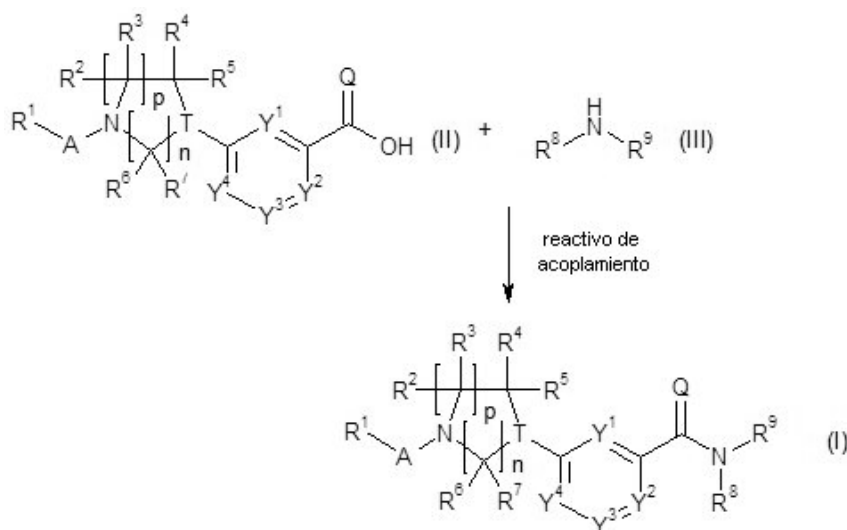
3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-N-(R)-1,2,3,4-tetrahidronaftaleno-1-ilbenzamida (Compuesto N.º I.n.001);

- 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-*N*-((*R*)-1-feniletil)benzamida (Compuesto N.º I.n.003);
- 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-*N*-(1,2,3,4-tetrahidronaftaleno-1-il)benzamida (Compuesto N.º I.n.005);
- 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-*N*-(1-feniletil)benzamida (Compuesto N.º I.n.007);
- 5 *N*-bencil-3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-*N*-benzamida (Compuesto N.º I.n.009);
- 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-*N*-fenilbenzamida (Compuesto N.º I.n.011);
- 3-{1-[2-(2,5-dimetilfenil)acetil]piperidin-4-il}-*N*-(*R*)-(1,2,3,4-tetrahidronaftaleno-1-il)benzamida (Compuesto N.º I.n.049);
- 3-{1-[2-(3,5-dimetilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-*N*-(1,2,3,4-tetrahidronaftaleno-1-il)benzamida (Compuesto N.º I.n.097);
- 10 *N*-metil-3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-*N*-(*R*)-1,2,3,4-tetrahidronaftaleno-1-ilbenzamida (Compuesto N.º I.o.001);
- N*-metil-3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-*N*-((*R*)-1-feniletil)benzamida (Compuesto N.º I.o.003);
- N*-metil-3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-*N*-(1,2,3,4-tetrahidronaftaleno-1-il)benzamida (Compuesto N.º I.o.005);
- 15 *N*-metil-3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-*N*-(1-feniletil)benzamida (Compuesto N.º I.o.007);
- ((*R*)-1,2,3,4-tetrahidronaftaleno-1-il)amida del ácido 1'-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-6-carboxílico (Compuesto N.º 1.p.001);
- (1,2,3,4-tetrahidronaftaleno-1-il)amida del ácido 1'-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-6-carboxílico (Compuesto N.º 1.p.005);
- 20 (1-feniletil)amida del ácido 1'-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-6-carboxílico (Compuesto N.º 1.p.007); (*R*)-(1,2,3,4-tetrahidronaftaleno-1-il)amida del ácido 1'-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[3,4']bipiridinil-5-carboxílico (Compuesto N.º 1.t.001);
- (*R*)-(1,2,3,4-tetrahidronaftaleno-1-il)amida del ácido 1'-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[4,4']bipiridinil-2-carboxílico (Compuesto N.º 1.v.001);
- 25 3-{4-[2-(3,5-dimetilpirazol-1-il)acetil]piperazin-1-il}-*N*-(*R*)-(1,2,3,4-tetrahidronaftaleno-1-il)benzamida (Compuesto N.º 1.z.001); y
- 3-{4-[2-(3,5-dimetilpirazol-1-il)acetil]piperazin-1-il}-*N*-(1,2,3,4-tetrahidronaftaleno-1-il)benzamida (Compuesto N.º 1.z.005).

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

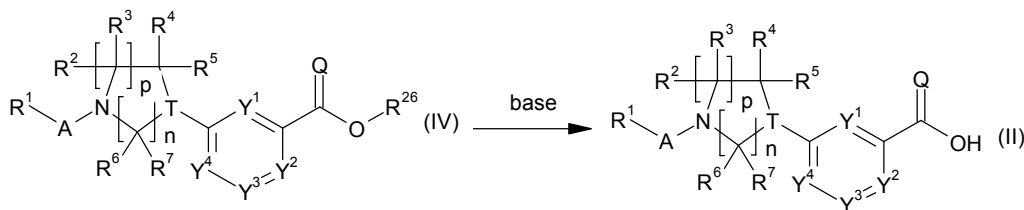
- 30 Los compuestos de fórmula I, donde R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸, R⁹, A, T, Y¹, Y², Y³ e Y⁴, n, p y Q son como se han definido para la fórmula I, se pueden obtener mediante la transformación de un compuesto de fórmula II, donde R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, A, T, Y¹, Y², Y³ e Y⁴, n, p y Q son como se han definido para la fórmula I, con un compuesto de fórmula III, donde R⁸ y R⁹ son como se han definido para la fórmula I, y un reactivo de acoplamiento peptídico tal como BOP, PyBOP o HATU. Esto se muestra en el Esquema 1.

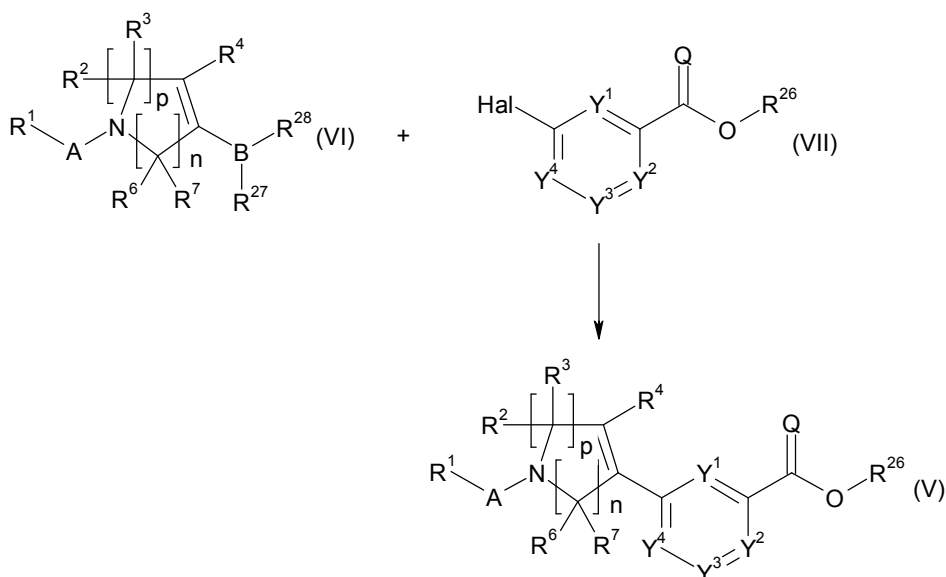
Esquema 1



Los compuestos de fórmula II, donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , A, T, Y^1 , Y^2 , Y^3 e Y^4 , n, p y Q son como se han definido para la fórmula I, se pueden obtener mediante la saponificación de un compuesto de fórmula IV, donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , A, T, Y^1 , Y^2 , Y^3 e Y^4 , n, p y Q son como se han definido para la fórmula I y R^{26} es alquilo C_1 - C_6 o arilo opcionalmente sustituido, con una base tal como hidróxido de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de litio, carbonato de potasio, carbonato de sodio, etc. Esto se muestra en el Esquema 2.

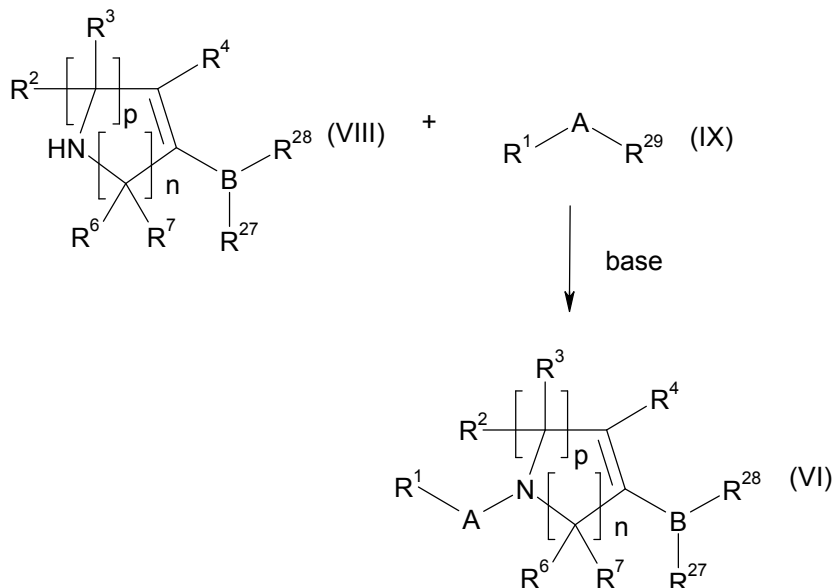
Esquema 2





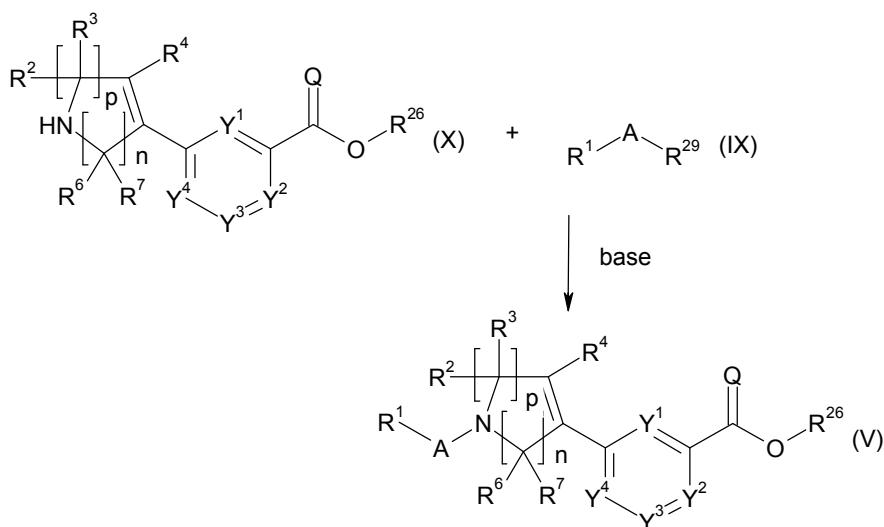
5 Los compuestos de fórmula VI, donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , n , p y A son como se han definido para la fórmula I y R^{27} y R^{28} son cada uno independientemente hidroxi o alquilo C_1 - C_6 o, junto con el átomo de boro interyacente, forman un anillo heterocíclico saturado de cinco o seis miembros, se pueden obtener mediante la transformación de un compuesto de fórmula VIII, donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , n y p son como se han definido para la fórmula I y R^{27} y R^{28} son cada uno independientemente hidroxi o alquilo C_1 - C_6 o, junto con el átomo de boro interyacente, forman un anillo heterocíclico saturado de cinco o seis miembros, con un compuesto de fórmula IX, donde R^1 y A son como se han definido para la fórmula I y R^{29} es hidroxi o halógeno, preferentemente fluoro, cloro o bromo, y un reactivo de acoplamiento peptídico o una base tal como piridina, trietilamina, etildiisopropilamina, etc. Esto se muestra en el Esquema 5.

10 Esquema 5



15 Como alternativa, los compuestos de fórmula V, donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , A , Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , n , p y Q son como se han definido para la fórmula I y R^{26} es alquilo C_1 - C_6 o arilo opcionalmente sustituido, se pueden obtener mediante la transformación de un compuesto de fórmula X, donde R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , A , Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , n , p y Q son como se han definido para la fórmula I y R^{26} es alquilo C_1 - C_6 o arilo opcionalmente sustituido, con un compuesto de fórmula IX, donde R^1 y A son como se han definido para la fórmula I y R^{29} es hidroxi o halógeno, preferentemente fluoro, cloro o bromo, y un reactivo de acoplamiento peptídico o una base tal como piridina, trietilamina, etildiisopropilamina, etc. Esto se muestra en el Esquema 6.

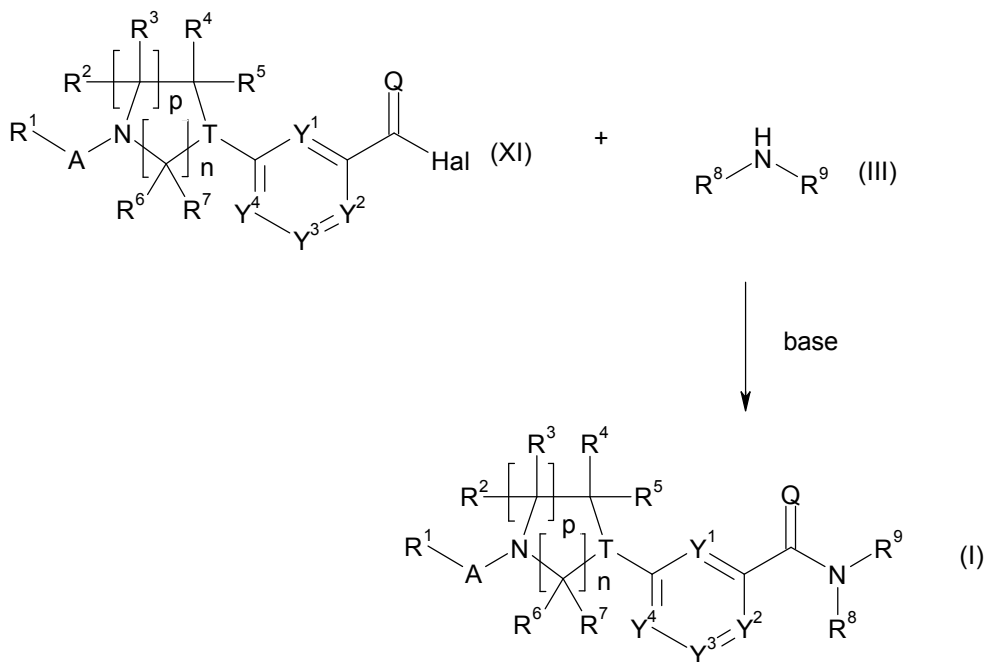
Esquema 6



5

Como alternativa, los compuestos de fórmula I, donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , A, T, Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , n, p y Q son como se han definido para la fórmula I, se pueden obtener mediante la transformación de un compuesto de fórmula XI, donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , A, T, Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , n, p y Q son como se han definido para la fórmula I y Hal es halógeno, preferentemente fluoro, cloro o bromo, con un compuesto de fórmula III, donde R^8 y R^9 son como se han definido para la fórmula I, con una base tal como piridina, trietilamina, etildisopropilamina, etc. Esto se muestra en el Esquema 7.

Esquema 7

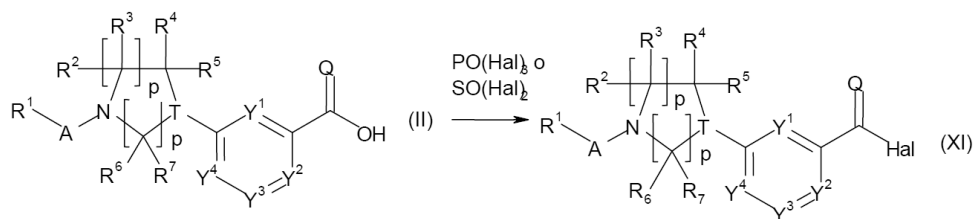


10

Los compuestos de fórmula XI, donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , A, T, Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , n, p y Q son como se han definido para la fórmula I y Hal es halógeno, preferentemente fluoro, cloro o bromo, se pueden obtener mediante la transformación de un compuesto de fórmula II, donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , A, T, Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , n, p y Q son como se han definido para la fórmula I, con un haluro de fosforilo, tal como cloruro de fosforilo o bromuro de fosforilo, o un haluro de tionilo, tal como cloruro de tionilo o bromuro de tionilo. Esto se muestra en el Esquema 8.

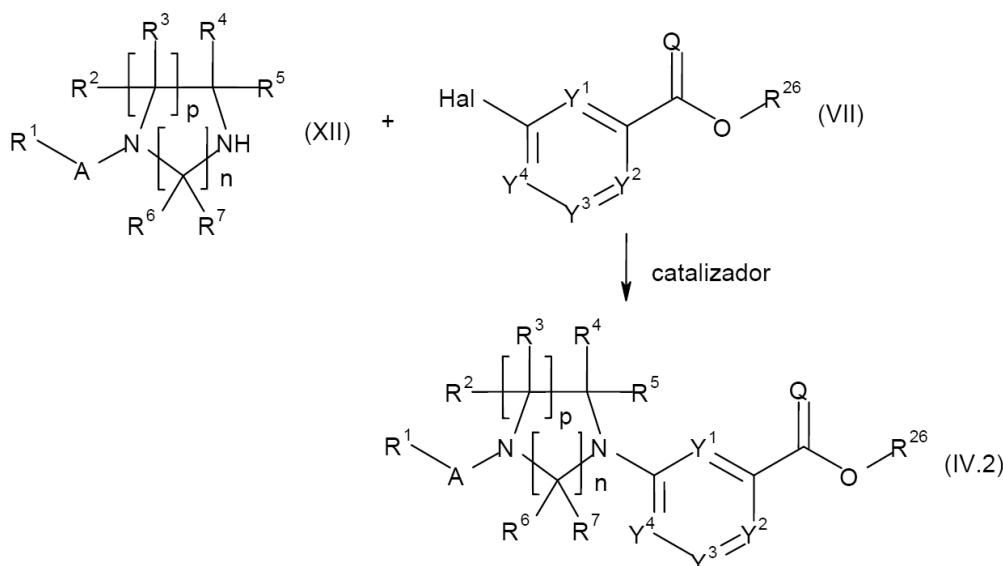
15

Esquema 8



Los compuestos de fórmula IV.2, donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , A, Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , n, p y Q son como se han definido para la fórmula I y R^{26} es alquilo C_1 - C_6 o arilo opcionalmente sustituido, se pueden obtener mediante la transformación de un compuesto de fórmula XII, donde R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , n, p y A son como se han definido para la fórmula I, con un compuesto de fórmula VII, donde Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 y Q son como se han definido para la fórmula I, R^{26} es alquilo C_1 - C_6 o arilo opcionalmente sustituido y Hal es halógeno, preferentemente yodo, bromo o cloro. Esto se muestra en el Esquema 9.

Esquema 9



Sorprendentemente, se acaba de descubrir que los nuevos compuestos de fórmula I presentan, a efectos prácticos, un nivel muy ventajoso de actividad biológica para la protección de plantas contra enfermedades provocadas por hongos.

Los compuestos de fórmula I se pueden utilizar en el sector agrícola y campos de uso relacionados, p. ej., como principios activos para controlar plagas en plantas, o en materiales inertes para controlar microorganismos responsables de su descomposición u organismos potencialmente dañinos para el ser humano. Los nuevos compuestos se caracterizan por su excelente actividad para tasas de aplicación bajas, por ser bien tolerados por las plantas y por ser ecológicos. Presentan unas propiedades curativas, preventivas y sistémicas muy útiles, y se pueden emplear para proteger numerosas plantas de cultivo. Los compuestos de fórmula I se pueden emplear para inhibir o exterminar las plagas que aparecen en plantas o partes de plantas (frutos, flores, hojas, tallos, tubérculos, raíces) de diferentes cultivos de plantas útiles, a la vez que también protegen las partes de las plantas que crecen más tarde, p. ej., frente a microorganismos fitopatógenos.

También es posible emplear los compuestos de fórmula I como agentes de revestimiento para tratar el material de propagación vegetal, p. ej., semillas tales como frutos, tubérculos o granos, o esquejes vegetales (por ejemplo, arroz), para protegerlo contra infecciones fúngicas, así como también contra hongos fitopatógenos presentes en la tierra. El material de propagación se puede tratar con una composición que comprenda un compuesto de fórmula I antes de plantarlo, por ejemplo, las semillas se pueden revestir antes de ser sembradas. Los principios activos de acuerdo con la invención también se pueden aplicar a granos (recubrimiento), ya sea impregnando las semillas con una formulación líquida o recubriéndolas con una formulación sólida. La composición también se puede aplicar al sitio de siembra cuando el material de propagación está siendo plantado, por ejemplo, al surco de la semilla durante la siembra. La invención se refiere además a tales métodos de tratamiento del material de propagación vegetal y al material de propagación vegetal tratado de tal modo.

Además, los compuestos de acuerdo con la presente invención se pueden emplear para controlar hongos en áreas relacionadas, por ejemplo, en la protección de materiales técnicos, incluidos la madera y productos técnicos relacionados con la madera, en el almacenamiento de alimentos o en la gestión sanitaria.

Además, la invención se podría utilizar para proteger materiales inertes contra ataques fúngicos, p. ej., madera, paneles para tabicar y pintura.

Los compuestos de fórmula I son eficaces, por ejemplo, contra los hongos fitopatógenos de las siguientes clases: hongos imperfectos (p. ej., *Alternaria* spp.), basidiomicetos (p. ej., *Corticium* spp., *Ceratobasidium* spp., *Waitea* spp., *Thanatephorus* spp., *Rhizoctonia* spp., *Hemileia* spp., *Puccinia* spp., *Phakopsora* spp., *Ustilago* spp., *Tilletia* spp.), ascomicetos (p. ej., *Venturia* spp., *Blumeria* spp., *Erysiphe* spp., *Podosphaera* spp., *Uncinula* spp., *Monilinia* spp., *Sclerotinia* spp., *Colletotrichum* spp., *Glomerella* spp., *Fusarium* spp., *Gibberella* spp., *Monographella* spp., *Phaeosphaeria* spp., *Mycosphaerella* spp., *Cercospora* spp., *Pyrenophora* spp., *Rhynchosporium* spp., *Magnaporthe* spp., *Gaeumannomyces* spp., *Oculimacula* spp., *Ramularia* spp., *Botryotinia* spp.) y oomicetos (p. ej., *Phytophthora* spp., *Pythium* spp., *Plasmopara* spp., *Peronospora* spp., *Pseudoperonospora* spp., *Bremia* spp.). Se observa una actividad extraordinaria contra el mildiu lanoso (p. ej., *Plasmopara viticola*) y añublo tardío (p. ej., *Phytophthora infestans*). Además, los nuevos compuestos de fórmula I son eficaces contra bacterias fitopatógenas gram positivas y gram negativas (p. ej., *Xanthomonas* spp., *Pseudomonas* spp., *Erwinia amylovora*, *Ralstonia* spp.) y virus (p. ej., el virus del mosaico del tabaco).

Dentro del alcance de la presente invención, los cultivos diana y/o las plantas útiles que se desea proteger habitualmente comprenden las siguientes especies de plantas: cereales (trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz, sorgo y especies relacionadas); remolacha (remolacha azucarera y remolacha forrajera); pomos, drupas y bayas (manzanas, peras, ciruelas, duraznos, almendras, cerezas, frutillas, frambuesas y moras); plantas leguminosas (porotos, lentejas, arvejas, soja); plantas oleosas (colza, mostaza, amapola, aceitunas, girasoles, coco, plantas de aceite de ricino, granos de cacao, maníes); plantas cucurbitáceas (calabazas, pepinos, melones); plantas que producen fibras (algodón, lino, cáñamo, yute); frutas cítricas (naranjas, limones, pomelos, mandarinas); hortalizas (espinacas, lechuga, espárragos, coles, zanahorias, cebollas, tomates, papas, pimentón dulce); lauráceas (palta, *cinnamomum*, alcanfor) o plantas tales como tabaco, frutos secos, café, berenjenas, caña de azúcar, té, morrón, vides, lúpulo, bananas y plantas de goma natural, así como también pasto y plantas ornamentales.

Las plantas útiles y/o cultivos diana de acuerdo con la invención incluyen variedades convencionales, así como también variedades mejoradas o modificadas genéticamente tales como, por ejemplo, variedades resistentes a insectos (p. ej., variedades Bt. y VIP), así como también resistentes a enfermedades, tolerantes a herbicidas (p. ej., variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato comercializadas con los nombres comerciales RoundupReady® y LibertyLink®) y tolerantes a nematodos. A modo de ejemplo, las variedades de cultivos mejoradas o modificadas genéticamente adecuadas incluyen las variedades del algodón Stoneville 5599BR y Stoneville 4892BR.

Se debe sobreentender que la expresión "plantas útiles" y/o "cultivos diana" también incluye las plantas útiles que se han modificado para que sean tolerantes a herbicidas, tales como bromoxinil, o a clases de herbicidas (tales como, por ejemplo, inhibidores de HPPS, inhibidores de ALS, por ejemplo, primisulfurón, prosulfurón y trifloxisulfurón, inhibidores de EPSPS (5-enolpirovil-shikimato-3-fosfato-sintasa), inhibidores de GS (glutamina-sintetasa) o inhibidores de PPO (protoporfirinógeno-oxidasa)) como resultado de métodos convencionales de cultivo selectivo o de ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que se ha modificado para que sea tolerante a imidazolinonas, p. ej., imazamox, mediante métodos convencionales de cultivo selectivo (mutagénesis) es la colza de verano Clearfield® (canola). Los ejemplos de cultivos que se han modificado para que sean tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas mediante métodos de ingeniería genética incluyen las variedades de maíz resistentes a glufosinato y glifosato, comercializadas con los nombres comerciales RoundupReady®, Herculex I® y LibertyLink®.

Se debe sobreentender que la expresión "plantas útiles" y/o "cultivos diana" también incluye las plantas útiles que se han transformado utilizando técnicas de ADN recombinante, las cuales permiten sintetizar una o más toxinas que actúan selectivamente tales como las que se conocen, por ejemplo, las que provienen de bacterias que producen toxinas, especialmente las del género *Bacillus*.

Se debe sobreentender que la expresión "plantas útiles" y/o "cultivos diana" también incluye las plantas útiles que se han transformado utilizando técnicas de ADN recombinante, las cuales permiten sintetizar sustancias antipatógenas con una acción selectiva tales como, por ejemplo, las denominadas "proteínas relacionadas con la patogénesis" (PRP, remítase, p. ej., a EP-A-0 392 225). Algunos ejemplos de estas sustancias antipatógenas y de plantas transgénicas capaces de sintetizar estas sustancias antipatógenas se describen, por ejemplo, en EP-A-0 392 225, WO 95/33818 y EP-A-0 353 191. Los métodos para producir estas plantas transgénicas son generalmente conocidos por los expertos en la materia y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas previamente.

Se pretende que el término "emplazamiento" de una planta, según se emplea en la presente, abarque el lugar en el que se cultivan las plantas, donde se siembran los materiales de propagación vegetal de las plantas o donde se colocarán los materiales de propagación vegetal de las plantas en la tierra. Un ejemplo de este emplazamiento es un campo en el que se producen plantas de cultivo.

Se sobreentenderá que la expresión "material de propagación vegetal" se refiere a partes generativas de la planta, tales como las semillas, las cuales se pueden emplear para la multiplicación de la última, y a material vegetativo, tal como esquejes o tubérculos, por ejemplo, papas. Se pueden mencionar, por ejemplo, semillas (en el sentido estricto), raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas y partes de plantas. También se pueden mencionar las plantas germinadas y las plántulas que se van a trasplantar después de la germinación o después de que emerjan de la tierra. Estas plántulas se pueden proteger antes del trasplante mediante un tratamiento total o parcial de inmersión. Preferentemente, se sobreentenderá que el "material de propagación vegetal" se refiere a las semillas.

Los compuestos de fórmula I se pueden emplear en una forma no modificada o, preferentemente, junto con adyuvantes empleados convencionalmente en el campo de la formulación. Con este fin, se pueden formular convencionalmente de una forma conocida para obtener concentrados emulsionables, pastas que se pueden aplicar como recubrimiento, soluciones o suspensiones diluibles o que se pueden pulverizar directamente, emulsiones diluidas, polvos humectables, polvos solubles, polvos finos, materiales granulados y también encapsulaciones, p. ej., en sustancias poliméricas. Del mismo modo que para el tipo de composiciones, los métodos de aplicación, tales como pulverización, atomización, espolvoreación, dispersión, recubrimiento o vertido, se seleccionan de acuerdo con los objetivos deseados y las circunstancias del caso. Las composiciones también pueden contener otros adyuvantes tales como estabilizantes, antiespumantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes o adherentes, así como fertilizantes, dadores de micronutrientes u otras formulaciones para obtener efectos especiales.

Los adyuvantes y portadores adecuados, p. ej., para uso agrícola, pueden ser sólidos o líquidos y son sustancias útiles en la tecnología de la formulación, p. ej., sustancias minerales naturales o regeneradas, disolventes, dispersantes, agentes humectantes, adherentes, espesantes, aglutinantes o fertilizantes. Estos portadores se describen, por ejemplo, en WO 97/33890.

Los compuestos de fórmula I se pueden emplear en forma de composiciones y se pueden aplicar al área de cultivo o a la planta que se desee tratar, simultánea o sucesivamente, con otros compuestos. Estos otros compuestos pueden ser, p. ej., fertilizantes o dadores de micronutrientes u otros preparados que fomentan el crecimiento de las plantas. También pueden ser herbicidas selectivos o herbicidas no selectivos, así como insecticidas, fungicidas, bactericidas, nematocidas, molusquicidas o mezclas de varios de estos preparados, si se desea junto con otros portadores, surfactantes o adyuvantes que faciliten la aplicación empleados habitualmente en el campo de la formulación.

Los compuestos de fórmula I se emplean normalmente en forma de composiciones fungicidas para el control o la protección contra microorganismos fitopatógenos, que comprenden como principio activo al menos un compuesto de fórmula I o al menos un compuesto individual preferido como los definidos anteriormente, en forma libre o en forma salina útil desde un punto de vista agroquímico, y al menos uno de los adyuvantes mencionados anteriormente.

La invención proporciona una composición fungicida que comprende al menos un compuesto de fórmula I, un portador aceptable en agricultura y opcionalmente un adyuvante. Un portador agrícola aceptable es, por ejemplo, un portador que sea adecuado para el uso agrícola. Los portadores agrícolas son muy conocidos en la técnica. Preferentemente, dichas composiciones fungicidas pueden comprender un principio activo fungicida adicional además del compuesto de fórmula I.

El compuesto de fórmula (I) puede ser el único principio activo de una composición o puede estar mezclado con uno o más principios activos adicionales tales como un insecticida, fungicida, sinergista, herbicida o regulador del crecimiento vegetal, cuando proceda. En algunos casos, un principio activo adicional puede producir actividades sinérgicas inesperadas. Los ejemplos de principios activos adicionales adecuados incluyen los siguientes: azoxistrobina (131860-33-8), dimoxistrobina (149961-52-4), enestrobina (238410-11-2), fluoxastrobina (193740-76-0), kresoxim metílico (143390-89-0), metominostrobin (133408-50-1), orisastrobina (248593-16-0), picoxistrobina (117428-22-5), piraclostrobina (175013-18-0), azaconazol (60207-31-0), bromuconazol (116255-48-2), ciproconazol (94361-06-5), difenoconazol (119446-68-3), diniconazol (83657-24-3), diniconazol-M (83657-18-5), epoxiconazol (13385-98-8), fenbuconazol (114369-43-6), fluquinconazol (136426-54-5), flusilazol (85509-19-9), flutriafol (76674-21-0), hexaconazol (79983-71-4), imazalilo (58594-72-2), imibenconazol (86598-92-7), ipconazol (125225-28-7), metconazol (125116-23-6), miclobutanilo (88671-89-0), oxpoconazol (174212-12-5), pefurazoato (58011-68-0), penconazol (66246-88-6), procloraz (67747-09-5), propiconazol (60207-90-1), protioconazol (178928-70-6), simeconazol (149508-90-7), tebuconazol (107534-96-3), tetraconazol (112281-77-3), triadimefón (43121-43-3), triadimenol (55219-65-3), triflumizol (99387-89-0), triticonazol (131983-72-7), diclobutrazol (76738-62-0), etaconazol (60207-93-4), fluconazol (86386-73-4), fluconazol-cis (112839-32-4), tiabendazol (148-79-8), quinconazol (103970-75-8), fenpiclonilo (74738-17-3), fludioxonilo (131341-86-1), ciprodinilo (121552-61-2), mepanipirim (110235-47-7), pirimetanilo (53112-28-0), aldimorf (91315-15-0), dodemorf (1593-77-7), fenpropimorf (67564-91-4), tridemorf (81412-43-3), fenpropidina (67306-00-7), espiroamina (118134-30-8), isopirazam (881685-58-1), sedaxane (874967-67-6), bixafén (581809-46-3), pentiopirad (183675-82-3), fluxapiraxad (907204-31-3), boscalid (188425-85-6), penflufén (494793-67-8), fluopiram (658066-35-4), mandipropamida (374726-62-2), bentiavalicarb (413615-35-7), dimetomorf (110488-70-5), clorotalonilo (1897-45-6), fluazinam (79622-59-6), ditianona (3347-22-6), metrafenona (220899-03-6), triclozazol (41814-78-2), mepanoxam (70630-17-0), metalaxilo (57837-19-1), acibenzolar (126448-41-7) (acibenzolar-S-metilo (126448-41-7)), mancozeb (8018-01-7), ametoctradina (865318-97-4), ciflufenamida (180409-60-3), ipconazol (125225-28-7), amisulbrom (348635-87-0), etaboxam (16650-77-3), fluopicolida (239110-15-7), flutianilo (304900-25-2), isotianilo (224049-04-1), proquinazid (189278-12-4), valifenal (283159-90-0), 1-metilciclopropeno (3100-04-7), trifloxistrobina (141517-21-7), azufre (7704-34-9), carbonato de amonio y cobre (CAS

- 33113-08-5), oleato de cobre (CAS 1120-44-1), folpet (133-07-3), quinoxifeno (124495-18-7), captán (133-06-2), fenhexamida (126833-17-8), glufosinato y sus sales (51276-47-2, 35597-44-5 (isómero S)), glifosato (1071-83-6) y sus sales (69254-40-6 (diamonio), 34494-04-7 (dimetilamonio), 38641-94-0 (isopropilamonio), 40465-66-5 (monoamonio), 70901-20-1 (potasio), 70393-85-0 (sesquisodio), 81591-81-3 (trimesio)), (2-diclorometilen-3-etil-1-metilindan-4-il)amida del ácido 1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxílico, (4'-metilsulfanilbifenil-2-il)amida del ácido 1,3-dimetil-1*H*-pirazol-4-carboxílico, [2-(2,4-diclorofenil)-2-metoxi-1-metiletil]amida del ácido 1,3-dimetil-4*H*-pirazol-4-carboxílico, (5-cloro-2,4-dimetilpiridin-3-il)-(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (5-bromo-4-cloro-2-metoxipiridin-3-il)-(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, 2-{2-[(*E*)-3-(2,6-diclorofenil)-1-metilprop-2-en-(*E*)-ilidenoaminoximetil]fenil}-2-[(*Z*)-metoxiimino]-*N*-metilacetamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina.
- Otro aspecto de la invención se refiere al uso de un compuesto de fórmula I o de un compuesto individual preferido como los definidos anteriormente, de una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula I o al menos un compuesto individual preferido como los definidos anteriormente, o de una mezcla fungicida que comprende al menos un compuesto de fórmula I o al menos un compuesto individual preferido como los definidos anteriormente, mezclado con otros fungicidas, como los descritos anteriormente, para controlar o prevenir la infestación de plantas, p. ej., de plantas útiles tales como plantas de cultivo, del material de propagación de estas, p. ej., semillas, cultivos recolectados, p. ej., cultivos alimentarios recolectados, o de materiales inertes por parte de microorganismos fitopatógenos, preferentemente organismos fúngicos.
- Otro aspecto de la invención se refiere a un método para controlar o prevenir una infestación de plantas, p. ej., de plantas útiles tales como plantas de cultivo, del material de propagación de estas, p. ej., semillas, cultivos recolectados, p. ej., cultivos alimentarios recolectados, o de materiales inertes por parte de microorganismos fitopatógenos o responsables de la descomposición, u organismos potencialmente dañinos para el ser humano, especialmente organismos fúngicos, que comprende aplicar un compuesto de fórmula I o un compuesto individual preferido como los definidos anteriormente como principio activo a las plantas, a partes de las plantas o al emplazamiento de estas, al material de propagación de estas o a cualquier parte de los materiales inertes.
- Controlar o prevenir quiere decir reducir la infestación de microorganismos fitopatógenos o responsables de la descomposición, u organismos potencialmente dañinos para el ser humano, especialmente organismos fúngicos, hasta un nivel tal que se demuestra una mejora.
- Un método preferido para controlar o prevenir una infestación de plantas de cultivo por parte de microorganismos fitopatógenos, especialmente organismos fúngicos, que comprende aplicar un compuesto de fórmula I o una composición agroquímica que contenga al menos uno de dichos compuestos, es la aplicación foliar. La frecuencia de aplicación y la tasa de aplicación dependerán del riesgo de infestación por parte del patógeno correspondiente. Sin embargo, los compuestos de fórmula I también se pueden infiltrar en la planta a través de las raíces mediante la tierra (acción sistémica) empapando el emplazamiento de la planta con una formulación líquida o aplicando los compuestos en forma sólida a la tierra, p. ej., en forma granular (aplicación en la tierra). En cultivos de arrozales, estos materiales granulados se pueden aplicar al campo de arroz inundado. Los compuestos de fórmula I también se pueden aplicar a las semillas (recubrimiento) impregnando las semillas o los tubérculos con una formulación líquida del fungicida o recubriéndolos con una formulación sólida.
- Una formulación, p. ej., una composición que contiene el compuesto de fórmula I y, si se desea, un adyuvante sólido o líquido, o monómeros para encapsular el compuesto de fórmula I, se puede preparar empleando un método conocido, habitualmente mezclando y/o moliendo íntimamente el compuesto con extendedores, por ejemplo, disolventes, portadores sólidos y, opcionalmente, compuestos tensioactivos (surfactantes).
- Las formulaciones y/o composiciones agroquímicas normalmente contendrán entre un 0.1 y un 99% en peso, preferentemente entre un 0.1 y un 95% en peso, del compuesto de fórmula I, entre un 99.9 y un 1% en peso, preferentemente entre un 99.8 y un 5% en peso, de un adyuvante sólido o líquido, y entre un 0 y un 25% en peso, preferentemente entre un 0.1 y un 25% en peso, de un surfactante.
- Las tasas de aplicación convenientes son normalmente de 5 g a 2 kg de principio activo (p.a.) por hectárea (ha), preferentemente de 10 g a 1 kg de p.a./ha, de la forma más preferida de 20 g a 600 g de p.a./ha. Cuando se emplea como un agente para empapar las semillas, las dosis convenientes son de 10 mg a 1 g de sustancia activa por kg de semillas.
- Aunque se prefiere formular los productos comerciales como concentrados, el usuario final normalmente empleará formulaciones diluidas.
- Los siguientes ejemplos no limitantes ilustran la invención descrita anteriormente con más detalle.
- Ejemplo 1: Este ejemplo ilustra la preparación de 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-*N*-(*R*)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilbenzamida (Compound No. I.n.001)
- a) Preparación del éster *tert*-butílico del ácido 4-(3-etoxicarbonilfenil)-3,6-dihidro-2*H*-piridino-1-carboxílico¹

A una solución 3-yodobenzoato de etilo (10 g, 36.2 mmol) en dioxano (400 ml) se añadieron sucesivamente bistrifenilfosfinpaladiolcloruro (1.26 g, 1.8 mmol), éster *tert*-butilico del ácido 4-(4,4,5,5-tetrametil-[1,3,2]dioxaborolan-2-il)-3,6-dihidro-2*H*-piridino-1-carboxílico² (13.44 g, 43.46 mmol) y una sol. ac. de carbonato de sodio (11.5 g en 100 ml de agua, 108.6 mmol) a TA. Después de agitar durante 3 h a 110°C, se evaporó el disolvente y el aceite amarillo resultante se disolvió en acetato de etilo (300 ml) y se lavó con salmuera (300 ml). La fase orgánica se secó con sulfato de sodio, se filtró y se evaporó a presión reducida. La mezcla cruda se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (acetato de etilo/heptano de 0:1 a 3:7) para proporcionar el éster *tert*-butilico del ácido 4-(3-etoxicarbonilfenil)-3,6-dihidro-2*H*-piridino-1-carboxílico (11.28 g, 94%). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ = 1.39-1.43 (t, 3H), 1.53 (s, 9H), 2.55-2.59 (m, 2H), 3.64 (t, 2H), 4.17-4.22 (m, 2H), 4.35-4.42 (q, 2H), 6.12 (m, 1 H), 7.39-7.43 (t, 1 H), 7.55-7.58 (m, 1 H), 7.91-7.94 (m, 1 H), 8.05 (s, 1 H). MS: m/z = 332 (M+1).

¹ El éster etílico del ácido 3-piperidin-4-ilbenzoico también se puede preparar de acuerdo con la siguiente referencia WO 2004092124 A2 20041028 (Merck & Co., Inc., EE. UU.).

² El éster *tert*-butilico del ácido tetrametil-[1,3,2]dioxaborolan-2-il)-3,6-dihidro-2*H*-piridino-1-carboxílico también se puede preparar de acuerdo con la siguiente referencia: Eastwood, P.R. *Tetrahedron Letters* **2000**, 41, 3705 o comprado a un proveedor adecuado (CAS 286961-14-6).

b) Preparación del éster *tert*-butilico del ácido 4-(3-etoxicarbonilfenil)piperidino-1-carboxílico¹

Una solución del éster *tert*-butilico del ácido 4-(3-etoxicarbonilfenil)-3,6-dihidro-2*H*-piridino-1-carboxílico (11.28 g, 34.035 mmol) en etanol (680 ml) se hizo pasar a través de un cartucho Pd/C utilizando un aparato H-Cube (20 °C, 10 bar, 2 ml/min.). A continuación, se evaporó el disolvente a presión reducida para proporcionar el éster *tert*-butilico del ácido 4-(3-etoxicarbonilfenil)piperidino-1-carboxílico (10.55 g, 93%), que se puede utilizar en el siguiente paso sin una purificación adicional. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ = 1.39-1.43 (t, 3H), 1.51 (s, 9H), 1.61-1.72 (dc, 1 H), 1.78-1.90 (m, 1 H), 2.66-2.74 (dt, 1 H), 2.74-2.89 (m, 1 H), 4.20-4.31 (m, 1 H), 4.32-4.42 (c, 2H), 7.39-7.41 (m, 2H), 7.88-7.92 (m, 2H). MS: m/z = 334 (M+1).

¹ El éster etílico del ácido 3-piperidin-4-ilbenzoico también se puede preparar de acuerdo con la siguiente referencia WO 2004092124 A2 20041028 (Merck & Co., Inc., EE. UU.).

c) Preparación de la sal clorhídrica del éster etílico del ácido 3-piperidin-4-ilbenzoico¹

A una solución del éster *tert*-butilico del ácido 4-(3-etoxicarbonilfenil)piperidino-1-carboxílico (10.55 g, 31.64 mmol) se añadió una solución 4M de HCl en dioxano (79 ml, 316.41 mmol) a TA. Después de agitar durante toda la noche a TA, se evaporó el disolvente a presión reducida. El aceite viscoso amarillento resultante se purificó con éter dietílico y se filtró para proporcionar la sal clorhídrica del éster etílico del ácido 3-piperidin-4-ilbenzoico (8.53 g, cuant.). ¹H-RMN (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 1.81-1.86 (t, 3H), 1.91-1.98 (m, 3H), 2.50-2.52 (m, 1H (se superpone con el DMSO), 2.95-3.05 (m, 2H), 3.32-3.39 (m, 2H), 4.31-4.39 (c, 2H), 7.49-7.52 (m, 2H), 7.81-7.83 (m, 2H), 9.5 (a, 2H). MS: m/z = 234 ((M-HCl)+1).

d) Preparación del éster etílico del ácido 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}benzoico

A una solución de ácido (5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acético (5.23 g, 20.75 mmol) en DMF (50 ml) se añadió diisopropiletilamina (43 ml, 207.58 mmol) y a continuación hexafluorofosfato de 2-(1*H*-7-azabenzotriazol-1-il)-1,1,3,3-tetrametiluronio uronium metanamino (10.52 g, 22.83 mmol) a TA. Después de agitar 15 min a TA, se añadió la sal clorhídrica del éster etílico del ácido 3-piperidin-4-ilbenzoico (5.6 g, 20.75 mmol) a la mezcla de reacción. Después de agitar durante toda la noche a TA, se evaporó el disolvente y el aceite marrón resultante se disolvió en acetato de etilo (200 ml), se lavó con una solución ac. sat. de bicarbonato de sodio (100 ml) y la fase acuosa se extrajo de nuevo con acetato de etilo (200 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con una solución 1M de HCl (400 ml) y salmuera (400 ml), se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se evaporaron a presión reducida. La mezcla cruda se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano de 0:1 a 1:1) para proporcionar el éster etílico del ácido 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}benzoico (4.35 g, 49.5%). ¹H-RMN (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 1.28-1.39 (t, 3H), 1.45-1.55 (m, 1 H), 1.65-1.1.79 (m, 1 H), 1.80-1.91 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.68-2.73 (m, 1 H), 2.89-2.95 (m, 1 H), 3.99-4.04 (m, 1 H), 4.29-4.33 (c, 2H), 4.46-4.52 (m, 1 H), 5.21-5.38 (dd, 2H, diastereotópico), 6.50 (s, 1 H), 7.47 (t, 1 H), 7.55 (d, 1 H), 7.80 (s, 1 H), 7.81 (d, 1 H). MS: m/z = 424 (M+1).

e) Preparación del ácido 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}benzoico

A una solución del éster etílico del ácido 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}benzoico (4.35 g, 10.27 mmol) en metanol (50 ml) se añadió una solución ac. de hidróxido de sodio (2 M, 7.7 ml, 15.41 mmol) a TA. Después de agitar 4 h a TA, se eliminó el disolvente y el residuo se disolvió en THF (30 ml) y se añadió una solución ac. de hidróxido de litio (121 mg en 5 ml de agua) a TA. Después de agitar durante toda la noche a TA, se eliminó el disolvente y el residuo se disolvió en acetato de etilo (50 ml) y la mezcla de reacción se acidificó con una solución ac. 2M de HCl hasta pH 1-2. Después de la separación de las fases, la fase ac. se reextrajo con acetato de etilo (20 ml) y las fases orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (50 ml), se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se evaporaron a presión reducida para proporcionar el ácido 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}benzoico (2.40 g, 59%), que se puede utilizar en el siguiente paso sin una purificación adicional. ¹H-RMN (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 1.45-1.55 (m, 1 H), 1.65-1.1.79 (m, 1H), 1.80-1.91 (m, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.67-2.78 (m, 1H), 2.89-2.95 (m,

1H), 3.17-3.24 (m, 1 H), 3.95-4.04 (m, 1 H), 4.46-4.52 (m, 1 H), 5.21-5.38 (dd, 2H, diastereotópico), 6.50 (s, 1 H), 7.47 (t, 1 H), 7.55 (d, 1 H), 7.80 (s, 1 H), 7.81 (d, 1 H). MS: m/z = 396 (M+1).

f) Preparación de 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-N-(R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il-benzamida (Compuesto N.º I.n.001)

- 5 A una solución del ácido 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}benzoico (100 mg, 0.25 mmol) en DMF (2 ml) se añadió diisopropiletilamina (0.16 mL, 0.76 mmol) y a continuación hexafluorofosfato de 2-(1H-7-azabenzotriazol-1-il)-1,1,3,3-tetrametiluronio metanaminio (0.128 g, 0.27 mmol) a TA. Después de agitar 15 min. a TA, se añadió (R)-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)amina (0.045 g, 0.25 mmol) a la mezcla de reacción. Después de agitar 2 h a TA, se evaporó el disolvente y el aceite marrón resultante se disolvió en acetato de etilo (10 ml), se lavó con una solución ac. sat. de bicarbonato de sodio (20 ml) y la fase acuosa se reextrajo con acetato de etilo (20 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con una solución 1M de HCl (20 ml) y salmuera (20 ml), se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se evaporaron a presión reducida. La mezcla cruda se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano de 1:1 a 8:2) para proporcionar 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-N-(R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il-benzamida (125 mg, 94%). ¹H-RMN (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 1.52-1.61 (m, 1 H), 1.68-1.89 (m, 5H), 1.91-2.02 (m, 1 H), 2.22 (s, 3H), 2.64-2.92 (m, 4H), 3.15-3.24 (m, 1 H), 3.99-4.04 (m, 1 H), 4.46-4.52 (m, 1 H), 5.19-5.38 (m, 3H), 6.50 (s, 1 H), 7.12-7.19 (m, 4H), 7.38 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.82 (s, 1 H), 8.71 (d, 1H). MS: m/z = 525 (M+1).

Ejemplo 2: Este ejemplo ilustra la preparación de N-metil-3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-N-(R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il-benzamida (Compuesto N.º I.o.001)

- 20 a) Preparación de N-metil-3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-N-(R)-1,2,3,4-tetrahidro-naftalen-1-il-benzamida (Compuesto N.º I.o.001)

A una solución de ácido 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}benzoico (320 mg, 0.80 mmol) en DMF (8 ml) se añadió diisopropiletilamina (1.01 ml, 4.85 mmol) y a continuación hexafluorofosfato de 2-(1H-7-azabenzotriazol-1-il)-1,1,3,3-tetrametiluronio metanaminio (0.41 g, 0.89 mmol) a TA. Después de agitar 15 min. a TA, se añadió metil-(R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il-amina (0.158 g, 0.80 mmol) a la mezcla de reacción. Después de agitar durante 2 h a TA, se evaporó el disolvente y el aceite marrón resultante se disolvió en acetato de etilo (20 ml), se lavó con una solución ac. sat. de bicarbonato de sodio (30 ml) y la fase acuosa se reextrajo con acetato de etilo (20 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con una solución 1M de HCl (50 ml) y salmuera (50 ml), se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se evaporaron a presión reducida. La mezcla cruda se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano de 1:1 a 8:2) para proporcionar N-metil-3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-N-(R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il-benzamida (200 mg, 46%). ¹H-RMN (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 1.45-1.59 (m, 1 H), 1.63-1.91 (m, 5H), 1.91-2.02 (m, 1 H), 2.22 (s, 3H), 2.61 (s, 3H), 2.64-2.92 (m, 4H), 3.15-3.24 (m, 1 H), 3.99-4.04 (m, 1 H), 4.46-4.52 (m, 1 H), 5.19-5.38 (m, 2H), 5.74-5.81 (m, 1 H), 6.50 (s, 1 H), 7.12-7.23 (m, 4H), 7.28-7.47 (m, 4H). MS: m/z = 539 (M+1).

- 35 Ejemplo 3: Este ejemplo ilustra la preparación de N-metil-3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometil-pirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-N-((R)-1-feniletil)benzamida (Compuesto N.º I.o.003)

a) Preparación de N-metil-3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-N-((R)-1-feniletil)benzamida (Compuesto N.º I.o.003)

40 A una solución de ácido 3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}benzoico (320 mg, 0.80 mmol) en DMF (8 ml) se añadió diisopropiletilamina (1.01 ml, 4.85 mmol) y a continuación hexafluorofosfato 2-(1H-7-azabenzotriazol-1-il)-1,1,3,3-tetrametiluronio metanaminio (0.41 g, 0.89 mmol) a TA. Después de agitar durante 15 min. a TA, se añadió metil-((R)-1-feniletil)amina (0.132 g, 0.80 mmol) a la mezcla de reacción. Después de agitar durante 2 h a TA, se evaporó el disolvente y el aceite marrón resultante se disolvió en acetato de etilo (20 ml), se lavó con una solución ac. sat. de bicarbonato de sodio (30 ml) y la fase acuosa se reextrajo con acetato de etilo (20 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con una solución 1M de HCl (50 ml) y salmuera (50 ml) se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se evaporaron a presión reducida. La mezcla cruda se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (acetato de etilo/ciclohexano de 1:1 a 8:2) para proporcionar N-metil-3-{1-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]piperidin-4-il}-N-((R)-1-feniletil)benzamida (170 mg, 41%). ¹H-RMN (400 MHz, d₆-DMSO): δ = 1.55 (d, 3H), 1.62-1.71 (m, 1 H), 1.82-1.89 (m, 2H), 1.99 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.54-2.73 (m, 3H), 2.81-2.90 (m, 1H), 3.12-3.21 (m, 1H), 3.99-4.04 (m, 1H), 4.46-4.52 (m, 1H), 5.19-5.38 (m, 2H), 6.50 (s, 1H), 7.12-7.41 (m, 9H). MS: m/z = 513 (M+1)

Ejemplo 4: Este ejemplo ilustra la preparación de la metil-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)amida del ácido 1'-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-6-carboxílico (Compuesto N.º I.q.005)

a) Preparación del éster 1'-tert-butílico y éster 6-etílico del ácido 3',6'-dihidro-2'H-[2,4']bipiridinil-6,1'-dicarboxílico

- 55 A una solución del éster etílico del ácido 6-bromopiridin-2-carboxílico (1 g, 4.35 mmol) en dioxano (40 ml) se añadieron sucesivamente bistrifenilfosfinpaladiolcloruro (0.152 g, 0.217 mmol), éster tert-butílico del ácido 4-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2)dioxaborolan-2-il)-(R)-3,6-dihidro-2'H-piridino-1-carboxílico² (1.61 g, 5.21 mmol) y una sol. ac. de carbonato de sodio

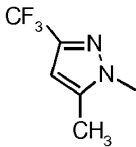
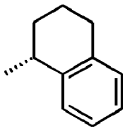
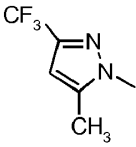
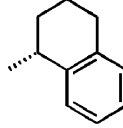
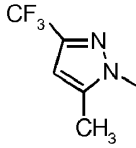
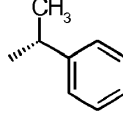
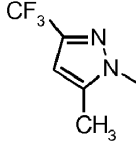
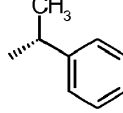
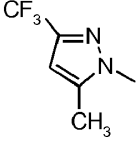
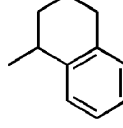
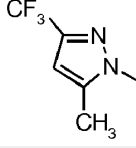
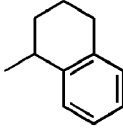
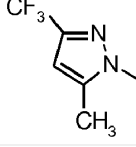
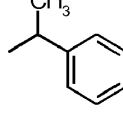
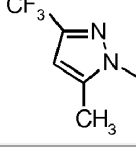
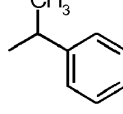
- (1.38 g en 10 ml de agua, 13.04 mmol) a TA. Después de agitar 3 h a 110 °C, el disolvente se evaporó y el aceite amarillo resultante se disolvió en acetato de etilo (30 ml) y se lavó con salmuera (30 ml). La fase orgánica se secó con sulfato de sodio, se filtró y se evaporó a presión reducida. La mezcla cruda se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (acetato de etilo/heptano de 0:1 a 3:7) para proporcionar el éster 1'-*tert*-butilico y éster 6-etílico del ácido 3',6'-dihidro-2'-*H*-[2,4']bipiridinil-6,1'-dicarboxílico (1.13 g, 78%). ¹H-RMN (400 MHz, *d*₆-DMSO): δ = 1.31-1.38 (t, 3H), 1.47 (s, 9H), 2.55-2.59 (m, 2H), 3.51-3.59 (m, 2H), 4.08-4.12 (m, 2H), 4.31-4.37 (c, 2H), 6.74 (m, 1 H), 7.75-7.79 (d, 1 H), 7.88-7.91 (m, 1 H), 7.92-7.99 (t, 1 H). MS: *m/z* = 333 (M+1).
- b) Preparación del éster 1'-*tert*-butilico y éster 6-etílico del ácido 3',4',5',6'-tetrahidro-2'-*H*-[2,4']bipiridinil-6,1'-dicarboxílico
- Una solución del éster 1'-*tert*-butilico y éster 6-etílico del ácido 3',6'-dihidro-2'-*H*-[2,4']bipiridinil-6,1'-dicarboxílico (1.12 g, 3.37 mmol) en etanol (67 ml) se hizo pasar a través un cartucho de Pd/C utilizando un aparato H-Cube (20 °C, 10 bar, 2 ml/min.). El disolvente se evaporó a continuación a presión reducida para proporcionar el éster 1'-*tert*-butilico y éster 6-etílico del ácido 3',4',5',6'-tetrahidro-2'-*H*-[2,4']bipiridinil-6,1'-dicarboxílico (1.001 g, 89%), que se puede utilizar en el siguiente paso sin una purificación adicional. ¹H-RMN (400 MHz, *d*₆-DMSO): δ = 1.31-1.38 (t, 3H), 1.47 (s, 9H), 1.55-1.65 (m, 2H), 1.79-1.88 (m, 2H), 2.91-2.99 (m, 2H), 3.42-3.48 (m, 1 H), 4.05-4.12 (m, 2H), 4.31-4.37 (c, 2H), 7.55 (d, 1 H), 7.84-7.92 (m, 2H). MS: *m/z* = 333 (M+1). MS: *m/z* = 335 (M+1).
- c) Preparación del éster 1'-*tert*-butilico del ácido 3',4',5',6'-tetrahidro-2'-*H*-[2,4']bipiridinil-6,1'-dicarboxílico
- A una solución del éster 1'-*tert*-butilico y éster 6-etílico del ácido 3',4',5',6'-tetrahidro-2'-*H*-[2,4']bipiridinil-6,1'-dicarboxílico (100 mg, 0.3 mmol) en metanol (5 ml) se añadió una solución ac. de hidróxido de sodio (2 M, 0.23 ml, 0.5 mmol) a TA. Después de agitar durante 4 h a TA, se eliminó el disolvente, el residuo se disolvió en THF (5 ml) y se añadió una solución ac. de hidróxido de litio (7 mg en 1 ml de agua) a TA. Después de agitar durante toda la noche a TA, se eliminó el disolvente y el residuo se disolvió en acetato de etilo (10 ml) y la mezcla de reacción se acidificó con una solución ac. 2M de HCl hasta pH 2-3. Después de la separación de las fases, la fase ac. se reextrajo con acetato de etilo (10 ml) y las fases orgánicas combinadas se lavaron con salmuera (10 ml), se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se evaporaron a presión reducida para proporcionar el éster 1'-*tert*-butilico del ácido 3',4',5',6'-tetrahidro-2'-*H*-[2,4']bipiridinil-6,1'-dicarboxílico (45 mg, 49 %), que se puede utilizar en el siguiente paso sin una purificación adicional. ¹H-RMN (400 MHz, *d*₆-DMSO): δ = 1.43 (s, 9H), 1.58-1.68 (m, 2H), 1.81-1.84 (m, 2H), 2.84-2.96 (m, 2H), 3.27-3.39 (m, 1 H), 4.07-4.10 (m, 2H), 7.52-7.54 (d, 1 H), 7.86-7.92 (m, 2H). MS: *m/z* = 329 (M+23).
- d) Preparación del éster *tert*-butilico del ácido 6-[metil-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)carbamoil]-3',4',5',6'-tetrahidro-2'-*H*-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico
- A una solución del éster 1'-*tert*-butilico del ácido 3',4',5',6'-tetrahidro-2'-*H*-[2,4']bipiridinil-6,1'-dicarboxílico (150 mg, 0.49 mmol), metil-(*R*)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilamina (0.079 g, 0.49 mmol) y diisopropiletilamina (0.50 ml, 0.49 mmol) en DMF (10 ml) se añadió gota a gota BOP (238 mg, 0.49 mmol) a TA. Después de agitar durante toda la noche a TA, la mezcla de reacción se vertió sobre agua (10 ml) y se extrajo con acetato de etilo (20 ml). La fase acuosa se reextrajo con acetato de etilo (20 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con una solución ac. sat. de bicarbonato de sodio (30 ml), una solución 1M de HCl (30 ml) y salmuera (30 ml), se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se evaporaron a presión reducida. La mezcla cruda se purificó mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice (acetato de etilo/hexano 4:1) para proporcionar el éster *tert*-butilico del ácido 6-[metil-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)carbamoil]-3',4',5',6'-tetrahidro-2'-*H*-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (215 mg, 97%). ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ = 1.47 (s, 9H), 1.64-2.05 (m, 8H), 2.18-2.22 (m, 1H), 2.72-2.81 (m, 4H), 2.82 (s, 3H), 4.15-4.25 (m, 2H), 5.15-5.20 (m, 1H), 7.18-7.25 (m, 5H), 7.53-7.71 (m, 1 H), 7.73-7.74 (m, 1 H).
- e) Preparación de la sal clorhídrica de la metil-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)amida del ácido 1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-6-carboxílico
- A una solución del éster *tert*-butilico del ácido 6-[metil-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)carbamoil]-3',4',5',6'-tetrahidro-2'-*H*-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (202 mg, 0.45 mmol) se añadió una solución 4M de HCl en dioxano (1.13 ml, 4.5 mmol) a TA. Después de agitar durante toda la noche a TA, se evaporó el disolvente a presión reducida para proporcionar la sal clorhídrica de la metil-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)amida del ácido 1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-6-carboxílico (162 mg, 93%). ¹H-RMN (400 MHz, *d*₆-DMSO): δ = 1.83-2.02 (m, 6H), 2.51 (s, 3H), 2.52-2.59 (m, 2H), 2.71-3.03 (m, 2H), 3.29-3.38 (m, 2H), 3.97-4.05 (m, 2H), 4.78-4.83 (m, 1H), 7.08-7.23 (m, 4H), 7.36-7.41 (m, 1H), 7.52-7.55 (m, 1H), 7.90-7.95 (m, 1H), 8.81 (a, 1 H), 9.04 (a, 1 H).
- f) Preparación de la metil-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)amida del ácido 1'-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-6-carboxílico (Compuesto N.º I.q.005)
- A una solución de ácido (5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acético (81 mg, 0.39 mmol), sal clorhídrica de la metil-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)amida del ácido 1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-6-carboxílico (150 mg, 0.39 mmol) y diisopropilamina (0.41 ml, 0.39 mmol) en DMF (10 ml) se añadió gota a gota BOP (191 mg, 0.39 mmol) a TA. Después de agitar durante toda la noche a TA, la mezcla de reacción se vertió sobre agua (10 ml) y se extrajo con acetato de etilo (20 ml). La fase acuosa se reextrajo con acetato de etilo (20 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavaron con una solución ac. sat. de bicarbonato de sodio (30 ml), una solución 1M de HCl (30 ml) y salmuera (30 ml), se secaron con sulfato de sodio, se filtraron y se evaporaron a presión reducida. La mezcla cruda se purificó mediante cromatografía en

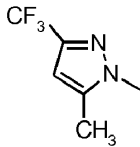
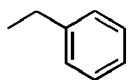
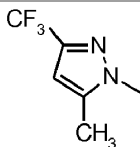
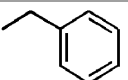
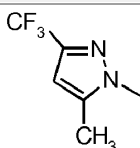
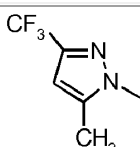
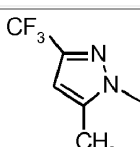
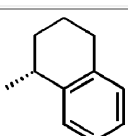
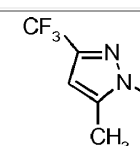
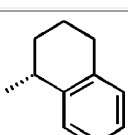
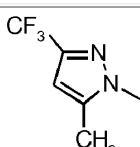
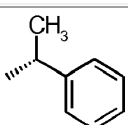
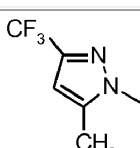
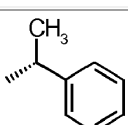
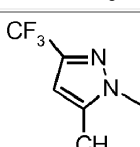
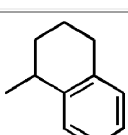
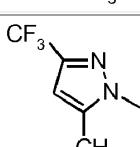
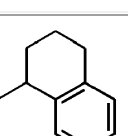
5

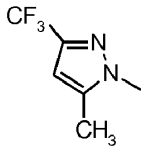
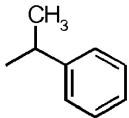
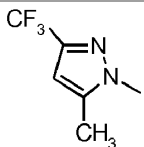
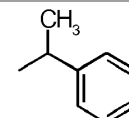
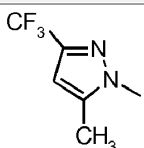
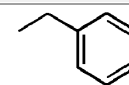
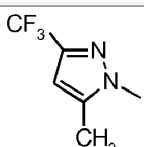
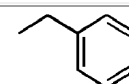
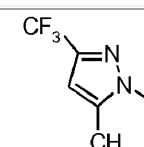
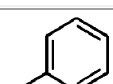
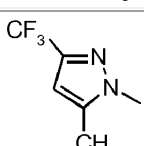
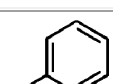
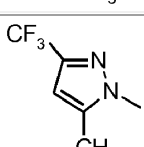
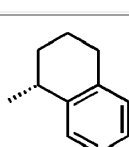
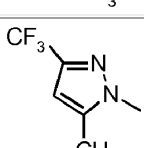
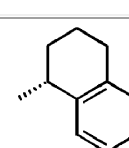
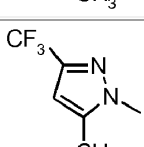
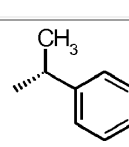
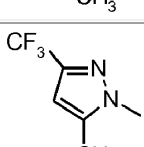
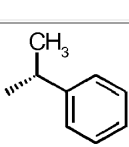
columna sobre gel de sílice (acetato de etilo) para proporcionar la metil-(1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-amida del ácido 1'-[2-(5-metil-3-trifluorometilpirazol-1-il)acetil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-6-carboxílico (150 mg, 71%). P.f. 62-65°C. ¹H-RMN (400 MHz, CDCl₃): δ = 1.67-2.02 (m, 6H), 2.18-2.22 (m, 1H), 2.30 (s, 3H), 2.71 (s, 3H), 2.72-2.75 (m, 2H), 3.17-3.27 (m, 2H), 3.97-4.05 (m, 2H), 4.58-4.78 (m, 2H), 4.96 (s, 2H), 5.05-5.15 (m, 1H), 6.33 (s, 1H), 7.10-7.24 (m, 4H), 7.28-7.32 (m, 1H), 7.57-7.58 (m, 1 H), 7.76-7.78 (m, 1 H).

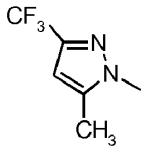
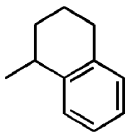
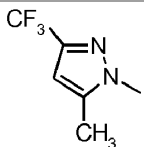
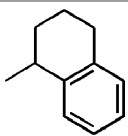
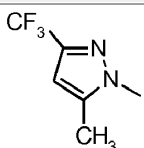
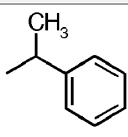
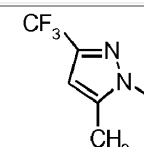
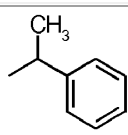
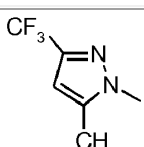
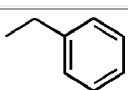
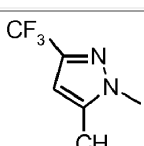
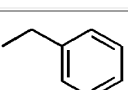
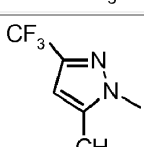
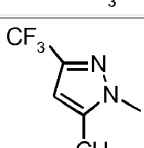
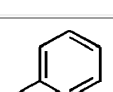
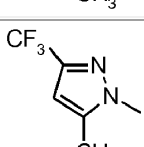
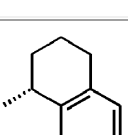
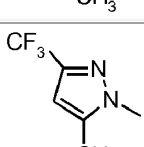
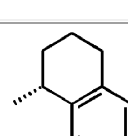
La Tabla 1 siguiente ilustra ejemplos de compuestos individuales de fórmula I de acuerdo con la invención.

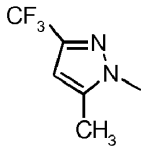
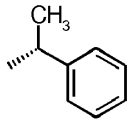
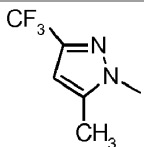
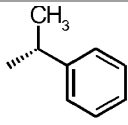
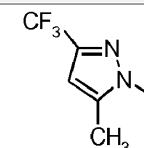
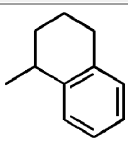
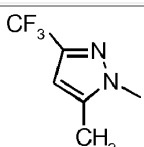
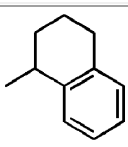
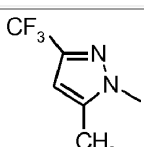
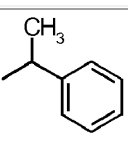
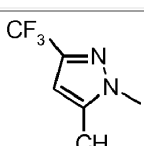
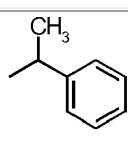
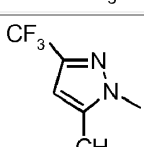
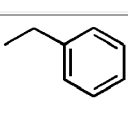
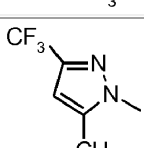
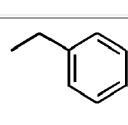
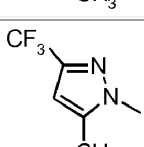
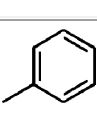
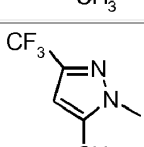
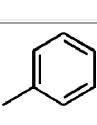
Tabla 1: compuestos individuales de fórmula I de acuerdo con la invención

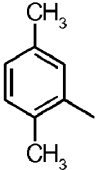
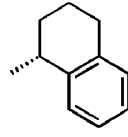
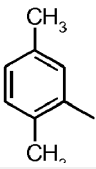
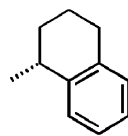
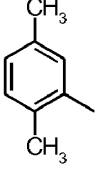
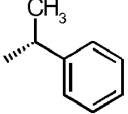
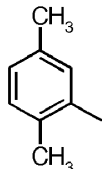
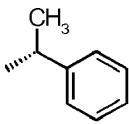
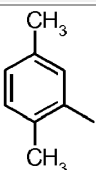
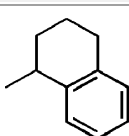
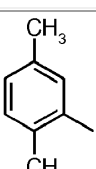
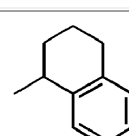
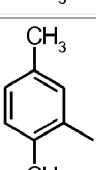
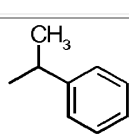
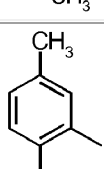
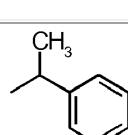
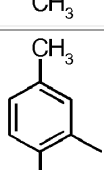
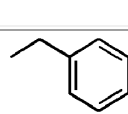
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
001		-CH ₂ C(=O)-	O	
002		-CH ₂ C(=O)-	S	
003		-CH ₂ C(=O)-	O	
004		-CH ₂ C(=O)-	S	
005		-CH ₂ C(=O)-	O	
006		-CH ₂ C(=O)-	S	
007		-CH ₂ C(=O)-	O	
008		-CH ₂ C(=O)-	S	

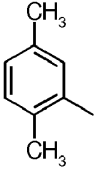
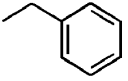
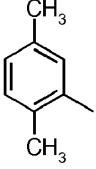
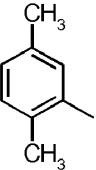
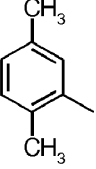
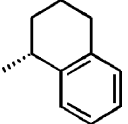
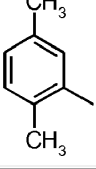
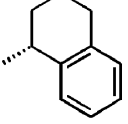
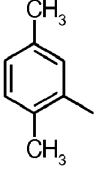
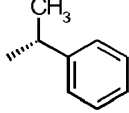
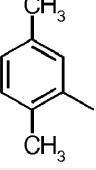
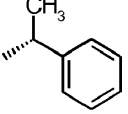
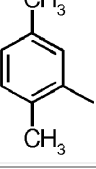
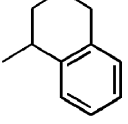
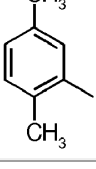
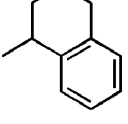
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
009		-CH ₂ C(=O)-	O	
010		-CH ₂ C(=O)-	S	
011		-CH ₂ C(=O)-	O	
012		-CH ₂ C(=O)-	S	
013		-CH ₂ C(=S)-	O	
014		-CH ₂ C(=S)-	S	
015		-CH ₂ C(=S)-	O	
016		-CH ₂ C(=S)-	S	
017		-CH ₂ C(=S)-	O	
018		-CH ₂ C(=S)-	S	

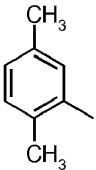
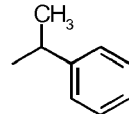
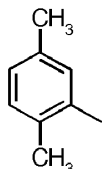
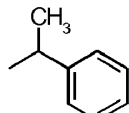
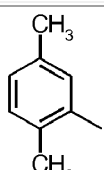
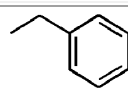
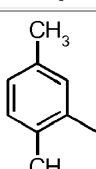
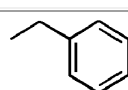
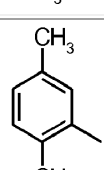
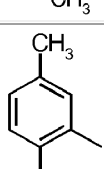
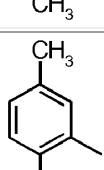
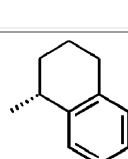
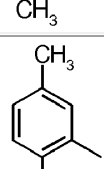
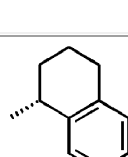
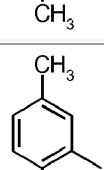
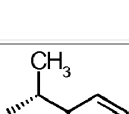
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
019		-CH ₂ C(=S)-	O	
020		-CH ₂ C(=S)-	S	
021		-CH ₂ C(=S)-	O	
022		-CH ₂ C(=S)-	S	
023		-CH ₂ C(=S)-	O	
024		-CH ₂ C(=S)-	S	
025		-OC(=O)-	O	
026		-OC(=O)-	S	
027		-OC(=O)-	O	
028		-OC(=O)-	S	

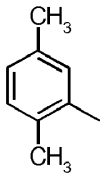
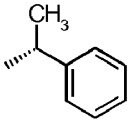
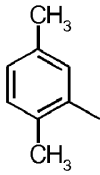
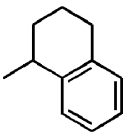
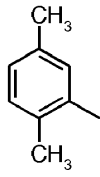
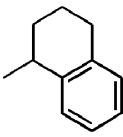
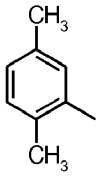
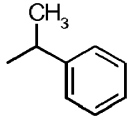
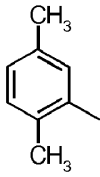
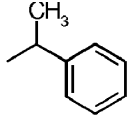
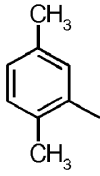
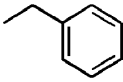
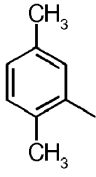
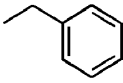
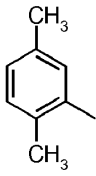
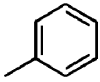
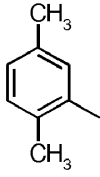
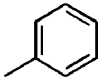
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
029		-OC(=O)-	O	
030		-OC(=O)-	S	
031		-OC(=O)-	O	
032		-OC(=O)-	S	
033		-OC(=O)-	O	
034		-OC(=O)-	S	
035		-OC(=O)-	O	
036		-OC(=O)-	S	
037		-CH ₂ SO ₂ -	O	
038		-CH ₂ SO ₂ -	S	

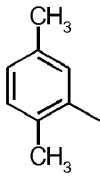
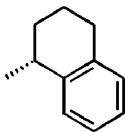
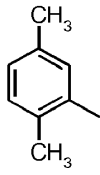
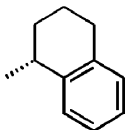
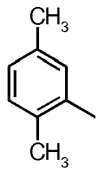
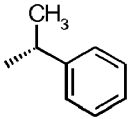
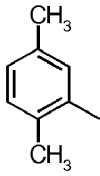
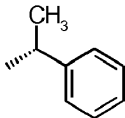
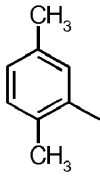
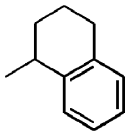
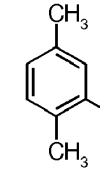
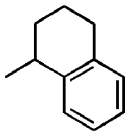
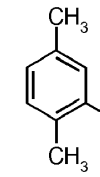
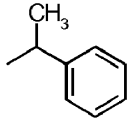
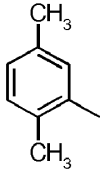
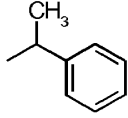
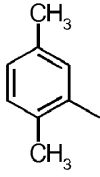
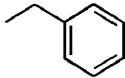
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
039		- CH ₂ SO ₂ -	O	
040		-CH ₂ SO ₂ -	S	
041		- CH ₂ SO ₂ -	O	
042		-CH ₂ SO ₂ -	S	
043		- CH ₂ SO ₂ -	O	
044		- CH ₂ SO ₂ -	S	
045		- CH ₂ SO ₂ -	O	
046		- CH ₂ SO ₂ -	S	
047		- CH ₂ SO ₂ -	O	
048		- CH ₂ SO ₂ -	S	

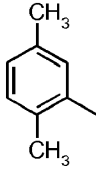
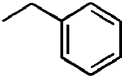
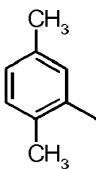
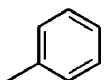
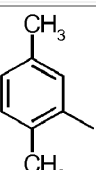
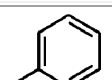
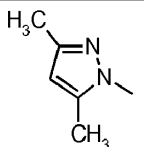
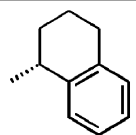
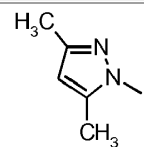
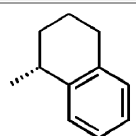
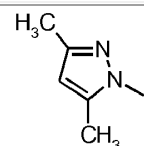
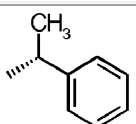
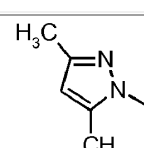
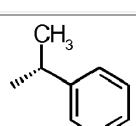
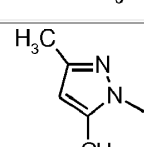
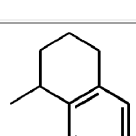
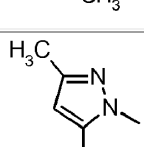
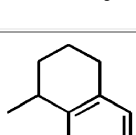
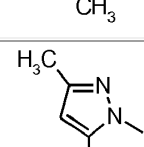
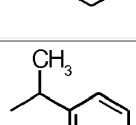
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
049		-CH ₂ C(=O)-	O	
050		-CH ₂ C(=O)-	S	
051		-CH ₂ C(=O)-	O	
052		-CH ₂ C(=O)-	S	
053		-CH ₂ C(=O)-	O	
054		-CH ₂ C(=O)-	S	
055		-CH ₂ C(=O)-	O	
056		-CH ₂ C(=O)-	S	
057		-CH ₂ C(=O)-	O	

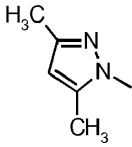
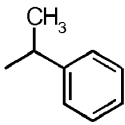
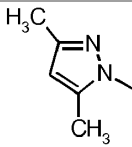
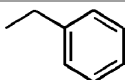
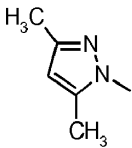
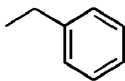
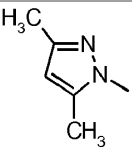
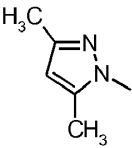
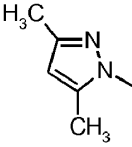
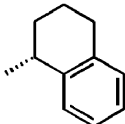
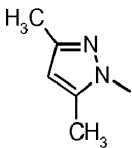
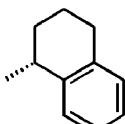
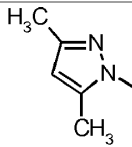
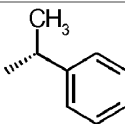
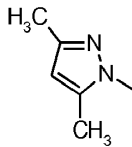
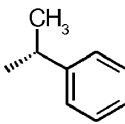
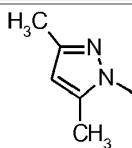
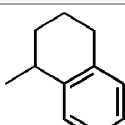
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
058		-CH ₂ C(=O)-	S	
059		-CH ₂ C(=O)-	O	
060		-CH ₂ C(=O)-	S	
061		-CH ₂ C(=S)-	O	
062		-CH ₂ C(=S)-	S	
063		-CH ₂ C(=S)-	O	
064		-CH ₂ C(=S)-	S	
065		-CH ₂ C(=S)-	O	
066		-CH ₂ C(=S)-	S	

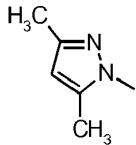
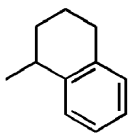
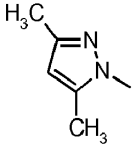
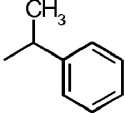
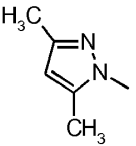
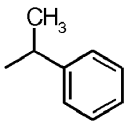
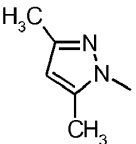
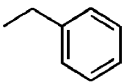
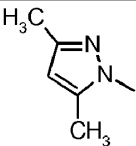
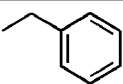
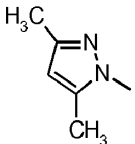
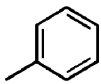
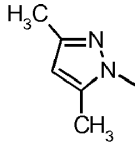
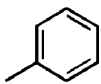
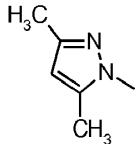
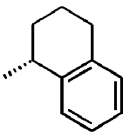
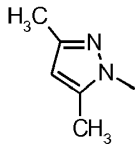
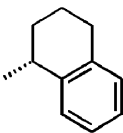
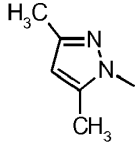
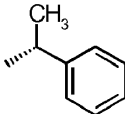
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
067		-CH ₂ C(=S)-	O	
068		-CH ₂ C(=S)-	S	
069		-CH ₂ C(=S)-	O	
070		-CH ₂ C(=S)-	S	
071		-CH ₂ C(=S)-	O	
072		-CH ₂ C(=S)-	S	
073		-OC(=O)-	O	
074		-OC(=O)-	S	
075		-OC(=O)-	O	

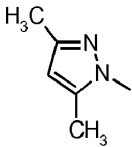
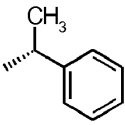
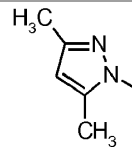
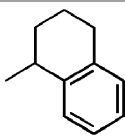
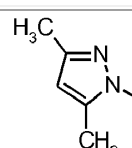
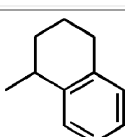
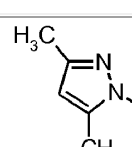
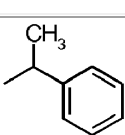
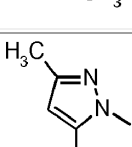
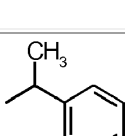
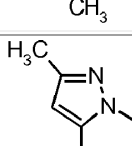
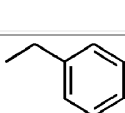
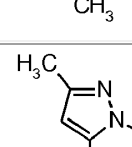
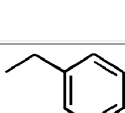
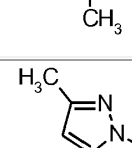
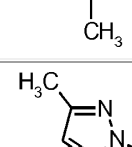
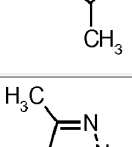
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
076		-OC(=O)-	S	
077		-OC(=O)-	O	
078		-OC(=O)-	S	
079		-OC(=O)-	O	
080		-OC(=O)-	S	
081		-OC(=O)-	O	
082		-OC(=O)-	S	
083		-OC(=O)-	O	
084		-OC(=O)-	S	

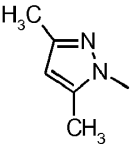
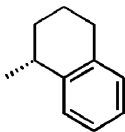
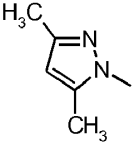
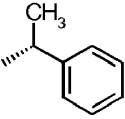
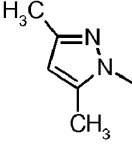
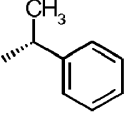
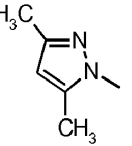
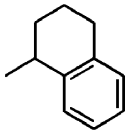
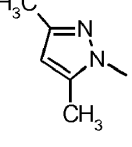
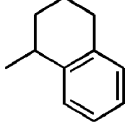
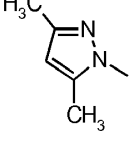
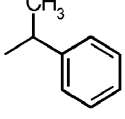
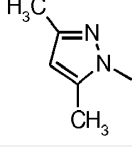
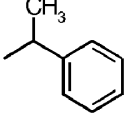
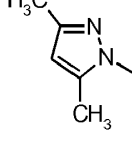
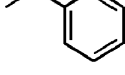
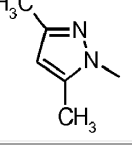
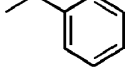
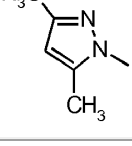
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
085		- CH ₂ SO ₂ -	O	
086		- CH ₂ SO ₂ -	S	
087		- CH ₂ SO ₂ -	O	
088		- CH ₂ SO ₂ -	S	
089		- CH ₂ SO ₂ -	O	
090		- CH ₂ SO ₂ -	S	
091		- CH ₂ SO ₂ -	O	
092		-CH ₂ SO ₂ -	S	
093		- CH ₂ SO ₂ -	O	

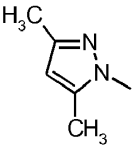
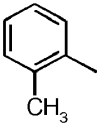
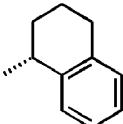
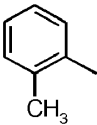
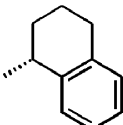
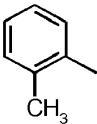
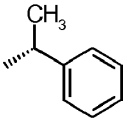
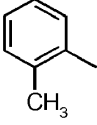
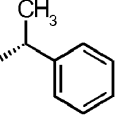
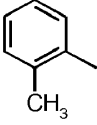
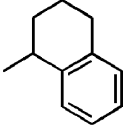
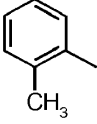
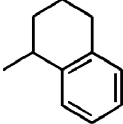
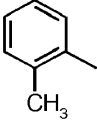
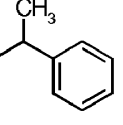
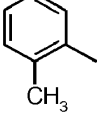
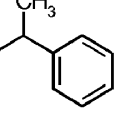
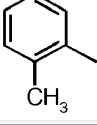
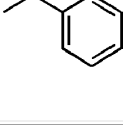
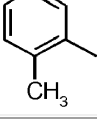
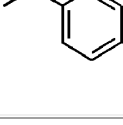
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
094		-CH ₂ SO ₂ -	S	
095		-CH ₂ SO ₂ -	O	
096		-CH ₂ SO ₂ -	S	
097		-CH ₂ C(=O)-	O	
098		-CH ₂ C(=O)-	S	
099		-CH ₂ C(=O)-	O	
100		-CH ₂ C(=O)-	S	
101		-CH ₂ C(=O)-	O	
102		-CH ₂ C(=O)-	S	
103		-CH ₂ C(=O)-	O	

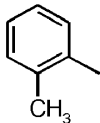
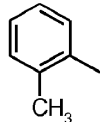
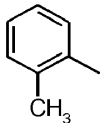
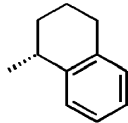
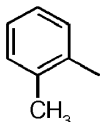
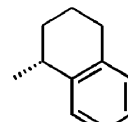
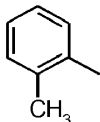
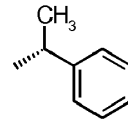
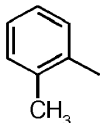
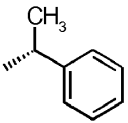
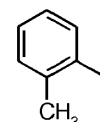
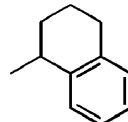
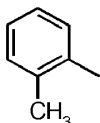
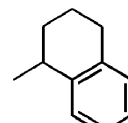
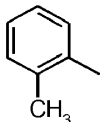
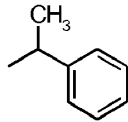
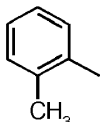
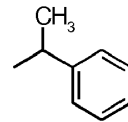
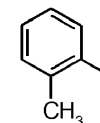
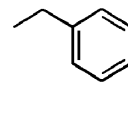
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
104		-CH ₂ C(=O)-	S	
105		-CH ₂ C(=O)-	O	
106		-CH ₂ C(=O)-	S	
107		-CH ₂ C(=O)-	O	
108		-CH ₂ C(=O)-	S	
109		-CH ₂ C(=S)-	O	
110		-CH ₂ C(=S)-	S	
111		-CH ₂ C(=S)-	O	
112		-CH ₂ C(=S)-	S	
113		-CH ₂ C(=S)-	O	

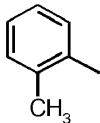
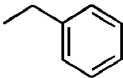
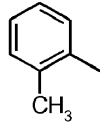
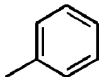
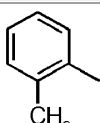
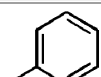
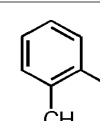
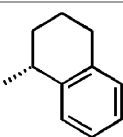
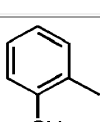
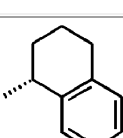
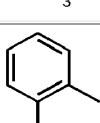
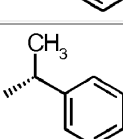
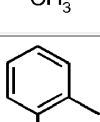
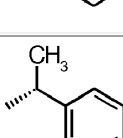
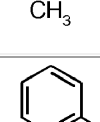
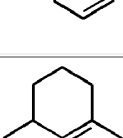
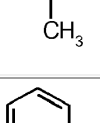
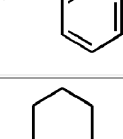
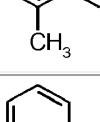
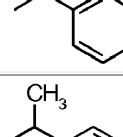
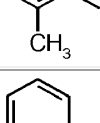
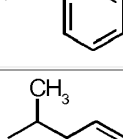
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
114		-CH ₂ C(=S)-	S	
115		-CH ₂ C(=S)-	O	
116		-CH ₂ C(=S)-	S	
117		-CH ₂ C(=S)-	O	
118		-CH ₂ C(=S)-	S	
119		-CH ₂ C(=S)-	O	
120		-CH ₂ C(=S)-	S	
121		-OC(=O)-	O	
122		-OC(=O)-	S	
123		-OC(=O)-	O	

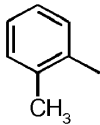
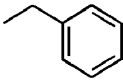
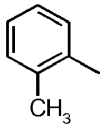
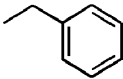
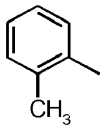
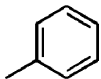
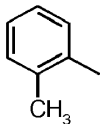
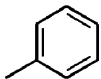
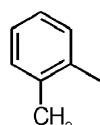
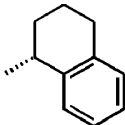
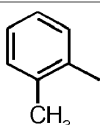
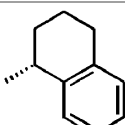
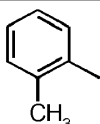
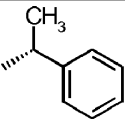
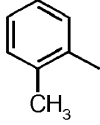
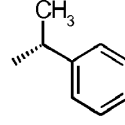
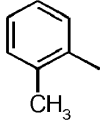
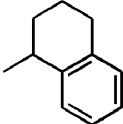
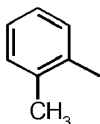
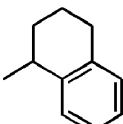
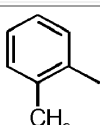
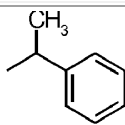
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
124		-OC(=O)-	S	
125		-OC(=O)-	O	
126		-OC(=O)-	S	
127		-OC(=O)-	O	
128		-OC(=O)-	S	
129		-OC(=O)-	O	
130		-OC(=O)-	S	
131		-OC(=O)-	O	
132		-OC(=O)-	S	
133		-CH ₂ SO ₂ -	O	

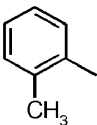
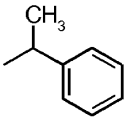
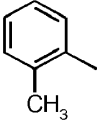
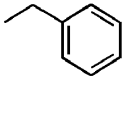
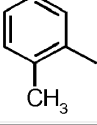
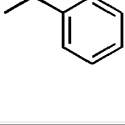
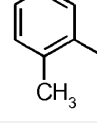
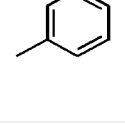
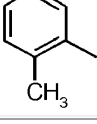
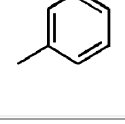
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
134		- CH ₂ SO ₂ -	S	
135		- CH ₂ SO ₂ -	O	
136		- CH ₂ SO ₂ -	S	
137		- CH ₂ SO ₂ -	O	
138		- CH ₂ SO ₂ -	S	
139		- CH ₂ SO ₂ -	O	
140		- CH ₂ SO ₂ -	S	
141		-CH ₂ SO ₂ -	O	
142		- CH ₂ SO ₂ -	S	
143		- CH ₂ SO ₂ -	O	

Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
144		-CH ₂ SO ₂ -	S	
145		-CH ₂ C(=O)-	O	
146		-CH ₂ C(=O)-	S	
147		-CH ₂ C(=O)-	O	
148		-CH ₂ C(=O)-	S	
149		-CH ₂ C(=O)-	O	
150		-CH ₂ C(=O)-	S	
151		-CH ₂ C(=O)-	O	
152		-CH ₂ C(=O)-	S	
153		-CH ₂ C(=O)-	O	
154		-CH ₂ C(=O)-	S	

Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
155		-CH ₂ C(=O)-	O	
156		-CH ₂ C(=O)-	S	
157		-CH ₂ C(=S)-	O	
158		-CH ₂ C(=S)-	S	
159		-CH ₂ C(=S)-	O	
160		-CH ₂ C(=S)-	S	
161		-CH ₂ C(=S)-	O	
162		-CH ₂ C(=S)-	S	
163		-CH ₂ C(=S)-	O	
164		-CH ₂ C(=S)-	S	
165		-CH ₂ C(=S)-	O	

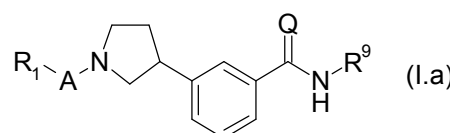
Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
166		-CH ₂ C(=S)-	S	
167		-CH ₂ C(=S)-	O	
168		-CH ₂ C(=S)-	S	
169		-OC(=O)-	O	
170		-OC(=O)-	S	
171		-OC(=O)-	O	
172		-OC(=O)-	S	
173		-OC(=O)-	O	
174		-OC(=O)-	S	
175		-OC(=O)-	O	
176		-OC(=O)-	S	

Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
177		-OC(=O)-	O	
178		-OC(=O)-	S	
179		-OC(=O)-	O	
180		-OC(=O)-	S	
181		-CH ₂ SO ₂ -	O	
182		- CH ₂ SO ₂ -	S	
183		- CH ₂ SO ₂ -	O	
184		- CH ₂ SO ₂ -	S	
185		- CH ₂ SO ₂ -	O	
186		-CH ₂ SO ₂ -	S	
187		- CH ₂ SO ₂ -	O	

Compuesto N.º	R ¹	A	Q	R ⁹
188		- CH ₂ SO ₂ -	S	
189		- CH ₂ SO ₂ -	O	
190		- CH ₂ SO ₂ -	S	
191		- CH ₂ SO ₂ -	O	
192		- CH ₂ SO ₂ -	S	

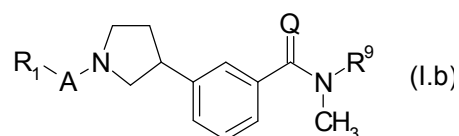
donde

a) 192 compuestos de fórmula (I.a):



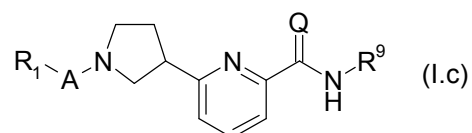
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

5 b) 192 compuestos de fórmula (I.b):



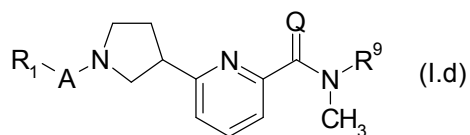
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

c) 192 compuestos de fórmula (I.c):



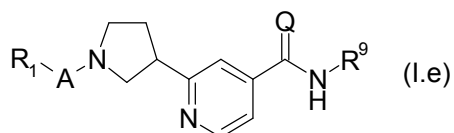
10 donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

d) 192 compuestos de fórmula (I.d):



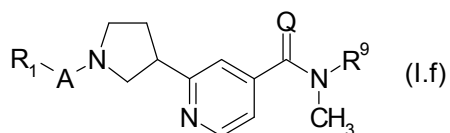
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

e) 192 compuestos de fórmula (I.e):



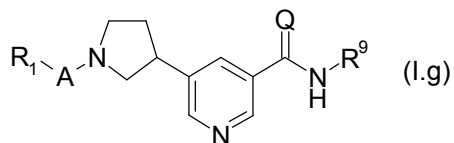
5 donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

f) 192 compuestos de fórmula (I.f):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

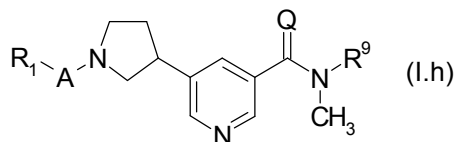
g) 192 compuestos de fórmula (I.g):



10

donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

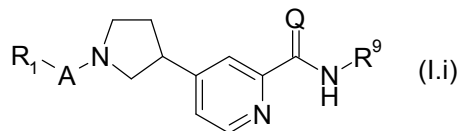
h) 192 compuestos de fórmula (I.h):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

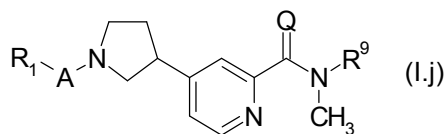
15

i) 192 compuestos de fórmula (I.i):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

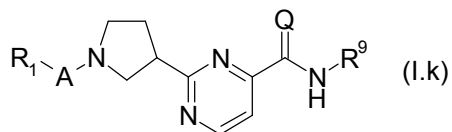
j) 192 compuestos de fórmula (I.j):



20

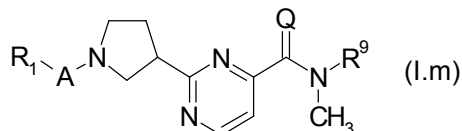
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

k) 192 compuestos de fórmula (I.k):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

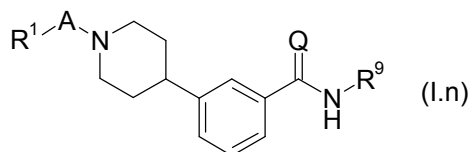
m) 192 compuestos de fórmula (I.m):



5

donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

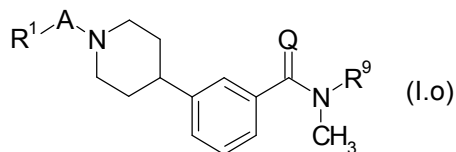
n) 192 compuestos de fórmula (I.n):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

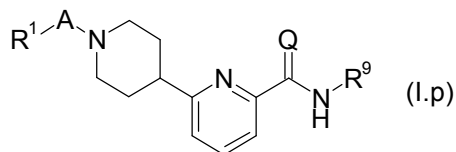
10

o) 192 compuestos de fórmula (I.o):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

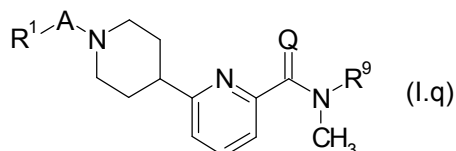
p) 192 compuestos de fórmula (I.p):



15

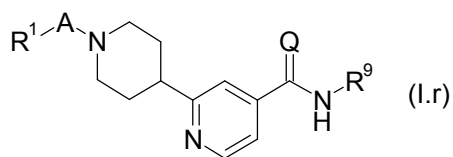
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

q) 192 compuestos de fórmula (I.q):



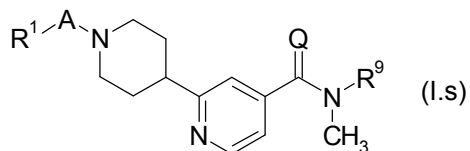
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

r) 192 compuestos de fórmula (I.r):



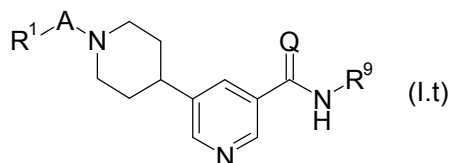
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

s) 192 compuestos de fórmula (I.s):



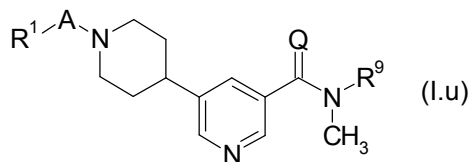
5 donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

t) 192 compuestos de fórmula (I.t):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

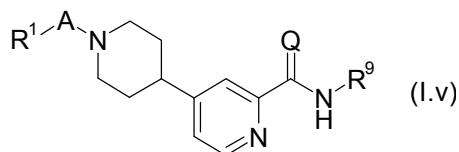
u) 192 compuestos de fórmula (I.u):



10

donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

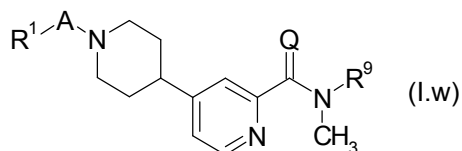
v) 192 compuestos de fórmula (I.v):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

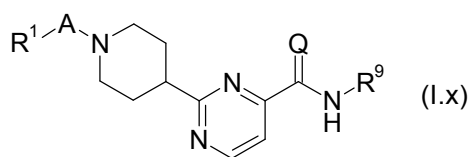
15

w) 192 compuestos de fórmula (I.w):



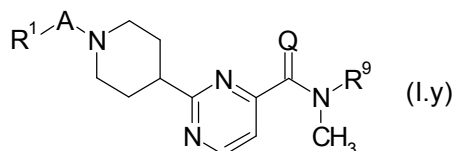
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

x) 192 compuestos de fórmula (I.x):



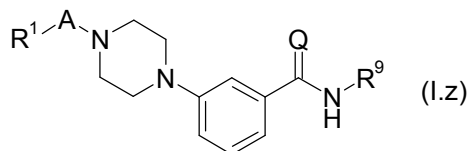
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

y) 192 compuestos de fórmula (I.y):



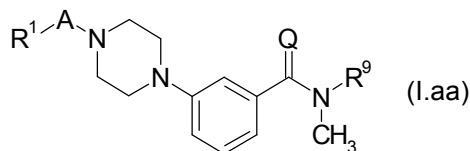
5 donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

z) 192 compuestos de fórmula (I.z):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

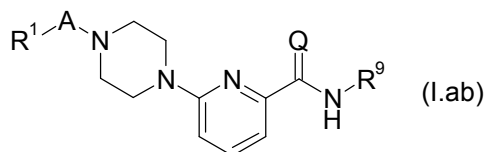
aa) 192 compuestos de fórmula (I.aa):



10

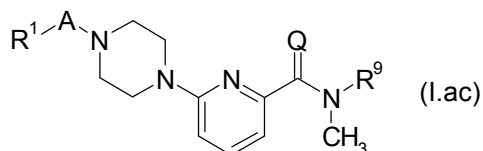
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

ab) 192 compuestos de fórmula (I.ab):



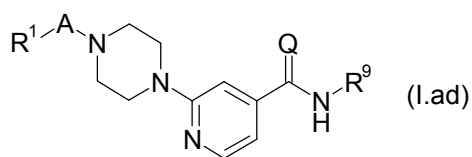
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

15 ac) 192 compuestos de fórmula (I.ac):



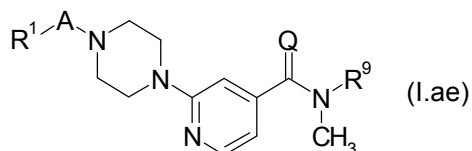
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

ad) 192 compuestos de fórmula (I.ad):



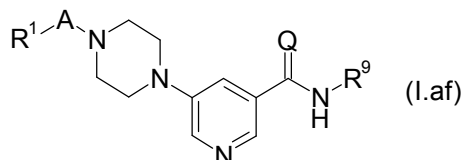
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

ae) 192 compuestos de fórmula (I.ae):



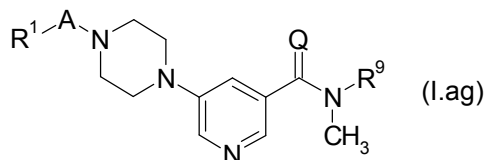
5 donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

af) 192 compuestos de fórmula (I.af):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

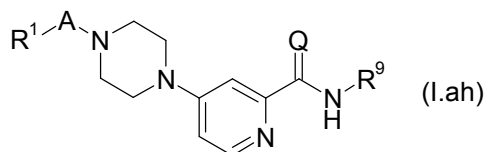
ag) 192 compuestos de fórmula (I.ag):



10

donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

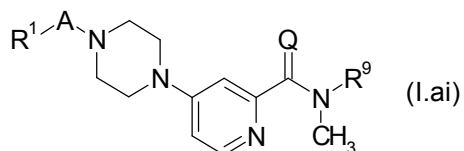
ah) 192 compuestos de fórmula (I.ah):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

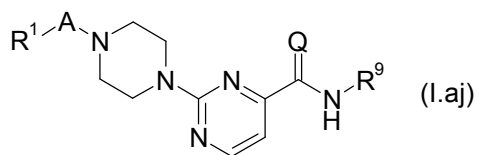
15

ai) 192 compuestos de fórmula (I.ai):



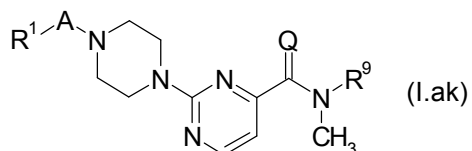
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

aj) 192 compuestos de fórmula (I.aj):



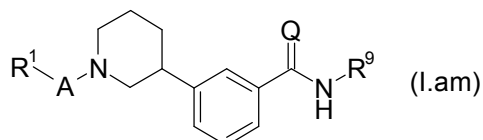
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

ak) 192 compuestos de fórmula (I.ak):



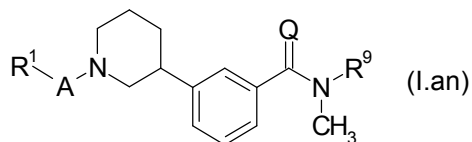
5 donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

am) 192 compuestos de fórmula (I.am):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

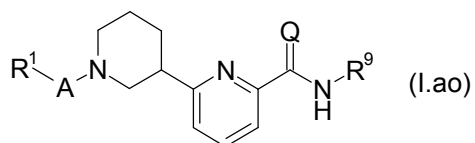
an) 192 compuestos de fórmula (I.an):



10

donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

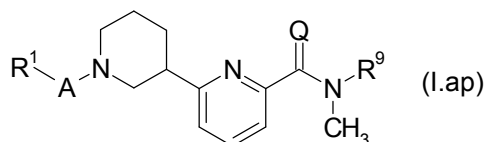
ao) 192 compuestos de fórmula (I.ao):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

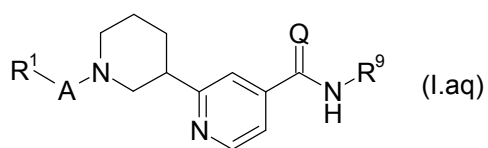
15

ap) 192 compuestos de fórmula (I.ap):



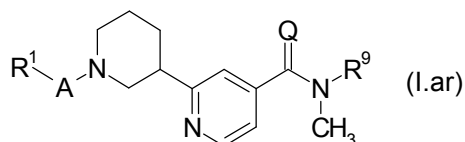
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

aq) 192 compuestos de fórmula (I.aq):



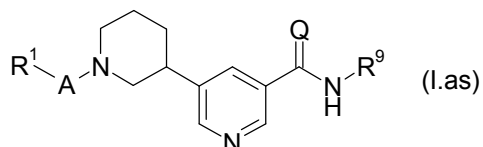
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

ar) 192 compuestos de fórmula (I.ar):



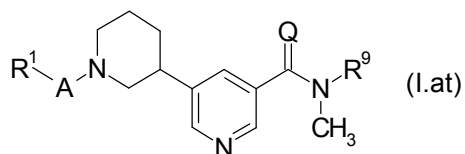
5 donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

as) 192 compuestos de fórmula (I.as):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

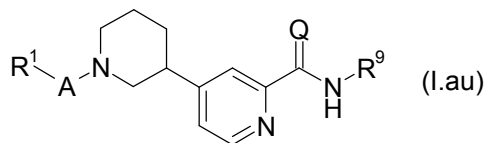
at) 192 compuestos de fórmula (I.at):



10

donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

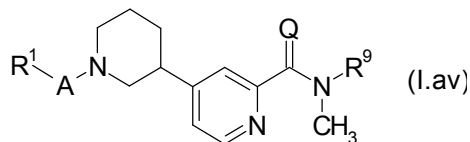
au) 192 compuestos de fórmula (I.au):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

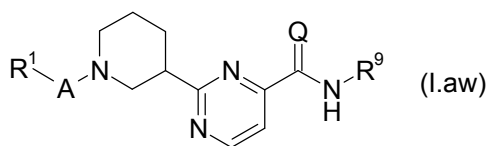
15

av) 192 compuestos de fórmula (I.av):



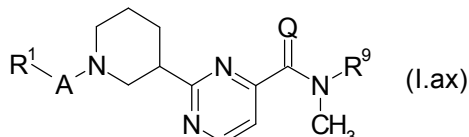
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

aw) 192 compuestos de fórmula (I.aw):



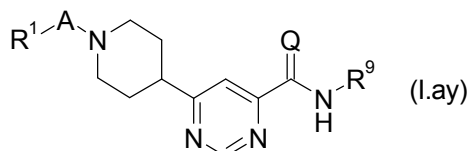
donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

ax) 192 compuestos de fórmula (I.ax):



5 donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

ay) 192 compuestos de fórmula (I.ay):



donde A, Q, R¹ y R⁹ son como se han definido en la Tabla 1.

10 En toda esta descripción, las temperaturas se proporcionan en grados Celsius y "p.f." quiere decir punto de fusión. LC/MS quiere decir cromatografía líquida/espectroscopía de masas, y la descripción del equipo y el método es: (HP 1100 HPLC de Agilent, Phenomenex Gemini C18, tamaño de partícula 3 µm, columna 110 Angström, 30 x 3 mm, 1.7 ml/min, 60 °C, H₂O + 0.05% de HCOOH (95%)/CH₃CN/MeOH 4:1 + 0.04% de HCOOH (5%) – 2 min – CH₃CN/MeOH 4:1 + 0.04% de HCOOH (5%) – 0.8 min., espectrómetro de masas ZQ de Waters, método de ionización: electrospray (ESI), polaridad: iones positivos, capilaridad (kV): 3.00, cono (V): 30.00, extractor (V): 2.00, temperatura de la fuente (°C): 100, temperatura de desolvatación (°C): 250, flujo de gas de cono (l/h): 50, flujo de gas de desolvatación (l/h): 400).

15

Tabla 2: Punto de fusión y datos de LC/MS para los compuestos de la Tabla 1

Compuesto N.º	Punto de fusión (°C)	LC/MS
I.n.001		t _R = 1.97 min. ; MS: m/z = 525 (M+1)
I.n.003	215-217	
I.n.005		t _R = 1.96 min. ; MS: m/z = 525 (M+1)
I.n.009		t _R = 3.46 min. ; MS: m/z = 485 (M+1)
I.n.011		t _R = 1.85 min. ; MS: m/z = 471 (M+1)
I.n.049		t _R = 2.08 min. ; MS: m/z = 481 (M+1)
I.n.073		t _R = 2.17 min. ; MS: m/z = 483 (M+1)
I.n.085		t _R = 2.12 min. ; MS: m/z = 517 (M+1)
I.n.097		t _R = 1.80 min. ; MS: m/z = 471 (M+1)
I.n.169		t _R = 2.11 min. ; MS: m/z = 469 (M+1)
I.o.001		t _R = 2.03 min. ; MS: m/z = 539 (M+1)
I.o.003		t _R = 1.95 min. ; MS: m/z = 513 (M+1)
I.o.009		t _R = 1.88 min. ; MS: m/z = 499 (M+1)
I.p.001		t _R = 1.97 min. ; MS: m/z = 526 (M+1)
I.p.003		t _R = 1.92 min. ; MS: m/z = 500 (M+1)

Compuesto N.º	Punto de fusión (°C)	LC/MS
I.p.005		t _R = 2.01 min. ; MS: m/z = 526 (M+1)
I.p.009		t _R = 1.87 min. ; MS: m/z = 486 (M+1)
I.p.011		t _R = 1.92 min. ; MS: m/z = 472 (M+1)
I.p.049		t _R = 2.09 min. ; MS: m/z = 482 (M+1)
I.p.073		t _R = 2.18 min. ; MS: m/z = 484 (M+1)
I.p.085		t _R = 2.14 min. ; MS: m/z = 518 (M+1)
I.p.097		t _R = 1.82 min. ; MS: m/z = 472 (M+1)
I.q.001		t _R = 1.94 min. ; MS: m/z = 540 (M+1)
I.q.005	62-65	
I.z.001	210	
I.z.005		t _R = 1.91 min. ; MS: m/z = 526 (M+1)
I.z.011		t _R = 1.78 min. ; MS: m/z = 472 (M+1)
I.z.073	183-185	
I.z.085	186-189	
I.aa.001		t _R = 1.98 min. ; MS: m/z = 540 (M+1)
I.aa.011		t _R = 1.79 min. ; MS: m/z = 486 (M+1)
I.v.001		t _R = 2.02 min. ; MS: m/z = 526 (M+1)
I.w.001		t _R = 1.88 min. ; MS: m/z = 540 (M+1)
I.r.001		t _R = 1.84min. ; MS: m/z = 526 (M+1)
I.ay.001		t _R = 1.99 min. ; MS: m/z = 527 (M+1)
I.aw.001		t _R = 1.94min. ; MS: m/z = 527 (M+1)
I.t.001	140	
I.u.001		t _R = 1.85 min. ; MS: m/z = 540 (M+1)

Los compuestos de acuerdo con la presente invención se pueden preparar de acuerdo con los esquemas de reacción mencionados anteriormente, en los que, a menos que se indique lo contrario, la definición de cada variable es según se ha definido anteriormente para un compuesto de fórmula (I).

Ejemplos biológicos

5 *Phytophthora infestans* / tomate / prevención en discos de hoja (añublo tardío del tomate)

10 Se colocan discos de hoja de tomate en agar-agua en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizan con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Los discos de hoja se inoculan con una suspensión de esporas del hongo 1 día después de la aplicación. Los discos de hoja inoculados se incuban a 16 °C y un 75% de HR con un régimen de luz que consiste en 24 h de oscuridad seguidas de 12 h de luz / 12 h de oscuridad en una cámara climática, y la actividad de un compuesto se determina como el porcentaje de control de la enfermedad en comparación con los discos de hoja no tratados cuando se observa un nivel adecuado de daños debidos a la enfermedad en discos de hoja de control no tratados (5 – 7 días después de la aplicación).

15 Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.n.011, I.n.049, I.n.097, I.t.001, I.v.001, I.z.001 y I.z.005 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Phytophthora infestans / papa / prevención (añublo tardío de la papa)

20 Se pulverizan plantas de papa cv. Bintje de 2 semanas en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo se inoculan pulverizándolas con una suspensión de esporangios 2 días después de la aplicación. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 18 °C con 14 h de luz/día y un 100% de HR en una cámara de crecimiento y el porcentaje del área de hoja afectada por la enfermedad se determina cuando se observa un nivel adecuado de la enfermedad en plantas de control no tratadas (5 – 7 días después de la aplicación).

Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.n.049, I.v.001, I.z.001 y I.z.0051 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Phytophthora infestans / papa / duración prolongada (añublo tardío de la papa)

- 5 Se pulverizan plantas de papa cv. Bintje de dos semanas en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo se inoculan pulverizándolas con una suspensión de esporangios 6 días después de la aplicación. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 18 °C con 14 h de luz/día y un 100% de HR en una cámara de crecimiento y el porcentaje del área de hoja afectada por la enfermedad se determina cuando se observa un nivel adecuado de la enfermedad en plantas de control no tratadas (9 – 11 días después de la aplicación).
- 10 Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.097, I.t.001, I.v.001, I.z.001 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Phytophthora infestans / papa / curación (añublo tardío de la papa)

- 15 Se inoculan plantas de papa cv. Bintje de 2 semanas pulverizándolas con una suspensión de esporangios un día antes de la aplicación. Las plantas inoculadas se pulverizan en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 18 °C con 14 h de luz/día y un 100% de HR en una cámara de crecimiento y el porcentaje del área de hoja afectada por la enfermedad se determina cuando se observa un nivel adecuado de la enfermedad en plantas de control no tratadas (3 – 4 días después de la aplicación).
- 20 Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.v.001, I.z.001 y I.z.005 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Plasmopara viticola / uva / prevención en discos de hoja (mildiu lanudo de la uva)

- 25 Se colocan discos de hoja de vid en agar-agua en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizan con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Los discos de hoja se inoculan con una suspensión de esporas del hongo 1 día después de la aplicación. Los discos de hoja inoculados se incuban a 19 °C y un 80% de HR con un régimen de luz que consiste en 12 h de luz / 12 h de oscuridad en una cámara climática, y la actividad de un compuesto se determina como el porcentaje de control de la enfermedad en comparación con los discos de hoja no tratados cuando se observa un nivel adecuado de daños debidos a la enfermedad en discos de hoja de control no tratados (6 – 8 días después de la aplicación).
- 30 Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.n.011, I.n.049, I.n.097, I.t.001, I.v.001, I.z.001 y I.z.005 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Plasmopara viticola / uva / prevención (mildiu lanudo de la uva)

- 35 Se pulverizan plántulas de uva cv. Gutedel de 5 semanas en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo se inoculan pulverizando una suspensión de esporangios sobre la superficie inferior de las hojas un día después de la aplicación. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 22 °C y un 100% de HR en un invernadero, y el porcentaje del área de hoja afectada por la enfermedad se determina cuando se observa un nivel adecuado de la enfermedad en plantas de control no tratadas (6 – 8 días después de la aplicación).
- 40 Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.n.011, I.v.001, I.z.001 y I.z.005 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Plasmopara viticola / uva / duración prolongada (mildiu lanudo de la uva)

- 45 Se pulverizan plántulas de uva cv. Gutedel de 5 semanas en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo se inoculan pulverizando una suspensión de esporangios sobre la superficie inferior de las hojas 6 días después de la aplicación. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 22 °C y un 100% de HR en un invernadero, y el porcentaje del área de hoja afectada por la enfermedad se determina cuando se observa un nivel adecuado de la enfermedad en plantas de control no tratadas (11 – 13 días después de la aplicación).
- 50 Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.t.001, I.v.001, I.z.001 y I.z.005 proporcionan al menos un 80% de control de los discos de hoja a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Plasmopara viticola / uva / curación (mildiu lanudo de la uva)

5 Se inoculan plántulas de uva cv. Gutedel de 5 semanas pulverizando una suspensión de esporangios sobre la superficie inferior de las hojas un día antes de la aplicación. Las plantas de uva inoculadas se pulverizan en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 22 °C y un 100% de HR en un invernadero, y el porcentaje del área de hoja afectada por la enfermedad se determina cuando se observa un nivel adecuado de la enfermedad en plantas de control no tratadas (4 – 6 días después de la aplicación).

Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.n.049, I.v.001 y I.z.001 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

I.p.003		$t_R = 1.92 \text{ min. ; MS: } m/z = 500 \text{ (M+1)}$
I.p.005		$t_R = 2.01 \text{ min. ; MS: } m/z = 526 \text{ (M+1)}$
I.p.009		$t_R = 1.87 \text{ min. ; MS: } m/z = 486 \text{ (M+1)}$
I.p.011		$t_R = 1.92 \text{ min. ; MS: } m/z = 472 \text{ (M+1)}$
I.p.049		$t_R = 2.09 \text{ min. ; MS: } m/z = 482 \text{ (M+1)}$
I.p.073		$t_R = 2.18 \text{ min. ; MS: } m/z = 484 \text{ (M+1)}$
I.p.085		$t_R = 2.14 \text{ min. ; MS: } m/z = 518 \text{ (M+1)}$
I.p.097		$t_R = 1.82 \text{ min. ; MS: } m/z = 472 \text{ (M+1)}$
I.q.001		$t_R = 1.94 \text{ min. ; MS: } m/z = 540 \text{ (M+1)}$
I.q.005	62-65	
I.z.001	210	
I.z.005		$t_R = 1.91 \text{ min. ; MS: } m/z = 526 \text{ (M+1)}$
I.z.011		$t_R = 1.78 \text{ min. ; MS: } m/z = 472 \text{ (M+1)}$
I.z.073	183-185	
I.z.085	186-189	
I.aa.001		$t_R = 1.98 \text{ min. ; MS: } m/z = 540 \text{ (M+1)}$
I.aa.011		$t_R = 1.79 \text{ min. ; MS: } m/z = 486 \text{ (M+1)}$
I.v.001		$t_R = 2.02 \text{ min. ; MS: } m/z = 526 \text{ (M+1)}$
I.w.001		$t_R = 1.88 \text{ min. ; MS: } m/z = 540 \text{ (M+1)}$
I.r.001		$t_R = 1.84 \text{ min. ; MS: } m/z = 526 \text{ (M+1)}$
I.ay.001		$t_R = 1.99 \text{ min. ; MS: } m/z = 527 \text{ (M+1)}$
I.aw.001		$t_R = 1.94 \text{ min. ; MS: } m/z = 527 \text{ (M+1)}$
I.t.001	140	
I.u.001		$t_R = 1.85 \text{ min. ; MS: } m/z = 540 \text{ (M+1)}$

10 Ejemplos biológicos

Phytophthora infestans / tomate / prevención en discos de hoja (añublo tardío del tomate)

15 Se colocan discos de hoja de tomate en agar-agua en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizan con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Los discos de hoja se inoculan con una suspensión de esporas del hongo 1 día después de la aplicación. Los discos de hoja inoculados se incuban a 16 °C y un 75% de HR con un régimen de luz que consiste en 24 h de oscuridad seguidas de 12 h de luz / 12 h de oscuridad en una cámara climática, y la actividad de un compuesto se determina como el porcentaje de control de la enfermedad en comparación con los discos de hoja no tratados cuando se observa un nivel adecuado de daños debidos a la enfermedad en discos de hoja de control no tratados (5 – 7 días después de la aplicación).

20 Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.n.011, I.n.049, I.n.097, I.t.001, I.v.001, I.z.001 y I.z.005 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Phytophthora infestans / papa / prevención (añublo tardío de la papa)

- Se pulverizan plantas de papa cv. Bintje de 2 semanas en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo se inoculan pulverizándolas con una suspensión de esporangios 2 días después de la aplicación. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 18 °C con 14 h de luz/día y un 100% de HR en una cámara de crecimiento y el porcentaje del área de hoja afectada por la enfermedad se determina cuando se observa un nivel adecuado de la enfermedad en plantas de control no tratadas (5 – 7 días después de la aplicación).

Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.n.049, I.v.001, I.z.001 y I.z.005 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Phytophthora infestans / papa / duración prolongada (añublo tardío de la papa)

- Se pulverizan plantas de papa cv. Bintje de dos semanas en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo se inoculan pulverizándolas con una suspensión de esporangios 6 días después de la aplicación. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 18 °C con 14 h de luz/día y un 100% de HR en una cámara de crecimiento y el porcentaje del área de hoja afectada por la enfermedad se determina cuando se observa un nivel adecuado de la enfermedad en plantas de control no tratadas (9 – 11 días después de la aplicación).
- Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.097, I.t.001, I.v.001, I.z.005 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Phytophthora infestans / papa / curación (añublo tardío de la papa)

- Se inoculan plantas de papa cv. Bintje de 2 semanas pulverizándolas con una suspensión de esporangios un día antes de la aplicación. Las plantas inoculadas se pulverizan en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 18 °C con 14 h de luz/día y un 100% de HR en una cámara de crecimiento y el porcentaje del área de hoja afectada por la enfermedad se determina cuando se observa un nivel adecuado de la enfermedad en plantas de control no tratadas (3 – 4 días después de la aplicación).
- Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.v.001, I.z.001 y I.z.005 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Plasmopara viticola / uva / prevención en discos de hoja (mildiu lanudo de la uva)

- Se colocan discos de hoja de vid en agar-agua en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizan con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Los discos de hoja se inoculan con una suspensión de esporas del hongo 1 día después de la aplicación. Los discos de hoja inoculados se incuban a 19 °C y un 80% de HR con un régimen de luz que consiste en 12 h de luz / 12 h de oscuridad en una cámara climática, y la actividad de un compuesto se determina como el porcentaje de control de la enfermedad en comparación con los discos de hoja no tratados cuando se observa un nivel adecuado de daños debidos a la enfermedad en discos de hoja de control no tratados (6 – 8 días después de la aplicación).
- Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.n.011, I.n.049, I.n.097, I.t.001, I.v.001, I.z.001 y I.z.005 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Plasmopara viticola / uva / prevención (mildiu lanudo de la uva)

- Se pulverizan plántulas de uva cv. Gutedel de 5 semanas en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo se inoculan pulverizando una suspensión de esporangios sobre la superficie inferior de las hojas un día después de la aplicación. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 22 °C y un 100% de HR en un invernadero, y el porcentaje del área de hoja afectada por la enfermedad se determina cuando se observa un nivel adecuado de la enfermedad en plantas de control no tratadas (6 – 8 días después de la aplicación).
- Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.n.011, I.v.001, I.z.001 y I.z.005 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

Plasmopara viticola / uva / duración prolongada (mildiu lanudo de la uva)

- Se pulverizan plántulas de uva cv. Gutedel de 5 semanas en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo se inoculan pulverizando una suspensión de esporangios sobre la superficie inferior de las hojas 6 días después de la aplicación. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 22 °C y un 100% de HR en un invernadero, y el porcentaje del área de hoja afectada por la enfermedad se determina cuando se observa un nivel adecuado de la enfermedad en plantas de control no tratadas (11 – 13 días después de la aplicación).

Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.t.001, I.v.001, I.z.001 y I.z.005 proporcionan al menos un 80% de control de los discos de hoja a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

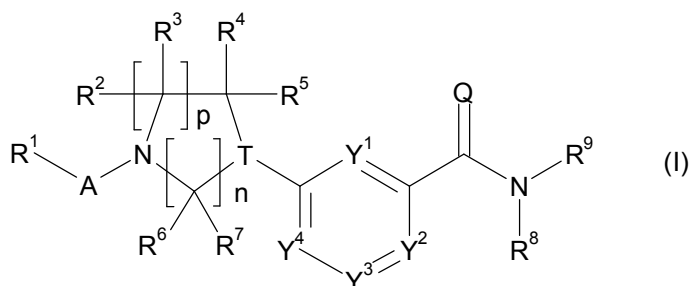
Plasmopara viticola / uva / curación (mildiu lanudo de la uva)

- 5 Se inoculan plántulas de uva cv. Gutedel de 5 semanas pulverizando una suspensión de esporangios sobre la superficie inferior de las hojas un día antes de la aplicación. Las plantas de uva inoculadas se pulverizan en una cámara de pulverización con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Las plantas de ensayo inoculadas se incuban a 22 °C y un 100% de HR en un invernadero, y el porcentaje del área de hoja afectada por la enfermedad se determina cuando se observa un nivel adecuado de la enfermedad en plantas de control no tratadas (4 – 6 días después de la aplicación).
- 10

Los compuestos I.n.001, I.n.003, I.n.005, I.n.009, I.n.049, I.v.001 y I.z.001 proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad a 200 ppm en este ensayo, en comparación con los discos de hoja de control no tratados en las mismas condiciones, los cuales presentan un desarrollo considerable de la enfermedad.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula I:



donde

5 A es $x-C(R^{10}R^{11})-C(=O)-$, $x-C(R^{12}R^{13})-C(=S)-$, $x-O-C(=O)-$, $x-O-C(=S)-$, $x-N(R^{14})-C(=O)-$, $x-N(R^{15})-C(=S)-$, $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$ o $x-N=C(R^{30})-$, en cada caso x indica el enlace que está conectado a R^1 ;

T es CR^{18} o N;

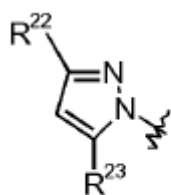
Y^1 , Y^2 , Y^3 e Y^4 son independientemente CR^{19} o N;

Q es O o S;

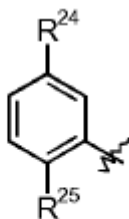
10 n es 1 o 2;

p es 1 o 2, siempre que cuando n sea 2, p sea 1;

R^1 se selecciona del grupo (c) o (d):



(c)

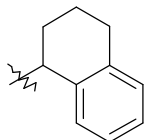


(d)

15 donde R^{22} , R^{23} , R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente entre hidrógeno, halógeno, metilo y halometilo; R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} y R^{30} son cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;

R^8 , R^{14} y R^{15} son cada uno independientemente hidrógeno o alquilo C_1-C_4 ; y

R^9 es fenilo, bencilo o un grupo (a):



(a)

20

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

o una de sus sales o N-óxidos.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, donde

25 A es $x-CH_2-C(=O)-$, donde x indica el enlace que está conectado a R^1 ;

T es CH;

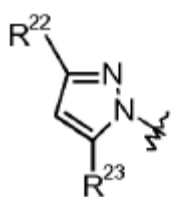
Y^1, Y^2, Y^3 e Y^4 son indipendentemente CH;

Q es O;

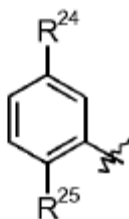
n es 2;

5 p es 1;

R¹ se selecciona del grupo (c) o (d):



(c)



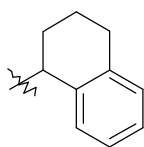
(d)

donde R^{22} , R^{23} , R^{24} y R^{25} se seleccionan independientemente entre hidrógeno, halógeno, metilo y halometilo;

R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 y R^7 son cada uno hidrógeno;

10 R⁸ es hidrógeno o metilo; y

R⁹ es fenilo, bencilo o un grupo (a):



(a)

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

3. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 o 2, donde al menos tres de los grupos Y^1 , Y^2 , Y^3 e Y^4 son CH y el otro grupo Y^1 , Y^2 , Y^3 o Y^4 es CH o N.

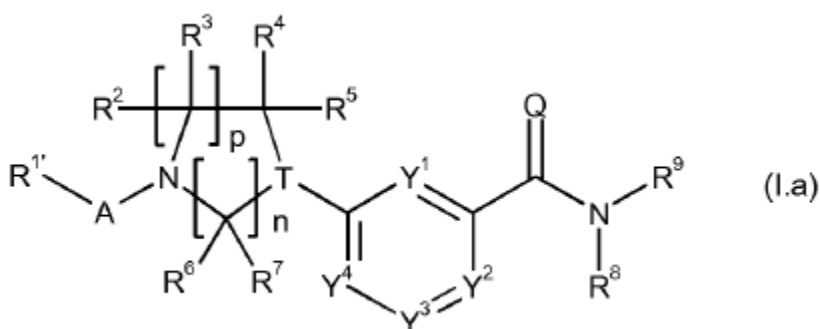
4. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, donde Y^2 es N.

5. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, donde p es 1 y n es 2.

20 6. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, donde R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 son H.

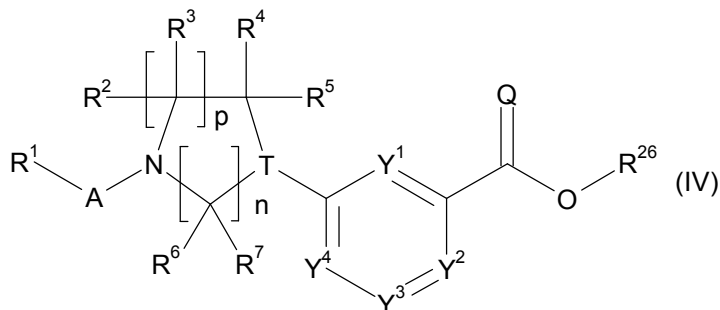
7. El compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, donde Q es O.

8. Un compuesto de fórmula l.a:



donde R^1 es alquilo C_1-C_8 e $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, A, Q, T, n, p, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8$ y R^9 tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I, según se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7;

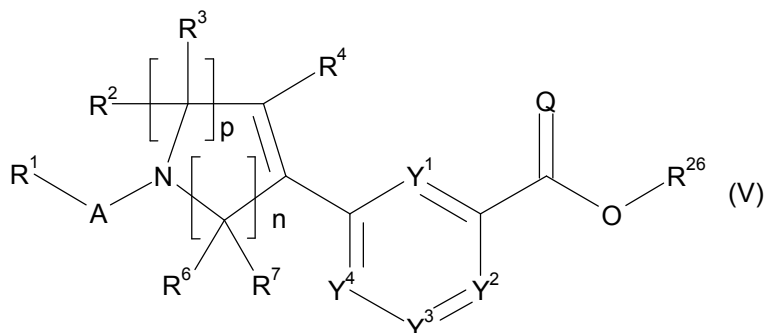
o un compuesto de fórmula IV:



- 5 donde $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, A, Q, T, n, p, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ y R^7 tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I, según se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7; y

R^{26} es alquilo C_1-C_6 o fenilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , hidroxilo, amino, ciano y halógeno;

o un compuesto de fórmula V:



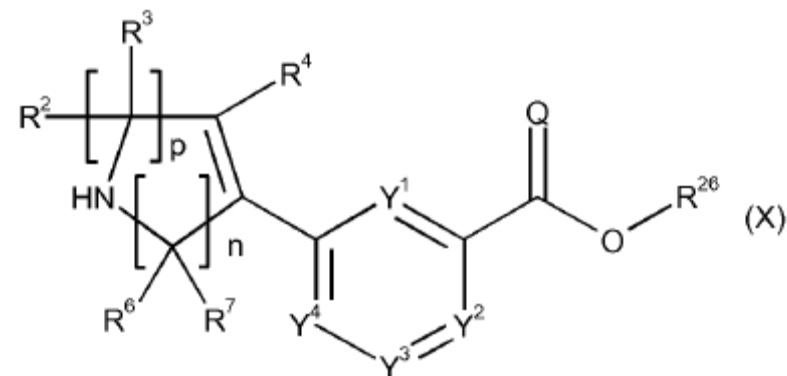
10

donde $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, A, Q, n, p, R^1, R^2, R^3, R^4, R^6$ y R^7 tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I, según se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7; y

R^{26} es alquilo C_1-C_6 o fenilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , hidroxilo, amino, ciano y halógeno;

15

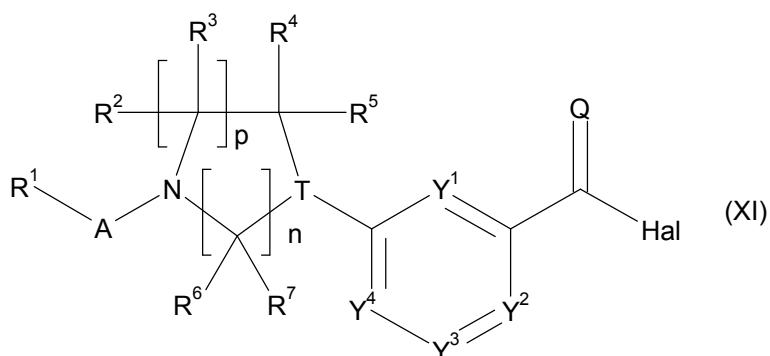
o un compuesto de fórmula X:



donde $Y^1, Y^2, Y^3, Y^4, Q, n, p, R^2, R^3, R^4, R^6$ y R^7 tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I, según se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7; y R^{26} es alquilo C_1-C_6 o fenilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , hidroxilo, amino, ciano y halógeno;

20

o un compuesto de fórmula XI:



donde Y^1 , Y^2 , Y^3 , Y^4 , A, Q, n, p, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y R^7 tienen las definiciones que se han descrito para la fórmula I, según se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7; y Hal se refiere a halógeno.

- 5 9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 8, donde R^{26} es alquilo C_1-C_6 o fenilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente entre alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , hidroxilo, amino, ciano y halógeno.
10. Una composición fungicida que comprende al menos un compuesto como el que se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 y un portador aceptable en agricultura, que comprende opcionalmente un adyuvante y que comprende opcionalmente al menos un compuesto activo como fungicida adicional.
- 10 11. Un método para controlar o prevenir una infestación de plantas, el material de propagación de estas, cultivos recolectados o materiales inertes por parte de microorganismos fitopatógenos o responsables de la descomposición, u organismos potencialmente dañinos para el ser humano, que comprende aplicar un compuesto como el definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 a la planta, a partes de la planta o al emplazamiento de esta, al material de propagación de esta o a cualquier parte de los materiales inertes.
- 15 12. El método de acuerdo con la reivindicación 11, donde los microorganismos fitopatógenos son organismos fúngicos.