

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 590 466**

51 Int. Cl.:

A01N 43/08	(2006.01) A01N 43/90	(2006.01)
A01N 43/54	(2006.01) A01N 47/24	(2006.01)
A01N 43/56	(2006.01) A01P 3/00	(2006.01)
A01N 43/653	(2006.01) A01N 37/50	(2006.01)
A01N 43/713	(2006.01) A01N 47/28	(2006.01)
A01N 43/76	(2006.01)	
A01N 43/78	(2006.01)	
A01N 43/80	(2006.01)	
A01N 43/82	(2006.01)	
A01N 43/88	(2006.01)	

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **06.12.2012 PCT/EP2012/074586**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **27.06.2013 WO13092224**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **06.12.2012 E 12795452 (7)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **08.06.2016 EP 2793579**

54 Título: **Uso de compuestos de tipo estrobilurina para combatir hongos fitopatógenos resistentes a inhibidores de Qo**

30 Prioridad:

21.12.2011 EP 11195032
26.10.2012 EP 12190109

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
22.11.2016

73 Titular/es:

BASF SE (100.0%)
Carl-Bosch-Strasse 38
67056 Ludwigshafen am Rhein, DE

72 Inventor/es:

RHEINHEIMER, JOACHIM;
TERTERYAN, VIOLETA;
REDLICH, STEFAN;
KREMZOV, DORIS;
ROSENBAUM, CLAUDIA;
ROHRER, SEBASTIAN GEORGIOS;
GRAMMENOS, WASSILIOS;
PILGER, CHRISTIAN;
RÖHL, FRANZ;
GEWEHR, MARKUS;
STAMMLER, GERD;
MONTAG, JURITH y
SAUTER, HUBERT

74 Agente/Representante:

CARVAJAL Y URQUIJO, Isabel

ES 2 590 466 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

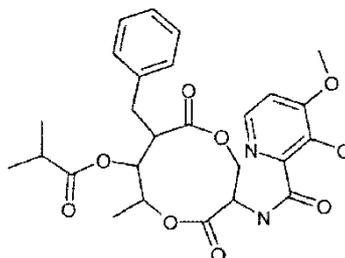
Uso de compuestos de tipo estrobilurina para combatir hongos fitopatógenos resistentes a inhibidores de Qo

La presente invención se refiere al uso de compuestos de tipo estrobilurina de fórmula I y a los N-óxidos y las sales de los mismos para combatir hongos fitopatógenos que contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a los inhibidores de Qo, y a métodos para combatir tales hongos. La invención también se refiere a compuestos novedosos, procesos de preparación de estos compuestos, a composiciones que comprenden al menos un compuesto tal, a aplicaciones para la salud de la planta y a semillas recubiertas con al menos un compuesto tal.

Los fungicidas de los inhibidores de Qo, frecuentemente denominados fungicidas de tipo estrobilurina (Sauter 2007: Capítulo 13.2. Strobilurins and other complex III inhibitors. En: Krämer, W.; Schirmer, U. (Ed.) - Modern Crop Protection Compounds. Volumen 2. Wiley-VCH Verlag 457-495), se usan convencionalmente para controlar varios patógenos fúngicos en cultivos. Los inhibidores de Qo funcionan normalmente inhibiendo la respiración al unirse a un centro de oxidación de ubihidroquinona de un complejo de citocromo bc_1 (complejo de transporte de electrones III) en las mitocondrias. Dicho centro de oxidación está localizado en el lado exterior de la membrana mitocondrial interna. Un claro ejemplo del uso de inhibidores de Qo incluye el uso de, por ejemplo, estrobilurinas en trigo para el control de *Septoria tritici* (también conocido como *Mycosphaerella graminicola*), que es la causa de las manchas foliares del trigo. Desafortunadamente, el amplio uso de tales inhibidores de Qo ha producido la selección de patógenos mutantes que son resistentes a tales inhibidores de Qo (Gisi et al., Pest Manag Sci 56, 833-841, (2000). La resistencia a los inhibidores de Qo se ha detectado en varios hongos fitopatógenos, tales como *Blumeria graminis*, *Mycosphaerella fijiensis*, *Pseudoperonospora cubensis* o *Venturia inaequalis*. Si bien en tanto se detectaron varios mecanismos de resistencia (por ejemplo, Jabs et al. Phytomedizin 31, 15-16 (2001); Olaya et al., Pestic Sci 54, 230-236 (1998), la mayor parte de la resistencia a los inhibidores de Qo en usos agrícolas se ha atribuido a patógenos que contienen una única sustitución de restos de aminoácidos G143A en el gen del citocromo b para su complejo de citocromo bc_1 , la proteína diana de los inhibidores de Qo. Véanse, por ejemplo, Lucas, Pestic Outlook 14(6), 268-70 (2003); y Fraaije et al., Phytopathol 95(8), 933-41 (2005). Así, son deseables nuevos métodos y composiciones para controlar enfermedades inducidas por patógenos en cultivos, que comprenden plantas sometidas a patógenos que son resistentes a los inhibidores de Qo. Además, en muchos casos, en particular a bajas tasas de aplicación, la actividad fungicida de los compuestos fungicidas análogos de la estrobilurina conocidos no es satisfactoria, especialmente en caso de que una alta proporción de los patógenos fúngicos contengan una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a los inhibidores de Qo. Basándose en esto, también fue un objetivo de la presente invención proporcionar compuestos que tuvieran una mejor actividad y/o un espectro de actividad más amplio contra hongos fitopatógenos dañinos.

"Inhibidor de Qo", como se usa en el presente documento, incluye cualquier sustancia que es capaz de reducir y/o inhibir la respiración fijándose a un centro de oxidación de ubihidroquinona de un complejo de citocromo bc_1 en las mitocondrias. El centro de oxidación normalmente está localiza en el lado externo de la membrana mitocondrial interna.

A partir del documento WO 2009/155095 se conoce el uso de un inhibidor de Qi UK2A de la fórmula

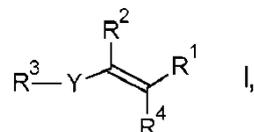


para combatir hongos fitopatógenos que son resistentes a los inhibidores de Qo. Los inhibidores de Qo funcionan normalmente inhibiendo la respiración al fijarse a un centro de oxidación de ubihidroquinona de un complejo de citocromo bc_1 en las mitocondrias, estando dicho centro de oxidación localizado en el lado interior de la membrana mitocondrial interna.

Los compuestos análogos de la estrobilurina según la presente invención se diferencian de aquellos descritos en la publicación anteriormente mencionada por la fórmula I específica y por inhibir la respiración al fijarse a un centro de oxidación de ubihidroquinona de un complejo de citocromo bc_1 en las mitocondrias que los define como inhibidores de Qo. Además de los elementos estructurales específicos de análogos de estrobilurina R^4 , estos compuestos contienen dos átomos de carbono específicos unidos por un doble enlace, en el que los grupos R^1 y R^2 tienen orientación cis, o R^1 y R^2 , junto con los dos átomos de carbono anteriormente mencionados que los unen, forman un

anillo de fenilo si R⁴ es 4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-on-1-ilo.

Por consiguiente, la presente invención se refiere al uso de compuestos de la fórmula I



en la que:

- 5 R¹, R² independientemente entre sí, son hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquenilo C₂-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, en los que los grupos R¹ y R² tienen orientación cis, o R¹ y R², junto con los dos átomos de carbono que los unen, forman un anillo de fenilo a condición de que R⁴ sea 4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-on-1-ilo (fórmula R4-7), y en los que los restos alifáticos de R¹ y/o R² o el anillo de fenilo anteriormente mencionado pueden llevar 1, 2, 3 o hasta el máximo número de grupos R^a iguales o diferentes que independientemente entre sí están seleccionados de: R^a halógeno, CN, nitro, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

- 15 Y es un enlace directo o un grupo divalente seleccionado de -OCH₂-, -CH₂-, -CH₂CH₂-, -C(Z)=N-O-CH₂-, -CHZ-C(Z)=N-O-CH₂-, -O-N=C(Z)-C(Z)=N-O-CH₂-, -C(=O)-C(Z)=N-O-CH₂- y -C(=N-O-Z)-C(Z)=N-O-CH₂-, en los que el enlace representado a la izquierda del grupo divalente Y está unido a R³ y el enlace representado a la derecha está unido al átomo de carbono que está sustituido con R², y

Z, que puede ser igual o diferente a cualquiera otro Z, es hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

- 20 R³ es fenilo o un heterociclilo mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, en el que los átomos del miembro de anillo del heterociclilo incluyen, además de los átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo de N, O y S; en el que los grupos cíclicos R³ pueden llevar 1, 2, 3, 4 o hasta el máximo número posible de grupos R^b iguales o diferentes que independientemente entre sí están seleccionados de:

- 25 R^b, que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^b, es amino, halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, CN, carboxilo, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alqueniloxi C₂-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alquiniloxi C₂-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-amino, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, alquil C₁-C₄-carboniloxi, fenilo, naftilo o un heterociclilo mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo que consiste en N, O y S como miembros de anillo; y en el que los grupos fenilo y heterociclilo R^b anteriormente mencionados están unidos mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre, y dos radicales R^b que están unidos a átomos del miembro de anillo adyacente del grupo cíclico R³ pueden formar junto con dichos átomos del miembro de anillo un ciclo condensado de 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, que puede ser un carbociclo o heterociclo, en el que los átomos del miembro de anillo del heterociclo incluyen, además de los átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo de N, O y S, en el que los grupos alifáticos o cíclicos R^b pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^c iguales o diferentes:

- 35 R^c, que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^c, es halógeno, hidroxilo, nitro, CN, carboxilo, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₈, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alqueniloxi C₂-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alquiniloxi C₂-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆-imino-, alqueniloxi C₂-C₆-imino-, alquiniloxi C₂-C₆-imino-, haloalqueniloxi C₂-C₆-imino-, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, fenilo o un heterociclilo de 5 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a tres heteroátomos del grupo que consiste en N, O y S como miembros de anillo; en el que los grupos cíclicos R^c anteriormente mencionados están unidos mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre, y en el que los grupos alifáticos o cíclicos R^c pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^d iguales o diferentes:

R^d, que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^d, es halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; o

- 45 R³ es -CR^A=N-O-R^B, en la que

R^A es amino, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆, alqueniloxi C₂-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄-imino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-amino, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, alquil C₁-C₄-carboniloxi, fenilo, fenil-alquilo C₁-C₄, naftilo o un heterociclilo

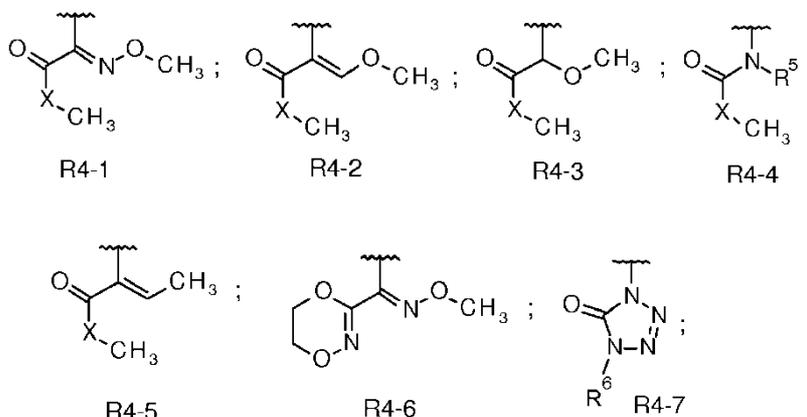
mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo que consiste en O, N y S como miembros de anillo; y en el que el cíclico R^A anteriormente mencionado está unidos mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre;

- 5 R^B es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄-imino-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, fenilo, fenil-alquilo C₁-C₄, naftilo o un heterocíclico mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo que consiste en O, N y S como miembros de anillo;

- 10 en el que los grupos alifáticos o cíclicos R^A y/o R^B pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^E iguales o diferentes:

R^E, que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^E, es halógeno, hidroxilo, nitro, CN, carboxilo, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₈, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;

R⁴ es un grupo monovalente seleccionado de las fórmulas R4-1 a R4-7



15

en las que la línea dentada define el punto de unión, y

X es un enlace directo o un grupo divalente CH₂, O o NH,

R⁵ es alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆,

R⁶ es alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

- 20 y los N-óxidos y las sales agrícolamente aceptables de los mismos, para combatir hongos fitopatógenos que contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo.

Además, la presente invención también se refiere a métodos para combatir hongos fitopatógenos que contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo usando los compuestos anteriormente mencionados de fórmula I.

- 25 Ciertos compuestos de tipo estrobilurina de fórmula I, en la que R⁴ es 1-metoxicarbonil-2-metoxi-eten-1-ilo (definido como R4-2 en el presente documento, en la que X es O) y R¹ es CF₃, se mencionan en el documento WO 1998/021174: éster metílico del ácido (E)-2-[1-metoxi-met-(E)-iliden]-5-(4-fenoxi-fenoxi)-3-trifluorometil-pent-3-enoico (CAS n.º 207852-99-1); éster metílico del ácido (E)-2-[1-metoxi-met-(E)-iliden]-5-(3-fenoxi-fenoxi)-3-trifluorometil-pent-3-enoico (207853-00-7); éster metílico del ácido (E)-2-[1-metoxi-met-(E)-iliden]-4-metil-5-(3-fenoxifenoxi)-3-trifluorometil-pent-3-enoico; y éster metílico del ácido (E)-5,5,5-trifluoro-2-[1-metoxi-met-(E)-iliden]-3-metil-4-(4-fenoxi-fenoximetil)-pent-3-enoico. Sin embargo, no se menciona que los compuestos de tipo estrobilurina inhiben patógenos fúngicos que contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo. II

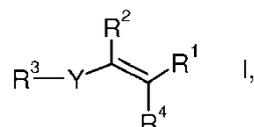
- 35 Además, la preparación del compuesto éster metílico del ácido (2E,3Z)-2-(etiliden)-5-fenil-3-pentenoico (CAS n.º 681026-20-0) se ha descrito en J Organomet Chem 689, 575-584 (2004).

Además, ciertos compuestos de tipo estrobilurina, en los que R¹ y R², junto con los dos átomos de carbono que los

unen, forman un anillo de fenilo y en los que R⁴ es 1-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-on-4-ilo (R4-7) se conocen, entre otras cosas, de los documentos WO 1996/036229, WO 1999/046246 y DE 199 00 571 A1.

- Los compuestos según la presente invención se diferencian de aquellos descritos en las publicaciones anteriormente mencionadas en que R¹ y R² no forman con los dos átomos de carbono que los unen un anillo de fenilo, y que se excluyen el éster metílico del ácido (E)-2-[1-metoxi-met-(E)-iliden]-5-(4-fenoxi-fenoxi)-3-trifluorometil-pent-3-enoico (207852-99-1); éster metílico del ácido (E)-2-[1-metoxi-met-(E)-iliden]-5-(3-fenoxi-fenoxi)-3-trifluorometil-pent-3-enoico (207853-00-7); éster metílico del ácido (E)-2-[1-metoxi-met-(E)-iliden]-4-metil-5-(3-fenoxi-fenoxi)-3-trifluorometil-pent-3-enoico; éster metílico del ácido (E)-5,5,5-trifluoro-2-[1-metoxi-met-(E)-iliden]-3-metil-4-(4-fenoxi-fenoximetil)-pent-3-enoico; y éster metílico del ácido (2E,3Z)-2-(etiliden)-5-fenil-3-pentenoico (CAS n.º 681026-20-0).

Por lo tanto, según un segundo aspecto, la invención proporciona compuestos de fórmula I que se representan por la fórmula I



en la que:

- 15 R¹, R² independientemente entre sí, son hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquenoilo C₂-C₆, alquenoiloxi C₂-C₆, alquinoilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, en los que los grupos R¹ y R² tienen orientación cis, en los que los restos alifáticos de R¹ y/o R² pueden llevar 1, 2, 3 o hasta el máximo número de grupos R^a iguales o diferentes que independientemente entre sí están seleccionados de:
- R^a halógeno, CN, nitro, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 20 Y es un enlace directo o un grupo divalente seleccionado de -OCH₂-, -CH₂-, -CH₂CH₂-, -C(Z)=N-O-CH₂-, -CHZ-C(Z)=N-O-CH₂-, -O-N=C(Z)-C(Z)=N-O-CH₂-, -C(=O)-C(Z)=N-O-CH₂- y -C(=N-O-Z)-C(Z)=N-O-CH₂-, en los que el enlace representado a la izquierda del grupo divalente Y está unido a R³ y el enlace representado a la derecha está unido al átomo de carbono que está sustituido con R², y
- Z, que puede ser igual o diferente a cualquiera otro Z, es alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;
- 25 R³ es fenilo o un heterociclilo mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, en el que los átomos del miembro de anillo del heterociclilo incluyen, además de los átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo de N, O y S; en el que los grupos cíclicos R³ pueden llevar 1, 2, 3, 4 o hasta el máximo número posible de grupos R^b iguales o diferentes que independientemente entre sí están seleccionados de:
- 30 R^b, que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^b, es amino, halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, CN, carboxilo, alquilo C₁-C₄, alquenoilo C₂-C₄, alquinoilo C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenoilo C₃-C₆, alquenoiloxi C₂-C₆, alquinoiloxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alquenoiloxi C₂-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alquinoiloxi C₂-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-amino, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, alquil C₁-C₄-carbonilo, fenilo, naftilo o un heterociclilo mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo que consiste en N, O y S como miembros de anillo; y en el que los grupos fenilo y heterociclilo R^b anteriormente mencionados están unidos mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre; y dos radicales R^b que están unidos a átomos del miembro de anillo adyacente del grupo cíclico R³ pueden formar junto con dichos átomos del miembro de anillo un ciclo condensado de 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, que puede ser un carbociclo o heterociclo, en el que los átomos del miembro de anillo del heterociclo condensado incluyen, además de los átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo de N, O y S, y en el que los grupos alifáticos o cíclicos R^b pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^c iguales o diferentes:
- 45 R^c, que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^c, es halógeno, hidroxilo, nitro, CN, carboxilo, alquilo C₁-C₄, alquenoilo C₂-C₄, alquinoilo C₂-C₈, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alquenoiloxi C₂-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alquinoiloxi C₂-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-imino-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆-imino-, alquenoiloxi C₂-C₆-imino-, alquinoiloxi C₂-C₆-imino-, haloalquenoiloxi C₂-C₆-imino-, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquenoilo C₃-C₆, fenilo o un heterociclilo de 5 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a tres heteroátomos del grupo que consiste en N, O y S como

El término "compuestos I" se refiere a compuestos de fórmula I. Asimismo, esta terminología se aplica a todas las sub-fórmulas, por ejemplo, "compuestos I.2" se refiere a compuestos de fórmula I.2 o "compuestos V" se refiere a compuestos de fórmula V, etc.

5 Los compuestos I pueden obtenerse por diversas vías en analogía a los procesos del estado de la técnica conocidos (por ejemplo, documento WO 1998/021174, J Organomet Chem 689, 575-584 (2004), documento WO 1996/036229) y, ventajosamente, por las síntesis mostradas en los siguientes esquemas y en la parte experimental de la presente solicitud.

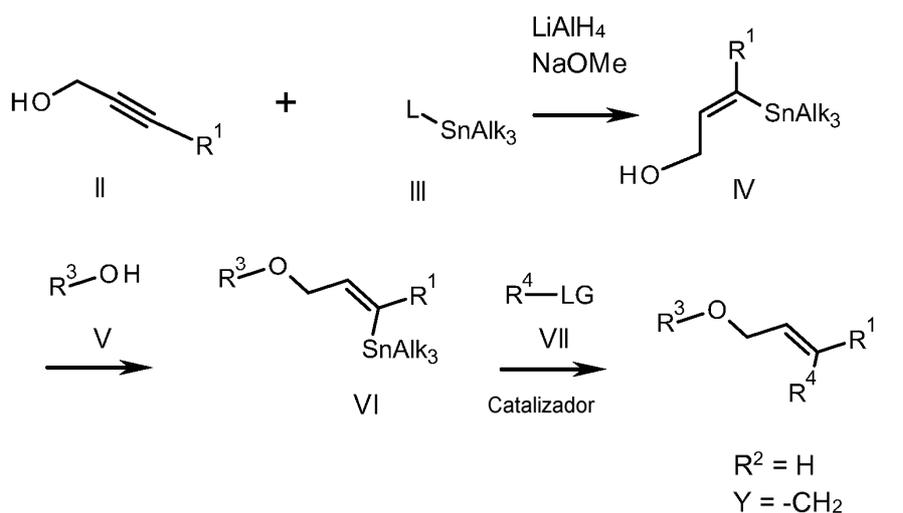
10 Un método adecuado para preparar los compuestos I se ilustra en el Esquema 1. Empieza con la reducción de un compuesto II de acetileno con un agente reductor como hidruro de litio y aluminio, preferentemente en presencia de un disolvente. Disolventes adecuados son inertes contra el agente reductor usado y se seleccionan preferentemente de éteres cíclicos o alifáticos como dietil éter, tetrahidrofurano (THF), 1,4-dioxano y metil-terc-butil éter (MTBE). La temperatura de reacción puede estar entre -40 °C y 100 °C, preferentemente -20 y 60 °C. Después de formarse un producto intermedio reducido, se añade un compuesto de estaño de fórmula III, en la que Alk define un residuo de alquilo adecuado como metilo, etilo, n-propilo o n-butilo y en la que L es un grupo saliente tal como halógeno, etoxi y metoxi, en particular metoxi. El producto intermedio IV resultante es un compuesto estable que puede aislarse y purificarse con los métodos usuales (por ejemplo, extracción y cromatografía).

El compuesto IV se hace reaccionar adicionalmente con el compuesto V para dar el producto intermedio VI aplicando los métodos usuales para el acoplamiento de alcoholes alifáticos con compuestos IV de hidroxilo. La reacción de Mitsunobu ha demostrado ser especialmente útil.

20 El compuesto VI se acopla entonces con el compuesto VII, en el que LG es un grupo saliente, que es preferentemente halógeno (excepto flúor) o un grupo sulfonilo tal como triflato, preferentemente en presencia de un catalizador adecuado tal como catalizadores de metales de transición conocidos, más preferentemente catalizadores de paladio, en los que el ligando puede ser trifurilfosfina, trifenilfosfina, tritolilfosfina o ligandos de fosfina bidentados. Pueden añadirse compuestos de cobre tales como CuI_2 para mejorar la reacción. Aquí es posible una amplia
25 variedad de disolventes, prefiriéndose THF, 1,4-dioxano y amidas como dimetilformamida (DMF). Las temperaturas de reacción pueden ser -20 a 150 °C, preferentemente 20 a 120 °C.

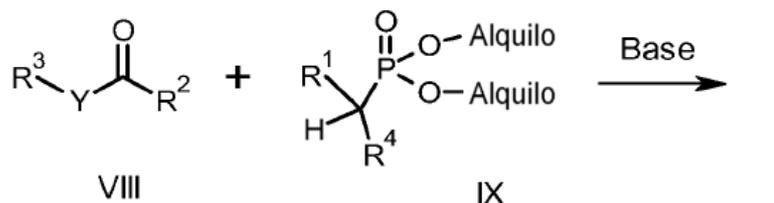
Los compuestos resultantes I, en los que Y es $-\text{OCH}_2-$ y R^2 es H, pueden modificarse adicionalmente. Por ejemplo, si R^4 contiene un grupo éster, VIII puede transformarse en una metilamida mediante reacción con metilamina.

Esquema 1:



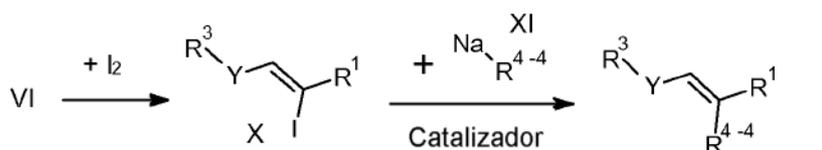
30 Otro método general para preparar compuestos I se ilustra en el Esquema 2. Los materiales de partida VIII son tanto conocidos como pueden prepararse análogamente a compuestos conocidos. La reacción de Wittig-Horner de compuestos VIII con compuestos IX ilustrada aquí (véase también Tetrahedron Lett. 1988, 29, 3361) puede sustituirse por la reacción de Wittig si esto produce mejores rendimientos. Estas reacciones, además de las
35 condiciones de reacción, son muy conocidas. Un problema específico es la relación E/Z en el doble enlace recién formado. El isómero deseado va normalmente acompañado de algún isómero no deseado, que tiene que eliminarse por purificación conocida en la técnica (por ejemplo, cromatografía, destilación, cristalización, etc.).

Esquema 2:



Una vía para los compuestos I, en la que R⁴ es de fórmula R₄-4, se ilustra en el Esquema 3. El compuesto X puede obtenerse por ejemplo, a partir del compuesto VI por reacción directa con yodo. El yodo en los compuestos X puede sustituirse con otros grupos salientes adecuados, por ejemplo, con bromo, cloro o triflato. El átomo de sodio en la sal VII puede sustituirse con otros átomos metálicos adecuados, por ejemplo, potasio, litio, magnesio, calcio, etc. La reacción de acoplamiento de X y XI se realiza preferentemente en presencia de un catalizador de metal de transición que es preferentemente cobre en presencia de un sistema de ligando que contiene nitrógeno (véase, por ejemplo: Tetrahedron Lett 2008, 49 (26), 4196-4199; Org Lett. 2004, 6 (11), 1809-1812).

10 Esquema 3:



Si no pueden obtenerse compuestos I individuales por las vías descritas anteriormente, pueden prepararse por derivatización de otros compuestos I.

15 Si la síntesis da mezclas de isómeros en el caso de oximas, una separación es generalmente no necesariamente requerida ya que en algunos casos los isómeros individuales pueden convertirse entre sí durante el procesamiento para su uso o durante la aplicación (por ejemplo, bajo la acción de luz, ácidos o bases). Tales conversiones también pueden tener lugar después de uso, por ejemplo, en el tratamiento de plantas en la planta tratada, o en el hongo dañino que va a controlarse.

20 En las definiciones de las variables dadas anteriormente se usan términos colectivos que son generalmente representativos de los sustituyentes en cuestión. El término "C_n-C_m" indica el número de átomos de carbono posible en cada caso en el sustituyente o resto de sustituyente en cuestión.

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

25 El término "alquilo C₁-C₆" se refiere a un grupo de hidrocarburo saturado de cadena lineal o ramificado que tiene 1 a 6 átomos de carbono, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo (isobutilo), 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, hexilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo. Asimismo, el término "alquilo C₁-C₄" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificado que tiene 1 a 4 átomos de carbono.

30 El término "haloalquilo C₁-C₄" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificado que tiene 1 a 4 átomos de carbono (como se definió anteriormente), en el que algunos o todos los átomos de hidrógeno en estos grupos pueden sustituirse con átomos de halógeno como se ha mencionado anteriormente, por ejemplo, clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo y pentafluoroetilo, 2-fluoropropilo, 3-fluoropropilo, 2,2-difluoropropilo, 2,3-difluoropropilo, 2-cloropropilo, 3-cloropropilo, 2,3-dicloropropilo, 2-bromopropilo, 3-bromopropilo, 3,3,3-trifluoropropilo, 3,3,3-tricloropropilo, CH₂-C₂F₅, CF₂-C₂F₅, CF(CF₃)₂, 1-(fluorometil)-2-fluoroetilo, 1-(clorometil)-2-cloroetilo, 1-(bromometil)-2-bromoetilo, 4-fluorobutilo, 4-clorobutilo, 4-bromobutilo o nonafluorobutilo. Asimismo, el término "haloalquilo C₁-C₆" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificado que tiene 1 a 6 átomos de carbono.

El término "alcoxi C₁-C₆" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificado que tiene 1 a 6 átomos de carbono que está unido mediante un oxígeno, en cualquier posición en el grupo alquilo, por ejemplo, OCH₃, OCH₂CH₃, O(CH₂)₂CH₃, 1-metiletoxi, O(CH₂)₃CH₃, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi o 1,1-dimetiletoxi, O(CH₂)₄CH₃ o O(CH₂)₅CH₃. Asimismo, el término "alcoxi C₁-C₄" se refiere a un grupo alquilo de cadena lineal o ramificado que
5 tiene 1 a 4 átomos de carbono que está unido mediante un oxígeno, en cualquier posición en el grupo alquilo.

El término "haloalcoxi C₁-C₄" se refiere a un grupo alcoxi C₁-C₄ como se definió anteriormente, en el que algunos o todos los átomos de hidrógeno pueden sustituirse con átomos de halógeno como se ha mencionado anteriormente, por ejemplo, OCH₂F, OCHF₂, OCF₃, OCH₂Cl, OCHCl₂, OCl₃, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2-bromoetoxi, 2-yodoetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-
10 cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, OC₂F₅, 2-fluoropropoxi, 3-fluoropropoxi, 2,2-difluoropropoxi, 2,3-difluoro-propoxi, 2-cloropropoxi, 3-cloropropoxi, 2,3-dicloropropoxi, 2-bromopropoxi, 3-bromopropoxi, 3,3,3-trifluoropropoxi, 3,3,3-tricloropropoxi, OCH₂-C₂F₅, OCF₂-C₂F₅, 1-(CH₂F)-2-fluoroetoxi, 1-(CH₂Cl)-2-cloroetoxi, 1-(CH₂Br)-2-bromoetoxi, 4-fluorobutoxi, 4-clorobutoxi, 4-bromobutoxi o nonafluorobutoxi. Asimismo, el término "haloalcoxi C₁-C₆" se refiere a un grupo alcoxi C₁-C₆ como se definió
15 anteriormente, en el que algunos o todos los átomos de hidrógeno pueden sustituirse con átomos de halógeno como se ha mencionado anteriormente.

El término "alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄" se refiere a alquilo que tiene 1 a 4 átomos de carbono, en el que un átomo de hidrógeno del radical alquilo está sustituido con un grupo alcoxi C₁-C₄. Asimismo, el término "alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆" se refiere a alquilo que tiene 1 a 6 átomos de carbono, en el que un átomo de hidrógeno del radical alquilo está
20 sustituido con un grupo alcoxi C₁-C₆.

El término "alquil C₁-C₄-amino" se refiere a un radical amino que lleva un grupo alquilo C₁-C₄ como sustituyente, por ejemplo, metilamino, etilamino, propilamino, 1-metiletilamino, butilamino, 1-metilpropilamino, 2-metilpropilamino, 1,1-dimetiletilamino y similares. Asimismo, el término "alquil C₁-C₆-amino" se refiere a un radical amino que lleva un
grupo alquilo C₁-C₆ como sustituyente.

El término "di(alquil C₁-C₄)amino" se refiere a un radical amino que llevan dos grupos alquilo C₁-C₄ iguales o diferentes como sustituyentes, por ejemplo, dimetilamino, dietilamino, di-n-propilamino, diisopropilamino, N-etil-N-metilamino, N-(n-propil)-N-metilamino, N-(isopropil)-N metilamino, N-(n-butil)-N-metilamino, N-(2-butil)-N metilamino, N-(isobutil)-N-metilamino, y similares. Asimismo, el término "di(alquil C₁-C₆)amino" se refiere a un radical amino que
25 lleva dos grupos alquilo C₁-C₆ iguales o diferentes como sustituyentes.

El término "alcoxi C₁-C₄-imino" se refiere a un radical imino divalente (alquil C₁-C₄-O-N=) que lleva un grupo alcoxi C₁-C₆ como sustituyente, por ejemplo, metilimino, etilimino, propilimino, 1-metiletilimino, butilimino, 1-metilpropilimino, 2-metilpropilimino, 1,1-dimetiletilimino y similares.
30

El término "alcoxi C₁-C₆-imino-alquilo C₁-C₄" se refiere a alquilo que tiene 1 a 4 átomos de carbono (como se definió anteriormente), en el que dos átomos de hidrógeno de un átomo de carbono del radical alquilo están sustituidos con un radical alcoxi C₁-C₆-imino divalente (alquil C₁-C₆-O-N=) como se definió anteriormente.
35

El término "alqueniloxi C₂-C₆-imino-alquilo C₁-C₄" se refiere a alquilo que tiene 1 a 4 átomos de carbono (como se definió anteriormente), en el que dos átomos de hidrógeno de un átomo de carbono del radical alquilo están sustituidos con un radical alqueniloxi C₂-C₆-imino divalente (alquenil C₂-C₆-O-N=).

El término "alquiniloxi C₂-C₆-imino-alquilo C₁-C₄" se refiere a alquilo que tiene 1 a 4 átomos de carbono (como se definió anteriormente), en el que dos átomos de hidrógeno de un átomo de carbono del radical alquilo están sustituidos con un radical alquiniloxi C₂-C₆-imino divalente (alquinil C₂-C₆-O-N=).
40

El término "alquil C₁-C₄-carbonilo" se refiere a un radical alquilo C₁-C₄ que está unido mediante un grupo carbonilo. El término "(alcoxi C₁-C₆)carbonilo" se refiere a un radical alcoxi C₁-C₆ que está unido mediante un grupo carbonilo.

El término "alquil C₁-C₆-aminocarbonilo" se refiere a un radical alquil C₁-C₆-amino que está unido mediante un grupo carbonilo. Asimismo, el término "di(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo" se refiere a un radical dialquil (C₁-C₆)amino que está unido mediante un grupo carbonilo.
45

El término "alqueno C₂-C₄" se refiere a un radical de hidrocarburo insaturado de cadena lineal o ramificado que tiene 2 a 4 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, por ejemplo, etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo (alilo), 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo. Asimismo, el término "alqueno C₂-C₆" se refiere a un radical de hidrocarburo insaturado de cadena lineal o ramificado que tiene 2 a 6 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición.
50

El término "alqueno C₂-C₄" se refiere a un radical de hidrocarburo insaturado de cadena lineal o ramificado que tiene

2 a 4 átomos de carbono y que contiene al menos un triple enlace, tal como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo. Asimismo, el término "alquinilo C₂-C₆" se refiere a un radical de hidrocarburo insaturado de cadena lineal o ramificado que tiene 2 a 6 átomos de carbono y al menos un triple enlace.

5 El término "cicloalquilo C₃-C₆" se refiere a radicales de hidrocarburo saturados monocíclicos, bicíclicos, que tienen 3 a 6 miembros de anillo de carbono, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

Asimismo, el término "cicloalquenilo C₃-C₆" se refiere a radicales de hidrocarburo insaturados que tienen 3 a 6 miembros de anillo de carbono y un doble enlace en cualquier posición, tal como ciclopropenilo, ciclobutenilo, ciclopentenilo o ciclohexenilo.

10 El término "cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄" se refiere a alquilo que tiene 1 a 4 átomos de carbono (como se definió anteriormente), en el que un átomo de hidrógeno del radical alquilo está sustituido con un radical cicloalquilo que tiene 3 a 6 átomos de carbono.

El término "fenil-alquilo C₁-C₄" se refiere a alquilo que tiene 1 a 4 átomos de carbono (como se definió anteriormente), en el que un átomo de hidrógeno del radical alquilo está sustituido con un radical fenilo.

15 Sales agrícolamente aceptables de los compuestos I engloban especialmente las sales de aquellos cationes o las sales de adición de ácido de aquellos ácidos cuyos cationes y aniones, respectivamente, no tienen efecto adverso sobre la acción fungicida de los compuestos I. Cationes adecuados son así en particular los iones de los metales alcalinos, preferentemente sodio y potasio, de los metales alcalinotérreos, preferentemente calcio, magnesio y bario, de los metales de transición, preferentemente manganeso, cobre, cinc y hierro, y también el ión amonio que, si se desea, puede llevar uno a cuatro sustituyentes alquilo C₁-C₄ y/o un sustituyente fenilo o bencilo, preferentemente diisopropilamonio, tetrametilamonio, tetrabutilamonio, trimetilbencilamonio, además iones fosfonio, iones sulfonio, preferentemente tri(alquil C₁-C₄)sulfonio, e iones sulfoxonio, preferentemente tri(alquil C₁-C₄)sulfoxonio. Aniones de sales de adición de ácido útiles son principalmente cloruro, bromuro, fluoruro, hidrogenosulfato, sulfato, dihidrogenofosfato, hidrogenofosfato, fosfato, nitrato, bicarbonato, carbonato, hexafluorosilicato, hexafluorofosfato, benzoato, y los aniones de ácidos alcanóicos C₁-C₄, preferentemente formiato, acetato, propionato y butirato.

20 Pueden formarse haciendo reaccionar un compuesto de fórmula I con un ácido del anión correspondiente, preferentemente de ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácido nítrico.

25

Los compuestos de fórmula I pueden estar presentes en atropisómeros que surgen de la rotación limitada alrededor de un enlace sencillo de grupos asimétricos. También forman parte de la materia de la presente invención.

30 Dependiendo del patrón de sustitución, los compuestos de fórmula I y sus N-óxidos pueden tener uno o más centros de quiralidad, en cuyo caso están presentes como enantiómeros puros o diaestereómeros puros o como mezclas de enantiómeros o diaestereómeros. Ambos, los enantiómeros puros o los diaestereómeros y sus mezclas, son materia de la presente invención.

Con respecto a las variables, las realizaciones de los productos intermedios se corresponden con las realizaciones de los compuestos I.

35 Se da preferencia a aquellos compuestos I y si procede también a los compuestos de todas las sub-fórmulas proporcionadas en el presente documento, por ejemplo, fórmulas I.1 y I.2, y a los productos intermedios tales como los compuestos II, III, IV y V, en los que los sustituyentes y variables (tales como k, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, X, Y, Z, R^A, R^B, R^a, R^b, R^c, R^d y R^e) tienen, independientemente entre sí o más preferentemente en combinación (cualquier combinación posible de 2 o más sustituyentes como se define en el presente documento), los siguientes significados:

40

También se da preferencia a los usos, métodos, mezclas y composiciones, en los que las definiciones (tal como hongos fitopatógenos, tratamientos, cultivos, compuestos II, principios activos adicionales, disolventes, vehículos sólidos) tienen, independientemente entre sí o más preferentemente en combinación, los siguientes significados e incluso más preferentemente en combinación (cualquier combinación posible de 2 o más definiciones como se proporciona en el presente documento) con los significados preferidos de los compuestos I en el presente documento:

45

Según una realización de la invención, la invención también se refiere a un método para combatir hongos fitopatógenos que contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo, que comprende: tratar los hongos fitopatógenos que contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo o los materiales, plantas, la tierra o semillas que están en riesgo de enfermar por los hongos fitopatógenos que contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo con una cantidad eficaz de al menos un compuesto I, o una composición que lo comprende del mismo.

50

El término "hongos fitopatógenos que contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo" debe entenderse que al menos el 10 % de las cepas aisladas fúngicas que van a controlarse contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo, más preferentemente al menos el 30 %, incluso más preferentemente al menos el 50 %, y lo más preferentemente al menos el 75 % de los hongos, en particular entre el 90 y el 100 %.

Se ha observado bajo condiciones de campo que las poblaciones de hongos fitopatógenos que consisten aparentemente en cepas no resistentes pueden desarrollar fácilmente resistencia. Los compuestos pueden aplicarse bajo tales condiciones, también, con el fin de prevenir la formación de resistencia y la propagación de cepas resistentes en general. A este respecto, también es útil tengan fuerte actividad contra hongos fitopatógenos no resistentes.

Según otra realización, el método para combatir hongos fitopatógenos, comprende: a) identificar los hongos fitopatógenos que contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo, o los materiales, plantas, la tierra o semillas que están en riesgo de enfermar por los hongos fitopatógenos como se define en el presente documento, y b) tratar dichos hongos o los materiales, plantas, la tierra o semillas con una cantidad eficaz de al menos un compuesto I, o una composición que lo comprende del mismo.

Según otra realización de la invención, la invención también se refiere a un método para combatir hongos fitopatógenos que contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo, que comprende: tratar los hongos fitopatógenos de los que al menos el 10 % contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo o los materiales, plantas, la tierra o semillas que están en riesgo de enfermar por los hongos fitopatógenos que contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo con una cantidad eficaz de al menos un compuesto I, o una composición que lo comprende del mismo; más preferentemente al menos el 30 %, incluso más preferentemente al menos el 50 %, y lo más preferentemente al menos el 75 % de los hongos contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo.

Según una realización del uso y el método para combatir hongos fitopatógenos, en el que la mutación en el gen mitocondrial citocromo b de los hongos fitopatógenos es G143A.

Según otra realización, los hongos fitopatógenos están seleccionados del grupo que consiste en basidiomicetos, ascomicetos y oomicetos.

Según otra realización, los hongos fitopatógenos están seleccionados del grupo que consiste en *Alternaria alternata*, *Blumeria graminis*, *Pyricularia oryzae* (también conocido como *Magnaporthe grisea*), *Septoria tritici* (también conocido como *Mycosphaerella graminicola*), *Mycosphaerella fijiensis*, *Venturia inaequalis*, *Pyrenophora teres*, *Pyrenophora tritici-repentis* y *Plasmopara viticola*, en particular *Septoria tritici*.

Una realización de la invención se refiere a los compuestos I, en los que R¹ es halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alqueno C₂-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinoxilo C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, en el que los restos alifáticos de R¹ pueden llevar 1, 2, 3 o hasta el máximo número de grupos R^b iguales o diferentes que, independientemente entre sí, están seleccionados de halógeno, CN, nitro, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; más preferentemente R¹ es halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄; incluso más preferentemente R¹ es halógeno, alquilo C₁-C₄, cloroalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄; en particular alquilo C₁-C₄.

Según otra realización, si R⁴ es 1-metoxicarbonil-2-metoxi-eten-1-ilo (R⁴-2, en la que X es O), R¹ no puede ser CF₃.

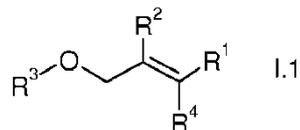
Según otra realización, R² es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄; más preferentemente, R² es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄; incluso más preferentemente, R² es hidrógeno, alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄; en particular hidrógeno.

Según otra realización, R² es halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alqueno C₂-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinoxilo C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, en el que los restos alifáticos de R² pueden llevar 1, 2, 3 o hasta el máximo número de grupos R^a iguales o diferentes que, independientemente entre sí, están seleccionados de halógeno, CN, nitro, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄.

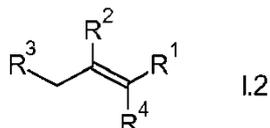
Según otra realización, Z es hidrógeno o metilo, en particular metilo.

Según otra realización, Y es un grupo divalente seleccionado de -OCH₂-, -CH₂-, -CH₂CH₂-, -C(CH₃)=N-O-CH₂-, -O-N=C(CH₃)-C(CH₃)=N-O-CH₂- y -C(=N-O-CH₃)-C(CH₃)=N-O-CH₂-; preferentemente -OCH₂-, -CH₂CH₂-, -C(CH₃)=N-O-

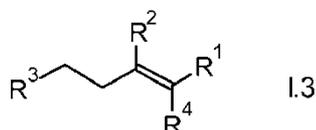
CH₂-, -O-N=C(CH₃)-C(CH₃)=N-O-CH₂- o -C(=N-O-CH₃)-C(CH₃)=N-O-CH₂-, en los que el enlace representado a la izquierda del grupo divalente Y está unido a R³ y el enlace representado a la derecha está unido al átomo de carbono que está sustituido con R²; en particular, Y es -OCH₂, cuyos compuestos son de fórmula I.1:



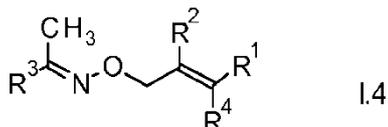
5 Según otra realización, Y es -CH₂-, cuyos compuestos son de fórmula I.2:



Según otra realización, Y es -CH₂CH₂-, cuyos compuestos son de fórmula I.3:

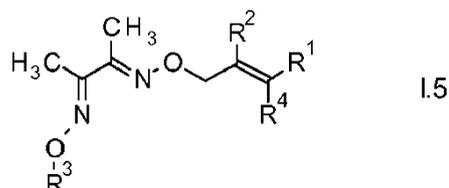


Según otra realización, Y es -C(CH₃)=N-O-CH₂-, cuyos compuestos son de fórmula I.4:

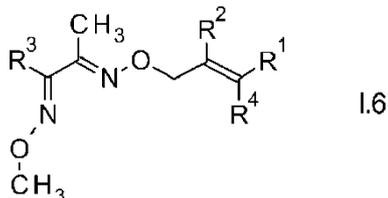


10

Según otra realización, Y es -O-N=C(CH₃)-C(CH₃)=N-O-CH₂-, cuyos compuestos son de fórmula I.5:



Según otra realización, Y es -C(=N-O-CH₃)-C(CH₃)=N-O-CH₂-, cuyos compuestos son de fórmula I.6:



15 Realizaciones particularmente preferidas de la invención se refieren a los compuestos I, en los que el grupo Y es uno de los siguientes radicales Y-1 a Y-10, en los que el enlace representado a la izquierda del grupo divalente Y está unido a R³ y el enlace representado a la derecha está unido al átomo de carbono que está sustituido con R²:

N.º	Y	N.º	Y
Y-1	-OCH ₂ -	Y-6	-C(=N-O-CH ₃)-C(CH ₃)=N-O-CH ₂ -
Y-2	-CH ₂ -	Y-7	-CH ₂ -C(CH ₃)=N-O-CH ₂ -
Y-3	-CH ₂ CH ₂ -	Y-8	-C(=O)-C(CH ₃)=N-O-CH ₂ -

N.º	Y		N.º	Y
Y-4	-C(CH ₃)=N-O-CH ₂ -		Y-9	-CH ₂ OCH ₂ -
Y-5	-O-N=C(CH ₃)-C(CH ₃)=N-O-CH ₂ -		Y-10	-CH=N-O-CH ₂ -

Realizaciones particularmente preferidas de la invención se refieren a los compuestos I, en los que el grupo Y es -OCH₂-.

5 Según otra realización, R³ es fenilo o un heterociclilo mono- o bíciclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, en el que los átomos del miembro de anillo del heterociclilo incluyen, además de los átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo de N, O y S, en el que R³ pueden llevar 1, 2, 3, 4 o hasta el máximo número posible de grupos R^b iguales o diferentes como se define en el presente documento; más preferentemente, dicho heterociclilo mono- o bíciclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático es un heteroarilo de 5 a 6 miembros en el que los átomos del miembro de anillo del heteroarilo incluyen, además de los átomos de carbono, 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados del grupo de N, O y S.

Según otra realización, R³ es fenilo, en el que el fenilo puede llevar 1, 2, 3, 4 o hasta el máximo número posible de grupos R^b iguales o diferentes como se define en el presente documento.

15 Según otra realización, R³ es un heteroarilo de 5 miembros, en el que los átomos del miembro de anillo del heterociclilo incluyen, además de los átomos de carbono, 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados del grupo de N, O y S, en el que el heteroarilo pueden llevar 1, 2, 3, 4 o hasta el máximo número posible de grupos R^b iguales o diferentes como se define en el presente documento; más preferentemente, dicho heteroarilo es pirazolilo, imidazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo o 1,2,4-tiadiazolilo.

20 Según otra realización, R³ es pirazolilo, imidazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo o 1,2,4-tiadiazolilo, que está sustituido con fenilo, en el que dicho fenilo pueden llevar 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^c iguales o diferentes, que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^c, en el que R^c es halógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-imino-alquilo C₁-C₄, fenilo o un heterociclilo de 5 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a tres heteroátomos del grupo que consiste en N, O y S como miembros de anillo; y en el que los grupos heterociclilo R^c anteriormente mencionados están unidos mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre y pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^d iguales o diferentes como se define en el presente documento.

30 Según otra realización, R³ es un heteroarilo de 6 miembros, en el que los átomos del miembro de anillo del heterociclilo incluyen, además de los átomos de carbono, 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados del grupo de N, O y S, en el que el heteroarilo pueden llevar 1, 2, 3, 4 o hasta el máximo número posible de grupos R^b iguales o diferentes como se define en el presente documento; más preferentemente, dicho heteroarilo es piridinilo o pirimidinilo.

Según otra realización, R³ lleva 1, 2 o 3 grupos R^b iguales o diferentes.

35 Según otra realización, R^b, independientemente entre sí, están seleccionados de carboxilo, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-amino, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, alquil C₁-C₄-carbonilo, fenilo, naftilo o un heterociclilo mono- o bíciclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo que consiste en O, N y S como miembros de anillo; y en el que los grupos fenilo y heterociclilo R^b anteriormente mencionados están unidos mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre.

40 Según otra realización, los grupos alifáticos o cíclicos R^b llevan por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^c iguales o diferentes, que pueden ser iguales o diferentes a cualquiera otro R^c, seleccionados de halógeno, hidroxilo, nitro, CN, carboxilo, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₈, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; más preferentemente R^b llevan por su parte 1, 2 o 3 grupos R^c iguales o diferentes.

45 Según otra realización, R^c, que, puede ser igual o diferente a cualquiera otro R^c, es halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-imino-alquilo C₁-C₄, fenilo o un heterociclilo de 5 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a tres heteroátomos del grupo que consiste en N, O y S como miembros de anillo; en el que los grupos cíclicos R^c anteriormente mencionados están unidos mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre y pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^d iguales o diferentes como se define en el presente documento.

Según otra realización, dos radicales R^b que están unidos a átomos del miembro de anillo adyacente del grupo cíclico R^3 forman, junto con dichos átomos del miembro de anillo, un ciclo condensado de 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, que puede ser un carbociclo o heterociclo, en el que los átomos del miembro de anillo del heterociclo condensado incluyen, además de los átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo de N, O y S.

Según otra realización, R^3 es $-CR^A=N-O-R^B$, en la que R^A es amino, hidroxilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_4 -imino-alquilo C_1-C_4 , alquil C_1-C_4 -amino, alcoxi C_1-C_4 -carbonilo, alquil C_1-C_4 -carbonilo, fenilo, naftilo o un heterociclilo mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo que consiste en O, N y S como miembros de anillo; y en el que los grupos fenilo y heterociclilo R^A anteriormente mencionados están unidos mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre, en el que los grupos alifáticos o cíclicos R^A pueden llevar 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^e iguales o diferentes, que pueden ser iguales o diferentes a cualquier otro R^e , es halógeno, hidroxilo, nitro, CN, carboxilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_8 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 .

Según otra realización, R^3 es $-CR^A=N-O-R^B$, en la que R^B es hidroxilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquenilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_4 -imino- C_1-C_4 -alquilalcoxi C_1-C_4 -carbonilo, fenilo, naftilo o un heterociclilo mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo que consiste en O, N y S como miembros de anillo, en el que los grupos alifáticos o cíclicos R^B pueden llevar 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^e iguales o diferentes, que pueden ser iguales o diferentes a cualquier otro R^e , es halógeno, hidroxilo, nitro, CN, carboxilo, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_8 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 .

Más preferentemente R^A y R^B , independientemente entre sí, son alquilo C_1-C_4 que pueden llevar 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de halógenos iguales o diferentes; en particular R^A y R^B son metilo.

Según otra realización, los grupos alifáticos o cíclicos R^A y/o R^B pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^e iguales o diferentes, más preferentemente llevan 0, 1 o 3 grupos R^e iguales o diferentes.

Según otra realización, R^e , que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^e , es halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 .

Según otra realización, R^4 es $-C(=NOCH_3)-CONHCH_3$, $-C(=NOCH_3)-COOCH_3$, $-C(=CHOCH_3)-COOCH_3$, $-C(=CHOCH_3)-CONHCH_3$, $-N(OCH_3)-COOCH_3$, $-N(CH_3)-COOCH_3$ o $-N(CH_2CH_3)-COOCH_3$

Según otra realización, R^4 es R4-1 como se define en el presente documento, en el que X es O.

Según otra realización, R^4 es R4-1 como se define en el presente documento, en el que X es NH.

Según otra realización, R^4 es R4-2 como se define en el presente documento, en el que X es O.

Según otra realización, R^4 es R4-2 como se define en el presente documento, en el que X es NH.

Según otra realización, R^4 es R4-3 como se define en el presente documento, en el que X es O.

Según otra realización, R^4 es R4-3 como se define en el presente documento, en el que X es NH.

Según otra realización, R^4 es R4-4 como se define en el presente documento, en el que X es O.

Según otra realización, R^4 es R4-4 como se define en el presente documento, en el que X es NH.

Según otra realización, R^5 es alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 , más preferentemente alquilo C_1-C_2 o alcoxi C_1-C_2 , incluso más preferentemente metilo, etilo o metoxi.

Según otra realización, R^4 es R4-4 como se define en el presente documento, en el que X es O y en el que R^5 es metilo, etilo o metoxi.

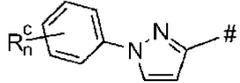
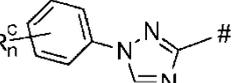
Según otra realización, R^4 es R4-5 como se define en el presente documento, en el que X es O.

Según otra realización, R⁴ es R4-5 como se define en el presente documento, en el que X es NH.

Según otra realización, R⁴ es R4-6 como se define en el presente documento.

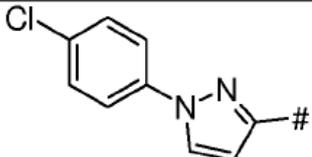
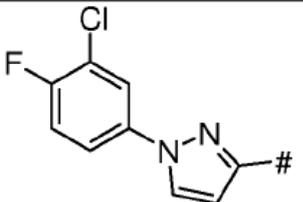
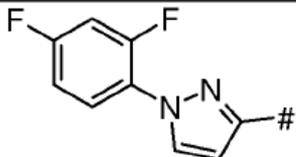
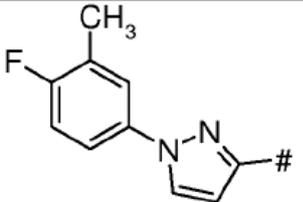
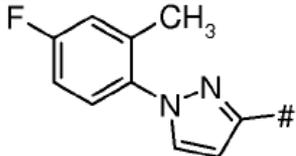
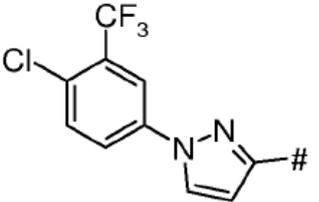
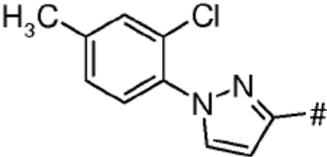
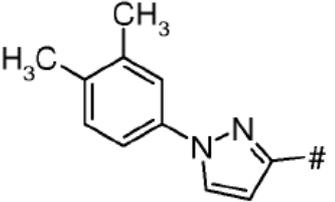
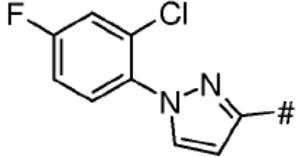
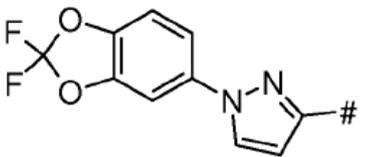
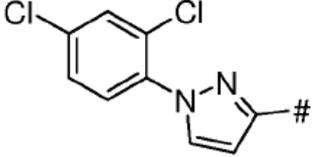
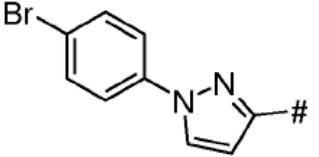
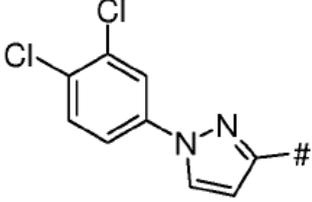
Según otra realización, R⁴ es R4-7 como se define en el presente documento.

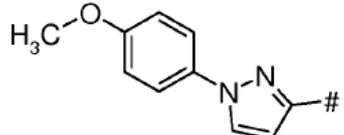
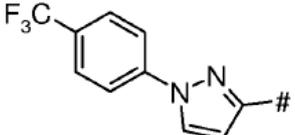
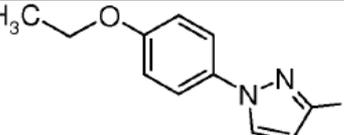
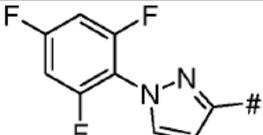
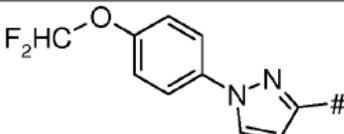
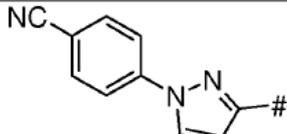
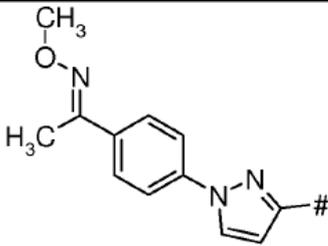
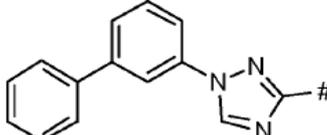
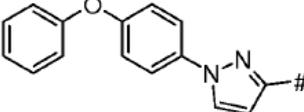
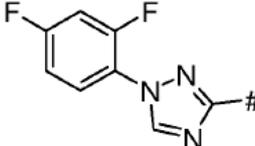
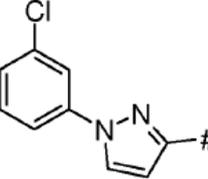
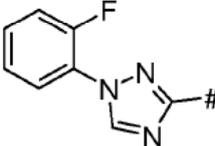
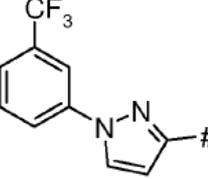
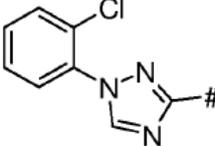
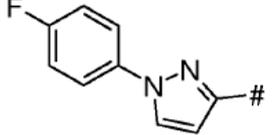
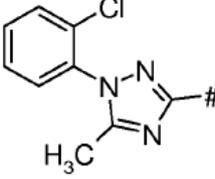
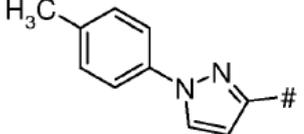
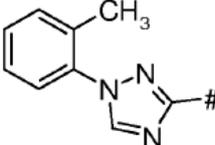
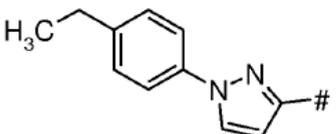
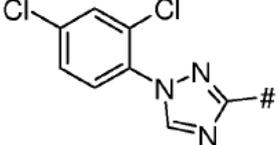
5 Realizaciones adicionales de la invención se refieren a compuestos I, en los que el grupo R³ es uno de los siguientes radicales R3-A a R3-B, en los que # indica el punto de unión al resto conector Y:

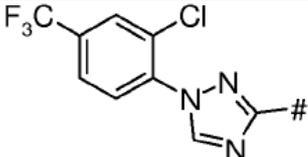
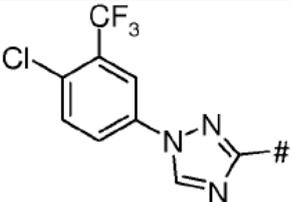
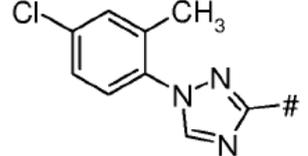
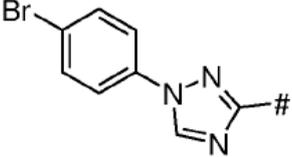
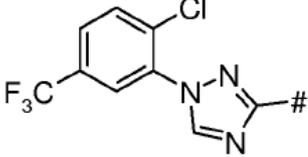
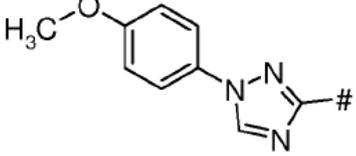
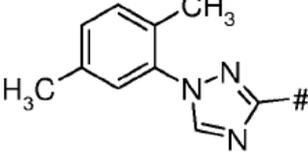
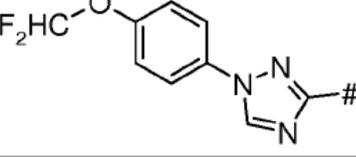
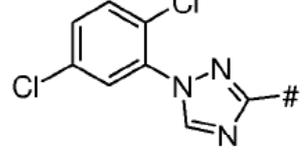
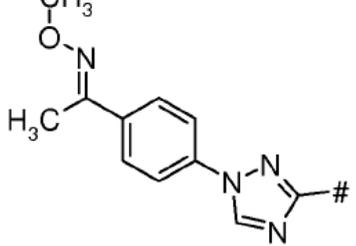
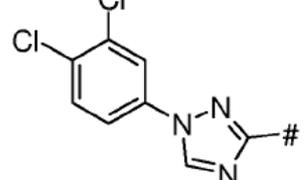
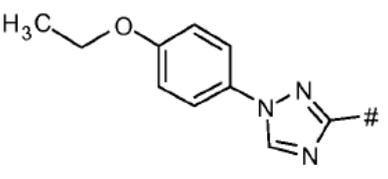
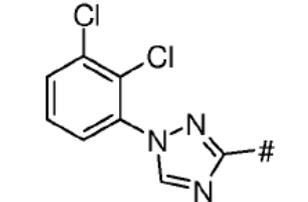
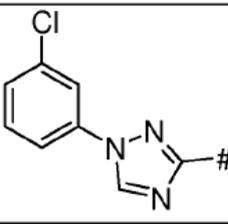
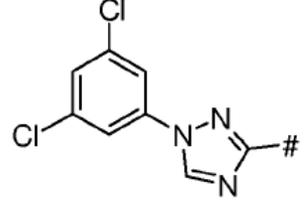
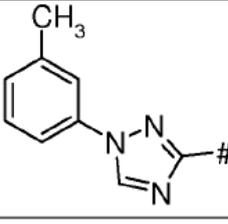
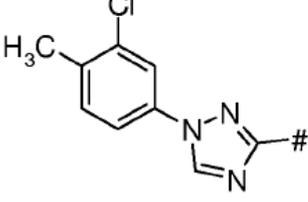
Línea	R3
R3-A	
R3-B	

Realizaciones particularmente preferidas de la invención se refieren a los compuestos I, en los que el grupo R³ es uno de los siguientes radicales R3-1 a R3-195, en los que # indica el punto de unión al resto conector Y:

Tabla A.

Línea	R ³	Línea	R ³
R3-1		R3-8	
R3-2		R3-9	
R3-3		R3-10	
R3-4		R3-11	
R3-5		R3-12	
R3-6		R3-13	
R3-7			

Línea	R ³	Línea	R ³
R3-14		R3-24	
R3-15		R3-25	
R3-16		R3-26	
R3-17		R3-27	
R3-18		R3-28	
R3-19		R3-29	
R3-20		R3-30	
R3-21		R3-31	
R3-22		R3-32	
R3-23		R3-33	

Línea	R ³	Línea	R ³
R3-34		R3-43	
R3-35		R3-44	
R3-36		R3-45	
R3-37		R3-46	
R3-38		R3-47	
R3-39		R3-48	
R3-40		R3-49	
R3-41		R3-50	
R3-42			

Línea	R ³	Línea	R ³
R3-51		R3-61	
R3-52		R3-62	
R3-53		R3-63	
R3-54		R3-64	
R3-55		R3-65	
R3-56		R3-66	
R3-57		R3-67	
R3-58		R3-68	
R3-59		R3-69	
R3-60		R3-70	
R3-71		R3-71	

Línea	R ³	Línea	R ³
R3-72		R3-82	
R3-73		R3-83	
R3-74		R3-84	
R3-75		R3-85	
R3-76		R3-86	
R3-77		R3-87	
R3-78		R3-88	
R3-79		R3-89	
R3-80		R3-90	
R3-81			

Línea	R ³	Línea	R ³
R3-91		R3-101	
R3-92		R3-102	
R3-93		R3-103	
R3-94		R3-104	
R3-95		R3-105	
R3-96		R3-106	
R3-97		R3-107	
R3-98		R3-108	
R3-99		R3-109	
R3-100		R3-110	
		R3-111	

Línea	R ³	Línea	R ³
R3-112		R3-122	
R3-113		R3-123	
R3-114		R3-124	
R3-115		R3-125	
R3-116		R3-126	
R3-117		R3-127	
R3-118		R3-128	
R3-119		R3-129	
R3-120			
R3-121			

Línea	R ³	Línea	R ³
R3-130		R3-139	
R3-131		R3-140	
R3-132		R3-141	
R3-133		R3-142	
R3-134		R3-143	
R3-135		R3-144	
R3-136		R3-145	
R3-137		R3-146	
R3-138		R3-147	
R3-148		R3-148	

Línea	R ³	Línea	R ³
R3-149		R3-159	
R3-150		R3-160	
R3-151		R3-161	
R3-152		R3-162	
R3-153		R3-163	
R3-154		R3-164	
R3-155		R3-165	
R3-156		R3-166	
R3-157			
R3-158			

Línea	R ³	Línea	R ³
R3-167		R3-175	
R3-168		R3-176	
R3-169		R3-177	
R3-170		R3-178	
R3-171		R3-179	
R3-172		R3-180	
R3-173		R3-181	
R3-174		R3-182	
		R3-183	

Línea	R ³	Línea	R ³
R3-184		R3-194	
R3-185		R3-195	
R3-186			
R3-187			
R3-188			
R3-189			
R3-190			
R3-191			
R3-192			
R3-193			

en las que # indica el punto de unión al resto conector Y.

Realizaciones preferidas de la invención se refieren a los compuestos I, en los que el grupo R³ es R3-A, en particular R3-1 (1-(4-clorofenil)-pirazol-3-ilo).

5 Los compuestos I y las composiciones según la invención, respectivamente, son adecuados como fungicidas. Se distinguen por una excelente eficacia contra un amplio espectro de hongos fitopatógenos, que incluyen hongos transmitidos por la tierra, que derivan especialmente de las clases de Plasmodiophoromycetes, Peronosporomycetes (sin. Oomycetes), Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes y Deuteromycetes (sin. Fungi imperfecti). Algunos son sistémicamente eficaces y pueden usarse para la protección de cultivos como fungicidas foliares, fungicidas para el revestimiento de semillas y fungicidas de la tierra. Además, son adecuados para controlar hongos dañinos que se produce, entre otros, en madera o raíces de plantas.

15 Los compuestos I y las composiciones según la invención son particularmente importantes para el control de una multitud de hongos fitopatógenos en diversas plantas cultivadas, tales como cereales, por ejemplo, trigo, centeno, cebada, tritical, avena o arroz; remolacha, por ejemplo, remolacha azucarera o remolacha forrajera; frutas, tales como pomos, frutas de hueso o frutas blandas, por ejemplo, manzanas, peras, ciruelas, melocotones, almendras, cerezas, fresas, frambuesas, moras o grosellas; plantas leguminosas, tales como lentejas, guisantes, alfalfa o sojas; plantas oleaginosas, tales como colza, mostaza, aceitunas, girasoles, coco, granos de cacao, plantas de aceite de ricino, palmas aceiteras, frutos secos molidos o sojas; cucurbitáceas, tales como calabazas, pepino o melones; plantas fibrosas, tales como algodón, lino, cáñamo o yute; fruto cítrico, tal como naranjas, limones, pomelos o mandarinas; verduras, tales como espinaca, lechuga, espárrago, repollos, zanahorias, cebollas, tomates, papas, cucurbitáceas o pimentón; plantas lauráceas, tales como aguacates, canela o alcanfor; plantas de energía y materia prima, tales como maíz, soja, colza, caña de azúcar o palma aceitera; maíz; tabaco; frutos secos; café; té; bananas; vides (uvas de mesa y parras para zumo de uva); lúpulo; césped; hierba dulce (también llamada estevia); plantas de caucho natural o plantas ornamentales y de silvicultura, tales como flores, arbustos, árboles de hoja ancha o perennes, por ejemplo coníferas; y en el material de propagación vegetal, tal como semillas, y el material de cultivo de estas plantas.

Preferentemente, los compuestos I y las composiciones de los mismos, respectivamente, se usan para el control de una multitud de hongos en los cultivos de campo, tales como patatas, remolachas azucareras, tabaco, trigo, centeno, cebada, avena, arroz, maíz, algodón, sojas, colza, legumbres, girasoles, café o caña de azúcar; frutas; vides; ornamentales; o verduras, tales como pepinos, tomates, judías o calabazas.

30 Debe entenderse que el término "material de propagación vegetal" indica todas las partes generativas de la planta, tales como semillas y material vegetativo de la planta, tal como esquejes y tubérculos (por ejemplo, patatas), que pueden usarse para la multiplicación de la planta. Esto incluye semillas, raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas, brotes, retoños y otras partes de las plantas, incluso plantas de semillero y plantas jóvenes, que se trasplantarán después de la germinación o después de la emergencia de la tierra. Estas plantas jóvenes también pueden protegerse, antes de trasplantarlas, por un tratamiento total o parcial mediante inmersión o vertido.

Preferentemente, el tratamiento de los materiales de propagación vegetal con los compuestos I y las composiciones de los mismos, respectivamente, se usa para controlar una multitud de hongos en cereales, tales como trigo, centeno, cebada y avena; arroz, maíz, algodón y sojas.

40 Debe entenderse que el término "plantas cultivadas" incluye plantas que se han modificado por reproducción, mutagénesis o ingeniería genética que incluye, pero no se limita a, productos agrícolas biotecnológicos en el comercio o en desarrollo (véase <http://ceragmc.org/>, véase allí la base de datos de cultivos GM). Las plantas genéticamente modificadas son plantas cuyo material genético ha sido modificado por el uso de técnicas de ADN recombinante que, en circunstancias naturales, no pueden obtenerse fácilmente por reproducción cruzada, mutaciones o recombinación natural. Normalmente, se integran uno o más genes en el material genético de una planta genéticamente modificada con el fin de mejorar ciertas propiedades de la planta. Tales modificaciones genéticas también incluyen, pero no se limitan a, la modificación dirigida posterior a la traducción de proteína(s), oligopéptidos o polipéptidos, por ejemplo, mediante glucosilación o adiciones de polímeros, tales como restos prenilados, acetilados o farnesilados, o restos de PEG.

50 Los compuestos I y las composiciones de los mismos, respectivamente, son particularmente adecuados para controlar las siguientes enfermedades de las plantas:

Albugo spp. (roya blanca) en ornamentales, verduras (por ejemplo, *A. candida*) y girasoles (por ejemplo, *A. tragopogonis*); *Alternaria spp.* (mancha foliar por *Alternaria*) en verduras, colza (*A. brassicola* o *brassicae*), remolachas azucareras (*A. tenuis*), frutas, arroz, soja, patatas (por ejemplo, *A. solani* o *A. alternata*), tomates (por ejemplo, *A. solani* o *A. alternata*) y trigo; *Aphanomyces spp.* en remolachas azucareras y verduras; *Ascochyta spp.* en cereales y verduras, por ejemplo, *A. tritici* (antracnosis) en trigo y *A. hordei* en cebada; *Bipolaris* y *Drechslera spp.*

(teleomorfo: *Cochliobolus spp.*), por ejemplo, tizón de la hoja del sur (*D. maydis*) o tizón de la hoja del norte (*B. zeicola*) en maíz, por ejemplo, mancha foliar (*B. sorokiniana*) en cereales y, por ejemplo, *B. oryzae* en arroz y césped; *Blumeria* (anteriormente *Erysiphe*) *graminis* (oidio) en cereales (por ejemplo, en trigo o cebada); *Botrytis cinerea* (teleomorfo: *Botryotinia fuckeliana*: moho gris) en frutas y bayas (por ejemplo, fresas), verduras (por ejemplo, lechuga, zanahorias, apio y repollos), colza, flores, vides, plantas de silvicultura y trigo; *Bremia lactucae* (mildiu) en lechuga; *Ceratocystis* (sin. *Ophiostoma*) *spp.* (podredumbre o marchitamiento) en árboles de hoja ancha y perennes, por ejemplo, *C. ulmi* (enfermedad del olmo holandés) en olmos; *Cercospora spp.* (manchas foliares por *Cercospora*) en maíz (por ejemplo, mancha gris de la hoja: *C. zeae-maydis*), arroz, remolachas azucareras (por ejemplo, *C. beticola*), caña de azúcar, verduras, café, sojas (por ejemplo, *C. sojina* o *C. kikuchii*) y arroz; *Cladosporium spp.* en tomates (por ejemplo, *C. fulvum*: moho de la hoja) y cereales, por ejemplo, *C. herbarum* (espiga negra) en trigo; *Claviceps purpurea* (cornezuelo) en cereales; *Cochliobolus* (anamorfo: *Helminthosporium* de *Bipolaris*) *spp.* (manchas de las hojas) en maíz (*C. carbonum*), cereales (por ejemplo, *C. sativus*, anamorfo: *B. sorokiniana*) y arroz (por ejemplo, *C. miyabeanus*, anamorfo: *H. oryzae*); *Colletotrichum* (teleomorfo: *Glomerella*) *spp.* (antracnosis) en algodón (por ejemplo, *C. gossypii*), maíz (por ejemplo, *C. graminicola*: podredumbre del tallo por antracnosis), frutos blandos, patatas (por ejemplo, *C. coccodes*: mancha negra), judías (por ejemplo, *C. lindemuthianum*) y sojas (por ejemplo, *C. truncatum* o *C. gloeosporioides*); *Corticium spp.*, por ejemplo, *C. sasakii* (tizón de la vaina) en arroz; *Corynespora cassiicola* (manchas de las hojas) en soja y ornamentales; *Cyloconium spp.*, por ejemplo, *C. oleaginum* en olivos; *Cylindrocarpon spp.* (por ejemplo, úlcera del árbol frutal o deterioro de la vid joven, teleomorfo: *Nectria* o *Neonectria spp.*) en árboles frutales, vides (por ejemplo, *C. liriodendri*, teleomorfo: *Neonectria liriodendri*: enfermedad del Pie Negro) y ornamentales; *Dematophora* (teleomorfo: *Rosellinia*) *necatrix* (podredumbre de raíz y tallo) en sojas; *Diaporthe spp.*, por ejemplo, *D. phaseolorum* (caída) en sojas; *Drechslera* (sin. *Helminthosporium*, teleomorfo: *Pyrenophora*) *spp.* en maíz, cereales, tales como cebada (por ejemplo, *D. teres*, mancha en red) y trigo (por ejemplo, *D. tritici-repentis*: mancha bronceada), arroz y césped; *Esca* (acronecrosis, apoplejía) en vides, causada por *Fomitiporia* (sin. *Phellinus*) *punctata*, *F. mediterranea*, *Phaeomoniella chlamydospora* (anteriormente *Phaeoacremonium chlamydosporum*), *Phaeoacremonium aleophilum* y/o *Botryosphaeria obtusa*; *Elsinoe spp.* en frutos de pomo (*E. piri*), frutos blandos (*E. veneta*: antracnosis) y vides (*E. ampelina*: antracnosis); *Etyloma oryzae* (tizne de la hoja) en arroz; *Epicoccum spp.* (moho negro) en trigo; *Erysiphe spp.* (oidio) en remolachas azucareras (*E. betae*), verduras (por ejemplo, *E. pisi*), tales como cucurbitáceas (por ejemplo, *E. cichoracearum*), repollos, colza (por ejemplo, *E. cruciferarum*); *Eutypa lata* (úlceras por *Eutypa* o acronecrosis, anamorfo: *Cytosporina lata*, sin. *Libertella blepharis*) en árboles frutales, vides y maderas ornamentales; *Exserohilum* (sin. *Helminthosporium*) *spp.* en maíz (por ejemplo, *E. turcicum*); *Fusarium* (teleomorfo: *Gibberella*) *spp.* (marchitamiento, podredumbre de raíz o tallo) en diversas plantas, tales como *F. graminearum* o *F. culmorum* (podredumbre de raíz, costra o tizón de la parte superior) en cereales (por ejemplo, trigo o cebada), *F. oxysporum* en tomates, *F. solani* en soja y *F. verticillioides* en maíz; *Gaeumannomyces graminis* (añublo) en cereales (por ejemplo, trigo o cebada) y maíz; *Gibberella spp.* en cereales (por ejemplo, *G. zeae*) y arroz (por ejemplo, *G. fujikuroi*: enfermedad de Bakanae); *Glomerella cingulata* en vides, frutos de pomo y otras plantas y *G. gossypii* en algodón; complejos de tinción de granos en arroz; *Guignardia bidwellii* (podredumbre negra) en vides; *Gymnosporangium spp.* en plantas rosáceas y enebros, por ejemplo, *G. sabiniae* (roya) en peras; *Helminthosporium spp.* (sin. *Drechslera*, teleomorfo: *Cochliobolus*) en maíz, cereales y arroz; *Hemileia spp.*, por ejemplo, *H. vastatrix* (roya de la hoja del café) en café; *Isariopsis clavispora* (sin. *Cladosporium vitis*) en vides; *Macrophomina phaseolina* (sin. *phaseoli*) (podredumbre de raíz y tallo) en sojas y algodón; *Microdochium* (sin. *Fusarium*) *nivale* (moho rosa de la nieve) en cereales (por ejemplo, trigo o cebada); *Microsphaera diffusa* (oidio) en sojas; *Monilinia spp.*, por ejemplo, *M. laxa*, *M. fructicola* y *M. fructigena* (tizón de flor y ramas pequeñas, podredumbre marrón) en frutos de hueso y otras plantas rosáceas; *Mycosphaerella spp.* en cereales, bananas, frutos blandos y frutos secos molidos, tales como, por ejemplo, *M. graminicola* (anamorfo: *Septoria tritici*, mancha por *Septoria*) en trigo o *M. fijiensis* (enfermedad de Sigatoka negra) en bananas; *Peronospora spp.* (mildiu) en repollo (por ejemplo, *P. brassicae*), colza (por ejemplo, *P. parasitica*), cebollas (por ejemplo, *P. destructor*), tabaco (*P. tabacina*) y sojas (por ejemplo, *P. manshurica*); *Phakopsora pachyrhizi* y *P. meibomiae* (roya de la soja) en sojas; *Phialophora spp.* por ejemplo, en vides (por ejemplo, *P. tracheiphila* y *P. tetraspora*) y sojas (por ejemplo, *P. gregata*: podredumbre de tallo); *Phoma lingam* (podredumbre de raíz y tallo) en colza y repollo y *P. betae* (podredumbre de raíz, mancha de la hoja y caída) en remolachas azucareras; *Phomopsis spp.* en girasoles, vides (por ejemplo, *P. viticola*: mancha de la caña y la hoja) y sojas (por ejemplo, podredumbre de tallo: *P. phaseoli*, teleomorfo: *Diaporthe phaseolorum*); *Physoderma maydis* (manchas marrones) en maíz; *Phytophthora spp.* (marchitamiento, raíz, hoja, fruto y raíz del tallo) en diversas plantas, tales como pimentón y cucurbitáceas (por ejemplo, *P. capsici*), sojas (por ejemplo, *P. megasperma*, sin. *P. sojiae*), patatas y tomates (por ejemplo, *P. infestans*: tizón tardío) y árboles de hoja ancha (por ejemplo, *P. ramorum*: muerte súbita del roble); *Plasmodiophora brassicae* (hernia) en repollo, colza, rábano y otras plantas; *Plasmopara spp.*, por ejemplo, *P. viticola* (mildiu de la vid) en vides y *P. halstedii* en girasoles; *Podosphaera spp.* (oidio) en plantas rosáceas, lúpulo, frutos de pomo y blandos, por ejemplo, *P. leucotricha* en manzanas; *Polymyxa spp.*, por ejemplo, en cereales, tales como cebada y trigo (*P. graminis*) y remolachas azucareras (*P. betae*) y enfermedades virales así transmitidas; *Pseudocercospora herpotrichoides* (mancha ocular, teleomorfo: *Tapesia yallundae*) en cereales, por ejemplo, trigo o cebada; *Pseudoperonospora* (mildiu) en diversas plantas, por ejemplo, *P. cubensis* en cucurbitáceas o *P. humili* en lúpulo; *Pseudoopezicula tracheiphila* (enfermedad del fuego rojo o quemador de raíz, anamorfo: *Phialophora*) en vides; *Puccinia spp.* (royas) en diversas plantas, por ejemplo, *P. triticina* (roya marrón o de la hoja), *P. striiformis* (roya a rayas o amarilla), *P. hordei* (roya enana), *P. graminis* (roya del tallo o negra) o *P. recondita* (roya marrón o de la hoja) en cereales, tales como, por ejemplo, trigo, cebada o centeno, *P. kuehnii* (roya naranja) en caña de azúcar y *P. asparagi* en espárrago; *Pyrenophora* (anamorfo: *Drechslera*) *tritici-repentis* (mancha bronceada) en trigo o *P.*

5 *teres* (mancha en red) en cebada; *Pyricularia* spp., por ejemplo, *P. oryzae* (teleomorfo: *Magnaporthe grisea*, hongo del arroz) en arroz y *P. grisea* en césped y cereales; *Pythium* spp. (caída) en césped, arroz, maíz, trigo, algodón, colza, girasoles, sojas, remolachas azucareras, verduras y diversas otras plantas (por ejemplo, *P. ultimum* o *P. aphanidermatum*); *Ramularia* spp., por ejemplo, *R. collo-cygni* (manchas foliares por *Ramularia*, manchas fisiológicas de las hojas) en cebada y *R. beticola* en remolachas azucareras; *Rhizoctonia* spp. en algodón, arroz, patatas, césped, maíz, colza, patatas, remolachas azucareras, verduras y diversas otras plantas, por ejemplo, *R. solani* (podredumbre de raíz y tallo) en soja, *R. solani* (tizón de la vaina) en arroz o *R. cerealis* (tizón primaveral por *Rhizoctonia*) en trigo o cebada; *Rhizopus stolonifer* (moho negro, podredumbre leve) en fresas, zanahorias, repollos, vides y tomates; *Rhynchosporium secalis* (escaldadura) en cebada, centeno y tritical; *Sarocladium oryzae* y *S. attenuatum* (podredumbre de la vaina) en arroz; *Sclerotinia* spp. (podredumbre de tallo o moho blanco) en verduras y cultivos de campo, tales como colza, girasoles (por ejemplo, *S. sclerotiorum*) y sojas (por ejemplo, *S. rolfsii* o *S. sclerotiorum*); *Septoria* spp. en diversas plantas, por ejemplo, *S. glycines* (mancha marrón) en sojas, *S. tritici* (mancha por *Septoria*) en trigo y *S.* (sin. *Stagonospora*) *nodorum* (mancha por *Stagonospora*) en cereales; *Uncinula* (sin. *Erysiphe*) *necator* (oídio, anamorfo: *Oidium tuckeri*) en vides; *Setosphaeria* spp. (tizón de la hoja) en maíz (por ejemplo, *S. turcicum*, sin. *Helminthosporium turcicum*) y césped; *Sphacelotheca* spp. (tizne) en maíz, (por ejemplo, *S. reiliana*: tizne de parte superior), sorgo y caña de azúcar; *Sphaerotheca fuliginea* (oídio) en cucurbitáceas; *Spongospora subterranea* (costra pulverulenta) en patatas y enfermedades virales así transmitidas; *Stagonospora* spp. en cereales, por ejemplo, *S. nodorum* (mancha por *Stagonospora*, teleomorfo: *Leptosphaeria* [sin. *Phaeosphaeria*] *nodorum*) en trigo; *Synchytrium endobioticum* en patatas (enfermedad de verruga de la patata); *Taphrina* spp., por ejemplo, *T. deformans* (enfermedad de enrollamiento de la hoja) en melocotones y *T. pruni* (cavidad en la ciruela) en ciruelas; *Thielaviopsis* spp. (podredumbre de raíz negra) en tabaco, frutos de pomo, verduras, sojas y algodón, por ejemplo, *T. basicola* (sin. *Chalara elegans*); *Tilletia* spp. (carbón común o tizne hediondo) en cereales, tales como, por ejemplo, *T. tritici* (sin. *T. caries*, carbón del trigo) y *T. controversa* (carbón enano) en trigo; *Typhula incarnata* (moho de la nieve gris) en cebada o trigo; *Urocystis* spp., por ejemplo, *U. occulta* (tizne de tallo) en centeno; *Uromyces* spp. (roya) en vegetales, tales como judías (por ejemplo, *U. appendiculatus*, sin. *U. phaseoli*) y remolachas azucareras (por ejemplo, *U. betae*); *Ustilago* spp. (tizne suelto) en cereales (por ejemplo, *U. nuda* y *U. avenae*), maíz (por ejemplo, *U. maydis*: tizne del maíz) y caña de azúcar; *Venturia* spp. (costra) en manzanas (por ejemplo, *V. inaequalis*) y peras; y *Verticillium* spp. (marchitamiento) en diversas plantas, tales como frutos y ornamentales, vides, frutos blandos, vegetales y cultivos de campo, por ejemplo, *V. dahliae* en fresas, colza, patatas y tomates.

Los compuestos I y las composiciones de los mismos, respectivamente, pueden usarse para mejorar la salud de una planta. La invención también se refiere a un método para mejorar la salud de la planta tratando una planta, su material de propagación y/o el sitio donde la planta está creciendo o crecerá con una cantidad eficaz de compuestos I y composiciones de los mismos, respectivamente.

35 Debe entenderse que el término "salud de la planta" indica una condición de la planta y/o sus productos que está determinada por varios indicadores, solos o en combinación entre sí, tales como rendimiento (por ejemplo, aumento de la biomasa y/o aumento del contenido de componentes valiosos), vigor de la planta (por ejemplo, crecimiento de la planta mejorado y/u hojas más verdes ("efecto de mayor verdor")), calidad (por ejemplo, contenido o composición mejorado de ciertos componentes) y tolerancia al estrés abiótico y/o biótico. Los indicadores anteriormente
40 identificados para la condición de salud de una planta pueden ser interdependientes y pueden ser el resultado el uno del otro.

Los compuestos de fórmula I pueden estar presentes en diferentes modificaciones cristalinas cuya actividad biológica puede diferir. Asimismo, son materia de la presente invención.

45 Los compuestos I se emplean como tales o en forma de composiciones tratando los hongos o las plantas, materiales de propagación vegetal, tales como semillas, tierra, superficies, materiales o habitaciones que se desean proteger del ataque fúngico, con una cantidad fungicidamente eficaz de las sustancias activas. La aplicación puede llevarse a cabo tanto antes como después de la infección de las plantas, materiales de propagación vegetal, tales como semillas, tierra, superficies, materiales o habitaciones, por los hongos.

50 Los materiales de propagación vegetal pueden tratarse con los compuestos I como tales o una composición que comprende al menos un compuesto I profilácticamente tanto durante como antes de plantarse o trasplantarse.

La invención también se refiere a composiciones agroquímicas que comprenden un compuesto auxiliar y al menos un compuesto I según la invención.

55 Una composición agroquímica comprende una cantidad fungicidamente eficaz de un compuesto I. El término "cantidad eficaz" indica una cantidad de la composición o de los compuestos I que es suficiente para controlar hongos dañinos en plantas cultivadas o para proteger materiales, y que no produce un daño sustancial a las plantas tratadas. Una cantidad tal puede variar en un amplio intervalo y depende de diversos factores, tales como las especies fúngicas que van a controlarse, el material o la planta cultivada tratada, las condiciones climáticas y el compuesto I específico usado.

Los compuestos I, sus N-óxidos y sales pueden convertirse en los tipos habituales de composiciones agroquímicas, por ejemplo, soluciones, emulsiones, suspensiones, polvillo, polvos, pastas, gránulos, productos prensados, cápsulas y mezclas de los mismos. Ejemplos de tipos de composición son suspensiones (por ejemplo, SC, OD, FS), concentrados emulsionables (por ejemplo, EC), emulsiones (por ejemplo, EW, EO, ES, ME), cápsulas (por ejemplo, CS, ZC), pastas, pastillas, polvos o polvillo humectables (por ejemplo, WP, SP, WS, DP, DS), productos prensados (por ejemplo, BR, TB, DT), gránulos (por ejemplo, WG, SG, GR, FG, GG, MG), artículos insecticidas (por ejemplo, LN), además de formulaciones en gel para el tratamiento de materiales de propagación vegetal, tales como semillas (por ejemplo, GF). Estas composiciones y composiciones adicionales se definen en "Catalogue of pesticide formulation types and international coding system", Technical Monograph No. 2, 6ª Ed., mayo de 2008, CropLife International.

Las composiciones se preparan de una manera conocida, como se describe por Mollet y Grubemann, *Formulation technology*, Wiley VCH, Weinheim, 2001; o Knowles, *New developments in crop protection product formulation*, Agron Reports DS243, T&F Informa, Londres, 2005.

Auxiliares adecuados son disolventes, vehículos líquidos, vehículos sólidos o cargas, tensioactivos, dispersantes, emulsionantes, hidratantes, adyuvantes, solubilizantes, potenciadores de la penetración, coloides protectores, agentes de adhesión, espesantes, humectantes, repelentes, atrayentes, estimulantes alimenticios, compatibilizadores, bactericidas, agentes anticongelantes, agentes antiespumantes, colorantes, agentes de adhesividad y aglutinantes.

Disolventes y vehículos líquidos adecuados son agua y disolventes orgánicos, tales como fracciones de aceite mineral de punto de ebullición de medio a alto, por ejemplo, queroseno, gasóleo; aceites de origen vegetal o animal; hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, tolueno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados; alcoholes, por ejemplo, etanol, propanol, butanol, alcohol bencílico, ciclohexanol; glicoles; DMSO; cetonas, por ejemplo, ciclohexanona; ésteres, por ejemplo, lactatos, carbonatos, ésteres de ácidos grasos, gamma-butirolactona; ácidos grasos; fosfonatos; aminas; amidas, por ejemplo, N-metilpirrolidona, dimetilamidas de ácidos grasos; y mezclas de los mismos.

Vehículos sólidos o cargas adecuados son tierras minerales, por ejemplo, silicatos, geles de sílice, talco, caolines, p caliza, cal, creta, arcillas, dolomita, tierra de diatomeas, bentonita, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio; polisacáridos, por ejemplo, celulosa, almidón; fertilizantes, por ejemplo, sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas; productos de origen vegetal, por ejemplo, harina de cereal, harina de corteza de árbol, harina de madera, harina de cáscara de nuez y mezclas de los mismos.

Tensioactivos adecuados son compuestos tensioactivos, tales como tensioactivos aniónicos, catiónicos, no iónicos y anfóteros, polímeros de bloque, polielectrolitos y mezclas de los mismos. Tales tensioactivos pueden usarse como emulsionante, dispersante, solubilizante, hidratante, potenciador de la penetración, coloide protector o adyuvante. Ejemplos de tensioactivos se enumeran en McCutcheon's, Vol.1: *Emulsifiers & Detergents*, McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. o North American Ed).

Tensioactivos aniónicos adecuados son sales alcalinas, alcalinotérricas o de amonio de sulfonatos, sulfatos, fosfatos, carboxilatos y mezclas de los mismos. Ejemplos de sulfonatos son alquilarilsulfonatos, difenilsulfonatos, sulfonatos de alfa-olefina, sulfonatos de lignina, sulfonatos de ácidos grasos y aceites, sulfonatos de alquilfenoles etoxilados, sulfonatos de arilfenoles alcoxilados, sulfonatos de naftalenos condensados, sulfonatos de dodecil- y tridecilbencenos, sulfonatos de naftalenos y alquilnaftalenos, sulfosuccinatos o sulfosuccinatos. Ejemplos de sulfatos son sulfatos de ácidos grasos y aceites, de alquilfenoles etoxilados, de alcoholes, de alcoholes etoxilados o de ésteres de ácidos grasos. Ejemplos de fosfatos son ésteres de fosfato. Ejemplos de carboxilatos son alquilcarboxilatos, y alcohol carboxilado o etoxilatos de alquilfenol.

Tensioactivos no iónicos adecuados son alcoxilatos, amidas de ácidos grasos N-sustituidos, óxidos de amina, ésteres, tensioactivos basados en azúcar, tensioactivos poliméricos y mezclas de los mismos. Ejemplos de alcoxilatos son compuestos tales como alcoholes, alquilfenoles, aminas, amidas, arilfenoles, ácidos grasos o ésteres de ácidos grasos que han sido alcoxilados con 1 a 50 equivalentes. Pueden emplearse óxido de etileno y/u óxido propileno para la alcoxilación, preferentemente óxido de etileno. Ejemplos de aminas de ácidos grasos N-sustituidos son glucamidas de ácido graso o alcanolamidas de ácido graso. Ejemplos de ésteres son ésteres de ácidos grasos, ésteres de glicerol o monoglicéridos. Ejemplos de tensioactivos basados en azúcar son sorbitanos, sorbitanos etoxilados, ésteres de sacarosa y de glucosa o alquilpoliglucósidos. Ejemplos de tensioactivos poliméricos son homo- o copolímeros de vinilpirrolidona, alcoholes vinílicos o acetato de vinilo.

Tensioactivos catiónicos adecuados son tensioactivos cuaternarios, por ejemplo, compuestos de amonio cuaternario con uno o dos grupos hidrófobos, o sales de aminas primarias de cadena larga. Tensioactivos anfóteros adecuados son alquilbetaínas e imidazolininas. Polímeros de bloque adecuados son polímeros de bloque del tipo A-B o A-B-A que comprenden bloques de poli(óxido de etileno) y poli(óxido de propileno), o del tipo A-B-C que comprende alcohol, poli(óxido de etileno) y poli(óxido de propileno). Polielectrolitos adecuados son poliácidos o polibases.

Ejemplos de poliácidos son sales alcalinas de ácido poliacrílico o polímeros tipo peine de poliácidos. Ejemplos de polibases son polivinilaminas o polietilenaminas.

5 Adyuvantes adecuados son compuestos que ellos mismos tienen una actividad pesticida insignificante o incluso ninguna actividad pesticida y que mejoran el rendimiento biológico del compuesto I sobre la diana. Ejemplos son tensioactivos, aceites minerales o vegetales, y otros auxiliares. Otros ejemplos se enumeran por Knowles, Adjuvants and additives, Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, Capítulo 5.

Espesantes adecuados son polisacáridos (por ejemplo, goma xantana, carboximetilcelulosa), arcillas inorgánicas (orgánicamente modificadas o no modificadas), policarboxilatos y silicatos.

10 Bactericidas adecuados son derivados de bronopol e isotiazolinona, tales como alquilisotiazolinonas y bencisotiazolinonas.

Agentes anticongelantes adecuados son etilenglicol, propilenglicol, urea y glicerina.

Agentes antiespumantes adecuados son siliconas, alcoholes de cadena larga y sales de ácidos grasos.

15 Colorantes adecuados (por ejemplo, en rojo, azul o verde) son pigmentos de baja solubilidad en agua y colorantes solubles en agua. Ejemplos son colorantes inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, hexacianoferrato de hierro) y colorantes orgánicos (por ejemplo, colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina).

Agentes de adhesividad o aglutinantes adecuados son polivinilpirrolidonas, poli(acetatos de vinilo), poli(alcoholes vinílicos), poli(acrilatos), ceras biológicas o sintéticas y éteres de celulosa.

Ejemplos de tipos de composiciones y su preparación son:

i) Concentrados solubles en agua (SL, LS)

20 Se disuelven 10-60 % en peso de un compuesto I y 5-15 % en peso de agente humectante (por ejemplo, alcoxilatos de alcohol) en agua y/o en un solvente soluble en agua (por ejemplo, alcoholes) hasta el 100 % en peso. La sustancia activa se disuelve tras la dilución con agua.

ii) Concentrados dispersables (DC)

25 Se disuelven 5-25 % en peso de un compuesto I y 1-10 % en peso de dispersante (por ejemplo, polivinilpirrolidona) en disolvente orgánico (por ejemplo, ciclohexanona) hasta el 100 % en peso. La dilución con agua da una dispersión.

iii) Concentrados emulsionables (EC)

30 Se disuelven 15-70 % en peso de un compuesto I y 5-10 % en peso de emulsionantes (por ejemplo, dodecilmencensulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) en disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático) hasta el 100 % en peso. La dilución con agua da una emulsión.

iv) Emulsiones (EW, EO, ES)

35 Se disuelven 5-40 % en peso de un compuesto I y 1-10 % en peso de emulsionantes (por ejemplo, dodecilmencensulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) en 20-40 % en peso de disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático). Esta mezcla se introduce en agua hasta el 100 % en peso mediante una máquina emulsionante y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión.

v) Suspensiones (SC, OD, FS)

40 En un molino de bolas con agitación se trituran 20-60 % en peso de un compuesto I con la adición 2-10 % en peso de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato sódico y etoxilato de alcohol), 0,1-2 % en peso de espesante (por ejemplo, goma xantana) y agua hasta el 100 % en peso dando una suspensión fina de sustancia activa. La dilución con agua da una suspensión estable de la sustancia activa. Para la composición de tipo FS se añade hasta el 40 % en peso de aglutinante (por ejemplo, poli(alcohol vinílico)).

vi) Gránulos dispersables en agua y gránulos solubles en agua (WG, SG)

Se muelen finamente 50-80 % en peso de un compuesto I con la adición de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio y etoxilato de alcohol) hasta el 100 % en peso y se preparan como gránulos dispersables en agua o gránulos solubles en agua por medio de artefactos técnicos (por ejemplo, extrusión, torre de pulverización, lecho fluidizado). La dilución con agua da una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

5 vii) Polvos dispersables en agua y polvos solubles en agua (WP, SP, WS)

Se muelen 50-80 % en peso de un compuesto I en un molino de rotor-estator con la adición de 1-5 % en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio), 1-3 % en peso de agentes humectantes (por ejemplo, etoxilato de alcohol) y vehículo sólido (por ejemplo, gel de sílice) hasta el 100 % en peso de. La dilución con agua da una dispersión o solución estable de la sustancia activa.

10 viii) Gel (GW, GF)

En un molino de bolas con agitación se trituran 5-25 % en peso de un compuesto I con la adición 3-10 % en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato de sodio), 1-5 % en peso de espesante (por ejemplo, carboximetilcelulosa) y agua hasta el 100 % en peso dando una suspensión fina de sustancia activa. La dilución con agua da una suspensión estable de la sustancia activa.

15 iv) Microemulsión (ME)

Se añaden 5-20 % en peso de un compuesto I a 5-30 % en peso de mezcla de disolvente orgánico (por ejemplo, dimetilamida de ácido graso y ciclohexanona), 10-25 % en peso de mezcla de tensioactivos (por ejemplo, etoxilato de alcohol y etoxilato de arilfenol) y agua hasta el 100 %. Esta mezcla se agita durante 1 h para producir espontáneamente una microemulsión termodinámicamente estable.

20 iv) Microcápsulas (CS)

Una fase oleosa que comprende 5-50 % en peso de un compuesto I, 0-40 % en peso de disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático), 2-15 % en peso de monómeros acrílicos (por ejemplo, metacrilato de metilo, ácido metacrílico y un di- o triacrilato) se dispersa en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, poli(alcohol vinílico)). La polimerización de radicales iniciada por un iniciador de radicales produce la formación de microcápsulas de poli(met)acrilato. Alternativamente, una fase oleosa que comprende 5-50 % en peso de un compuesto I según la invención, 0-40 % en peso de disolvente orgánico insoluble en agua (por ejemplo, hidrocarburo aromático) y un monómero de isocianato (por ejemplo, difenilmeteno-4,4'-diisocianato) se dispersa en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, poli(alcohol vinílico)). La adición de una poliamina (por ejemplo, hexametildiamina) produce la formación de microcápsulas de poliurea. Los monómeros representan el 1-10 % en peso. El % en peso se refiere a la composición de CS total.

ix) Polvos extensibles (DP, DS)

Se muelen finamente 1-10 % en peso de un compuesto I, y se mezclan íntimamente con un vehículo sólido (por ejemplo, caolín finamente dividido) hasta el 100 % en peso.

x) Gránulos (GR, FG)

35 Se muelen finamente 0,5-30 % en peso de un compuesto I y se asocian con un vehículo sólido (por ejemplo, silicato) hasta el 100 % en peso. La granulación se logra por extrusión, secado por pulverización o lecho fluidizado.

xi) Líquidos de volumen ultra-bajo (UL)

Se disuelven 1-50 % en peso de un compuesto I en disolvente orgánico (por ejemplo, hidrocarburo aromático) hasta el 100 % en peso.

40 Los tipos de composiciones i) a xi) pueden comprender opcionalmente auxiliares adicionales, tales como 0,1-1 % en peso de bactericidas, 5-15 % en peso de agentes anticongelantes, 0,1-1 % en peso de agentes antiespumantes y 0,1-1 % en peso de colorantes.

45 Las composiciones agroquímicas comprenden generalmente entre el 0,01 y el 95 %, preferentemente entre el 0,1 y el 90 % y en particular entre el 0,5 y el 75 % en peso de sustancia activa. Las sustancias activas se emplean en una pureza del 90 % al 100 %, preferentemente del 95 % al 100 % (según el espectro de RMN).

Las soluciones para el tratamiento de semillas (LS), suspoemulsiones (SE), concentrados fluidos (FS), polvos para

tratamiento en seco (DS), polvos dispersables en agua para tratamiento en suspensión (WS), polvos solubles en agua (SS), emulsiones (ES), concentrados emulsionables (EC) y geles (GF) se emplean normalmente para los fines de tratamiento de materiales de propagación vegetal, particularmente semillas. Las composiciones en cuestión dan, después de una dilución de dos a diez veces, concentraciones de sustancia activa del 0,01 al 60 % en peso, preferentemente del 0,1 al 40 %, en las preparaciones listas para usar. La aplicación puede llevarse a cabo antes o durante la siembra. Métodos para aplicar el compuesto I y las composiciones del mismo, respectivamente, al material de propagación vegetal, especialmente las semillas, incluyen métodos de aplicación por recubrimiento, revestimiento, granulación, espolvoreo, empapado y en surco del material de propagación. Preferentemente, el compuesto I o las composiciones del mismo, respectivamente, se aplican al material de propagación vegetal por un método tal que no induce la germinación, por ejemplo, por recubrimiento, granulación, revestimiento y espolvoreo de semillas.

Cuando se emplean en la protección de plantas, las cantidades de sustancias activas aplicadas son, dependiendo del tipo de efecto deseado, de 0,001 a 2 kg por ha, preferentemente de 0,005 a 2 kg por ha, más preferentemente de 0,05 a 0,9 kg por ha y, en particular, de 0,1 a 0,75 kg por ha.

En el tratamiento de materiales de propagación vegetal, tales como semillas, por ejemplo, por espolvoreo, revestimiento o empapado de semilla, generalmente se requieren cantidades de sustancia activa de 0,1 a 1000 g, preferentemente de 1 a 1000 g, más preferentemente de 1 a 100 g y lo más preferentemente 5 a 100 g por 100 kilogramos de material de propagación vegetal (preferentemente semillas).

Cuando se usan en la protección de materiales o productos almacenados, la cantidad de sustancia activa aplicada depende del tipo de área de aplicación y del efecto deseado. Cantidades habitualmente aplicadas en la protección de materiales son 0,001 g a 2 kg, preferentemente 0,005 g a 1 kg, de sustancia activa por metro cúbico de material tratado.

Pueden añadirse diversos tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, fertilizantes o micronutrientes y pesticidas adicionales (por ejemplo, herbicidas, insecticidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, protectores) a las sustancias activas o a las composiciones que los comprenden como premezclas o, si es apropiado, no hasta inmediatamente antes de uso (mezcla en el tanque). Estos agentes pueden mezclarse con las composiciones según la invención en una relación en peso de 1:100 a 100:1, preferentemente 1:10 a 10:1.

El usuario aplica la composición según la invención normalmente de un dispositivo de predosificación, un pulverizador de mochila, un tanque de pulverización, un avión de pulverización o un sistema de irrigación. Normalmente, la composición agroquímica está constituida por agua, tampón y/o auxiliares adicionales en la concentración de aplicación deseada y así se obtiene el líquido de pulverización listo para usar o la composición agroquímica según la invención. Normalmente, se aplican 20 a 2000 litros, preferentemente 50 a 400 litros, del líquido de pulverización listo para usar por hectárea de área agrícola útil.

Según una realización, el propio usuario puede mezclar los componentes individuales de la composición según la invención, tales como partes de un kit o partes de una mezcla binaria o ternaria, en un tanque de pulverización, y pueden añadirse auxiliares adicionales, si es apropiado.

La mezcla de los compuestos I o las composiciones que los comprenden en la forma de uso de fungicidas con otros fungicidas da como resultado, en muchos casos, una expansión del espectro fungicida de actividad que se obtiene o una prevención del desarrollo de resistencia fungicida. Además, en muchos casos, se obtienen efectos sinérgicos.

Está previsto que la siguiente lista de sustancias activas, junto con las cuales pueden usarse los compuestos I, ilustre las posibles combinaciones, pero no las limite:

A) Inhibidores de la respiración

- Inhibidores del complejo III en el sitio Q_o (por ejemplo, estrobilurinas): azoxistrobina, coumetoxistrobina, coumoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina, fenaministrobina, fenoxistrobina/fluoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobrina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobrina, pirametrobina, piraoxistrobina, trifloxistrobina, éster metílico del ácido 2-[2-(2,5-dimetil-fenoximetil)-fenil]-3-metoxi-acrílico y 2-(2-(3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-alilidenaminoximetil)-fenil)-2-metoxiimino-N-metil-acetamida, piribencarb, triclopircarb/clorodincarb, famoxadona, fenamidona;

- inhibidores del complejo III en el sitio Q_i: ciazofamid, amisulbrom, 2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-acetoxi-4-metoxi-piridin-2-carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo], 2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-(acetoximetoxi)-4-metoxi-piridin-2-carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo], 2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-isobutoxicarbonilo)-4-metoxi-piridin-2-carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo], 2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-(1,3-benzodioxol-5-ilmetoxi)-4-

metoxipiridin-2-carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo]; 2-metilpropanoato de (3S,6S,7R,8R)-3-[[[(3-hidroxi-4-metoxi-2-piridinil)carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-8-(fenilmetil)-1,5-dioxonan-7-ilo]

5 - inhibidores de complejo II (por ejemplo, carboxamidas): benodanil, benzovindiflupir, bixafen, boscalid, carboxin, fenfuram, fluopiram, flutolanil, fluxapiroxad, furametpir, isopirazam, mepronil, oxicarboxin, penflufen, pentiopirad, sedaxano, tecoftalam, tifluzamida, N-(4'-trifluorometiltiobifenil-2-il)-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(2-(1,3,3-trimetil-butyl)-fenil)-1,3-dimetil-5-fluoro-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida;

10 - otros inhibidores de la respiración (por ejemplo, complejo I, desacopladores): diflumentorim, (5,8-difluoroquinazolin-4-il)-{2-[2-fluoro-4-(4-trifluorometilpiridin-2-iloxi)-fenil]-etil}-amina; derivados de nitrofenilo: binapacril, dinobuton, dinocap, fluazinam; ferimzona; compuestos organometálicos: sales de fentina, tales como acetato de fentina, cloruro de fentina o hidróxido de fentina; ametotradin; y siltiofam;

15 B) Inhibidores de la biosíntesis de esteroides (fungicidas de SBI)

20 - Inhibidores de la C14 desmetilasa (fungicidas DMI): triazoles: azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, oxpoconazol, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, 1-[*rel*-(2S;3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-5-tiocianato-1H-[1,2,4]triazol, 2-[*rel*-(2S;3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-2H-[1,2,4]triazol-3-tiol; imidazoles: imazalil, pefurazoato, procloraz, triflumizol; pirimidinas, piridinas y piperazinas: fenarimol, nuarimol, pirifenox, triforina;

- inhibidores de la delta 14-reductasa: aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin, piperalin, espiroxamina;

25 - inhibidores de la 3-cetoreductasa: fenhexamid;

C) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos

- fungicidas de fenilamidas o acilaminoácido: benalaxil, benalaxil-M, kiralaxil, metalaxil, metalaxil-M (mefenoxam), ofurace, oxadixil;

30 - otros: himexazol, octilina, ácido oxolínico, bupirimato, 5-fluorocitosina, 5-fluoro-2-(p-tolilmetoxi)pirimidin-4-amina, 5-fluoro-2-(4-fluorofenilmetoxi)pirimidin-4-amina;

D) Inhibidores de la división celular y citoesqueleto

- inhibidores de tubulina, tales como bencimidazoles, tiofanatos: benomilo, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol, tiofanato-metilo; triazolopirimidinas: 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina

35 - otros inhibidores de la división celular: dietofencarb, etaboxam, pencicuron, fluopicolida, zoxamida, metrafenona, piriofenona;

E) Inhibidores de la síntesis de aminoácidos y proteínas

- inhibidores de la síntesis de metionina (anilino-pirimidinas): ciprodinil, mepanipirim, pirimetanil;

40 - inhibidores de la síntesis de proteínas: blasticidin-S, kasugamicina, clorhidrato de kasugamicina hidratada, mildiomicina, estreptomycin, oxitetraciclina, polioxina, validamicina A;

F) Inhibidores de la transducción de señales

- inhibidores de MAP / histidina cinasas: fluoroimid, iprodiona, procimidona, vinclozolin, fenciclonil, fludioxonil;

- inhibidores de la proteína G: quinoxifen;

G) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membrana

- Inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos: edifenfos, iprobenfos, pirazofos, isoprotiolano;
 - peroxidación de lípidos: dicloran, quintozeno, tecnazeno, tolclofos-metilo, bifenilo, cloroneb, etridiazol;
 - biosíntesis de los fosfolípidos y depósito de la pared celular: dimetomorf, flumorf, mandipropamid, pirimorf, bentiavalicarb, iprovalicarb, valifenalato y éster (4-fluorofenílico) del ácido N-(1-(1-(4-ciano-fenil)etanosulfonil)-but-2-il)carbámico;
 - compuestos que afectan la permeabilidad de la membrana celular y ácidos grasos: propamocarb, propamocarb-clorhidrato
 - inhibidores de amida hidrolasa del ácido graso: 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona
- 5
- H) Inhibidores con acción en múltiples sitios
- sustancias activas inorgánicas: mezcla de Burdeos, acetato de cobre, hidróxido de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico, azufre;
 - tio- y ditiocarbamatos: ferbam, mancozeb, maneb, metam, metiram, propineb, tiram, zineb, ziram;
 - compuestos de organocloro (por ejemplo, ftalimidas, sulfamidas, cloronitrilos): anilazina, clorotalonil, captafol, captan, folpet, diclofluanid, diclorofen, flusulfamida, hexaclorobenceno, pentaclorfenol y sus sales, ftalida, tolilfluanid, N-(4-cloro-2-nitro-fenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida;
 - guanidinas y otros: guanidina, dodina, base libre de dodina, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, tris(albesilato) de iminoctadina, ditanon, 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetraona;
- 15
- I) Inhibidores de la síntesis de la pared celular
- inhibidores de la síntesis de glucano: validamicina, polioxina B; inhibidores de la síntesis de melanina: piroquilon, triciclazol, carpropamid, diciclomet, fenoxanil;
- J) Inductores de la defensa de la planta
- acibenzolar-S-metilo, probenazol, isotianil, tiadinil, prohexadiona-calcio; fosfonatos: fosetil, fosetil-aluminio, ácido fosforoso y sus sales;
- 25
- K) Modo de acción desconocido
- bronopol, quinometionato, ciflufenamida, cimoxanil, dazomet, debacarb, diclomezina, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamin, fempirazamina, flumetover, flusulfamida, flutianil, metasulfocarb, nitrapirin, nitrotal-isopropilo, oxatiapiprolin, oxina-cobre, proquinazid, tebufloquin, tecloftalam, triazóxido, 2-butoxi-6-yodo-3-propilcromon-4-ona, N-(ciclopropilmetoxiimino-(6-difluoro-metoxi-2,3-difluoro-fenil)-metil)-2-fenilacetamida, N'-(4-(4-cloro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metilformamidina, N'-(4-(4-fluoro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metilformamidina, N'-(2-metil-5-trifluorometil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metilformamidina, N'-(5-difluorometil-2-metil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metilformamidina, éster 6-terc-butyl-8-fluoro-2,3-dimetil-quinolin-4-ílico del ácido metoxi-acético, 3-[5-(4-metilfenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina, 3-[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina (pirisoxazol),
- 30
- 35
- amida del ácido N-(6-metoxi-piridin-3-il)ciclopropanocarboxílico, 5-cloro-1-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-2-metil-1H-benzoimidazol, 2-(4-cloro-fenil)-N-[4-(3,4-dimetoxi-fenil)-isoxazol-5-il]-2-prop-2-iniloxi-acetamida;
- L) Agentes de biocontrol antifúngico, bioactivadores de plantas: *Ampelomyces quisqualis* (por ejemplo, AQ 10[®] de Intrachem Bio GmbH & Co. KG, Germany), *Aspergillus flavus* (por ejemplo, AFLAGUARD[®] de Syngenta, CH), *Aureobasidium pullulans* (por ejemplo, BOTECTOR[®] de bio-ferm GmbH, Alemania), *Bacillus pumilus* (por ejemplo, acceso de NRRL n.º B-30087 en SONATA[®] y BALLAD[®] Plus de AgraQuest Inc., EE.UU.), *Bacillus subtilis* (por ejemplo, cepa aislada NRRL-Nr. B-21661 en RHAPSODY[®], SERENADE[®] MAX y SERENADE[®] ASO de AgraQuest Inc., EE.UU.), *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* FZB24 (por ejemplo, TAEGRO[®] de Novozyme Biologicals, Inc., EE.UU.), *Candida oleophila* I-82 (por ejemplo, ASPIRE[®] de Ecogen Inc., EE.UU.), *Candida saitoana* (por ejemplo, BIOCURE[®] (en mezcla con lisozima) y BIOCOAT[®] de Micro Flo Company, EE.UU. (BASF SE) y Arysta), quitosano (por ejemplo, ARMOUR-ZEN de BotriZen Ltd., NZ), *Clonostachys rosea f. catenulata*, también llamada *Gliocladium*
- 40
- 45

catenulatum (por ejemplo, cepa aislada J1446: PRESTOP® de Verdera, Finlandia), *Coniothyrium minitans* (por ejemplo, CONTANS® de Prophyta, Alemania), *Cryphonectria parasitica* (por ejemplo, *Endothia parasítica* de CNICM, Francia), *Cryptococcus albidus* (por ejemplo, YIELD PLUS® de Anchor Bio-Technologies, Sudáfrica), *Fusarium oxysporum* (por ejemplo, BIOFOX® de S.I.A.P.A., Italia, FUSACLEAN® de Natural Plant Protection, Francia),
 5 *Metschnikowia fructicola* (por ejemplo, SHEMER® de Agrogreen, Israel), *Microdochium dimerum* (por ejemplo, ANTIBOT® de Agrauxine, Francia), *Phlebiopsis gigantea* (por ejemplo, ROTSOP® de Verdera, Finlandia), *Pseudozyma flocculosa* (por ejemplo, SPORODEX® de Plant Products Co. Ltd., Canadá), *Pythium oligandrum* DV74 (por ejemplo, POLYVERSUM® de Remeslo SSRO, Biopreparaty, Rep. Checa), *Reynoutria sachlinensis* (por ejemplo, REGALIA® de Marrone BioInnovations, EE.UU.), *Talaromyces flavus* V117b (por ejemplo, PROTUS® de Prophyta,
 10 Alemania), *Trichoderma asperellum* SKT-1 (por ejemplo, ECO-HOPE® de Kumiai Chemical Industry Co., Ltd., Japón), *T. atroviride* LC52 (por ejemplo, SENTINEL® de Agrimm Technologies Ltd, NZ), *T. harzianum* T-22 (por ejemplo, PLANTSHIELD® de la empresa BioWorks Inc., EE.UU.), *T. harzianum* TH 35 (por ejemplo, ROOT PRO® de Mycontrol Ltd., Israel), *T. harzianum* T-39 (por ejemplo, TRICHODEX® y TRICHODERMA 2000® de Mycontrol Ltd., Israel y Makhteshim Ltd., Israel), *T. harzianum* y *T. viride* (por ejemplo, TRICHOPEL de Agrimm Technologies Ltd,
 15 NZ), *T. harzianum* ICC012 y *T. viride* ICC080 (por ejemplo, REMEDIER® WP de Isagro Ricerca, Italia), *T. polysporum* y *T. harzianum* (por ejemplo, BINAB® de BINAB Bio-Innovation AB, Suecia), *T. stromaticum* (por ejemplo, TRICOVAB® de C.E.P.L.A.C., Brasil), *T. virens* GL-21 (por ejemplo, SOILGARD® de Certis LLC, EE.UU.), *T. viride* (por ejemplo, TRIECO® de Ecosense Labs. (India) Pvt. Ltd., India, BIO-CURE® F de T. Stanes & Co. Ltd., India), *T. viride* TV1 (por ejemplo, T. viride TV1 de Agribiotec srl, Italia), *Ulocladium oudemansii* HRU3 (por ejemplo,
 20 BOTRY-ZEN® de Botry-Zen Ltd, NZ);

M) Reguladores del crecimiento

ácido abscísico, amidoclor, ancimidol, 6-bencilaminopurina, brasinolida, butralin, clormequat (cloruro de clormequat), cloruro de colina, ciclanilida, daminozida, dikegulac, dimetipin, 2,6-dimetilpuridina, etefon, flumetralin, flurprimidol,
 25 flutiacet, forclorfenuron, ácido giberélico, inabenfide, ácido indol-3-acético, hidrazida maleica, mefluidida, mepiquat (cloruro de mepiquat), ácido naftalenoacético, N-6-benciladenina, paclobutrazol, prohexadiona (prohexadiona-calcio), prohidrojasmona, tidiazuron, triapentenol, fosforotriato de tributilo, ácido 2,3,5-tri-yodobenzoico, trinexapac-etilo y uniconazol;

N) Herbicidas

- 30 - acetamidas: acetoclor, alaclor, butaclor, dimetaclor, dimetenamid, flufenacet, mefenacet, metolaclor, metazaclor, napropamida, naproanilida, petoxamid, pretilaclor, propaclor, tenilclor;
- derivados de aminoácido: bilanafos, glifosato, glufosinato, sulfosato;
- ariloxifenoxipropionatos: clodinafop, cihalofop-butilo, fenoxaprop, fluazifop, haloxifop, metamifop, propaquizafop, quizalofop, quizalofop-P-tefurilo;
- Bipiridilos: diquat, paraquat;
- 35 - (tio)carbamatos: asulam, butilato, carbetamida, desmedifam, dimepiperato, eptam (EPTC), esprocarb, molinato, orbencarb, fenmedifam, prosulfocarb, piributicarb, tiobencarb, trialato;
- ciclohexanodionas: butroxidim, cletodim, cicloxidim, profoxidim, setoxidim, tepraloxidim, tralcoxidim;
- dinitroanilinas: benfluralin, etalfluralin, orizalin, pendimetalin, prodiamina, trifluralin;
- éteres de difenilo: acifluorfen, aclonifen, bifenox, diclofop, etoxifen, fomesafen, lactofen, oxifluorfen;
- 40 - hidroxibenzonitrilos: bomoxinil, diclobenil, ioxinil;
- imidazolinonas: imazametabenz, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquin, imazetapir;
- ácidos fenoxiacéticos: clomeprop, ácido 2,4-diclorofenoxiacético (2,4-D), 2,4-DB, diclorprop, MCPA, MCPA-tioetilo, MCPB, Mecoprop;
- pirazinas: cloridazon, flufenpir-etilo, flutiacet, norflurazon, piridato;
- 45 - piridinas: aminopirialid, clopiralid, diflufenican, ditiopir, fluridona, fluroxipir, picloram, picolinafen, tiazopir;
- sulfonilureas: amidosulfuron, azimsulfuron, bensulfuron, clorimuron-etilo, clorsulfuron, cinosulfuron,

- ciclosulfamuron, etoxisulfuron, flazasulfuron, flucetosulfuron, flupirsulfuron, foramsulfuron, halosulfuron, imazosulfuron, yodosulfuron, mesosulfuron, metazosulfuron, metsulfuron-metilo, nicosulfuron, oxasulfuron, primisulfuron, prosulfuron, pirazosulfuron, rimsulfuron, sulfometuron, sulfosulfuron, tifensulfuron, triasulfuron, tribenuron, trifloxisulfuron, triflusulfuron, tritosulfuron, 1-((2-cloro-6-propil-imidazo[1,2-b]piridazin-3-il)sulfonil)-3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)urea;
- 5
- triazinas: ametrina, atrazina, cianazina, dimetametrina, etiozin, hexazinona, metamitron, metribuzin, prometrina, simazina, terbutilazina, terbutrina, triaziflam;
 - ureas: clorotoluron, daimuron, diuron, fluometuron, isoproturon, linuron, metabenziazuron, tebutiuron;
 - otros inhibidores de la acetolactato sintasa: bispiribac-sodio, cloransulam-metilo, diclosulam, florasulam, flucarbazona, flumetsulam, metosulam, orto-sulfamuron, penoxsulam, propoxicarbazona, piribambenz-propilo, piribenzoxim, pirifitalid, piriminobac-metilo, pirimisulfan, piritiobac, piroxasulfona, piroxsulam;
- 10
- otros: amicarbazona, aminotriazol, anilofos, beflubutamid, benazolin, bencarbazona, benfluresato, benzofenap, bentazona, benzobiciclon, biciclopirona, bromacil, bromobutida, butafenacil, butamifos, cafenstrol, carfentrazona, cinidon-etilo, clortal, cinmetilin, clomazona, cumiluron, ciprosulfamida, dicamba, difenzoquat, diflufenzopir, *Drechslera monoceras*, endotal, etofumesato, etobenzanid, fenoxasulfona, fentrazamida, flumiclorac-pentilo, flumioxazin, flupoxam, flurocloridona, flurtamona, indanofan, isoxaben, isoxaflutol, lenacil, propanil, propizamida, quinclozac, quinmerac, mesotriona, ácido metilarsónico, naptalam, oxadiargilo, oxadiazon, oxaziclomefona, pentoxazona, pinoxaden, piraclonil, piraflufen-etilo, pirasulfotol, pirazoxifen, pirazolinato, quinoclamina, saflufenacil, sulcotriona, sulfentrazona, terbacil, tefuriltriona, tembotriona, tiencarbazona, topramezona, éster etílico del ácido (3-[2-cloro-4-fluoro-5-(3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-3,6-dihidro-2H-pirimidin-1-il)-fenoxi]-piridin-2-iloxi)-acético, éster metílico del ácido 6-amino-5-cloro-2-ciclopropil-pirimidina-4-carboxílico, 6-cloro-3-(2-ciclopropil-6-metil-fenoxi)-piridazin-4-ol, ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-clorofenil)-5-fluoro-piridin-2-carboxílico, éster metílico del ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metoxi-fenil)-piridin-2-carboxílico y éster metílico del ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-3-dimetilamino-2-fluoro-fenil)-piridin-2-carboxílico. O) Insecticidas
- 15
- 20
- 25
- organo(tio)fosfatos: acefato, azametifos, azinfos-metilo, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorfenvinfos, diazinon, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, disulfoton, etion, fenitrotion, fention, isoxation, malation, metamidofos, metidation, metil-paration, mevinfos, monocrotofos, oxidometon-metilo, paraoxon, paration, fentoato, fosalona, fosmet, fosfamidon, forato, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, protiofos, sulprofos, tetraclorvinfos, terbufos, triazofos, triclorfon;
- 30
- carbamatos: alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbaril, carbofurano, carbosulfan, fenoxicarb, furatiocarb, metiocarb, metomilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, triazamato;
 - piretroides: aletrina, bifentrina, ciflutrina, cihalotrina, cifenotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, imiprotrina, lambda-cihalotrina, permetrina, praletrina, piretrina I y II, resmetrina, silafluofen, tau-fluvalinato, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina, proflutrina, dimeflutrina;
 - reguladores del crecimiento de los insectos: a) inhibidores de la síntesis de quitina: benzoilureas: clorfluazuron, ciramazin, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, teflubenzuron, triflumuron; buprofezin, diofenolan, hexitiazox, etoxazol, clofentazina; b) antagonistas de ecdisona: halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida, azadiractina; c) juvenoides: piriproxifen, metopreno, fenoxicarb; d) inhibidores de la biosíntesis de los lípidos: espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramato;
 - compuestos agonistas/antagonistas de los receptores nicotínicos: clotianidín, dinotefurano, flupiradifurona, imidacloprid, tiametoxam, nitenpiram, acetamiprid, tiacloprid, 1-(2-cloro-tiazol-5-ilmetil)-2-nitrimino-3,5-dimetil-[1,3,5]triazinano;
 - compuestos antagonistas de GABA: endosulfan, etiprol, fipronil, vaniliprol, pirafluprol, piriprol, amida del ácido 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-metil-fenil)-4-sulfinaoil-1H-pirazol-3-carbotioico;
 - insecticidas de lactona macrocíclica: abamectina, emamectina, milbemectina, lepimectina, espinosad, espinetoram;
 - acaricidas del inhibidor del transporte de electrones en mitocondrias I (METI): fenazaquin, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenerim;
- 35
- 40
- 45
- 50
- compuestos de METI II y III: acequinocilo, fluaciprim, hidrametilnon;

- desacopladores: clorfenapir;
 - inhibidores de la fosforilación oxidativa: cihexatin, diafentiuron, óxido de fenbutatina, propargita;
 - compuestos disruptores de la muda: criomazina;
 - inhibidores de la oxidasa de función mixta: butóxido de piperonilo;
- 5 - bloqueantes de los canales de sodio: indoxacarb, metaflumizona;

- otros: benclotiaz, bifenazato, cartap, flonicamid, piridalilo, pimetrozina, azufre, tiociclam, flubendiamida, clorantraniliprol, ciazipir (HGW86), cienopirafen, flupirazofos, ciflumetofen, amidoflumet, imiciafos, bistrifluron y pirifluquinazon.

10 La presente invención se refiere además a composiciones agroquímicas que comprenden una mezcla de al menos un compuesto I (componente 1) y al menos una sustancia activa adicional útil para la protección de plantas, por ejemplo, seleccionada de los grupos A) a O) (componente 2), en particular un fungicida adicional, por ejemplo, uno o más fungicidas de los grupos A) a L), como se describió anteriormente, y, si se desea, un disolvente o vehículo sólido adecuado. Aquellas mezclas son de interés particular, ya que muchas de ellas, a la misma velocidad de aplicación, muestran mayores eficiencias contra hongos dañinos. Además, el combatir hongos dañinos con una mezcla de los compuestos I y al menos un fungicida de los grupos A) a L), como se describió anteriormente, es más eficiente que combatir aquellos hongos con los compuestos I individuales o fungicidas individuales de los grupos A) a L). Aplicando los compuestos I juntos con al menos una sustancia activa de los grupos A) a O) puede obtenerse un efecto sinérgico, es decir, se obtiene más que la simple adición de los efectos individuales (mezclas sinérgicas).

20 Esto puede obtenerse aplicando los compuestos I y al menos una sustancia activa adicional simultáneamente, ya sea en forma conjunta (por ejemplo, como mezcla en el tanque) o separada, o en forma sucesiva, en donde el intervalo de tiempo entre las aplicaciones individuales se selecciona para garantizar que la sustancia activa que se aplica primero aún se produzca en el sitio de acción en una cantidad suficiente en el momento de aplicar la(s) sustancia(s) activa(s) adicional(es). El orden de aplicación no es esencial para el desarrollo de la presente invención.

25 En las mezclas binarias, es decir, las composiciones según la invención que comprenden un compuesto I (componente 1) y sustancia activa adicional (componente 2), por ejemplo, una sustancia activa de los grupos A) a O), la relación de peso del componente 1 y el componente 2 depende generalmente de las propiedades de las sustancias activas usadas, normalmente está en el intervalo de 1:100 a 100:1, habitualmente en el intervalo de 1:50 a 50:1, preferentemente en el intervalo de 1:20 a 20:1, más preferentemente en el intervalo de 1:10 a 10:1 y, en particular en el intervalo de 1:3 a 3:1.

30 En mezclas ternarias, es decir, las composiciones según la invención que comprenden un compuesto I (componente 1) y una primera sustancia activa adicional (componente 2) y una segunda sustancia activa adicional (componente 3), por ejemplo, dos sustancias activas de los grupos A) a O), la relación de peso del componente 1 y el componente 2 depende de las propiedades de las sustancias activas usadas, preferentemente está en el intervalo de 1:50 a 50:1 y particularmente en el intervalo de 1:10 a 10:1, y la relación de peso del componente 1 y el componente 3 preferentemente está en el intervalo de 1:50 a 50:1 y particularmente en el intervalo de 1:10 a 10:1.

40 También se da preferencia a mezclas que comprenden un compuesto I (componente 1) y al menos una sustancia activa seleccionada del grupo A) (componente 2) y particularmente seleccionada de azoxistrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, trifloxistrobina; famoxadona, fenamidona; benzovindiflupir, bixafen, boscalid, fluopiram, fluxapiroxad, isopirazam, penflufen, pentiopirad, sedaxano; ametoctradin, ciazofamid, fluazinam, sales de fentina, tales como acetato de fentina.

45 Se da preferencia a mezclas que comprenden un compuesto de fórmula I (componente 1) y al menos una sustancia activa seleccionada del grupo B) (componente 2) y particularmente seleccionada de ciproconazol, difenoconazol, epoxiconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, metconazol, miclobutanil, penconazol, propiconazol, protioconazol, triadimefon, triadimenol, tebuconazol, tetraconazol, triticonazol, procloraz, fenarimol, triforina; dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin, espiroxamina; fenhexamid.

Se da preferencia a mezclas que comprenden un compuesto de fórmula I (componente 1) y al menos una sustancia activa seleccionada del grupo C) (componente 2) y particularmente seleccionada de metalaxil (metalaxil-M), mefenoxam, ofurace.

50 Se da preferencia a mezclas que comprenden un compuesto de fórmula I (componente 1) y al menos una sustancia activa seleccionada del grupo D) (componente 2) y particularmente seleccionada de benomilo, carbendazim, tiofanato-metilo, etaboxam, fluopicolida, zoxamida, metrafenona, piriufenona.

También se da preferencia a mezclas que comprenden un compuesto I (componente 1) y al menos una sustancia activa seleccionada del grupo E) (componente 2) y particularmente seleccionada de ciprodinil, mepanipirim, pirimetanil.

5 También se da preferencia a mezclas que comprenden un compuesto I (componente 1) y al menos una sustancia activa seleccionada del grupo F) (componente 2) y particularmente seleccionada de iprodiona, fludioxonil, vinclozolin, quinoxifen.

También se da preferencia a mezclas que comprenden un compuesto I (componente 1) y al menos una sustancia activa seleccionada del grupo G) (componente 2) y particularmente seleccionada de dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, bentiavalicarb, mandipropamid, propamocarb.

10 También se da preferencia a mezclas que comprenden un compuesto I (componente 1) y al menos una sustancia activa seleccionada del grupo H) (componente 2) y particularmente seleccionada de acetato de cobre, hidróxido de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, azufre, mancozeb, metiram, propineb, tiram, captafol, folpet, clorotalonil, diclofluanid, ditianon.

15 También se da preferencia a mezclas que comprenden un compuesto I (componente 1) y al menos una sustancia activa seleccionada del grupo I) (componente 2) y particularmente seleccionada de carpropamid y fenoxanil.

También se da preferencia a mezclas que comprenden un compuesto I (componente 1) y al menos una sustancia activa seleccionada del grupo J) (componente 2) y particularmente seleccionada de acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinil, fosetil, fosetil-aluminio, H₃PO₃ y sales de los mismos.

20 También se da preferencia a mezclas que comprenden un compuesto I (componente 1) y al menos una sustancia activa seleccionada del grupo K) (componente 2) y particularmente seleccionada de cimoxanil, proquinazid y *N*-metil-2-{1-[(5-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-1-il)-acetil]-piperidin-4-il}-*N*-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-4-tiazolcarboxamida.

25 También se da preferencia a mezclas que comprenden un compuesto I (componente 1) y al menos una sustancia activa seleccionada del grupo L) (componente 2) y particularmente seleccionada de *Bacillus subtilis* cepa NRRL n.º B-21661, *Bacillus pumilus* cepa NRRL n.º B-30087 y *Ulocladium oudemansii*.

Por consiguiente, la presente invención se refiere además a composiciones que comprenden un compuesto I (componente 1) y una sustancia activa adicional (componente 2), sustancia activa adicional que está seleccionada de la columna "Componente 2" de las líneas B-1 a B-369 de la Tabla B.

30 Otra realización se refiere a las composiciones B-1 a B-369 enumeradas en la Tabla B, en las que una fila de la Tabla B se corresponde en cada caso con una composición fungicida que comprende uno de los compuestos de fórmula I (componente 1) individualizados en la presente memoria descriptiva y la sustancia activa adicional respectiva de los grupos A) a O) (componente 2) establecida en la fila en cuestión. Preferentemente, las composiciones descritas comprenden las sustancias activas en cantidades sinérgicamente eficaces.

35 **Tabla B:** Composición que comprende un compuesto I individualizado y una sustancia activa adicional de los grupos A) a O)

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-1	un compuesto I individualizado	Azoxistrobina
B-2	un compuesto I individualizado	Coumetoxistrobina
B-3	un compuesto I individualizado	Coumoxistrobina
B-4	un compuesto I individualizado	Dimoxistrobina
B-5	un compuesto I individualizado	Enestroburina
B-6	un compuesto I individualizado	Fenaminstrobina
B-7	un compuesto I individualizado	Fenoxistrobina/Flufenoxistrobina

ES 2 590 466 T3

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-8	un compuesto l individualizado	Fluoxastrobina
B-9	un compuesto l individualizado	Kresoxim-metilo
B-10	un compuesto l individualizado	Metominostrobin
B-11	un compuesto l individualizado	Orisastrobina
B-12	un compuesto l individualizado	Picoxistrobina
B-13	un compuesto l individualizado	Piraclostrobina
B-14	un compuesto l individualizado	Pirametostrobin
B-15	un compuesto l individualizado	Piraoxistrobina
B-16	un compuesto l individualizado	Piribencarb
B-17	un compuesto l individualizado	Trifloxistrobina
B-18	un compuesto l individualizado	Triclopiricarb/Clorodincarb
B-19	un compuesto l individualizado	Éster metílico del ácido 2-[2-(2,5-dimetil-fenoximetil)-fenil]-3-metoxi-acrílico
B-20	un compuesto l individualizado	2-(2-(3-(2,6-Diclorofenil)-1-metil-alilidenaminoximetil)-fenil)-2-metoxiimino-N-metil-acetamida
B-21	un compuesto l individualizado	Benalaxil
B-22	un compuesto l individualizado	Benalaxil-M
B-23	un compuesto l individualizado	Benodanil
B-24	un compuesto l individualizado	Benzovindiflupir
B-25	un compuesto l individualizado	Bixafen
B-26	un compuesto l individualizado	Boscalid
B-27	un compuesto l individualizado	Carboxin
B-28	un compuesto l individualizado	Fenfuram
B-29	un compuesto l individualizado	Fenhexamid
B-30	un compuesto l individualizado	Flutolanil
B-31	un compuesto l individualizado	Fluxapiroxad
B-32	un compuesto l individualizado	Furametpir
B-33	un compuesto l individualizado	Isopirazam
B-34	un compuesto l individualizado	Isotianil
B-35	un compuesto l individualizado	Kiralaxil

ES 2 590 466 T3

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-36	un compuesto l individualizado	Mepronil
B-37	un compuesto l individualizado	Metalaxil
B-38	un compuesto l individualizado	Metalaxil-M
B-39	un compuesto l individualizado	Ofurace
B-40	un compuesto l individualizado	Oxadixil
B-41	un compuesto l individualizado	Oxicarboxin
B-42	un compuesto l individualizado	Penflufen
B-43	un compuesto l individualizado	Pentiopirad
B-44	un compuesto l individualizado	Sedaxano
B-45	un compuesto l individualizado	Tecloftalam
B-46	un compuesto l individualizado	Tifluzamida
B-47	un compuesto l individualizado	Tiadinil
B-48	un compuesto l individualizado	Anilida del ácido 2-amino-4-metil-tiazol-5-carboxílico
B-49	un compuesto l individualizado	N-(4'-trifluorometiltiobifenil-2-il)-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida
B-50	un compuesto l individualizado	N-(2-(1,3,3-trimetil-butil)-fenil)-1,3-dimetil-5-fluoro-1H-pirazol-4-carboxamida
B-51	un compuesto l individualizado	3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida
B-52	un compuesto l individualizado	3-(trifluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida
B-53	un compuesto l individualizado	1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida
B-54	un compuesto l individualizado	3-(trifluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida
B-55	un compuesto l individualizado	3-(difluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida
B-56	un compuesto l individualizado	1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida
B-57	un compuesto l individualizado	Dimetomorf
B-58	un compuesto l individualizado	Flumorf
B-59	un compuesto l individualizado	Pirimorf
B-60	un compuesto l individualizado	Flumetover
B-61	un compuesto l individualizado	Fluopicolida

ES 2 590 466 T3

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-62	un compuesto l individualizado	Fluopiram
B-63	un compuesto l individualizado	Zoxamida
B-64	un compuesto l individualizado	Carpropamid
B-65	un compuesto l individualizado	Diclocimet
B-66	un compuesto l individualizado	Mandipropamid
B-67	un compuesto l individualizado	Oxitetraciclina
B-68	un compuesto l individualizado	Siltiofam
B-69	un compuesto l individualizado	Amida del ácido N-(6-metoxi-piridin-3-il)ciclopropanocarboxílico
B-70	un compuesto l individualizado	Azaconazol
B-71	un compuesto l individualizado	Bitertanol
B-72	un compuesto l individualizado	Bromuconazol
B-73	un compuesto l individualizado	Ciproconazol
B-74	un compuesto l individualizado	Difenoconazol
B-75	un compuesto l individualizado	Diniconazol
B-76	un compuesto l individualizado	Diniconazol-M
B-77	un compuesto l individualizado	Epoxiconazol
B-78	un compuesto l individualizado	Fenbuconazol
B-79	un compuesto l individualizado	Fluquinconazol
B-80	un compuesto l individualizado	Flusilazol
B-81	un compuesto l individualizado	Flutriafol
B-82	un compuesto l individualizado	Hexaconazol
B-83	un compuesto l individualizado	Imibenconazol
B-84	un compuesto l individualizado	Ipconazol
B-85	un compuesto l individualizado	Metconazol
B-86	un compuesto l individualizado	Miclobutanil
B-87	un compuesto l individualizado	Oxpoconazol
B-88	un compuesto l individualizado	Paclobutrazol
B-89	un compuesto l individualizado	Penconazol

ES 2 590 466 T3

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-90	un compuesto l individualizado	Propiconazol
B-91	un compuesto l individualizado	Protioconazol
B-92	un compuesto l individualizado	Simeconazol
B-93	un compuesto l individualizado	Tebuconazol
B-94	un compuesto l individualizado	Tetraconazol
B-95	un compuesto l individualizado	Triadimefon
B-96	un compuesto l individualizado	Triadimenol
B-97	un compuesto l individualizado	Triticonazol
B-98	un compuesto l individualizado	Uniconazol
B-99	un compuesto l individualizado	1-[<i>rel</i> -(2 <i>S</i> ;3 <i>R</i>)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-5-tiocianato-1 <i>H</i> -[1,2,4]triazol
B-100	un compuesto l individualizado	2-[<i>rel</i> -(2 <i>S</i> ;3 <i>R</i>)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-2 <i>H</i> -[1,2,4]triazol-3-tiol
B-101	un compuesto l individualizado	Ciazofamid
B-102	un compuesto l individualizado	Amisulbrom
B-103	un compuesto l individualizado	Imazalil
B-104	un compuesto l individualizado	Sulfato de imazalil
B-105	un compuesto l individualizado	Pefurazoato
B-106	un compuesto l individualizado	Procloraz
B-107	un compuesto l individualizado	Triflumizol
B-108	un compuesto l individualizado	Benomilo
B-109	un compuesto l individualizado	Carbendazim
B-110	un compuesto l individualizado	Fuberidazol
B-111	un compuesto l individualizado	Tiabendazol
B-112	un compuesto l individualizado	Etaboxam
B-113	un compuesto l individualizado	Etridiazol
B-114	un compuesto l individualizado	Himexazol
B-115	un compuesto l individualizado	2-(4-Cloro-fenil)- <i>N</i> -[4-(3,4-dimet-oxi-fenil)-isoxazol-5-il]-2-prop-2-in-iloxi-acetamida
B-116	un compuesto l individualizado	Fluazinam

ES 2 590 466 T3

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-117	un compuesto l individualizado	Pirifenox
B-118	un compuesto l individualizado	3-[5-(4-Cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina (Pirisoxazol)
B-119	un compuesto l individualizado	3-[5-(4-Metil-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina
B-120	un compuesto l individualizado	Bupirinato
B-121	un compuesto l individualizado	Ciprodinil
B-122	un compuesto l individualizado	5-Fluorocitosina
B-123	un compuesto l individualizado	5-Fluoro-2-(p-tolilmetoxi)pirimidin-4-amina
B-124	un compuesto l individualizado	5-Fluoro-2-(4-fluorofenilmetoxi)-pirimidin-4-amina
B-125	un compuesto l individualizado	Diflumetorim
B-126	un compuesto l individualizado	(5,8-Difluoroquinazolin-4-il)-{2-[2-fluoro-4-(4-trifluorometilpiridin-2-iloxi)-fenil]-etil}-amina
B-127	un compuesto l individualizado	Fenarimol
B-128	un compuesto l individualizado	Ferimzona
B-129	un compuesto l individualizado	Mepanipirim
B-130	un compuesto l individualizado	Nitrapirin
B-131	un compuesto l individualizado	Nuarimol
B-132	un compuesto l individualizado	Pirimetanil
B-133	un compuesto l individualizado	Triforina
B-134	un compuesto l individualizado	Fenpiclonil
B-135	un compuesto l individualizado	Fludioxonil
B-136	un compuesto l individualizado	Aldimorf
B-137	un compuesto l individualizado	Dodemorf
B-138	un compuesto l individualizado	Acetato de dodemorf
B-139	un compuesto l individualizado	Fenpropimorf
B-140	un compuesto l individualizado	Tridemorf
B-141	un compuesto l individualizado	Fenpropidin
B-142	un compuesto l individualizado	Fluoroimid
B-143	un compuesto l individualizado	Iprodiona
B-144	un compuesto l individualizado	Procimidona

ES 2 590 466 T3

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-145	un compuesto l individualizado	Vinclozolin
B-146	un compuesto l individualizado	Famoxadona
B-147	un compuesto l individualizado	Fenamidona
B-148	un compuesto l individualizado	Flutianil
B-149	un compuesto l individualizado	Octilinona
B-150	un compuesto l individualizado	Probenazol
B-151	un compuesto l individualizado	Fenpirazamina
B-152	un compuesto l individualizado	Acibenzolar-S-metilo
B-153	un compuesto l individualizado	Ametoctradin
B-154	un compuesto l individualizado	Amisulbrom
B-155	un compuesto l individualizado	2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-isobutiriloximetoxi-4-metoxipiridin-2-carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-[1,5]dioxonan-7-ilo]
B-156	un compuesto l individualizado	2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-acetoxi-4-metoxi-piridin-2-carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo]
B-157	un compuesto l individualizado	2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-(acetoximetoxi)-4-metoxi-piridin-2-carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo]
B-158	un compuesto l individualizado	2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-isobutoxicarboniloxi-4-metoxi-piridin-2-carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo]
B-159	un compuesto l individualizado	2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-(1,3-benzodioxol-5-ilmetoxi)-4-metoxi-piridin-2-carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo]
B-160	un compuesto l individualizado	2-metilpropanoato de (3S,6S,7R,8R)-3-[[[(3-hidroxi-4-metoxi-2-piridinil)carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-8-(fenilmetil)-1,5-dioxonan-7-ilo]
B-161	un compuesto l individualizado	Anilazin
B-162	un compuesto l individualizado	Blasticidin-S
B-163	un compuesto l individualizado	Captafol
B-164	un compuesto l individualizado	Captan
B-165	un compuesto l individualizado	Quinometionato
B-166	un compuesto l individualizado	Dazomet
B-167	un compuesto l individualizado	Debacarb

ES 2 590 466 T3

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-168	un compuesto l individualizado	Diclomezina
B-169	un compuesto l individualizado	Difenzoquat
B-170	un compuesto l individualizado	Metilsulfato de difenzoquat
B-171	un compuesto l individualizado	Fenoxanil
B-172	un compuesto l individualizado	Folpet
B-173	un compuesto l individualizado	Ácido oxolínico
B-174	un compuesto l individualizado	Piperalin
B-175	un compuesto l individualizado	Proquinazid
B-176	un compuesto l individualizado	Piroquilon
B-177	un compuesto l individualizado	Quinoxifen
B-178	un compuesto l individualizado	Triazoxid
B-179	un compuesto l individualizado	Triciclazol
B-180	un compuesto l individualizado	2-Butoxi-6-yodo-3-propil-cromon-4-ona
B-181	un compuesto l individualizado	5-Cloro-1-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-2-metil-1H-benzimidazol
B-182	un compuesto l individualizado	5-Cloro-7-(4-metil-piperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluoro-fenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina
B-183	un compuesto l individualizado	Ferbam
B-184	un compuesto l individualizado	Mancozeb
B-185	un compuesto l individualizado	Maneb
B-186	un compuesto l individualizado	Metam
B-187	un compuesto l individualizado	Metasulphocarb
B-188	un compuesto l individualizado	Metiram
B-189	un compuesto l individualizado	Propineb
B-190	un compuesto l individualizado	Tiram
B-191	un compuesto l individualizado	Zineb
B-192	un compuesto l individualizado	Ziram
B-193	un compuesto l individualizado	Dietofencarb
B-194	un compuesto l individualizado	Bentiavalicarb
B-195	un compuesto l individualizado	lprovalicarb

ES 2 590 466 T3

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-196	un compuesto l individualizado	Propamocarb
B-197	un compuesto l individualizado	Clorhidrato de propamocarb
B-198	un compuesto l individualizado	Valifenalato
B-199	un compuesto l individualizado	éster (4-fluorofenílico) del ácido N-(1-(1-(4-cianofenil)etanosulfonil)-but-2-il)carbámico
B-200	un compuesto l individualizado	Dodina
B-201	un compuesto l individualizado	Base libre de dodina
B-202	un compuesto l individualizado	Guazatina
B-203	un compuesto l individualizado	Acetato de guazatina
B-204	un compuesto l individualizado	Iminoctadina
B-205	un compuesto l individualizado	Triacetato de iminoctadina
B-206	un compuesto l individualizado	Tris(albesilato) de iminoctadina
B-207	un compuesto l individualizado	Kasugamicina
B-208	un compuesto l individualizado	Clorhidrato de kasugamicina hidratada
B-209	un compuesto l individualizado	Polioxina
B-210	un compuesto l individualizado	Estreptomina
B-211	un compuesto l individualizado	Validamicina A
B-212	un compuesto l individualizado	Binapacril
B-213	un compuesto l individualizado	Dicloran
B-214	un compuesto l individualizado	Dinobuton
B-215	un compuesto l individualizado	Dinocap
B-216	un compuesto l individualizado	Nitrotal-isopropilo
B-217	un compuesto l individualizado	Tecnazen
B-218	un compuesto l individualizado	Sales de fentina
B-219	un compuesto l individualizado	Ditianon
B-220	un compuesto l individualizado	2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetraona
B-221	un compuesto l individualizado	Isoprotilano
B-222	un compuesto l individualizado	Edifenfos
B-223	un compuesto l individualizado	Fosetil, Fosetil-aluminio

ES 2 590 466 T3

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-224	un compuesto l individualizado	lprobenfos
B-225	un compuesto l individualizado	Ácido fosforoso (H ₃ PO ₃) y derivados
B-226	un compuesto l individualizado	Pirazofos
B-227	un compuesto l individualizado	Tolclofos-metilo
B-228	un compuesto l individualizado	Clorotalonil
B-229	un compuesto l individualizado	Diclofluanid
B-230	un compuesto l individualizado	Diclorofen
B-231	un compuesto l individualizado	Flusulfamida
B-232	un compuesto l individualizado	Hexaclorbenceno
B-233	un compuesto l individualizado	Pencicuron
B-234	un compuesto l individualizado	Pentaclorofenol y sales
B-235	un compuesto l individualizado	Ftalida
B-236	un compuesto l individualizado	Quintozeno
B-237	un compuesto l individualizado	Tiofanato-metilo
B-238	un compuesto l individualizado	Tolilfluanid
B-239	un compuesto l individualizado	N-(4-cloro-2-nitro-fenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida
B-240	un compuesto l individualizado	Mezcla de Burdeos
B-241	un compuesto l individualizado	Acetato de cobre
B-242	un compuesto l individualizado	Hidróxido de cobre
B-243	un compuesto l individualizado	Oxicloruro de cobre
B-244	un compuesto l individualizado	Sulfato de cobre básico
B-245	un compuesto l individualizado	Azufre
B-246	un compuesto l individualizado	Bifenil
B-247	un compuesto l individualizado	Bronopol
B-248	un compuesto l individualizado	Ciflufenamida
B-249	un compuesto l individualizado	Cimoxanil
B-250	un compuesto l individualizado	Difenilamin
B-251	un compuesto l individualizado	Metrafenona

ES 2 590 466 T3

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-252	un compuesto l individualizado	Piriofenona
B-253	un compuesto l individualizado	Mildiomicina
B-254	un compuesto l individualizado	Oxina-cobre
B-255	un compuesto l individualizado	Oxatiapirolin
B-256	un compuesto l individualizado	Prohexadiona calcio
B-257	un compuesto l individualizado	Espiroxamina
B-258	un compuesto l individualizado	Tebufluoquin
B-259	un compuesto l individualizado	Tolilfluamid
B-260	un compuesto l individualizado	N-(Ciclopropilmetoxiimino-(6-difluorometoxi-2,3-difluoro-fenil)-metil)-2-fenilacetamida
B-261	un compuesto l individualizado	N'-(4-(4-cloro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metilformamidina
B-262	un compuesto l individualizado	N'-(4-(4-fluoro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metilformamidina
B-263	un compuesto l individualizado	N'-(2-metil-5-trifluorometil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metilformamidina
B-264	un compuesto l individualizado	N'-(5-difluorometil-2-metil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metilformamidina
B-265	un compuesto l individualizado	éster 6-terc-butil-8-fluoro-2,3-dimetil-quinolin-4-ílico del ácido metoxiacético
B-266	un compuesto l individualizado	<i>Bacillus subtilis</i> NRRL n.º B-21661
B-267	un compuesto l individualizado	<i>Bacillus pumilus</i> NRRL n.º B-30087
B-268	un compuesto l individualizado	<i>Ulocladium oudemansii</i>
B-269	un compuesto l individualizado	Carbaril
B-270	un compuesto l individualizado	Carbofuran
B-271	un compuesto l individualizado	Carbosulfan
B-272	un compuesto l individualizado	Metomiltiodicarb
B-273	un compuesto l individualizado	Bifentrina
B-274	un compuesto l individualizado	Ciflutrina
B-275	un compuesto l individualizado	Cipermetrina
B-276	un compuesto l individualizado	alfa-Cipermetrina
B-277	un compuesto l individualizado	zeta-Cipermetrina

ES 2 590 466 T3

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-278	un compuesto l individualizado	Deltametrina
B-279	un compuesto l individualizado	Esfenvalerato
B-280	un compuesto l individualizado	Lambda-cihalotrina
B-281	un compuesto l individualizado	Permetrina
B-282	un compuesto l individualizado	Teflutrina
B-283	un compuesto l individualizado	Diflubenzuron
B-284	un compuesto l individualizado	Flufenoxuron
B-285	un compuesto l individualizado	Lufenuron
B-286	un compuesto l individualizado	Teflubenzuron
B-287	un compuesto l individualizado	Espirotetramato
B-288	un compuesto l individualizado	Clotianidin
B-289	un compuesto l individualizado	Dinotefuran
B-290	un compuesto l individualizado	Imidacloprid
B-291	un compuesto l individualizado	Tiametoxam
B-292	un compuesto l individualizado	Flupiradifurona
B-293	un compuesto l individualizado	Acetamiprid
B-294	un compuesto l individualizado	Tiacloprid
B-295	un compuesto l individualizado	Endosulfan
B-296	un compuesto l individualizado	Fipronil
B-297	un compuesto l individualizado	Abamectina
B-298	un compuesto l individualizado	Emamectina
B-299	un compuesto l individualizado	Espinosad
B-300	un compuesto l individualizado	Espinetoram
B-301	un compuesto l individualizado	Hidrametilnon
B-302	un compuesto l individualizado	Clorfenapir
B-303	un compuesto l individualizado	Óxido de fenbutatina
B-304	un compuesto l individualizado	Indoxacarb
B-305	un compuesto l individualizado	Metaflumizona

ES 2 590 466 T3

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-306	un compuesto l individualizado	Flonicamid
B-307	un compuesto l individualizado	Lubendiamida
B-308	un compuesto l individualizado	Clorantraniliprol
B-309	un compuesto l individualizado	Ciazipir (HGW86)
B-310	un compuesto l individualizado	Ciflumetofen
B-311	un compuesto l individualizado	Acetoclor
B-312	un compuesto l individualizado	Dimetenamid
B-313	un compuesto l individualizado	Metolaclor
B-314	un compuesto l individualizado	Metazaclor
B-315	un compuesto l individualizado	Glifosato
B-316	un compuesto l individualizado	Glufosinato
B-317	un compuesto l individualizado	Sulfosato
B-318	un compuesto l individualizado	Clodinafop
B-319	un compuesto l individualizado	Fenoxaprop
B-320	un compuesto l individualizado	Fluazifop
B-321	un compuesto l individualizado	Haloxifop
B-322	un compuesto l individualizado	Paraquat
B-323	un compuesto l individualizado	Fenmedifam
B-324	un compuesto l individualizado	Cletodim
B-325	un compuesto l individualizado	Cicloxidim
B-326	un compuesto l individualizado	Profoxidim
B-327	un compuesto l individualizado	Setoxidim
B-328	un compuesto l individualizado	Tepraloxidim
B-329	un compuesto l individualizado	Pendimetalin
B-330	un compuesto l individualizado	Prodiamina
B-331	un compuesto l individualizado	Trifluralin
B-332	un compuesto l individualizado	Acifluorfen
B-333	un compuesto l individualizado	Bromoxinil

ES 2 590 466 T3

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-334	un compuesto l individualizado	Imazametabenz
B-335	un compuesto l individualizado	Imazamox
B-336	un compuesto l individualizado	Imazapic
B-337	un compuesto l individualizado	Imazapir
B-338	un compuesto l individualizado	Imazaquin
B-339	un compuesto l individualizado	Imazetapir
B-340	un compuesto l individualizado	Ácido 2,4-diclorofenoxiacético (2,4-D)
B-341	un compuesto l individualizado	Cloridazon
B-342	un compuesto l individualizado	Clopiralid
B-343	un compuesto l individualizado	Fluroxipir
B-344	un compuesto l individualizado	Picloram
B-345	un compuesto l individualizado	Picolinafen
B-346	un compuesto l individualizado	Bensulfuron
B-347	un compuesto l individualizado	Clorimuron-etilo
B-348	un compuesto l individualizado	Ciclosulfamuron
B-349	un compuesto l individualizado	Iodosulfuron
B-350	un compuesto l individualizado	Mesosulfuron
B-351	un compuesto l individualizado	Metsulfuron-metilo
B-352	un compuesto l individualizado	Nicosulfuron
B-353	un compuesto l individualizado	Rimsulfuron
B-354	un compuesto l individualizado	Triflusulfuron
B-355	un compuesto l individualizado	Atrazina
B-356	un compuesto l individualizado	Hexazinona
B-357	un compuesto l individualizado	Diuron
B-358	un compuesto l individualizado	Florasulam
B-359	un compuesto l individualizado	Piroxasulfona
B-360	un compuesto l individualizado	Bentazona
B-361	un compuesto l individualizado	Cinidon-etilo

Mezcla	Componente 1	Componente 2
B-362	un compuesto I individualizado	Cinmetilin
B-363	un compuesto I individualizado	Dicamba
B-364	un compuesto I individualizado	Diflufenzopir
B-365	un compuesto I individualizado	Quinclorac
B-366	un compuesto I individualizado	Quinmerac
B-367	un compuesto I individualizado	Mesotriona
B-368	un compuesto I individualizado	Saflufenacil
B-369	un compuesto I individualizado	Topramezona

Las sustancias activas denominadas componente 2, su preparación y su actividad contra hongos dañinos son conocidas (véase: <http://www.alanwood.net/pesticides/>); estas sustancias están comercialmente disponibles. Los compuestos descritos por la nomenclatura de la IUPAC, su preparación y su actividad fungicida también son conocidos (véanse Can. J. Plant Sci. 48(6), 587-94, 1968; documentos EP-A 141 317; EP-A 152 031; EP-A 226 917; EP-A 243 970; EP-A 256 503; EP-A 428 941; EP-A 532 022; EP-A 1 028 125; EP-A 1 035 122; EP-A 1 201 648; EP-A 1 122 244, JP 2002316902; DE 19650197; DE 10021412; DE 102005009458; US 3.296.272; US 3.325.503; WO 98/46608; WO 99/14187; WO 99/24413; WO 99/27783; WO 00/29404; WO 00/46148; WO 00/65913; WO 01 /54501; WO 01/56358; WO 02/22583; WO 02/40431; WO 03/10149; WO 03/11853; WO 03/14103; WO 03/16286; WO 03/53145; WO 03/61388; WO 03/66609; WO 03/74491; WO 04/49804; WO 04/83193; WO 05/120234; WO 05/123689; WO 05/123690; WO 05/63721; WO 05/87772; WO 05/87773; WO 06/15866; WO 06/87325; WO 06/87343; WO 07/82098; WO 07/90624, WO 11/028657).

Las mezclas de sustancias activas pueden prepararse como composiciones que comprenden, además de los componentes activos, al menos un componente inerte por medios usuales, por ejemplo, por los medios dados para las composiciones de compuestos I.

Referente a los componentes usuales de tales composiciones, se hace referencia a las explicaciones dadas para las composiciones que contienen los compuestos I.

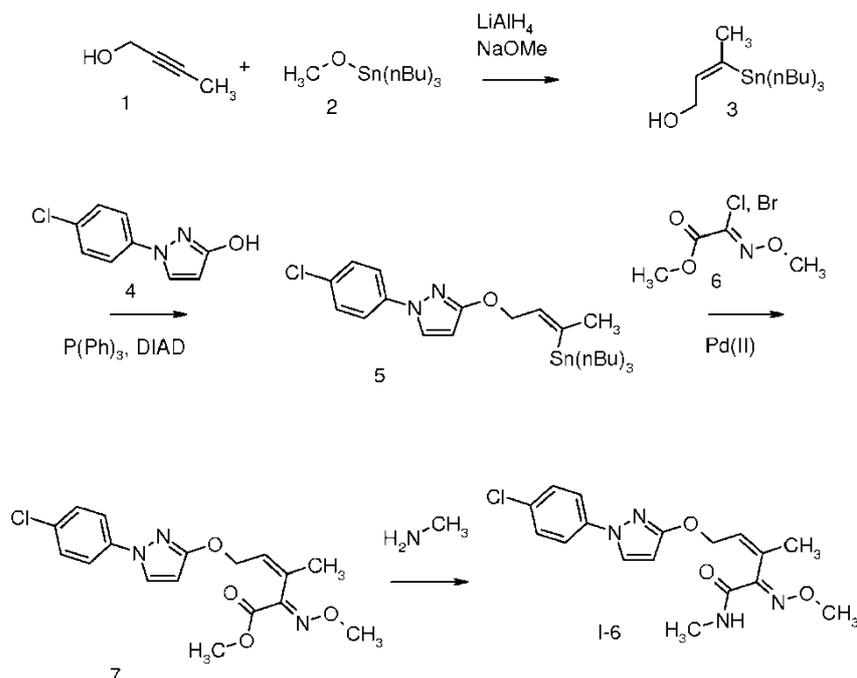
Las mezclas de sustancias activas según la presente invención son adecuadas como fungicidas, ya que son los compuestos de fórmula I. Se distinguen por una excelente eficacia contra un amplio espectro de hongos fitopatógenos, especialmente de las clases de los Ascomycetes, Basidiomycetes, Deuteromycetes y Peronosporomycetes (sin. Oomycetes). Además, se refiere a las explicaciones referentes a la actividad fungicida de los compuestos y las composiciones que contienen los compuestos I, respectivamente.

I. Ejemplos de síntesis

Con modificación adecuada de los compuestos de partida, los procedimientos mostrados en los ejemplos de síntesis a continuación se usaron para obtener los compuestos I adicionales. Los compuestos resultantes, junto con los datos físicos, se enumeran en la Tabla I a continuación.

1.1 Preparación de compuestos de tipo estrobilurina I

Ejemplo 1: Preparación de metilamida del ácido (Z)-5-[1-(4-cloro-fenil)-1H-pirazol-3-iloxi]-2-[(E)-met-oxiimino]-3-metil-pent-3-enico (I-6)

**Ej. 1a:** (Z)-3-Tributylestanil-but-2-en-1-ol (3)

A 156,9 ml (156,9 mmoles) de una solución 1 molar de hidruro de litio y aluminio en THF 0,77 g (14,3 mmoles) se añadió metilato de sodio y la temperatura redujo a 0 °C después. Entonces se añadió gota a gota una solución de 10,0 g (142,7 mmoles) de 2-butin-1-ol en 108 ml de THF con agitación a esta temperatura. La agitación continuó durante 36 h a 4 °C. A partir de aquí, a aproximadamente 0 °C, se añadieron lentamente 28,6 ml (292,5 mmoles) de acetato de etilo mientras que se agitaba. Se observó una reacción fuertemente exotérmica. La agitación continuó durante 10 min sin enfriamiento. Después de enfriarse a aproximadamente 0 °C, se añadieron gota a gota 45,8 g (142,7 mmoles) de tri(n-butil)estanol-metanolato mientras que se agitaba. La agitación continuó durante 2 d a 4 °C. Después de la adición de 112,9 g de metanol, la agitación continuó durante 1 h a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se vertió en 250 ml de agua, se extrajo tres veces con 150 ml de éter dietílico cada vez, los extractos combinados se lavaron dos veces con 80 ml de agua cada vez, entonces una vez con 40 ml de solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secaron con sulfato de sodio y se concentraron a vacío. Rendimiento 48,6 g de aceite, que se purificó por cromatografía sobre 300 g gel de sílice con hexano/MTBE (10:1). Rendimiento final 34,6 g (67 %) de aceite. δ = 0,90 (m); 1,30 (m); 1,50 (m); 1,97 (s); 4,02 (t); 6,27 (t).

Ej. 1b: 1-(4-Cloro-fenil)-3-((Z)-3-tributylestanil-but-2-eniloxi)-1H-pirazol (5)

A 8,09 g (30,8 mmoles) de trifetilfosfina en 200 ml de THF se añadieron con agitación a -75 °C 6,23 g (30,8 mmoles) de éster diisopropílico del ácido azodicarbónico. La mezcla se agitó a esta temperatura durante 5 min. Entonces se añadieron gota a gota 10,39 g (28,8 mmoles) de (Z)-3-tributyl-estanol-but-2-en-1-ol y se agitó durante 5 min a -75 °C. Después de la adición de 4,00 g (20,6 mmoles) de 1-(4-clorofenil)-3-hidroxipirazol a -75 °C se formó una suspensión roja. La mezcla se dejó calentar hasta temperatura ambiente y se agitó durante 3 d. Después de eliminar los disolventes a vacío se recogieron 29 g de aceite y se purificó por cromatografía sobre 120 g de sílice con MTBE/heptano. Rendimiento 8,3 g (75 %) de aceite. δ = 0,85 (m); 0,95 (m); 1,30 (m); 1,50 (m); 2,00 (s); 4,65 (d); 5,90 (d); 6,43 (t); 7,35 (d); 7,52 (d); 7,68 (d).

Ej. 1c: Éster metílico del ácido (Z)-5-[1-(4-cloro-fenil)-1H-pirazol-3-iloxi]-2-[(E)-metoxiimino]-3-metil-pent-3-enico (7)

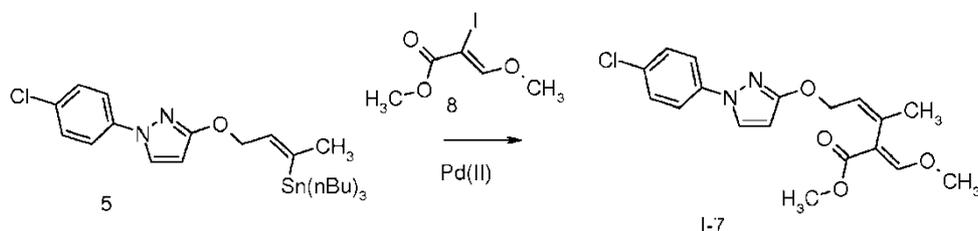
Se agitaron 3,00 g (5,58 mmoles) de 1-(4-cloro-fenil)-3-((Z)-3-tributylestanil-but-2-eniloxi)-1H-pirazol, 1,15 g (5,86 mmoles) de bromuro del ácido hidroxámico (6), 0,155 g (0,67 mmoles) de tri(2-fenil)fosfina y 96 mg (0,17 mmoles) de bis(dibencilidenacetona)-paladio en 10 ml de 1,4-dioxano durante 4 d a aproximadamente 80 °C. Después de eliminar los disolventes a vacío se recogieron 4,3 g de aceite y se purificó por cromatografía sobre 70 g de sílice con MTBE/heptano/1 % de trietilamina. Rendimiento 1,2 g (59 %) de aceite. δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (d); 5,85 (d); 5,93 (t); 7,35 (d); 7,52 (d); 7,65 (d).

Ej. 1d: Metilamida del ácido (Z)-5-[1-(4-cloro-fenil)-1H-pirazol-3-iloxi]-2-[(E)-metoxiimino]-3-metil-pent-3-enico (I-6)

Se agitaron 120 mg (0,33 mmoles) del éster metílico del ácido (Z)-5-[1-(4-cloro-fenil)-1H-pirazol-3-iloxi]-2-[(E)-

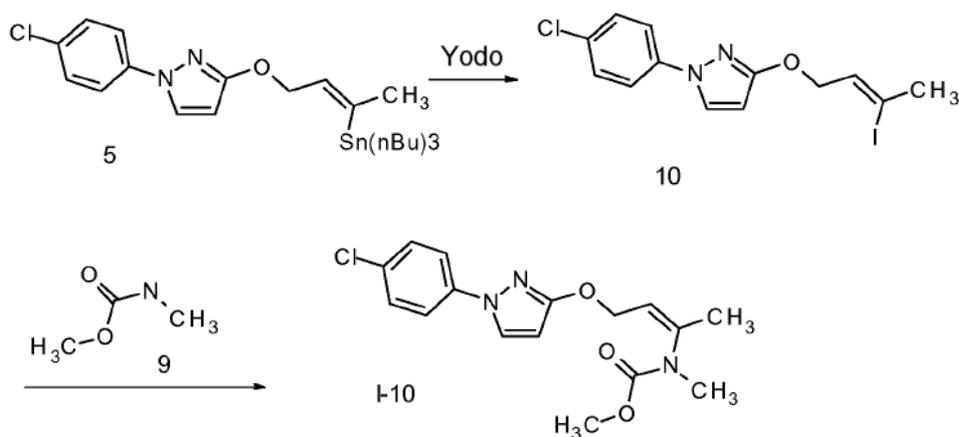
metoxiimino]-3-metil-pent-3-enico y 0,99 ml (1,98 mmoles) de una solución 2 molar de metilamina en THF durante la noche a temperatura ambiente en 2,0 ml de THF y 0,5 ml de agua. Después de eliminar el disolvente a vacío, el producto (120 mg) se recogió con rendimiento cuantitativo y buena pureza. Punto de fusión 129-130 °C.

Ejemplo 2: Éster metílico del ácido (Z)-5-[1-(4-cloro-fenil)-1H-pirazol-3-iloxi]-2-[1-metoxi-met-(E)-iliden]-3-metil-pent-3-enoico (compuesto I-7)



Se agitaron 1,50 g (2,79 mmoles) de 1-(4-cloro-fenil)-3-((Z)-3-tributilestanil-but-2-eniloxi)-1H-pirazol (5), 0,81 g (3,35 mmoles) del compuesto de éster (8) [Chem Comm 4, 423-425, (2006)], 0,223 g (0,28 mmoles) de cloruro de [(R)-(+)-2,2"-bis(difenilfosfina)-1,1"-bisnafil]-paladio(II) en 14 ml de 1,4-dioxano durante 4,5 d a aproximadamente 100 °C. Después de eliminar los disolventes a vacío se recogió el producto en bruto, que se purificó por cromatografía sobre 50 g de sílice con MTBE/hexano/2 % de trietilamina. Rendimiento 0,12 g, punto de fusión 123-125 °C.

Ejemplo 3: N-[(Z)-3-[1-(4-Clorofenil)pirazol-3-il]oxi-1-metil-prop-1-enil]-N-metil-carbamato de metilo (I-10)



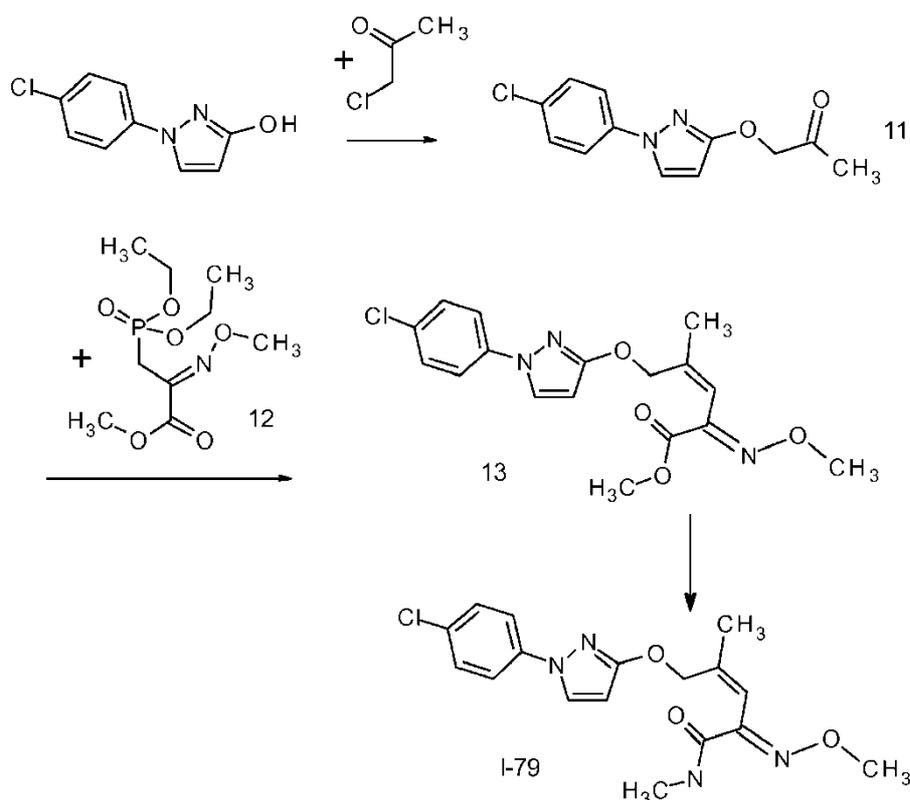
Ej. 3a: 1-(4-Clorofenil)-3-[(Z)-3-yodobut-2-enoxi]pirazol (10)

A 10,0 g (18,6 mmoles) de 1-(4-cloro-fenil)-3-((Z)-3-tributilestanil-but-2-eniloxi)-1H-pirazol en 100 ml de cloruro de metileno se añadieron 4,7 g (18,6 mmoles) de yodo a temperatura ambiente con agitación que continuó durante 3 h. Después de eliminar los disolventes a vacío, el producto en bruto se disolvió en 200 ml de MTBE. Se añadieron 100 ml de solución acuosa al 20 % de fluoruro de potasio y la mezcla se agitó durante 2 h a temperatura ambiente. La fase acuosa se separó y se extrajo dos veces con 20 ml de metil-terc-butil éter. Las fases orgánicas combinadas se lavaron dos veces con 20 ml de agua cada vez, se secaron con sulfato de sodio, y los disolventes se eliminaron a vacío. El producto en bruto (7,2 g) se purificó por cromatografía sobre 50 g de sílice con metil-terc-butil éter/hexano (1:20). Rendimiento 5,9 g, punto de fusión 75-77 °C.

Ej. 3b: N-[(Z)-3-[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oxi-1-metil-prop-1-enil]-N-metil-carbamato de metilo

Se agitaron 1,50 g (4,00 mmoles) de 1-(4-clorofenil)-3-[(Z)-3-yodobut-2-enoxi]pirazol, 0,43 g (4,81 mmoles) de éster metílico del ácido N-metilcarbámico (9), 76 mg (0,4 mmoles) de yoduro de cobre, 1,27 g (6,00 mmoles) de fosfato de potasio y 71 mg (0,80 mmoles) de N,N'-dimetiletilediamina en 14 ml de tolueno durante 1,5 d a 100 °C. Después de eliminar los disolventes a vacío, el producto en bruto se purificó por cromatografía sobre 50 g de sílice con MTBE/hexano (1:3). Rendimiento 0,67 g. RMN ¹H (CDCl₃): δ = 1,90 (s); 3,05 (s); 3,70 (s); 4,68 (m); 5,63 (m); 5,90 (d); 7,35 (m); 7,55 (m); 7,68 (d).

Ejemplo 4: (Z,E)-5-[1-(4-Clorofenil)pirazol-3-il]oxi-2-metoxiimino-N,4-dimetil-pent-3-enamida (compuesto I-79)



Ej. 4a: 1-[1-(4-Clorofenil)pirazol-3-il]oxipropan-2-ona (11)

Se agitaron 5,50 g (28,3 mmoles) de 1-(4-clorofenil)pirazol-3-ol, 3,91 g (28,3 mmoles) de carbonato de potasio y 50 mg de yoduro de sodio en 30 ml de DMF durante 5 min a temperatura ambiente. Entonces se añadieron gota a gota 2,62 g (28,3 mmoles) de cloroacetona mientras que se agitaba, que continuó a 60 °C durante 5 h. La mezcla se vertió en exceso de solución acuosa al 10 % de cloruro de litio y se extrajo tres veces con acetato de etilo. Los extractos combinados se lavaron dos veces con solución al 10 % de cloruro de litio y se secaron con sulfato de sodio. Después de eliminar el disolvente a vacío, el producto en bruto se purificó por cromatografía sobre sílice. Rendimiento 6,5 g. El producto se usó para la siguiente etapa.

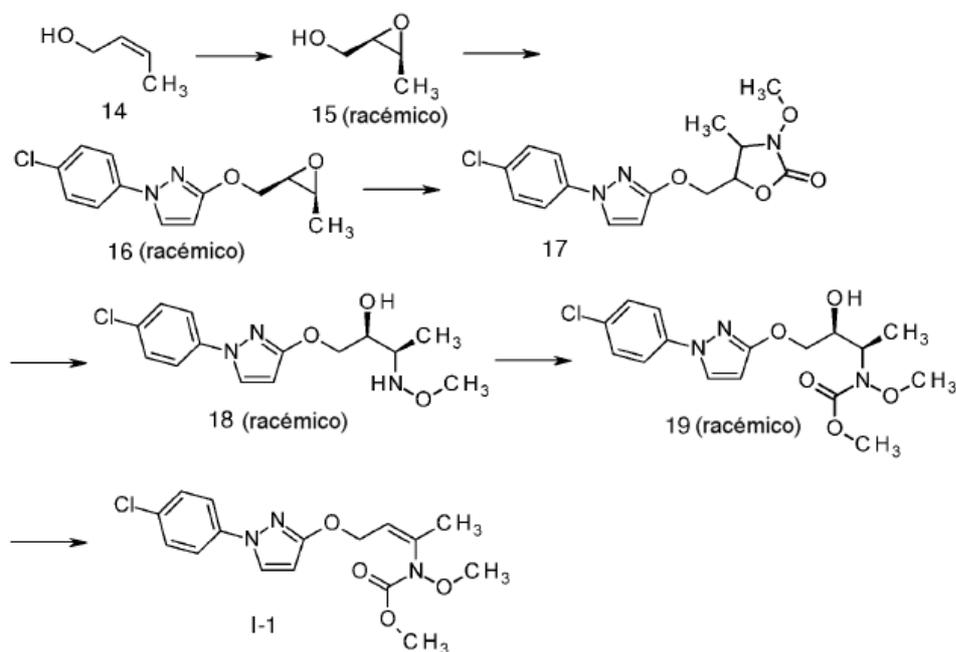
10 **Ej. 4b:** (Z,2E)-5-[1-(4-Clorofenil)pirazol-3-il]oxi-2-metoxiimino-4-metil-pent-3-enoato de metilo e isómero E (13)

A 5,26 g (21,0 mmoles) de 1-[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oxipropan-2-ona y 7,20 g (26,9 mmoles) de (2Z)-3-dietoxifosforil-2-metoxiimino-propanoato de metilo (que puede prepararse como se describe para el derivado de dimetoxi [(Tetrahedron Let 29, 3361-3364 (1988))] en 100 ml de THF se añadieron a temperatura ambiente con agitación 2,59 g (23,1 mmoles) de terc-butolato de potasio. La agitación continuó durante la noche. Después de eliminar el disolvente a vacío, la mezcla se purificó por cromatografía sobre sílice con heptano/acetato de etilo. Se recogieron 1,07 g de una mezcla 80:20 de E:Z. Ésta se ha usado directamente para la siguiente etapa.

Ej. 4c: (Z,2E)-5-[1-(4-Clorofenil)pirazol-3-il]oxi-2-metoxiimino-N,4-dimetil-pent-3-enamida

Se disolvieron 0,68 g (1,87 mmoles) de (Z,2E)-5-[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oxi-2-metoxiimino-4-metil-pent-3-enoato de metilo e isómero E de la reacción previa en 3,0 ml de THF. Se añadieron 2,0 ml de 40 % de metilamina acuosa a temperatura ambiente con agitación que continuó durante la noche. Después de eliminar el disolvente a vacío, la mezcla se purificó por cromatografía sobre sílice con un gradiente de heptano/acetato de etilo. Se recogieron 90 mg del isómero Z deseado. RMN ¹H (CDCl₃): δ = 2,03 (s); 2,85 (d); 3,97 (s); 4,64 (s); 5,87 (s); 6,02 (d); 6,65 (a); 7,35 (d); 7,50 (d); 7,67 (d).

Ejemplo 5: N-[(Z)-3-[1-(4-Clorofenil)pirazol-3-il]oxi-1-metil-prop-1-enil]-N-metoxi-carbamato de metilo (I-1)

**Ej. 5a:** Cis-3-metiloxiran-2-il]metanol (15)

5 A 10,0 g (138,7 mmoles) de Z-but-2-en-1-ol en 140 ml de diclorometano (DCM) se añadieron 37,6 g (152,6 mmoles) de ácido 3-cloroperbenzoico (70 % de pureza) a 0-5 °C en pequeñas porciones con agitación. La agitación continuó a 0 °C durante 2 h. Se añadieron 35,0 g de hidróxido de calcio a 0-5 °C con agitación, que continuó durante aproximadamente 2 h a 0 °C. El precipitado se separó por filtración, se lavó con DCM, y los filtrados se secaron con sulfato de sodio. El disolvente se eliminó en gran parte a 380 mbar/30 °C. Se usó el producto en bruto (15,0 g, pureza del 75 %) sin más purificación.

Ej. 5b: 1-(4-Clorofenil)-3-[[2R,3S)-3-metiloxiran-2-il]metoxi]pirazol racémico (16)

10 A 28,3 g (107,9 mmoles) de trifenilfosfina y 15,0 g (127,7 mmoles) de cis-3-metiloxiran-2-il]metanol (15) del experimento precedente en 400 ml de THF se añadieron con agitación a -75 °C 22,9 g (113,0 mmoles) de éster diisopropílico del ácido azodicarbónico. La mezcla se agitó a esta temperatura durante 5 min. Entonces se añadieron con agitación 20,0 g (102,8 mmoles) de 1-(4-clorofenil)-3-hidroxipirazol a -70 °C. La mezcla se dejó calentar hasta temperatura ambiente y se agitó durante aproximadamente 1 d. Después de eliminar los disolventes a vacío, el producto en bruto se agitó con 200 ml de diisopropil éter, del que se obtuvieron 42 g de una sustancia sólida y se purificó adicionalmente por cromatografía sobre 330 g de sílice con MTBE/heptano. Rendimiento 22,5 g (82 %).

Ej. 5c: 5-[[1-(4-Clorofenil)pirazol-3-il]oximetil]-3-metoxi-4-metil-oxazolidin-2-ona (17)

20 A 1,08 g (10,0 mmoles) de N-metoxicarbamato de metilo en 17 ml de DMSO se añadieron con agitación a temperatura ambiente 1,00 g (8,9 mmoles) de terc-butolato de potasio. La agitación continuó durante 5 min antes de añadir 2,00 g (7,56 mmoles) de 1-(4-clorofenil)-3-[[2R,3S)-3-metiloxiran-2-il]metoxi]pirazol. La mezcla se agitó a 90 °C durante 20 h. Después de enfriarse hasta temperatura ambiente, la mezcla de reacción se vertió en 150 ml de agua, se extrajo tres veces con 30 ml de acetato de etilo cada vez, los extractos combinados se secaron con sulfato de sodio y el disolvente se eliminó a vacío. El producto en bruto (2,5 g) se usó sin más purificación.

Ej. 5d: (2S,3R)-1-[1-(4-Clorofenil)pirazol-3-il]oxi-3-(metoxiamino)butan-2-ol racémico (18)

25 A 10,0 g (30,0 mmoles) de 5-[[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oximetil]-3-metoxi-4-metil-oxazolidin-2-ona en 100 ml de etanol se añadieron a temperatura ambiente con agitación 14,6 g (40,0 mmoles) de solución al 21 % de etilato de sodio (en etanol) y se agitó durante la noche. El disolvente se eliminó en gran medida a vacío y la mezcla restante se vertió en 250 ml de solución acuosa de dihidrogenofosfato de sodio, se extrajo tres veces con 150 ml de acetato de etilo cada vez, se secó con sulfato de sodio dando 8,7 g de un aceite después de la evaporación del disolvente a vacío. Se purificó adicionalmente por cromatografía sobre 120 g de sílice con MTBE/heptano. Rendimiento 4,0 g (43 %). RMN ¹H (CDCl₃): δ = 1,22 (d); 3,17 (m); 3,57 (s); 3,91 (m); 4,33 (m); 4,47 (m); 5,93 (s); 7,35 (d); 7,52 (d); 7,68 (s).

Ej. 5e: N-[(1R,2S)-3-[1-(4-Clorofenil)pirazol-3-il]oxi-2-hidroxi-1-metil-propil]-N-metoxi-carbamato de metilo racémico (19)

5 A 1,00 g (3,2 mmoles) de (2S,3R-1-[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oxi-3-(metoxiamino)butan-2-ol racémico en 7 ml de THF se añadieron 0,28 g (3,5 mmoles) de hidrogenocarbonato de sodio. Entonces se añadieron gota a gota 0,33 g (3,5 mmoles) de cloroformiato de metilo con agitación a temperatura ambiente. La agitación continuó durante la noche. La mezcla de reacción se vertió en 10 ml de agua, se extrajo tres veces con 10 ml de MTBE cada vez, los extractos combinados se secaron con sulfato de sodio, y el disolvente se eliminó a vacío. El producto en bruto (1,3 g) se usó sin más purificación.

Ej. 5f: N-[(Z)-3-[1-(4-Clorofenil)pirazol-3-il]oxi-1-metil-prop-1-enil]-N-metoxi-carbamato de metilo (I-1)

10 A 3,50 g (9,46 mmoles) de N-[(1 R,2S)-3-[1-(4-clorofenil)pirazol-3-il]oxi-2-hidroxi-1-metil-propil]-N-metoxi-carbamato de metilo racémico en 13 ml de THF se añadieron 2,61 g (9,94 mmoles) de trifetilfosfina con agitación a temperatura ambiente. La mezcla se enfrió a -15 °C. Entonces se añadieron 2,11 g (10,41 mmoles) de éster diisopropílico del ácido azodicarbónico con agitación que continuó durante 1 h a 0 °C y durante aproximadamente 1 d a temperatura ambiente. Después de eliminar los disolventes a vacío, el producto en bruto se purificó adicionalmente por cromatografía sobre 25 g de sílice con MTBE/heptano/1 % de trietilamina. RMN ¹H (CDCl₃): δ = 1,93 (s); 3,72 (s); 3,81 (s); 4,78 (d); 5,73 (t); 5,90 (d); 7,36 (d); 7,55 (d); 7,70 (d).

Tabla I. Compuestos de fórmula I con datos físicos (punto de fusión [°C]; RMN ¹H (CDCl₃) (δ); HPLC/EM tiempo de retención [min])

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN ¹ H (δ); R _t [min]
I-1	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 3,72 (s); 3,81 (s); 4,78 (d); 5,73 (t); 5,90 (d); 7,36 (d); 7,55 (d); 7,70 (d)
I-2	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	NH	Y-1	
I-3	CH ₃	H	R3-1	R4-3	O	Y-1	
I-4	CH ₃	H	R3-1	R4-3	NH	Y-1	
I-5	CH ₃	H	R3-1	R4-1	O	Y-1	88-89 °C
I-6	CH ₃	H	R3-1	R4-1	NH	Y-1	130 °C
I-7	CH ₃	H	R3-1	R4-2	O	Y-1	123-125 °C
I-8	CH ₃	H	R3-1	R4-2	NH	Y-1	
I-9	CH ₃	H	R3-1	R4-7		Y-1	
I-10	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R5 = CH ₃	O	Y-1	δ = 1,90 (s); 3,05 (s); 3,70 (s); 4,68 (m); 5,63 (m); 5,90 (d); 7,35 (m); 7,55 (m); 7,68 (d)

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-11	CH ₃	H	R3-2	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,85 (d); 3,95 (s); 4,55 (m); 5,87 (m); 5,95 (m); 6,70 (a); 6,95 (m); 7,73 (m); 7,80 (m)
I-12	CH ₃	H	R3-3	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,80 (d); 3,95 (s); 4,52 (m); 5,83 (d); 5,93 (m); 6,75 (a); 6,95 (m); 7,30 (m)
I-13	CH ₃	H	R3-4	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,38 (s); 2,80 (d); 3,95 (s); 4,55 (m); 5,88 (d); 5,95 (m); 6,75 (a); 7,13 (m); 7,28 (m); 7,41 (d); 7,64 (d)
I-14	CH ₃	H	R3-5	R4-1	NH	Y-1	125-127 °C
I-15	CH ₃	H	R3-6	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,85 (d); 3,95 (s); 4,55 (m); 5,90 (d); 5,95 (m); 6,70 (a); 7,32 (m); 7,50 (s); 7,54 (d); 7,70 (d)
I-16	CH ₃	H	R3-7	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,56 (m); 5,88 (d); 5,94 (m); 6,70 (a); 7,45 (m); 7,64 (s); 7,72 (d)
I-17	CH ₃	H	R3-8	R4-1	NH	Y-1	
I-18	CH ₃	H	R3-9	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,33 (s); 2,88 (d); 3,97 (s); 4,56 (m); 5,85 (m); 5,95 (m); 6,70 (a); 7,03 (t); 7,30 (m); 7,44 (m); 7,62 (m)
I-19	CH ₃	H	R3-10	R4-1	NH	Y-1	

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-20	CH ₃	H	R3-11	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,25 (s); 2,30 (s); 2,87 (d); 3,97 (s); 4,56 (m); 5,85 (d); 5,95 (m); 6,73 (a); 7,15 (d); 7,27 (m); 7,35 (d); 7,63 (d)
I-21	CH ₃	H	R3-12	R4-1	NH	Y-1	
I-22	CH ₃	H	R3-13	R4-1	NH	Y-1	
I-23	CH ₃	H	R3-14	R4-1	NH	Y-1	
I-24	CH ₃	H	R3-15	R4-1	NH	Y-1	
I-25	CH ₃	H	R3-16	R4-1	NH	Y-1	
I-26	CH ₃	H	R3-17	R4-1	NH	Y-1	
I-27	CH ₃	H	R3-14	R4-1	NH	Y-1	
I-28	CH ₃	H	R3-18	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,57 (m); 5,87 (m); 5,95 (m); 6,70 (a); 7,07 (m); 7,33 (m); 7,55 (m); 7,64 (m)
I-29	CH ₃	H	R3-19	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,58 (m); 5,88 (d); 5,94 (m); 6,70 (a); 7,15 (m); 7,30 (m); 7,43 (m); 7,64 (s); 7,70 (d)
I-30	CH ₃	H	R3-20	R4-1	NH	Y-1	
I-31	CH ₃	H	R3-21	R4-1	NH	Y-1	
I-32	CH ₃	H	R3-22	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,37 (s); 2,87 (d); 3,95 (s); 4,55 (m); 5,86 (d); 5,93 (m); 6,70 (a); 7,20 (m); 7,45 (m); 7,65 (d)
I-33	CH ₃	H	R3-23	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,23 (m); 1,95 (s); 2,64 (m); 2,87 (d); 3,95 (s); 4,58 (m); 5,87 (d); 5,95 (m); 6,70 (a); 7,25 (m); 7,48 (m); 7,67 (d)

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-34	CH ₃	H	R3-24	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,58 (m); 5,92 (m); 6,70 (a); 7,67 (m); 7,75 (d)
I-35	CH ₃	H	R3-25	R4-1	NH	Y-1	
I-36	CH ₃	H	R3-26	R4-1	NH	Y-1	
I-37	CH ₃	H	R3-58	R4-1	NH	Y-1	
I-38	CH ₃	H	R3-28	R4-1	NH	Y-1	
I-39	CH ₃	H	R3-29	R4-1	NH	Y-1	
I-40	CH ₃	H	R3-30	R4-1	NH	Y-1	
I-41	CH ₃	H	R3-31	R4-1	NH	Y-1	
I-42	CH ₃	H	R3-32	R4-1	NH	Y-1	
I-43	CH ₃	H	R3-33	R4-1	NH	Y-1	
I-44	CH ₃	H	R3-34	R4-1	NH	Y-1	
I-45	CH ₃	H	R3-35	R4-1	NH	Y-1	
I-46	CH ₃	H	R3-36	R4-1	NH	Y-1	
I-47	CH ₃	H	R3-37	R4-1	NH	Y-1	
I-48	CH ₃	H	R3-38	R4-1	NH	Y-1	
I-49	CH ₃	H	R3-39	R4-1	NH	Y-1	
I-50	CH ₃	H	R3-40	R4-1	NH	Y-1	
I-51	CH ₃	H	R3-41	R4-1	NH	Y-1	
I-52	CH ₃	H	R3-42	R4-1	NH	Y-1	
I-53	CH ₃	H	R3-43	R4-1	NH	Y-1	
I-54	CH ₃	H	R3-44	R4-1	NH	Y-1	
I-55	CH ₃	H	R3-45	R4-1	NH	Y-1	
I-56	CH ₃	H	R3-46	R4-1	NH	Y-1	
I-57	CH ₃	H	R3-47	R4-1	NH	Y-1	
I-58	CH ₃	H	R3-45	R4-1	NH	Y-1	
I-59	CH ₃	H	R3-49	R4-1	NH	Y-1	

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-60	CH ₃	H	R3-50	R4-1	NH	Y-1	
I-61	CH ₃	H	R3-51	R4-1	NH	Y-1	
I-62	CH ₃	H	R3-52	R4-1	NH	Y-1	
I-63	CH ₃	H	R3-53	R4-1	NH	Y-1	
I-64	CH ₃	H	R3-54	R4-1	NH	Y-1	
I-65	CH ₃	H	R3-55	R4-1	NH	Y-1	
I-66	CH ₃	H	R3-56	R4-1	NH	Y-1	
I-67	CH ₃	H	R3-57	R4-1	NH	Y-1	
I-68	CH ₃	H	R3-58	R4-4, R ₅ = OCH ₃	O	Y-1	
I-69	CH ₃	H	R3-58	R4-4, R ₅ = OCH ₃	NH	Y-1	
I-70	CH ₃	H	R3-58	R4-3	O	Y-1	
I-71	CH ₃	H	R3-58	R4-3	NH	Y-1	
I-72	CH ₃	H	R3-27	R4-1	O	Y-1	
I-73	CH ₃	H	R3-58	R4-2	O	Y-1	
I-74	CH ₃	H	R3-58	R4-2	NH	Y-1	
I-75	CH ₃	H	R3-58	R4-7		Y-1	
I-76	C ₂ H ₅	H	R3-1	R4-1	NH	Y-1	
I-77	C ₂ H ₅	H	R3-2	R4-1	NH	Y-1	
I-78	C ₂ H ₅	H	R3-58	R4-1	NH	Y-1	
I-79	H	CH ₃	R3-1	R4-1	NH	Y-1	δ = 2,03 (s); 2,85 (d); 3,97 (s); 4,64 (s); 5,87 (s); 6,02 (d); 6,65 (a); 7,35 (d); 7,50 (d); 7,67 (d)
I-80	H	CH ₃	R3-1	R4-1	O	Y-1	
I-81	CH ₃	H	R3-1	R4-1	NH	Y-3	
I-82	CH ₃	H	R3-59	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,16 (s); 2,18 (s); 2,30 (s); 2,90 (s); 3,97 (s); 4,33 (m); 4,65 (m); 5,30 (m); 5,87 (m); 6,07 (m); 6,55 (s); 6,65 (a); 6,96 (s)

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-83	CH ₃	H	R3-60	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,22 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,35 (m); 4,67 (m); 5,30 (m); 5,88 (m); 6,07 (m); 6,65 (a); 6,73 (d); 7,35 (d); 7,43 (s)
I-84	CH ₃	H	R3-61	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,15 (s); 2,18 (s); 2,28 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,33 (m); 4,67 (s); 5,39 (d); 5,43 (d); 5,88 (m); 6,57 (s); 6,65 (a); 6,95 (s)
I-85	CH ₃	H	R3-62	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,21 (s); 2,25 (s); 2,89 (d); 3,95 (s); 4,35 (m); 4,70 (s); 5,39 (d); 5,44 (d); 5,90 (m); 6,65 (a); 6,73 (d); 7,40 (d); 7,45 (s)
I-86	CH ₃	H	R3-63	R4-1	O	Y-1	δ = 1,73 (m); 1,93 (s); 2,15 (s); 2,30 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,33 (m); 4,60 (m); 5,75 (m); 5,85 (m); 6,55 (s); 6,95 (s)
I-87	CH ₃	H	R3-64	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,12 (s); 2,14 (s); 2,30 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,35 (m); 4,63 (m); 5,85 (m); 6,15 (m); 6,27 (m); 6,55 (s); 6,97 (s)
I-88	CH ₃	H	R3-65	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,17 (s); 2,19 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,35 (m); 4,65 (m); 5,87 (m); 6,17 (m); 6,31 (m); 6,72 (d); 7,35 (d); 7,43 (s).
I-89	CH ₃	H	R3-66	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,12 (s); 2,14 (s); 2,30 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 3,97 (s); 4,32 (m); 5,87 (m); 6,57 (s); 6,65 (a); 6,97 (s)

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-90	CH ₃	H	R3-63	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,73 (m); 1,93 (s); 2,15 (s); 2,30 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,33 (m); 4,55 (m); 5,75 (m); 5,90 (m); 6,57 (s); 6,65 (a); 6,95 (s)
I-91	CH ₃	H	R3-67	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,73 (m); 1,93 (s); 2,18 (s); 2,20 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,35 (m); 4,60 (m); 5,75 (m); 5,90 (m); 6,55 (a); 6,73 (m); 7,35 (m); 7,43 (s)
I-92	CH ₃	H	R3-64	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,15 (s); 2,30 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,33 (m); 4,60 (m); 5,87 (m); 6,15 (m); 6,27 (m); 6,57 (s); 6,65 (a); 6,95 (s)
I-93	CH ₃	H	R3-65	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,19 (s); 2,21 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,35 (m); 4,65 (m); 5,90 (m); 6,17 (m); 6,31 (m); 6,65 (a); 6,75 (d); 7,35 (m); 7,43 (s)
I-94	CH ₃	H	R3-59	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,15 (s); 2,30 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,33 (m); 4,63 (m); 5,30 (m); 5,87 (m); 6,07 (m); 6,53 (s); 6,97 (s)
I-95	CH ₃	H	R3-60	R4-1	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,22 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,37 (m); 4,67 (m); 5,30 (m); 5,87 (m); 6,07 (m); 6,70 (d); 7,37 (m); 7,45 (s)
I-96	CH ₃	H	R3-61	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,15 (s); 2,17 (s); 2,28 (s); 3,87 (s); 4,07 (s); 4,33 (m); 4,67 (s); 5,40 (d); 5,43 (d); 5,87 (m); 6,53 (s); 6,95 (s)

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-97	CH ₃	H	R3-62	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,21 (s); 2,23 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,37 (m); 4,70 (s); 5,39 (d); 5,42 (d); 5,87 (m); 6,70 (d); 7,38 (m); 7,45 (s)
I-98	CH ₃	H	R3-68	R4-1	O	Y-1	δ = 1,23 (t); 1,87 (s); 2,08 (s); 2,27 (s); 3,70 (s); 3,95 (s); 4,10 (q); 4,30 (m); 5,90 (m); 6,65 (s); 7,00 (s)
I-99	CH ₃	H	R3-69	R4-1	O	Y-1	
I-100	CH ₃	H	R3-69	R4-1	NH	Y-1	
I-101	CH ₃	H	R3-69	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	
I-102	CH ₃	H	R3-70	R4-1	O	Y-6	
I-103	CH ₃	H	R3-70	R4-1	NH	Y-6	
I-104	CH ₃	H	R3-70	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-6	
I-105	CH ₃	H	R3-71	R4-1	O	Y-4	
I-106	CH ₃	H	R3-71	R4-1	NH	Y-4	
I-107	CH ₃	H	R3-71	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-4	
I-108	CH ₃	H	R3-72	R4-1	NH	Y-1	
I-109	CH ₃	H	R3-72	R4-1	O	Y-1	
I-110	CH ₃	H	R3-72	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	
I-111	CH ₃	H	R3-72	R4-1	NH	Y-2	
I-112	CH ₃	H	R3-72	R4-1	O	Y-2	
I-113	CH ₃	H	R3-72	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-2	
I-114	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-2	
I-115	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	NH	Y-2	
I-116	CH ₃	H	R3-1	R4-3	O	Y-2	
I-117	CH ₃	H	R3-1	R4-3	NH	Y-2	
I-118	CH ₃	H	R3-1	R4-1	O	Y-2	
I-119	CH ₃	H	R3-1	R4-1	NH	Y-2	

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-120	CH ₃	H	R3-1	R4-2	O	Y-2	
I-121	CH ₃	H	R3-1	R4-2	NH	Y-2	
I-122	CH ₃	H	R3-1	R4-7		Y-2	
I-123	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ^b = CH ₃	O	Y-2	
I-124	CH ₃	H	R3-73	R4-1	NH	Y-1	
I-125	CH ₃	H	R3-74	R4-1	NH	Y-1	
I-126	CH ₃	H	R3-75	R4-1	NH	Y-1	
I-127	CH ₃	H	R3-76	R4-1	NH	Y-1	
I-128	CH ₃	H	R3-77	R4-1	NH	Y-1	
I-129	CH ₃	H	R3-78	R4-1	NH	Y-1	
I-130	CH ₃	H	R3-78	R4-1	NH	Y-1	
I-131	CH ₃	H	R3-80	R4-1	NH	Y-1	
I-132	CH ₃	H	R3-81	R4-1	NH	Y-1	
I-133	CH ₃	H	R3-82	R4-1	NH	Y-1	
I-134	CH ₃	H	R3-83	R4-1	NH	Y-1	
I-135	CH ₃	H	R3-84	R4-1	NH	Y-1	
I-136	CH ₃	H	R3-85	R4-1	NH	Y-1	
I-137	CH ₃	H	R3-86	R4-1	NH	Y-1	
I-138	CH ₃	H	R3-87	R4-1	NH	Y-1	
I-139	CH ₃	H	R3-88	R4-1	NH	Y-1	
I-140	CH ₃	H	R3-89	R4-1	NH	Y-1	
I-141	CH ₃	H	R3-90	R4-1	NH	Y-1	
I-142	CH ₃	H	R3-91	R4-1	NH	Y-1	
I-143	CH ₃	H	R3-92	R4-1	NH	Y-1	
I-144	CH ₃	H	R3-93	R4-1	NH	Y-1	
I-145	CH ₃	H	R3-94	R4-1	NH	Y-1	
I-146	CH ₃	H	R3-95	R4-1	NH	Y-1	
I-147	CH ₃	H	R3-96	R4-1	NH	Y-1	

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-148	CH ₃	H	R3-97	R4-1	NH	Y-1	
I-149	CH ₃	H	R3-98	R4-1	NH	Y-1	
I-150	CH ₃	H	R3-99	R4-1	NH	Y-1	
I-151	CH ₃	H	R3-100	R4-1	NH	Y-1	
I-152	CH ₃	H	R3-101	R4-1	NH	Y-1	
I-153	CH ₃	H	R3-102	R4-1	NH	Y-1	
I-154	CH ₃	H	R3-103	R4-1	NH	Y-1	
I-155	CH ₃	H	R3-104	R4-1	NH	Y-1	
I-156	CH ₃	H	R3-105	R4-1	NH	Y-1	
I-157	CH ₃	H	R3-106	R4-1	NH	Y-1	
I-158	CH ₃	H	R3-107	R4-1	NH	Y-1	
I-159	CH ₃	H	R3-108	R4-1	NH	Y-1	
I-160	CH ₃	H	R3-109	R4-1	NH	Y-1	
I-161	CH ₃	H	R3-110	R4-1	NH	Y-1	
I-162	CH ₃	H	R3-111	R4-1	NH	Y-1	
I-163	CH ₃	H	R3-112	R4-1	NH	Y-1	
I-164	CH ₃	H	R3-113	R4-1	NH	Y-1	
I-165	CH ₃	H	R3-114	R4-1	NH	Y-1	
I-166	CH ₃	H	R3-115	R4-1	NH	Y-1	
I-167	CH ₃	H	R3-116	R4-1	NH	Y-1	
I-168	CH ₃	H	R3-117	R4-1	NH	Y-1	
I-169	CH ₃	H	R3-118	R4-1	NH	Y-4	
I-170	CH ₃	H	R3-119	R4-1	NH	Y-4	
I-171	CH ₃	H	R3-120	R4-1	NH	Y-4	
I-172	CH ₃	H	R3-121	R4-1	NH	Y-4	
I-173	CH ₃	H	R3-122	R4-1	NH	Y-4	
I-174	CH ₃	H	R3-123	R4-1	NH	Y-4	
I-175	CH ₃	H	R3-124	R4-1	NH	Y-4	

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-176	CH ₃	H	R3-125	R4-1	NH	Y-4	
I-177	CH ₃	H	R3-126	R4-1	NH	Y-1	
I-178	CH ₃	OCH ₃	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	
I-179	CH ₃	OCH ₃	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	
I-180	CH ₃	OCH ₃	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	
I-181	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R ⁵ = OCH ₃	O	Y-1	
I-182	CH ₃	H	R3-1	R4-1	NH	Y-1	
I-183	CH ₃	H	R3-1	R4-1	O	Y-1	
I-184	CH ₃	H	R3-1	R4-2	NH	Y-1	
I-185	CH ₃	H	R3-1	R4-2	O	Y-1	
I-186	CH ₃	H	R3-127	R4-1	O	Y-1	79-81 °C
I-187	CH ₃	H	R3-127	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,12 (s); 2,18 (s); 2,87 (d); 3,97 (s); 3,98 (s); 4,35 (m); 5,90 (m); 6,65 (a); 7,35 (d); 7,43 (s)
I-188	C ₂ H ₅	H	R3-1	R4-1	O	Y-1	δ = 1,05 (m); 2,30 (m); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,62 (m); 5,90 (m); 7,35 (m); 7,52 (m); 7,70 (d)
I-189	CH ₃	H	R3-127	R4-4, R ⁵ = CH ₃	O	Y-1	δ = 1,90 (s); 2,22 (s); 2,24 (s); 3,02 (s); 3,70 (s); 3,98 (s); 4,48 (m); 5,57 (m); 6,75 (m); 7,40 (m); 7,45 (s)
I-190	CH ₃	H	R3-66	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,10 (s); 2,13 (s); 2,30 (s); 3,85 (s); 3,92 (s); 4,05 (s); 4,35 (m); 5,87 (m); 6,53 (s); 6,97 (s)
I-191	CH ₃	H	R3-128	R4-1	O	Y-1	δ = 1,30 (t); 1,95 (s); 2,20 (s); 2,22 (s); 3,85 (s); 4,06 (s); 4,20 (q); 4,37 (m); 5,87 (m); 6,71 (d); 7,37 (m); 7,45 (s)

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-192	CH ₃	H	R3-128	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,30 (t); 1,95 (s); 2,20 (s); 2,21 (s); 2,92 (d); 3,95 (s); 4,22 (m); 4,37 (m); 5,90 (m); 6,65 (a); 6,73 (m); 7,37 (m); 7,45 (s)
I-193	CH ₃	H	R3-68	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,32 (t); 1,95 (s); 2,16 (s); 2,17 (s); 2,32 (s); 2,92 (d); 3,97 (s); 4,20 (q); 4,33 (m); 5,90 (m); 6,57 (s); 6,65 (a); 7,97 (s)
I-194	CH ₃	H	R3-5	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,53 (m); 5,87 (d); 5,93 (m); 7,07 (m); 7,25 (m); 7,55 (m); 7,63 (d)
I-195	CH ₃	H	R3-6	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,55 (m); 5,88 (d); 5,93 (m); 7,33 (m); 7,48 (s); 7,53 (d); 7,70 (d)
I-196	CH ₃	H	R3-2	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,55 (m); 5,87 (d); 5,92 (m); 6,95 (m); 7,73 (d); 7,80 (m)
I-197	CH ₃	H	R3-4	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,37 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,55 (m); 5,85 (d); 5,92 (m); 7,12 (m); 7,28 (m); 7,43 (d); 7,67 (d)
I-198	CH ₃	H	R3-22	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,35 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,57 (m); 5,83 (d); 5,93 (m); 7,20 (d); 7,47 (d); 7,66 (d)
I-199	CH ₃	H	R3-24	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,60 (m); 5,95 (m); 7,67 (m); 7,77 (d)

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-200	CH ₃	H	R3-22	R4-1	O	Y-1	δ = 1,25 (m); 1,95 (s); 2,65 (m); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,58 (m); 5,83 (d); 5,93 (m); 7,25 (m); 7,48 (m); 7,67 (d)
I-201	CH ₃	H	R3-19	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (m); 5,87 (d); 5,93 (m); 7,15 (m); 7,30 (m); 7,45 (m); 7,63 (s); 7,70 (d)
I-202	CH ₃	H	R3-7	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (m); 5,90 (d); 5,95 (m); 7,45 (m); 7,67 (d); 7,73 (d)
I-203	CH ₃	H	R3-129	R4-1	O	Y-1	δ = 1,35 (d); 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,55 (m); 5,84 (d); 5,93 (m); 6,92 (m); 7,45 (m); 7,60 (d)
I-204	CH ₃	H	R3-11	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,32 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (m); 5,85 (d); 5,95 (m); 7,15 (d); 7,30 (m); 7,37 (s); 7,66 (d)
I-205	CH ₃	H	R3-3	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,25 (s); 3,83 (s); 4,05 (s); 4,54 (m); 5,82 (d); 5,92 (m); 6,95 (m); 7,25 (m); 7,32 (d)
I-206	CH ₃	H	R3-9	R4-1	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,31 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,56 (m); 5,85 (m); 5,95 (m); 7,03 (m); 7,33 (m); 7,43 (m); 7,64 (m).
I-207	CH ₃	H	R3-18	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (m); 5,85 (d); 5,95 (m); 7,05 (m); 7,33 (m); 7,55 (m); 7,65 (d)

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-208	CH ₃	H	R3-129	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,33 (d); 1,95 (s); 2,87 (d); 3,97 (s); 4,55 (m); 5,84 (m); 5,95 (m); 6,73 (a); 6,92 (d); 7,45 (d); 7,62 (m)
I-209	CH ₃	H	R3-58	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,83 (s); 4,05 (s); 4,65 (m); 5,95 (m); 7,43 (d); 7,55 (d); 8,23 (s)
I-210	Cl	CH ₃	R3-1	R4-1	NH	Y-1	δ = 2,10 (s); 2,65 (d); 4,01 (s); 4,95 (s); 5,97 (d); 6,85 (a); 7,37 (d); 7,50 (d); 7,67 (d)
I-211	anillo de fenilo*	R3-1	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	90 °C	
I-212	anillo de fenilo*	R3-98	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	151 °C	
I-213	anillo de fenilo*	R3-130	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-4		
I-214	anillo de fenilo*	R3-131	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-4	139-142 °C	
I-215	anillo de fenilo*	R3-132	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-4	58-63 °C	
I-216	anillo de fenilo*	R3-133	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	111-113 °C	
I-217	anillo de fenilo*	R3-65	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	78-88 °C	
I-218	anillo de fenilo*	R3-60	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	83-88 °C	
I-219	anillo de fenilo*	R3-67	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	87-89 °C	
I-220	anillo de fenilo*	R3-62	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	82-88 °C	
I-221	anillo de fenilo*	R3-134	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	92-98 °C	
I-222	anillo de fenilo*	R3-135	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	141-145 °C	
I-223	anillo de fenilo*	R3-64	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	88-91 °C	

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-224	anillo de fenilo*	R3-59	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	82-86 °C	
I-225	anillo de fenilo*	R3-63	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	64-70 °C	
I-226	anillo de fenilo*	R3-136	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	101-108 °C	
I-227	anillo de fenilo*	R3-137	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	98-102 °C	
I-228	anillo de fenilo*	R3-138	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	71-75 °C	
I-229	anillo de fenilo*	R3-139	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-7	72-74 °C	
I-230	anillo de fenilo*	R3-140	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-7	δ = 1,65 (s); 3,32 (s); 3,67 (s); 5,20 (s); 7,07 (m); 7,27 (m); 7,47 (m)	
I-231	anillo de fenilo*	R3-141	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	136-138 °C	
I-232	anillo de fenilo*	R3-142	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-7	δ = 1,65 (s); 3,43 (s); 3,70 (s); 5,20 (s); 7,30-7,65 (m)	
I-233	anillo de fenilo*	R3-127	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	R _t = 3,678 min	
I-234	anillo de fenilo*	R3-143	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	R _t = 4,092 min	
I-235	anillo de fenilo*	R3-144	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	R _t = 4,065 min	
I-236	anillo de fenilo*	R3-145	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	R _t = 3,947 min	
I-237	anillo de fenilo*	R3-146	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	R _t = 3,875 min	
I-238	anillo de fenilo*	R3-147	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	R _t = 4,100 min	
I-239	anillo de fenilo*	R3-68	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	R _t = 3,933 min	

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-240	anillo de fenilo*	R3-148	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-4	R _t = 3,496 min
I-241	anillo de fenilo*	R3-149	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-4	R _t = 4,075 min
I-242	anillo de fenilo*	R3-150	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-1	R _t = 4,128 min
I-243	anillo de fenilo*	R3-151	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-1	R _t = 3,894 min
I-244	anillo de fenilo*	R3-152	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-1	R _t = 3,875 min
I-245	anillo de fenilo*	R3-153	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-1	R _t = 3,995 min
I-246	anillo de fenilo*	R3-154	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-1	R _t = 4,115 min
I-247	anillo de fenilo*	R3-20	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-1	R _t = 3,715 min
I-248	anillo de fenilo*	R3-157	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-1	R _t = 3,714 min
I-249	anillo de fenilo*	R3-128	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-1	R _t = 3,861 min
I-250	anillo de fenilo*	R3-158	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-1	R _t = 4,251 min
I-251	anillo de fenilo*	R3-159	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-1	105-107 °C
I-252	anillo de fenilo*	R3-151	R4-7 R ⁶ =Etilo			Y-1	102-104 °C
I-253	anillo de fenilo*	R3-1	R4-7 R ⁶ =CHF ₂			Y-1	96-97 °C
I-254	anillo de fenilo*	R3-128	R4-7 R ⁶ =Etilo			Y-1	R _t = 4,219 min
I-255	anillo de fenilo*	R3-68	R4-7 R ⁶ =Etilo			Y-1	R _t = 4,239 min
I-256	anillo de fenilo*	R3-146	R4-7 R ⁶ =Etilo			Y-1	R _t = 4,176 min
I-257	anillo de fenilo*	R3-66	R4-7 R ⁶ =Etilo			Y-1	R _t = 4,013 min

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-258	anillo de fenilo*	R3-160	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	δ = 2,15 (s); 3,67 (s); 3,95 (s); 5,28 (s); 6,85 (m); 7,45 (m); 7,50 (m); 7,70 (m)	
I-259	anillo de fenilo*	R3-161	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	δ = 1,33 (t); 2,17 (s); 3,68 (s); 4,22 (q); 5,28 (s); 6,87 (d); 7,45 (m); 7,52 (m); 7,73 (m)	
I-260	anillo de fenilo*	R3-162	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	R _t = 3,924 min	
I-261	anillo de fenilo*	R3-163	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	R _t = 4,131 min	
I-262	anillo de fenilo*	R3-164	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	R _t = 4,141 min	
I-263	anillo de fenilo*	R3-165	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	R _t = 3,916 min	
I-264	anillo de fenilo*	R3-166	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	R _t = 4,220 min	
I-265	anillo de fenilo*	R3-167	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	R _t = 4,050 min	
I-266	anillo de fenilo*	R3-149	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-8	δ = 2,03 (s); 3,71 (s); 7,45-7,62 (m)	
I-267	anillo de fenilo*	R3-168	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	δ = 2,20 (s); 2,40 (s); 3,69 (s); 5,20 (s); 6,70 (s); 7,12 (s); 7,42 (s); 7,53 (m); 7,72 (m); 7,91 (s)	

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-268	anillo de fenilo*	R3-169	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	δ = 2,11 (s); 2,18 (s); 3,62 (s); 3,72 (s); 5,21 (s); 6,77 (s); 6,96 (s); 7,25 (s); 7,53 (m); 7,72 (m); 8,91 (s)	
I-269	anillo de fenilo*	R3-170	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	δ = 2,00 (s); 2,05 (s); 2,16 (s); 2,21 (s); 3,70 (s); 5,16 (s); 6,72 (s); 6,82 (s); 7,50 (m); 7,74 (m)	
I-270	anillo de fenilo*	R3-171	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	δ = 2,16 (s); 2,39 (s); 2,53 (s); 3,70 (s); 5,19 (s); 6,70 (s); 7,53 (m); 7,72 (m)	
I-271	anillo de fenilo*	R3-172	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	δ = 2,18 (s); 2,29 (s); 3,70 (s); 5,18 (s); 6,71 (s); 7,06 (s); 7,50 (m); 7,71 (m); 8,38 (s); 8,44 (s)	
I-272	anillo de fenilo*	R3-173	R4-7 R ⁶ =CH ₃		Y-1	δ = 1,28 (m); 2,12 (s); 3,00 (ancho); 3,58 (m); 3,69 (s); 5,52 (s); 6,28 (s); 7,45 (m); 7,72 (m)	

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-273	anillo de fenilo*	R3-174	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-1	δ = 0,97 (m); 1,02 (m); 1,20 (m); 1,90 (m); 2,05 (s); 2,62 (m); 3,68 (s); 5,51 (s); 5,84 (s); 7,50 (m); 7,73 (m)
I-274	anillo de fenilo*	R3-175	R4-7 R ⁶ =CH ₃			Y-8	R _t = 3,715 min
I-275	CH ₃	H	R3-20	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (m); 5,92 (m); 7,45 (m); 7,52 (m); 7,75 (m); 7,84 (d)
I-276	CH ₃	H	R3-12	R4-1	O	Y-1	72-74 °C
I-277	CH ₃	H	R3-15	R4-1	O	Y-1	73-75 °C
I-278	CH ₃	H	R3-176	R4-1	O	Y-1	δ = 1,97 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,58 (d); 5,90 (d); 5,95 (m); 7,17 (t); 7,43 (m); 7,65 (m)
I-279	CH ₃	H	R3-98	R4-1	O	Y-1	90-92 °C
I-280	CH ₃	H	R3-20	R4-1	NH	Y-1	101-103 °C
I-281	CH ₃	H	R3-12	R4-1	NH	Y-1	112-115 °C
I-282	CH ₃	H	R3-15	R4-1	NH	Y-1	93-95 °C
I-283	CH ₃	H	R3-176	R4-1	NH	Y-1	84-86 °C
I-284	CH ₃	H	R3-98	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,93 (d); 3,97 (s); 4,48 (m); 5,93 (m); 6,42 (m); 6,67 (ancho); 6,80 (d); 7,37 (d); 7,45 (m); 7,68 (m); 7,83 (m)
I-285	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R5 = OCH ₃	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 3,72 (s); 3,81 (s); 4,78 (d); 5,73 (t); 5,90 (d); 7,36 (d); 7,55 (d); 7,70 (d)

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-286	CH ₃	H	R3-51	R4-1	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,45 (s); 3,82 (s); 4,05 (s); 4,60 (d); 5,92 (t); 7,25-7,50 (m)
I-287	C ₂ H ₅	H	R3-1	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,05 (t); 2,30 (q); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,58 (m); 5,93 (m); 6,70 (ancho); 7,35 (m); 7,53 (m); 7,68 (s)
I-288	CH ₃	H	R3-58	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,63 (m); 5,95 (m); 6,75 (ancho); 7,43 (m); 7,55 (m); 8,23 (s)
I-289	CH ₃	H	R3-51	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,45 (s); 2,83 (d); 3,95 (s); 4,58 (m); 5,92 (m); 6,73 (ancho); 7,30-7,50 (m)
I-290	CH ₃	H	R3-1	R4-4, R5 = C ₂ H ₅	O	Y-1	δ = 1,18 (m); 1,95 (s); 3,45 (ancho); 3,73 (s); 4,67 (m); 5,70 (m); 5,90 (m); 7,35 (m); 7,53 (m); 7,67 (m)
I-291	CH ₃	H	R3-39	R4-1	O	Y-1	72 °C
I-292	CH ₃	H	R3-44	R4-1	O	Y-1	106-110 °C
I-293	CH ₃	H	R3-44	R4-1	NH	Y-1	177 °C
I-294	CH ₃	H	R3-177	R4-1	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 3,20 (m); 3,28 (m); 3,83 (s); 3,90 (m); 4,05 (s); 4,42 (m); 4,50 (m); 5,88 (m); 5,94 (s); 6,83 (m); 7,25 (m); 7,50 (s)
I-295	CH ₃	H	R3-39	R4-1	NH	Y-1	142 °C
I-296	Iso-butil	H	R3-1	R4-1	O	Y-1	δ = 0,93 (m); 1,60 (m); 2,15 (d); 3,84 (s); 4,07 (s); 4,62 (m); 5,89 (m); 7,35 (d); 7,53 (d); 7,67 (s)

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-297	CH ₃	H	R3-29	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,65 (m); 5,95 (m); 7,27 (m); 7,87 (m); 8,35 (s)
I-298	CH ₃	H	R3-36	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,65 (m); 5,95 (m); 7,63 (m); 7,67 (m); 7,93 (s); 8,37 (s)
I-299	Iso-butil	H	R3-1	R4-1	NH	Y-1	177 °C
I-300	C ₂ H ₅	H	R3-58	R4-1	O	Y-1	87 °C
I-301	CH ₃	H	R3-29	R4-1	NH	Y-1	140 °C
I-302	CH ₃	H	R3-36	R4-1	NH	Y-1	125 °C
I-303	CH ₃	H	R3-33	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,83 (s); 4,05 (s); 4,65 (m); 5,95 (m); 7,37 (m); 7,57 (m); 8,27 (s)
I-304	CH ₃	H	R3-54	R4-1	O	Y-1	δ = 1,25 (m); 1,95 (s); 2,68 (m); 3,83 (s); 4,05 (s); 4,65 (m); 5,95 (m); 7,30 (m); 7,51 (m); 8,20 (s)
I-305	CH ₃	H	R3-33	R4-1	NH	Y-1	126 °C
I-306	CH ₃	H	R3-54	R4-1	NH	Y-1	128 °C
I-307	CH ₃	H	R3-178	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 3,82 (s); 4,07 (s); 4,62 (m); 5,95 (m); 7,28 (m); 7,36 (m); 7,93 (s)
I-308	CH ₃	H	R3-130	R4-1	O	Y-4	δ = 1,95 (s); 2,25 (s); 3,80 (s); 4,05 (s); 4,55 (m); 5,90 (m); 7,25-7,60 (m); 7,77 (m); 7,85 (s); 8,05 (s); 8,27 (s)
I-309	CH ₃	H	R3-130	R4-1	NH	CH=N-O- CH ₂ -	δ = 1,95 (s); 2,88 (d); 3,96 (s); 4,50 (m); 5,92 (m); 6,70 (ancho); 7,25-7,60 (m); 7,76 (m); 8,05 (s); 8,08 (s); 8,27 (s)

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-310	CH ₃	H	R3-42	R4-1	O	Y-1	116 °C
I-311	C ₂ H ₅	H	R3-58	R4-1	NH	Y-1	154 °C
I-312	CH ₃	H	R3-30	R4-1	NH	Y-1	167 °C
I-313	CH ₃	H	R3-178	R4-1	NH	Y-1	143 °C
I-314	CH ₃	H	R3-42	R4-1	NH	Y-1	147 °C
I-315	CH ₃	H	R3-40	R4-1	NH	Y-1	153 °C
I-316	CH ₃	H	R3-177	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,88 (d); 3,20 (m); 3,28 (m); 3,90 (m); 3,95 (s); 4,42 (m); 4,50 (m); 5,90 (m); 5,95 (s); 6,67 (ancho); 6,86 (m); 7,25 (m); 7,50 (s)
I-317	CH ₃	H	R3-179	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,83 (s); 1,93 (s); 2,18 (s); 2,42 (m); 2,70 (m); 2,88 (d); 3,83 (s); 3,95 (s); 4,35 (m); 5,90 (m); 6,65 (m); 6,93 (m)
I-318	CH ₃	H	R3-38	R4-1	O	Y-1	87 °C
I-319	CH ₃	H	R3-32	R4-1	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,27 (s); 3,80 (s); 4,05 (s); 4,62 (m); 5,95 (m); 7,30 (m); 7,93 (s)
I-320	CH ₃	H	R3-34	R4-1	NH	Y-1	120 °C
I-321	CH ₃	H	R3-38	R4-1	NH	Y-1	143 °C
I-322	CH ₃	H	R3-37	R4-1	NH	Y-1	117 °C
I-323	CH ₃	H	R3-40	R4-1	O	Y-1	118 °C
I-324	CH ₃	H	R3-37	R4-1	O	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,23 (s); 2,35 (s); 3,80 (s); 4,05 (s); 4,62 (m); 5,95 (m); 7,15 (m); 7,91 (s)
I-325	CH ₃	H	R3-43	R4-1	NH	Y-1	136 °C

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-326	CH ₃	H	R3-34	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,83 (s); 4,05 (s); 4,63 (m); 5,95 (m); 7,67 (m); 7,82 (m); 8,42 (s)
I-327	CH ₃	H	R3-32	R4-1	NH	Y-1	δ = 2,07 (s); 2,42 (s); 2,92 (d); 4,08 (s); 4,78 (m); 6,08 (m); 6,93 (ancho); 7,45 (m); 8,08 (s)
I-328	CH ₃	H	R3-41	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,65 (m); 5,93 (m); 6,73 (ancho); 7,30 (m); 7,55 (m); 8,23 (s)
I-329	CH ₃	H	R3-28	R4-1	NH	Y-1	94 °C
I-330	CH ₃	H	R3-50	R4-1	NH	Y-1	130 °C
I-331	CH ₃	H	R3-41	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,87 (s); 4,06 (s); 4,63 (m); 5,93 (m); 7,32 (m); 7,55 (m); 8,23 (s)
I-332	C ₂ H ₅	H	R3-2	R4-1	O	Y-1	δ = 1,05 (t); 2,30 (m); 3,82 (s); 4,05 (s); 4,62 (d); 5,90 (m); 6,93 (m); 7,73 (m); 7,80 (m)
I-333	CH ₃	H	R3-180	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 3,85 (s); 4,07 (s); 4,40 (m); 5,88 (m); 6,66 (d); 6,78 (m); 7,37 (m); 7,45 (m); 7,83 (d)
I-334	CH ₃	H	R3-77	R4-1	O	Y-1	123-124 °C
I-335	CH ₃	H	R3-119	R4-1	O	Y-4	δ = 1,90 (s); 2,12 (s); 3,83 (s); 3,92 (s); 4,03 (s); 4,33 (m); 5,74 (m); 7,18-7,45 (m)
I-336	CH ₃	H	R3-80	R4-1	O	Y-1	133-134 °C

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-337	CH ₃	H	R3-180	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,90 (d); 3,97 (s); 4,40 (m); 5,88 (m); 6,66 (ancho); 6,82 (m); 7,37 (m); 7,45 (m); 7,81 (d)
I-338	CH ₃	H	R3-79	R4-1	O	Y-1	94-97 °C
I-339	CH ₃	H	R3-119	R4-1	NH	Y-4	δ = 1,90 (s); 2,12 (s); 2,85 (d); 3,92 (s); 4,33 (m); 5,75 (m); 6,60 (ancho); 7,18-7,45 (m)
I-340	CH ₃	H	R3-130	R4-1	O	CH=N-O- CH2-	δ = 1,95 (s); 3,82 (s); 4,05 (s); 4,52 (m); 5,87 (m); 7,25-7,60 (m); 7,75 (m); 7,80 (s); 8,05 (s); 8,26 (s)
I-341	CH ₃	H	R3-130	R4-1	NH	Y-4	δ = 1,95 (s); 2,25 (s); 2,83 (d); 3,97 (s); 4,54 (m); 5,93 (m); 6,75 (ancho); 7,25-7,60 (m); 7,77 (m); 7,82 (s); 8,02 (s); 8,29 (s)
I-342	CH ₃	H	R3-181	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,88 (d); 3,97 (s); 4,39 (m); 5,93 (m); 6,67 (ancho); 6,80 (m); 7,08 (m); 7,27 (m); 7,45 (m)
I-343	CH ₃	H	R3-182	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,91 (d); 3,98 (s); 4,41 (m); 5,93 (m); 6,70 (ancho); 6,85 (m); 7,37 (m); 7,65 (m)
I-344	CH ₃	H	R3-183	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,25 (s); 2,91 (d); 3,98 (s); 4,40 (m); 5,93 (m); 6,66 (ancho); 6,83 (m); 7,25-7,46 (m)
I-345	CH ₃	H	R3-184	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,25 (s); 2,90 (d); 3,85 (s); 3,98 (s); 4,38 (m); 5,93 (m); 6,66 (ancho); 6,82 (m); 7,30 (m)

ES 2 590 466 T3

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-346	CH ₃	H	R3-185	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,20 (s); 2,88 (d); 3,95 (s); 4,30 (m); 4,98 (s); 5,92 (m); 6,65 (m); 6,80 (m); 7,40 (m)
I-347	CH ₃	H	R3-69	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,65 (m); 5,92 (m); 6,67 (ancho); 6,87 (m); 7,25 (m); 7,67 (m)
I-348	CH ₃	H	R3-186	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,42 (m); 1,95 (s); 2,27 (s); 2,91 (d); 2,96 (m); 3,98 (s); 4,42 (m); 5,93 (m); 6,70 (ancho); 6,83 (m); 7,87 (m)
I-349	C ₂ H ₅	H	R3-5	R4-1	NH	Y-1	98 °C
I-350	CH ₃	H	R3-88	R4-1	O	Y-1	δ = 1,95 (s); 3,53 (s); 3,85 (s); 4,05 (s); 4,50 (m); 5,65 (s); 5,90 (m); 7,28 (m); 7,50 (s)
I-351	CH ₃	H	R3-88	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,50 (s); 3,97 (s); 4,48 (m); 5,65 (m); 5,93 (m); 6,70 (ancho); 7,28 (m); 7,50 (s)
I-352	CH ₃	H	R3-76	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,27 (s); 2,87 (d); 3,95 (s); 4,63 (m); 5,93 (m); 6,66 (ancho); 7,35 (m); 7,77 (m)
I-353	CH ₃	H	R3-187	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,87 (d); 3,97 (s); 4,63 (m); 5,90 (d); 5,95 (m); 6,70 (ancho); 7,48 (m); 7,85 (m); 7,97 (d)
I-354	CH ₃	H	R3-188	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,93 (s); 2,77 (d); 3,93 (s); 4,54 (m); 5,92 (m); 6,80 (ancho); 7,33 (m); 7,45 (m)

N.º	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y	p.f.. [°C]; RMN H (δ); R _t [min]
I-355	CH ₃	H	R3-189	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,85 (d); 3,95 (s); 4,55 (m); 5,92 (m); 6,70 (ancho); 7,23 (m); 7,40 (m); 7,64 (s); 7,78 (d)
I-356	CH ₃	H	R3-193	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,94 (s); 2,87 (d); 3,94 (s); 4,44 (m); 5,17 (s); 5,67 (d); 5,88 (m); 6,70 (ancho); 6,86 (m); 7,20 (m); 7,37 (d)
I-357	CH ₃	H	R3-194	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,80 (d); 3,95 (s); 4,55 (m); 5,87 (d); 5,93 (m); 6,75 (ancho); 7,25 (m); 7,35 (m); 7,45 (m); 7,55 (m); 7,70 (d)
I-358	CH ₃	H	R3-83	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,90 (d); 3,95 (s); 4,57 (m); 5,92 (m); 6,13 (s); 6,83 (ancho); 7,45 (m); 7,35 (m); 7,70 (m)
I-359	CH ₃	H	R3-195	R4-1	NH	Y-1	δ = 1,95 (s); 2,50 (s); 2,88 (d); 3,95 (s); 4,57 (m); 5,85 (d); 5,95 (m); 6,70 (ancho); 6,90 (m); 7,60 (m); 8,33 (d)
<p>* "anillo de fenilo" indica que R¹ y R², junto con los dos átomos de carbono que los unen, forman un anillo de fenilo. Isobutilo = 2-metil-1-propilo. p.f. = punto de fusión; R_t = tiempo de retención de HPLC. Datos de HPLC: columna RP-18 (Chromolith Speed ROD 50x4,6 mm de Merck KgaA, Alemania), 1,8 ml/min, volumen de inyección 2 µl, temperatura de la columna 40 °C. Eluyente: Acetonitrilo + 0,1 % de ácido trifluoroacético (TFA) / agua + 0,1 % de TFA (% de gradiente: 95 a 95:5 en el plazo de 5 min), 40 °C. EM: Ionización por electropulverización de cuadrupolo, 80 V (modo pos.).</p>							

II. Ejemplos de la acción contra hongos dañinos

La acción fungicida de los compuestos de fórmula I se demostró por los siguientes experimentos:

II.1 Pruebas de microtítulo

- 5 Las sustancias activas se formularon por separado como una solución madre en sulfóxido de dimetilo (DMSO) a una concentración de 10.000 ppm.

Ejemplo de uso 1: Actividad contra el patógeno de las manchas por *Septoria* producidas por *Septoria tritici* en la prueba de microtítulo

Cepas fúngicas usadas:

a) *Septoria tritici* (sensible al inhibidor de Qo, no mutante)

5 b) *Septoria tritici* (resistente al inhibidor de Qo, mutante G143A)

Se inocularon 100 ml de 2 % de extracto de malta en agua a pH 6,8 con microesporas de cultivos de 2 semanas de edad cultivados en 2 % de extracto de malta + 2 % de agar en placas de Petri y se incubaron durante 3 días en un agitador rotatorio a 24 °C y 150 rpm. El cultivo se recogió, se añadió glicerol (15 % (v/v)) y se mantuvo congelado a -20 °C en alícuotas de 1 ml.

10 Se descongeló una suspensión madre de 1 ml y se suspendió en 800 ml de 2 % de extracto de malta en agua a pH 6,8. Los compuestos se diluyeron a partir de la solución madre en DMSO (sulfóxido de dimetilo) en 10 etapas. Las soluciones de compuesto se diluyeron 1/5 con agua desionizada estéril antes de uso. Se transfirieron 5 µl de las soluciones de compuesto a microplacas vacías. Entonces, las placas se llenaron con 195 µl de la suspensión de microesporas de cada cepa.

15 Se determinó la actividad antifúngica midiendo la turbidez de un cultivo en microplacas de 96 pocillos en presencia de compuestos de prueba. El crecimiento fúngico se midió registrando la densidad óptica a 620 nm cada 15 h durante 150 h. La actividad antifúngica relativa se calculó por comparación del efecto de los compuestos de prueba con el efecto de un control de DMSO y un fungicida estándar.

20 Se calcularon los valores de CI_{50} (concentración del compuesto de prueba que produce el 50 % de inhibición del crecimiento fúngico) a partir de la dosis-respuesta resultante para cada compuesto y cepa. La concentración inicial de los compuestos de prueba y las 10 etapas de dilución (1:4 cada una) permitió evaluar valores de CI_{50} de 0,001 a 100 µmol/l (µM).

Tabla II

Compuesto	Cepa aislada de <i>Septoria tritici</i> resistente (mutación G143A) (R- CI_{50}) [µM]	Cepa aislada de <i>Septoria tritici</i> sensible (no mutante) (S- CI_{50}) [µM]	Factor de Resistencia RF = R- CI_{50} /S- CI_{50}
Azoxistrobina	> 100	3,5	n.d.
Dimoxistrobina	> 100	7,1	n.d.
Enestroburina	> 100	4,5	n.d.
Kresoxim-metilo	> 100	0,76	n.d.
Metominostrobin	> 100	> 100	n.d.
Orisastrobina	> 100	27	n.d.
Picoxistrobina	> 100	2,3	n.d.
Piracetostrobin	> 100	> 100	n.d.
Piraxistrobina	> 100	1,6	n.d.
Piraclostrobin	3,4	0,0012	2882
Trifloxistrobina	> 100	0,52	n.d.

ES 2 590 466 T3

Compuesto	Cepa aislada de <i>Septoria tritici</i> resistente (mutación G143A) (R-Cl ₅₀) [μM]	Cepa aislada de <i>Septoria tritici</i> sensible (no mutante) (S-Cl ₅₀) [μM]	Factor de Resistencia RF = R-Cl ₅₀ /S-Cl ₅₀
I-5	2,2	0,083	26
I-6	8,3	0,34	24
I-82	6,8	1,1	6
I-83	7,6	1,6	4,6
I-84	16,1	0,5	33
I-85	22	0,8	29
I-90	26	1,0	26
I-91	27	1,6	17
I-94	12	0,6	22
I-95	29	2,2	14
I-97	49	1,7	29
I-191	37	1,3	29
I-211	1,1	0,44	2,6
I-212	8,3	1,4	6
I-213	0,057	0,076	0,7
I-215	48	1,7	28
I-216	12,0	6,3	2,0
I-217	63	6,3	10
I-218	79	5,6	14
I-221	10	3,4	3
I-223	19	2,7	7
I-224	5,4	1,7	3,2
I-225	72	3,4	21
I-228	10	3,4	3,0
I-230	25	3,2	8
I-233	2,7	0,24	12
I-234	4	2,4	1,7
I-235	51	13	4

ES 2 590 466 T3

Compuesto	Cepa aislada de <i>Septoria tritici</i> resistente (mutación G143A) (R-Cl ₅₀) [μM]	Cepa aislada de <i>Septoria tritici</i> sensible (no mutante) (S-Cl ₅₀) [μM]	Factor de Resistencia RF = R-Cl ₅₀ /S-Cl ₅₀
I-236	24	6	4
I-238	12	6	1,9
I-243	15	4,1	3,6
I-244	1,3	0,6	2,0
I-247	9	5	1,9
I-249	11	2,4	5
I-250	97	19	5
I-255	42	19	2,2
I-256	24	21	1,1
I-257	67	15	4,5
I-260	3,3	2,3	1,4
I-261	5	2,9	1,6
I-262	1,6	1	1,6
I-265	4	3,8	1,1
I-267	5	2,9	1,7
I-269	74	8	10
I-270	57	6	10
I-271	7	1,9	3,9
I-273	22	5	4
I-274	19	9	2,0
I-287	18	1,5	12
I-288	28	3,5	8,0
I-291	18	1,0	18,0
I-292	33	7,9	4,2
I-298	31	3,6	8,6
I-303	4,6	0,27	17,0
I-304	9,1	0,53	17,2
I-305	32	9,3	3,4

Compuesto	Cepa aislada de <i>Septoria tritici</i> resistente (mutación G143A) (R-Cl ₅₀) [μM]	Cepa aislada de <i>Septoria tritici</i> sensible (no mutante) (S-Cl ₅₀) [μM]	Factor de Resistencia RF = R-Cl ₅₀ /S-Cl ₅₀
I-307	67	19,0	3,5
I-310	11	0,39	28,2
I-319	102	17,0	6,0
I-324	38	1,9	20,0
I-326	18	1,2	15,0
I-331	25	1,8	13,9
I-339	21	1,0	21,0

Aunque los fungicidas de tipo estrobilurina comerciales no muestran ninguna actividad contra la cepa *Septoria* resistente que contiene una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo (G143A), aunque es activo contra las cepas no mutantes sensibles, los compuestos I han sido activos contra ambas, las cepas resistentes y las no mutantes. En general, la relación del factor de resistencia (RF) calculada a partir de los valores de Cl₅₀ determinados para ambas cepas de *Septoria* fue inferior a 30 para los compuestos I según la invención. Sin embargo, las relaciones del factor de resistencia para los compuestos de tipo estrobilurina comerciales son en la mayoría de los casos superiores a 100 y normalmente superiores a varios cientos (para detalles véase, por ejemplo, FRAC, Mutations associated with QoI-resistance, Dec. 2006; <http://frac.info/frac/work/Mutations%20associated%20with%20QoI%20resistance.pdf> y citas citadas en su interior).

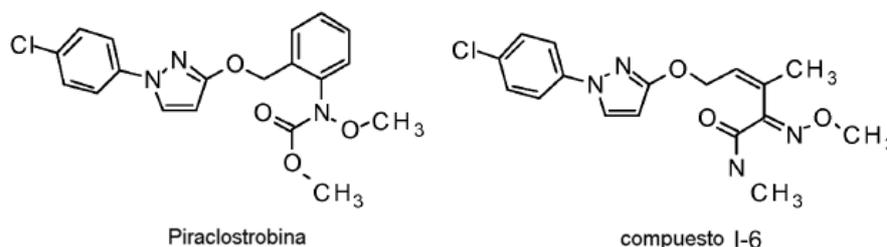
II.2 Ejemplos comparativos

A) Ensayos de campo

Compuestos usados:

El Compuesto I-6 se usó como 50 g/l de formulación EC. Se usó piraclostrobina como el producto comercial HEADLINE.

Compuestos usados:



Ensayo 1: Eficacia contra *Septoria tritici* en trigo de invierno

El ensayo se realizó bajo condiciones de campo en Böhl-Iggelheim, Renania-Palatinado, Alemania. Se sembraron semillas de trigo de invierno (cv. Riband) y se cultivaron bajo condiciones estándar con suministro adecuado de agua y nutrientes. En la etapa de crecimiento GS 32 (14 de abril de 2011), se hizo un primer tratamiento con compuesto (200 g de p.a. por ha) con un volumen de agua de 400 l/ha, que se repitió 21 días después en la etapa de crecimiento GS 39. No se aplicaron tratamientos fungicidas adicionales. La infección con patógenos fúngicos (por ejemplo, *Septoria tritici*) se produjo naturalmente. La evaluación de las incidencias de la enfermedad para *Septoria tritici* 20, 33 y 46 días después del último tratamiento (DAA) se muestran en la Tabla III. En la última fila se facilita la evaluación del porcentaje de cepas aisladas de *Septoria tritici* resistentes al inhibidor de Qo con la mutación G143A después de los tratamientos.

Tabla III

Tratamiento	Concentración (g de p.a./ha)	Enfermedad (%)			Porcentaje de mutación G143A (%) en cepas aisladas de <i>Septoria tritici</i>
		20 DAA	33 DAA	46 DAA	
Compuesto I-6	200	1	6	36	100
Piraclostrobina	200	8	32	93	100
Sin tratar	-	13	47	96	65

5 En esta prueba, el patógeno fúngico *Septoria tritici* se ha seleccionado completamente hacia cepas aisladas resistentes al inhibidor de Qo por cada uno de los tratamientos con los compuestos análogos a estrobilurina piraclostrobina y el compuesto I-6. Debido a este alto nivel de resistencia, la piraclostrobina mostró nivel de control insuficiente, aunque se ha usado a niveles de dosis comerciales, mientras que el compuesto I-6 fue capaz de controlar las cepas aisladas resistentes al inhibidor de Qo de *Septoria tritici* con la mutación G143.

Ensayo 2: Eficacia contra *Septoria tritici* en trigo de invierno

10 Este ensayo se realizó bajo condiciones de campo en Limburgerhof, Renania-Palatinado, Alemania. Se sembraron semillas de trigo de invierno (cv. Riband) y se cultivaron bajo condiciones estándar con suministro adecuado de agua y nutrientes. En la etapa de crecimiento GS 33 (8 de abril de 2011), se hizo un primer tratamiento con compuesto (200 g de p.a. por ha) con un volumen de agua de 400 l/ha, que se repitió 26 días después en la etapa de crecimiento GS 39. No se aplicaron tratamientos fungicidas adicionales. La infección con patógenos fúngicos (por ejemplo, *Septoria tritici*) se produjo naturalmente. La evaluación de las incidencias de la enfermedad para *Septoria tritici* 19 y 34 días después del último tratamiento (DAA) se muestran en la Tabla IV. En la última fila se facilita la evaluación del porcentaje de cepas aisladas de *Septoria tritici* resistentes al inhibidor de Qo con la mutación G143A después de los tratamientos.

Tabla IV

Tratamiento	Concentración (g de p.a./ha)	Enfermedad (%)		Porcentaje de mutación G143A (%) en cepas aisladas de <i>Septoria tritici</i>
		19 DAA	34 DAA	
Compuesto I-6	200	3	12	99
Piraclostrobina	200	5	28	100
Sin tratar	-	10	36	94

20 En esta prueba, aproximadamente la población entera del patógeno fúngico *Septoria tritici* ha sido resistente al inhibidor de Qo (como se evaluó al final del ensayo). Debido a este alto nivel de resistencia, la piraclostrobina ha mostrado actividad antifúngica solo ligeramente por encima del control no tratado, aunque se ha usado a niveles de dosis comerciales. Sin embargo, el compuesto I-6 fue capaz de reducir significativamente la infección por *Septoria tritici* resistente al inhibidor de Qo con la mutación G143.

B) Ensayos en invernadero

Las soluciones para pulverización se prepararon en varias etapas:

30 La solución madre se preparó del siguiente modo: se añadieron 1,26 ml de una mezcla 1:1 de ciclohexanona y sulfóxido de dimetilo a 8,4 mg de principio activo. A continuación, se añadieron 40,74 ml de una mezcla de agua, acetona (10 %), el emulsionante Wettol (0,1 %) y el agente humectante Silwet (0,05 %). Esta solución madre se diluyó entonces adicionalmente con la mezcla de disolvente-emulsionante-agua descrita a las concentraciones

deseadas.

Ensayo 3: Control de mancha foliar en trigo producida por dos cepas aisladas de *Septoria tritici* que contienen G143A en el gen citocromo b para su complejo de citocromo bc₁

- 5 Se cultivaron plantas de trigo en macetas. Estas plantas se pulverizaron hasta quedar empapadas con una suspensión acuosa que contenía la concentración deseada de principio activo. Al día siguiente, las plantas tratadas se inocularon con una suspensión acuosa de *Septoria tritici*. Después de la inoculación, las plantas de ensayo se cubrieron con una tapa y se transfirieron inmediatamente a una cámara con una humedad relativa de aproximadamente el 83 al 85 % y 19,5 a 20 °C. Después de 4 días se quitó la tapa. En conjunto, las plantas de ensayo se cultivaron durante aproximadamente 28 días en esa cámara de invernadero. Entonces, el grado de
- 10 ataque fúngico sobre las hojas se evaluó visualmente como el % de área de hoja enferma.

Tabla VII

Tratamiento	Conc. (ppm)	Cepa 1 de <i>Septoria tritici</i> resistente (mutación G143A) Nivel de enfermedad (%)	Cepa 2 de <i>Septoria tritici</i> resistente (mutación G143A) Nivel de enfermedad (%)
I-7	200	3	0
I-7	100	3	1
I-7	50	20	5
I-7	25	80	15
I-7	12,5	100	90
I-211	200	1	0
I-211	100	3	1
I-211	50	10	5
I-211	25	60	10
I-211	12,5	80	30
I-14	200	3	1
I-14	100	15	5
I-14	50	70	15
I-14	25	80	70
I-14	12,5	100	90
I-6	200	1	0
I-6	100	3	3
I-6	50	3	3
I-6	25	10	15
I-6	12,5	50	20
I-11	200	1	1

Tratamiento	Conc. (ppm)	Cepa 1 de <i>Septoria tritici</i> resistente (mutación G143A) Nivel de enfermedad (%)	Cepa 2 de <i>Septoria tritici</i> resistente (mutación G143A) Nivel de enfermedad (%)
I-11	100	3	5
I-11	50	30	30
I-11	25	90	50
I-11	12,5	100	70
Piraclostrobina	200	30	15
Piraclostrobina	100	90	25
Piraclostrobina	50	100	40
Piraclostrobina	25	100	60
Piraclostrobina	12,5	100	60
Trifloxistrobina	200	90	60
Trifloxistrobina	100	90	70
Trifloxistrobina	50	90	70
Trifloxistrobina	25	100	70
Trifloxistrobina	12,5	100	80

III. Modelado molecular

III.1 Modelos estructurales de sitio de unión no mutante y del mutante G143A

5 Se generaron modelos estructurales del sitio de unión del complejo de citocromo bc₁ no mutante y G143A basándose en la estructura cristalográfica del complejo de citocromo bc₁ bovino con azoxistrobina unida al sitio de Qo (PDB: 1SQB: Esser et al. J Mol Biol 341, 281-302 (2004)).

La estructura se importó en Schrödinger Maestro (versión 9.0, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009).

10 Se aisló citocromo b de la estructura del complejo y se trató con Schrödinger Protein Preparation Wizard (Schrödinger Suite 2009 Protein Preparation Wizard; Epik versión 2.0, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009; Impact versión 5.5, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009, versión óptima 2.1, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009). Esta estructura se usó como modelo para el sitio de unión no mutante sin cambios adicionales.

15 Se generó el modelo del mutante G143A cambiando un hidrógeno en la glicina 143 del modelo no mutante en un grupo metilo, generando así S-alanina, usando Schrödinger Maestro. Se minimizó la energía de los aminoácidos en una esfera de 5 Å alrededor de la molécula co-cristalizada de azoxistrobina usando Schrödinger MacroModel (versión 9.7, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009).

III.2 Acoplamiento molecular

Se prepararon estructuras de inhibidores para el acoplamiento con Schrödinger LigPrep (versión 2.3, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009) y se acoplaron en los modelos estructurales usando Schrödinger Glide (versión 5.5, Schrödinger, LLC, New York, NY, 2009).

III.3 Gráficas de inhibidores unidos al complejo de citocromo bc₁

Se generaron representaciones gráficas de las posiciones de las series de acoplamiento usando Molecular Operating Environment (MOE; 2010,10; Chemical Computing Group Inc., 1010 Sherbooke St. West, Suite #910, Montreal, QC, Canadá, H3A 2R7, 2010) y se refinaron usando el programa GNU Imagen Manipulation (GIMP, versión 2.6.8, 2008).

Como se ilustra en la Fig. 1, se ha llevado a cabo el modelado molecular de un complejo de citocromo bc₁ resistente al inhibidor de Qo artificial con la mutación G143A (véase más adelante para detalles). El acoplamiento del compuesto análogo a la estrobilurina comercial piraclostrobina muestra la interacción estérica que produce la unión alterada de este principio activo en el complejo de citocromo bc₁ del mutante G143A. Los compuestos de la presente invención evitan en gran medida esta interacción estérica sustituyendo, por tanto, el anillo de fenilo central de la piraclostrobina con una unidad de dos carbonos más pequeña y/o más flexible que puede ser adecuadamente sustituida o reemplazando los farmacóforos muy conocidos con el resto de tetrazolinona más pequeño R4-7.

III.4 Número de interacciones de van der Waals entre inhibidores y alanina G143A

Los ligandos acoplados se transfirieron al modelo de sitio de unión de G143A manteniendo las coordenadas del acoplamiento dentro del modelo no mutante. Así, se formaron complejos entre el sitio de unión de G143A y los ligandos. Aquellos se usaron como estructuras de partida para la siguiente minimización de energía usando Schrödinger MacroModel. Durante estas simulaciones, solo el ligando se dejó moverse libremente, la proteína se consideró "congelada". Las posiciones generadas por este procedimiento se consideraron el estado relajado de los inhibidores después de la introducción de la mutación G143A.

Se considera que dos átomos están interaccionando estéricamente si la distancia entre sus centros es más corta de 0,9 veces la suma de sus radios de van der Waals. Para los pares de átomos relevantes para la interacción de estrobilurina con alanina 143, las distancias respectivas se describen en la Tabla V.

Tabla V

Átomo 1	Radio 1 de vdW	Átomo 2	Radio 2 de vdW	Suma de vdW	Distancia de interacción
C	1,70	C	1,70	3,40	3,06
C	1,70	N	1,55	3,25	2,93
C	1,70	O	1,52	3,22	2,90
C	1,70	H	1,20	2,90	2,61
H	1,20	N	1,55	2,75	2,48
H	1,20	O	1,52	2,72	2,45

Después de la minimización en el sitio de unión de G143A como se ha descrito anteriormente, se contó el número de interacciones estéricas de van der Waals con la alanina 143 para cada inhibidor. Los resultados se dan en la Tabla VI.

Tabla VI

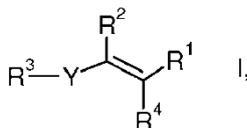
Compuesto	n.º de interacciones
I-5	3
I-6	3
Pirametostrobina	6
Metominostrobina	6

Compuesto	n.º de interacciones
Azoxistrobina	7
Enestroburina	7
Piraclostrobina	7
Dimoxistrobina	7
Orisastrobina	7
Piraoxistrobina	8
Picoxistrobina	8
Trifloxistrobina	8
Kresoxim-metilo	8

5 Se encontró que los compuestos I tienen un número pequeño de interacciones estéricas de van der Waals y también tienen inesperadamente alta actividad contra las cepas fúngicas resistentes al inhibidor de Qo que alojan dicha mutación G143A en pruebas de titulación de microtítulo, además de en ensayos de campo en sitios que tienen una alta porción de cepas fúngicas resistentes al inhibidor de Qo que alojan dicha mutación G143A (véase a continuación).

REIVINDICACIONES

1. Uso de compuestos de fórmula I



en la que:

- 5 R^1, R^2 independientemente entre sí, son hidrógeno, halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, alqueno $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ o cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, en los que los grupos R^1 y R^2 tienen orientación *cis*, o R^1 y R^2 , junto con los dos átomos de carbono que los unen, forman un anillo de fenilo a condición de que R^4 sea 4-metil-1,4-dihidro-tetrazol-5-on-1-ilo (fórmula R4-7), y en los que los restos alifáticos de R^1 y/o R^2 o el anillo de fenilo anteriormente mencionado pueden llevar 1, 2, 3 o hasta el máximo número de grupos R^a iguales o
10 diferentes que independientemente entre sí están seleccionados de:

R^a halógeno, CN, nitro, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ y haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$;

- Y es un enlace directo o un grupo divalente seleccionado de $-\text{OCH}_2-$, $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{O}-\text{N}=\text{C}(\text{Z})-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$ y $-\text{C}(=\text{N}-\text{O}-\text{Z})-\text{C}(\text{Z})=\text{N}-\text{O}-\text{CH}_2-$, en los que el enlace representado a la izquierda del grupo divalente Y está unido a R^3 y el enlace representado a la derecha está
15 unido al átomo de carbono que está sustituido con R^2 , y

Z, que puede ser igual o diferente a cualquier otro Z, es hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ o haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$;

- R^3 es fenilo o un heterociclilo mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, en el que los átomos del miembro de anillo del heterociclilo incluyen, además de los átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo de N, O y S;
20 en la que los grupos cíclicos R^3 pueden llevar 1, 2, 3, 4 o hasta el máximo número posible de grupos R^b iguales o diferentes que independientemente entre sí están seleccionados de:

- R^b , que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^b , es amino, halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, CN, carboxilo, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_4$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_4$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, cicloalquenoilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquenoilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ -imino-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_6$ -imino-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_6$ -imino-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$ -amino, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ -carbonilo, alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$ -carbonilo, fenilo, naftilo o un heterociclilo mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo que consiste en N, O y S como miembros de anillo; y en la que los grupos fenilo y heterociclilo R^b anteriormente mencionados están unidos mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre, y dos radicales R^b que están unidos a átomos del miembro de anillo adyacente del grupo cíclico R^3 pueden formar junto con dichos átomos del miembro de anillo un ciclo condensado de 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, que puede ser un carbociclo o heterociclo, en el que los átomos del miembro de anillo del heterociclo incluyen, además de los átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo de N, O y S,
30

y

- 35 en el que los grupos alifáticos o cíclicos R^b pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^c iguales o diferentes: R^c , que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^c , es halógeno, hidroxilo, nitro, CN, carboxilo, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_4$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_8$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ -imino-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_6$ -imino-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_6$ -imino-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ -imino-, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_6$ -imino-, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_6$ -imino-, haloalquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_6$ -imino-, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, cicloalquenoilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, fenilo o un heterociclilo de 5 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a tres heteroátomos del grupo que consiste en N, O y S como miembros de anillo; en el que los grupos cíclicos R^c anteriormente mencionados están unidos mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre, y en la que los grupos alifáticos o cíclicos R^c pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^d iguales o diferentes: R^d , que puede ser igual o diferente a
45 cualquier otro R^d , es halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ o haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$;

o

R^3 es $-\text{CR}^A=\text{N}-\text{O}-\text{R}^B$, en la que

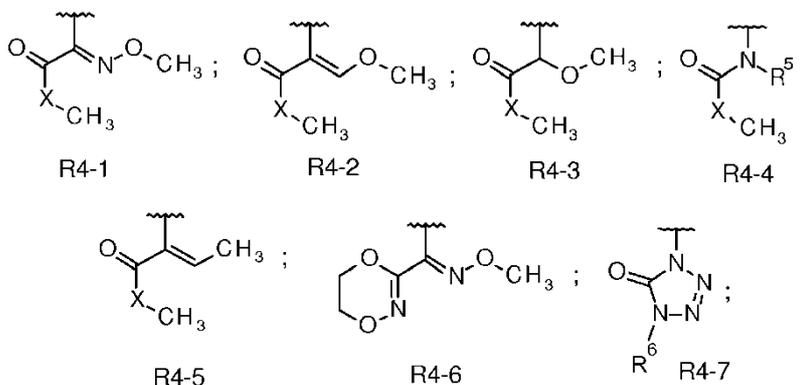
5 R^A es amino, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄-imino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-amino, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, alquil C₁-C₄-carbonilo, fenilo, fenil-alquilo C₁-C₄, naftilo o un heterocíclico mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo que consiste en O, N y S como miembros de anillo; y en el que el cíclico R^A anteriormente mencionado está unido mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre;

10 R^B es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄-imino-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, fenilo, fenil-alquilo C₁-C₄, naftilo o un heterocíclico mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo que consiste en O, N y S como miembros de anillo;

donde los grupos alifáticos o cíclicos R^A y/o R^B pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^e iguales o diferentes:

15 R^e , que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^e , es halógeno, hidroxilo, nitro, CN, carboxilo, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₈, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o

R^4 es un grupo monovalente seleccionado de las fórmulas R4-1 a R4-7



en las que la línea dentada define el punto de unión, y

X es un enlace directo o un grupo divalente CH₂, O o NH,

20 R^5 es alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆,

R^6 es alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

y los N-óxidos y las sales agrícolamente aceptables de los mismos, para combatir hongos fitopatógenos que contienen una mutación en el gen mitocondrial citocromo b que confiere resistencia a inhibidores de Qo, en el que la mutación es G143A.

25 2. El uso según la reivindicación 1, en el que los hongos fitopatógenos están seleccionados del grupo que consiste en *Alternaria alternata*, *Blumeria graminis*, *Pyricularia oryzae* (también conocido como *Magnaporthe grisea*), *Septoria tritici* (también conocido como *Mycosphaerella graminicola*), *Mycosphaerella fijiensis*, *Venturia inaequalis*, *Pyrenophora teres*, *Pyrenophora tritici-repentis* y *Plasmopara viticola*.

3. El uso según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, en el que el hongo fitopatógeno es *Septoria tritici*.

30 4. Un método para combatir hongos fitopatógenos como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, que comprende:

tratar los hongos fitopatógenos como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 o los materiales, plantas, la tierra o semillas que están en riesgo de enfermar por los hongos fitopatógenos como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 con una cantidad eficaz de al menos un compuesto de fórmula I como se define en la

35 reivindicación 1, o una composición que lo comprende del mismo.

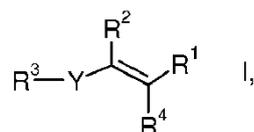
5. El método según la reivindicación 4, que comprende:

a) identificar los hongos fitopatógenos como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, o los materiales, plantas, la tierra o semillas que están en riesgo de enfermar por los hongos fitopatógenos como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3,

5 y

b) tratar dichos hongos o los materiales, plantas, la tierra o semillas con una cantidad eficaz de al menos un compuesto de fórmula I como se define en la reivindicación 1, o una composición que lo comprende del mismo.

6. Compuestos de fórmula I



10 en la que:

R^1, R^2 , independientemente entre sí, son hidrógeno, halógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquenoiloxi $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquinoilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ o cicloalquil $\text{C}_3\text{-C}_6$ -alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, en los que los grupos R^1 y R^2 tienen orientación cis, en los que los restos alifáticos de R^1 y/o R^2 pueden llevar 1, 2, 3 o hasta el máximo número de grupos R^a iguales o diferentes que independientemente entre sí están seleccionados de:

15 R^a halógeno, CN, nitro, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ y haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$;

Y es un enlace directo o un grupo divalente seleccionado de $-\text{OCH}_2-$, $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, $-\text{C}(\text{Z})=\text{N-O-CH}_2-$, $-\text{CHZ-C}(\text{Z})=\text{N-O-CH}_2-$, $-\text{O-N}=\text{C}(\text{Z})-\text{C}(\text{Z})=\text{N-O-CH}_2-$, $-\text{C}(=\text{O})-\text{C}(\text{Z})=\text{N-O-CH}_2-$ y $-\text{C}(=\text{N-O-Z})-\text{C}(\text{Z})=\text{N-O-CH}_2-$, en los que el enlace representado a la izquierda del grupo divalente Y está unido a R^3 y el enlace representado a la derecha está unido al átomo de carbono que está sustituido con R^2 , y

20 Z, que puede ser igual o diferente a cualquier otro Z, es alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ o haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$;

R^3 es fenilo o un heterociclilo mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, en el que los átomos del miembro de anillo del heterociclilo incluyen, además de los átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo de N, O y S;

25 en la que los grupos cíclicos R^3 pueden llevar 1, 2, 3, 4 o hasta el máximo número posible de grupos R^b iguales o diferentes que independientemente entre sí están seleccionados de:

30 R^b , que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^b , es amino, halógeno, hidroxilo, oxo, nitro, CN, carboxilo, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquenoilo $\text{C}_2\text{-C}_4$, alquinoilo $\text{C}_2\text{-C}_4$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, cicloalquenoilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, alquenoiloxi $\text{C}_2\text{-C}_6$, alquinoiloxi $\text{C}_3\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$ -imino-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquenoiloxi $\text{C}_2\text{-C}_6$ -imino-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquinoiloxi $\text{C}_2\text{-C}_6$ -imino-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$ -amino, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ -carbonilo, alquil $\text{C}_1\text{-C}_4$ -carboniloxi, fenilo, naftilo o un heterociclilo mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo que consiste en N, O y S como miembros de anillo; y en la que los grupos fenilo y heterociclilo R^b anteriormente mencionados están unidos mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre;

y

35 dos radicales R^b que están unidos a átomos del miembro de anillo adyacente del grupo cíclico R^3 pueden formar junto con dichos átomos del miembro de anillo un ciclo condensado de 5, 6 o 7 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático, que puede ser un carbociclo o heterociclo, en el que los átomos del miembro de anillo del heterociclo condensado incluyen, además de los átomos de carbono, 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados del grupo de N, O y S, y

40 en el que los grupos alifáticos o cíclicos R^b pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^c iguales o diferentes:

R^c , que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^c , es halógeno, hidroxilo, nitro, CN, carboxilo, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$,

alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₈, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alquino C₂-C₆-imino-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-imino-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆-imino-, alqueno C₂-C₆-imino-, alquino C₂-C₆-imino-, haloalqueno C₂-C₆-imino-, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, fenilo o un heterociclo de 5 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a tres heteroátomos del grupo que consiste en N, O y S como miembros de anillo; en el que los grupos cíclicos R^c anteriormente mencionados están unidos mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre y en el que los grupos alifáticos o cíclicos R^c pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^d iguales o diferentes:

R^d, que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^d, es halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

10 o

R³ es -CR^A=N-O-R^B, en la que

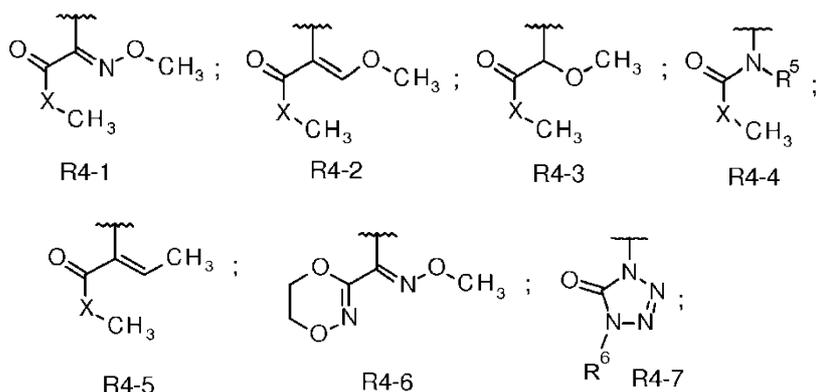
15 R^A es amino, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄-imino-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-amino, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, alquil C₁-C₄-carbonilo, fenilo, fenil-alquilo C₁-C₄, naftilo o un heterociclo mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo que consiste en O, N y S como miembros de anillo; y en el que el cíclico R^A anteriormente mencionado está unido mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre;

20 R^B es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalqueno C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄-imino-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, fenilo, fenil-alquilo C₁-C₄, naftilo o un heterociclo mono- o bicíclico de 3 a 10 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a cuatro heteroátomos del grupo que consiste en O, N y S como miembros de anillo;

en el que los grupos alifáticos o cíclicos R^A y/o R^B pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^e iguales o diferentes:

25 R^e, que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^e, es halógeno, hidroxilo, nitro, CN, carboxilo, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₈, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;

R⁴ es un grupo monovalente seleccionado de las fórmulas R4-1 a R4-7



30 en las que la línea dentada define el punto de unión, y en las que

X es un grupo divalente O o NH,

R⁵ es alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ o cicloalquilo C₃-C₆,

R⁶ es alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

35 y los N-óxidos y las sales agrícolamente aceptables de los mismos, excepto por el éster metílico del ácido (E)-2-[1-metoxi-met-(E)-iliden]-5-(4-fenoxi-fenoxi)-3-trifluorometil-pent-3-enoico (207852-99-1), éster metílico del ácido (E)-2-[1-metoxi-met-(E)-iliden]-5-(3-fenoxi-fenoxi)-3-trifluorometil-pent-3-enoico (207853-00-7); éster metílico del ácido (E)-2-[1-metoxi-met-(E)-iliden]-4-metil-5-(3-fenoxi-fenoxi)-3-trifluorometil-pent-3-enoico, éster metílico del ácido (E)-5,5,5-

trifluoro-2-[1-metoxi-met-(E)-iliden]-3-metil-4-(4-fenoxi-fenoximetil)-pent-3-enoico y éster metílico del ácido (2E,3Z)-2-(etiliden)-5-fenil-3-pentenoico (CAS n.º 681026-20-0).

7. Los compuestos según la reivindicación 6, con la condición de que R¹ no sea CF₃ si R⁴ es 1-metoxicarbonil-2-metoxi-eten-1-ilo (fórmula R4-2, en la que X es O).

5 8. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 6 a 7, en los que R¹ es hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, cloroalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄.

9. Los compuestos según la reivindicación 8, en los que R¹ es metilo o etilo.

10. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 6 a 9, en los que R² es hidrógeno.

10 11. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 6 a 10, en los que Y es -OCH₂-, -CH₂CH₂-, -C(CH₃)=N-O-CH₂-, -O-N=C(CH₃)-C(CH₃)=N-O-CH₂- o -C(=N-O-CH₃)-C(CH₃)=N-O-CH₂-.

12. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 6 a 11, en los que R³ es pirazolilo, imidazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo o 1,2,4-tiadiazolilo, que está sustituido con fenilo, en los que dicho fenilo puede llevar 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^c iguales o diferentes:

15 R^c, que puede ser igual o diferente a cualquier otro R^c, es halógeno, alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-imino-alquilo C₁-C₄, fenilo o un heterociclilo de 5 miembros saturado, parcialmente insaturado o aromático que, además de átomos de carbono, contiene uno a tres heteroátomos del grupo que consiste en N, O y S como miembros de anillo; y en los que los grupos heterociclilo R^c anteriormente mencionados están unidos mediante un enlace directo, un átomo de oxígeno o de azufre y pueden llevar por su parte 1, 2, 3 o hasta el máximo número posible de grupos R^d iguales o diferentes.

20

13. Los compuestos según cualquiera de las reivindicaciones 6 a 12, en los que R⁴ es -C(=NOCH₃)-CONHCH₃, -C(=NOCH₃)-COOCH₃, -C(=CHOCH₃)-COOCH₃, -C(=CHOCH₃)-CONHCH₃, -N(OCH₃)-COOCH₃, -N(CH₃)-COOCH₃ o -N(CH₂CH₃)-COOCH₃.

25 14. Composiciones agroquímicas en las que dichas composiciones comprenden un compuesto auxiliar y al menos un compuesto de fórmula I, como se define en cualquiera de las reivindicaciones 6 a 13, un N-óxido o una sal agrícolamente aceptable de las mismas.

15. Las composiciones según la reivindicación 14 que comprenden al menos una sustancia activa adicional.

16. Las composiciones según la reivindicación 15, en las que la sustancia activa adicional está seleccionada de las clases A) a O):

30 A) Inhibidores de la respiración

- Inhibidores del complejo III en el sitio Q_o (por ejemplo, estrobilurinas): azoxistrobina, coumetoxistrobina, coumoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina, fenaministrobina, fenoxistrobina/flufoxistrobina, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metoministrobina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclastrobina, pirametrobina, piraoxistrobina, trifloxistrobina, éster metílico del ácido 2-[2-(2,5-dimetil-fenoximetil)-fenil]-3-metoxi-acrílico y 2-(2-(3-(2,6-diclorofenil)-1-metil-alilidenaminooximetil)-fenil)-2-metoxiimino-N-metil-acetamida, pibibencarb, triclopiricarb/clorodincarb, famoxadona, fenamidona;

35

- inhibidores del complejo III en el sitio Q_i: ciazofamid, amisulbrom, 2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-acetoxi-4-metoxi-piridin-2-carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo], 2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-(acetoximetoxi)-4-metoxi-piridin-2-carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo], 2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[(3-isobutoxicarbonilo)-4-metoxi-piridin-2-carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo], 2-metilpropanoato de [(3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[3-(1,3-benzodioxol-5-ilmetoxi)-4-metoxipiridin-2-carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilo]; 2-metilpropanoato de (3S,6S,7R,8R)-3-[[3-(3-hidroxi-4-metoxi-2-piridinil)carbonil]amino]-6-metil-4,9-dioxo-8-(fenilmetil)-1,5-dioxonan-7-ilo

40

- inhibidores de complejo II (por ejemplo, carboxamidas): benodanil, benzovindiflupir, bixafen, boscalid, carboxin, fenfuram, fluopiram, flutolanil, fluxapiraxad, furametpir, isopirazam, mepronil, oxicarboxin, penflufen, pentiopirad, sedaxano, tecloftalam, tifulzamida, N-(4'-trifluorometiltiobifenil-2-il)-3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(2-(1,3,3-trimetil-butyl)-fenil)-1,3-dimetil-5-fluoro-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida,

45

1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(trifluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1,5-dimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida, 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetilindan-4-il)pirazol-4-carboxamida;

- 5 - otros inhibidores de la respiración (por ejemplo, complejo I, desacopladores): diflumetorim, (5,8-difluoroquinazolin-4-il)-{2-[2-fluoro-4-(4-trifluorometilpiridin-2-iloxi)-fenil]-etil}-amina; derivados de nitrofenilo: binapacril, dinobuton, dinocap, fluazinam; ferimzona; compuestos organometálicos: sales de fentina, tales como acetato de fentina, cloruro de fentina o hidróxido de fentina; ametoctradin; y siltiofam;

B) Inhibidores de la biosíntesis de esteroides (fungicidas de SBI)

- 10 - Inhibidores de la C14 desmetilasa (fungicidas DMI): triazoles: azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, oxpoconazol, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, triticonazol, uniconazol, 1-[*rel*-(2*S*;3*R*)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-5-tiocianato-1H-[1,2,4]triazol, 2-[*rel*-(2*S*;3*R*)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)-oxiranilmetil]-2H-[1,2,4]triazol-3-tiol; imidazoles: imazalil, pefurazoato, procloraz, triflumizol; pirimidinas, piridinas y piperazinas: fenarimol, nuarimol, pirifenox, triforina;

- inhibidores de la delta 14-reductasa: aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin, piperalin, espiroxamina;

- inhibidores de la 3-cetoreductasa: fenhexamid;

C) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos

- 20 - fungicidas de fenilamidas o acilaminoácido: benalaxil, benalaxil-M, kiralaxil, metalaxil, metalaxil-M (mefenoxam), ofurace, oxadixil;

- otros: himexazol, octilina, ácido oxolínico, bupirimato, 5-fluorocitosina, 5-fluoro-2-(p-tolilmetoxi)pirimidin-4-amina, 5-fluoro-2-(4-fluorofenilmetoxi)pirimidin-4-amina;

D) Inhibidores de la división celular y citoesqueleto

- 25 - inhibidores de tubulina, tales como bencimidazoles, tiofanatos: benomilo, carbendazim, fuberidazol, tiabendazol, tiofanato-metilo; triazolopirimidinas: 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina

- otros inhibidores de la división celular: dietofencarb, etaboxam, pencicuron, fluopicolida, zoxamida, metrafenona, piriofenona;

- 30 E) Inhibidores de la síntesis de aminoácidos y proteínas

- inhibidores de la síntesis de metionina (anilino-pirimidinas): ciprodinil, mepanipirim, pirimetanil;

- inhibidores de la síntesis de proteínas: blasticidin-S, kasugamicina, clorhidrato de kasugamicina hidratada, mildiomicina, estreptomycin, oxitetraciclina, polioxina, validamicina A;

F) Inhibidores de la transducción de señales

- 35 - inhibidores de MAP / histidina cinasas: fluoroimid, iprodiona, procimidona, vinclozolin, fenciclonil, fludioxonil;

- inhibidores de la proteína G: quinoxifen;

G) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membrana

- Inhibidores de la biosíntesis de fosfolípidos: edifenfos, iprobenfos, pirazofos, isoprotilano;

- peroxidación de lípidos: dicloran, quintozeno, tecnazeno, tolclofos-metilo, bifenilo, cloroneb, etridiazol;

- 40 - biosíntesis de los fosfolípidos y depósito de la pared celular: dimetomorf, flumorf, mandipropamid, pirimorf, bentiavalicarb, iprovalicarb, valifenalato y éster (4-fluorofenílico) del ácido N-(1-(1-(4-ciano-fenil)etanosulfonil)-but-2-

il) carbámico;

- compuestos que afectan la permeabilidad de la membrana celular y ácidos grasos: propamocarb, propamocarb-clorhidrato

5 - inhibidores de amida hidrolasa del ácido graso: 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona;

H) Inhibidores con acción en múltiples sitios

- sustancias activas inorgánicas: mezcla de Burdeos, acetato de cobre, hidróxido de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre básico, azufre;

- tio- y ditiocarbamatos: ferbam, mancozeb, maneb, metam, metiram, propineb, tiram, zineb, ziram;

10 - compuestos de organocloro (por ejemplo, ftalimidas, sulfamidas, cloronitrilos): anilazina, clorotalonil, captafol, captan, folpet, diclofluanid, diclorofen, flusulfamida, hexaclorobenceno, pentaclorfenol y sus sales, ftalida, tolilfluanid, N-(4-cloro-2-nitro-fenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida;

15 - guanidinas y otros: guanidina, dodina, base libre de dodina, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, tris(albesilato) de iminoctadina, ditianon, 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-c']dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetraona;

I) Inhibidores de la síntesis de la pared celular

- inhibidores de la síntesis de glucano: validamicina, polioxina B; inhibidores de la síntesis de melanina: piroquilon, triciclazol, carpropamid, diciclotmet, fenoxanil;

J) Inductores de la defensa de la planta

20 - acibenzolar-S-metilo, probenazol, isotianil, tiadinil, prohexadiona-calcio; fosfonatos: fosetil, fosetil-aluminio, ácido fosforoso y sus sales;

K) Modo de acción desconocido

25 - bronopol, quinometionato, ciflufenamida, cimoxanil, dazomet, debacarb, diclomezina, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamin, fempirazamina, flumetover, flusulfamida, flutianil, metasulfocarb, nitrapirin, nitrotal-isopropilo, oxatiapiprolin, oxina-cobre, proquinazid, tebufloquin, tecloftalam, triazóxido, 2-butoxi-6-yodo-3-propilcromon-4-ona, N-(ciclopropilmetoxiimino-(6-difluoro-metoxi-2,3-difluoro-fenil)-metil)-2-fenilacetamida, N'-(4-(4-cloro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metilformamidina, N'-(4-(4-fluoro-3-trifluorometil-fenoxi)-2,5-dimetil-fenil)-N-etil-N-metilformamidina, N'-(2-metil-5-trifluorometil-4-(3-trimetilsilanil-propoxi)-fenil)-N-etil-N-metilformamidina, N'-(5-difluorometil-2-metil-4-(3-trimetilsilanilpropoxi)-fenil)-N-etil-N-metilformamidina, éster 6-terc-butyl-8-fluoro-2,3-dimetil-quinolin-4-ílico del ácido metoxi-acético, 3-[5-(4-metilfenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina, 3-[5-(4-cloro-fenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina (pirisoxazol), amida del ácido N-(6-metoxi-piridin-3-il)ciclopropanocarboxílico, 5-cloro-1-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-2-metil-1H-benzoimidazol, 2-(4-cloro-fenil)-N-[4-(3,4-dimetoxi-fenil)-isoxazol-5-il]-2-prop-2-iniloxi-acetamida;

35 L) Agentes de biocontrol antifúngico, bioactivadores de plantas: *Ampelomyces quisqualis*, *Aspergillus flavus*, *Aureobasidium pullulans*, *Bacillus pumilus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus subtilis* var. *amyloliquefaciens* FZB24, *Candida oleophila* I-82, *Candida saitoana*, *Chitosan*, *Clonostachys rosea* f. *catenulata* también llamado *Gliocladium catenulatum*, *Coniothyrium minitans*, *Cryphonectria parasitica*, *Cryptococcus albidus*, *Fusarium oxysporum*, *Metschnikowia fructicola*, *Microdochium dimerum*, *Phlebiopsis gigantea*, *Pseudozyma flocculosa*, *Pythium oligandrum* DV74, *Reynoutria sachlinensis*, *Talaromyces flavus* V117b, *Trichoderma asperellum* SKT-1, *T. atroviride* LC52, *T. harzianum* T-22, *T. harzianum* TH 35, *T. harzianum* T-39, *T. harzianum* y *T. viride*, *T. harzianum* ICC012 y *T. viride* ICC080, *T. polysporum* y *T. harzianum*, *T. stromaticum*, *T. virens* GL-21, *T. viride*, *T. viride* TV1, *Ulocladium oudemansii* HRU3;

M) Reguladores del crecimiento

45 ácido abscísico, amidoclor, ancimidol, 6-bencilaminopurina, brasinólida, butralin, clormequat (cloruro de clormequat), cloruro de colina, ciclanilida, daminozida, dikegulac, dimetipin, 2,6-dimetilpuridina, etefon, flumetralin, flurprimidol, flutiacet, forclorfenuron, ácido giberélico, inabenfide, ácido indol-3-acético, hidrazida maleica, mefluidida, mepiquat (cloruro de mepiquat), ácido naftalenoacético, N-6-benciladenina, paclobutrazol, prohexadiona (prohexadiona-

calcio), prohidrojasmona, tidiazuron, triapentenol, fosforotriato de tributilo, ácido 2,3,5-tri-yodobenzoico, trinexapac-etilo y uniconazol;

N) Herbicidas

- 5 - acetamidas: acetoclor, alaclor, butaclor, dimetaclor, dimetenamid, flufenacet, mefenacet, metolaclor, metazaclor, napropamida, naproanilida, petoxamid, pretilaclor, propaclor, tenilclor;
- derivados de aminoácido: bilanafos, glifosato, glufosinato, sulfosato;
- ariloxifenoxipropionatos: clodinafop, cihalofop-butilo, fenoxaprop, fluazifop, haloxifop, metamifop, propaquizafof, quizalofop, quizalofop-P-tefurilo;
- Bipiridilos: diquat, paraquat;
- 10 - (tio)carbamatos: asulam, butilato, carbetamida, desmedifam, dimepiperato, eptam (EPTC), esprocarb, molinato, orbencarb, fenmedifam, prosulfocarb, piributicarb, tiobencarb, trialato;
- ciclohexanodionas: butroxidim, cletodim, cicloxidim, profoxidim, setoxidim, tepraloxidim, tralcoxidim;
- dinitroanilinas: benfluralin, etalfuralin, orizalin, pendimetalin, prodiamina, trifluralin;
- éteres de difenilo: acifluorfen, aclonifen, bifenox, diclofop, etoxifen, fomesafen, lactofen, oxifluorfen;
- 15 - hidroxibenzonitrilos: bomoxinil, diclobenil, ioxinil;
- imidazolinonas: imazametabenz, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquin, imazetapir;
- ácidos fenoxiacéticos: clomeprop, ácido 2,4-diclorofenoxiacético (2,4-D), 2,4-DB, diclorprop, MCPA, MCPA-tioetilo, MCPB, Mecoprop;
- pirazinas: cloridazon, flufenpir-etilo, flutiacet, norflurazon, piridato;
- 20 - piridinas: aminopiridid, clopiridid, diflufenican, ditiopir, fluridona, fluoxipir, picloram, picolinafen, tiazopir;
- sulfonilureas: amidosulfuron, azimsulfuron, bensulfuron, clorimuron-etilo, clorsulfuron, cinosulfuron, ciclosulfamuron, etoxisulfuron, flazasulfuron, flucetosulfuron, flupirsulfuron, foramsulfuron, halosulfuron, imazosulfuron, yodosulfuron, mesosulfuron, metazosulfuron, metsulfuron-metilo, nicosulfuron, oxasulfuron, primisulfuron, prosulfuron, pirazosulfuron, rimsulfuron, sulfometuron, sulfosulfuron, tifensulfuron, triasulfuron, tribenuron, trifloxisulfuron, triflusulfuron, tritosulfuron, 1-((2-cloro-6-propil-imidazo[1,2-b]piridazin-3-il)sulfonil)-3-(4,6-dimetoxipirimidin-2-il)urea;
- 25 - triazinas: ametrina, atrazina, cianazina, dimetametrina, etiozin, hexazinona, metamitron, metribuzin, prometrina, simazina, terbutilazina, terbutrina, triaziflam;
- ureas: clorotoluron, daimuron, diuron, fluometuron, isoproturon, linuron, metabenzthiazuron, tebutiuron;
- otros inhibidores de la acetolactato sintasa: bispiribac-sodio, cloransulam-metilo, diclosulam, florasulam, flucarbazona, flumetsulam, metosulam, orto-sulfamuron, penoxsulam, propoxicarbazona, piribambenz-propilo, piribenzoxim, pirifalid, piriminobac-metilo, pirimisulfan, piritiobac, piroxasulfona, piroxsulam;
- 30 - otros: amicarbazona, aminotriazol, anilofos, beflubutamid, benazolin, bencarbazona, benfluresato, benzofenap, bentazona, benzobicclon, biciclopirona, bromacil, bromobutida, butafenacil, butamifos, cafenstrol, carfentrazona, cinidon-etilo, clortal, cinmetilin, clomazona, cumiluron, ciprosulfamida, dicamba, difenzoquat, diflufenzopir, *Drechslera monoceras*, endotal, etofumesato, etobenzanid, fenoxasulfona, fentrazamida, flumiclorac-pentilo, flumioxazin, flupoxam, flurocloridona, flurtamona, indanofan, isoxaben, isoxaflutol, lenacil, propanil, propizamida, quinclozac, quinmerac, mesotriona, ácido metilarsónico, naptalam, oxadiargilo, oxadiazon, oxaziclomefona, pentoxazona, pinoxaden, piraclonil, piraflufen-etilo, pirasulfotol, pirazoxifen, pirazolinato, quinoclamina, saflufenacil, sulcotriona, sulfentrazona, terbacil, tefuriltriona, tembotriona, tiencarbazona, topramezona, éster etílico del ácido (3-
- 35 [2-cloro-4-fluoro-5-(3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-3,6-dihidro-2H-pirimidin-1-il)-fenoxi]-piridin-2-iloxi)-acético, éster metílico del ácido 6-amino-5-cloro-2-ciclopropil-pirimidina-4-carboxílico, 6-cloro-3-(2-ciclopropil-6-metil-fenoxi)-piridazin-4-ol, ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-clorofenil)-5-fluoro-piridin-2-carboxílico, éster metílico del ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-2-fluoro-3-metoxi-fenil)-piridin-2-carboxílico y éster metílico del ácido 4-amino-3-cloro-6-(4-cloro-3-dimetilamino-2-fluoro-fenil)-piridin-2-carboxílico.
- 40

O) Insecticidas

- organo(tio)fosfatos: acefato, azametifos, azinfos-metilo, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorfenvinfos, diazinon, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, disulfoton, etion, fenitroton, fention, isoxation, malation, metamidofos, metidation, metil-paration, mevinfos, monocrotofos, oxidometon-metilo, paraoxon, paration, fentoato, fosalona, fosmet, fosfamidon, forato, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, protiofos, sulprofos, tetraclorvinfos, terbufos, triazofos, tricloflon;
- 5 - carbamatos: alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, carbaril, carbofurano, carbosulfan, fenoxicarb, furatiocarb, metiocarb, metomilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, triazamato;
- piretroides: aletrina, bifentrina, ciflutrina, cihalotrina, cifenotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, deltametrina, esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, imiprotrina, lambda-cihalotrina, permetrina, praletrina, piretrina I y II, resmetrina, silafluofen, tau-fluvalinato, teflutrina, tetrametrina, tralometrina, transflutrina, proflutrina, dimeflutrina;
- 10 - reguladores del crecimiento de los insectos: a) inhibidores de la síntesis de quitina: benzoilureas: clorfluazuron, ciramazin, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, teflubenzuron, triflumuron; buprofezin, diofenolan, hexitiazox, etoxazol, clofentazina; b) antagonistas de ecdisona: halofenozida, metoxifenoazida, tebufenozida, azadiractina; c) juvenoides: piriproxifen, metopreno, fenoxicarb; d) inhibidores de la biosíntesis de los lípidos: espiroclorfen, espiromesifeno, espirotetramato;
- compuestos agonistas/antagonistas de los receptores nicotínicos: clotianidin, dinotefurano, imidacloprid, tiametoxam, nitenpiram, acetamiprid, tiacloprid, 1-(2-cloro-tiazol-5-ilmetil)-2-nitrimino-3,5-dimetil-[1,3,5]triazinano;
- 20 - compuestos antagonistas de GABA: endosulfan, etiprol, fipronil, vaniliprol, pirafluprol, piriprol, amida del ácido 5-amino-1-(2,6-dicloro-4-metil-fenil)-4-sulfinaoil-1H-pirazol-3-carbotioico;
- insecticidas de lactona macrocíclica: abamectina, emamectina, milbemectina, lepimectina, espinosad, espinetoram;
- acaricidas del inhibidor del transporte de electrones en mitocondrias I (METI): fenazaquin, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad, flufenerim;
- 25 - compuestos de METI II y III: acequinocilo, fluaciprim, hidrametilnon;
- desacopladores: clorfenapir;
- inhibidores de la fosforilación oxidativa: cihexatin, diafentiuron, óxido de fenbutatina, propargita;
- compuestos disruptores de la muda: criomazina;
- inhibidores de la oxidasa de función mixta: butóxido de piperonilo;
- 30 - bloqueantes de los canales de sodio: indoxacarb, metaflumizona;
- otros: benclotiaz, bifenazato, cartap, flonicamid, piridalilo, pimetrozina, azufre, tiociclám, flubendiamida, clorantraniliprol, ciazipir (HGW86), cienopirafen, flupirazofos, ciflumetofen, amidoflumet, imiciafos, bistrifluron y pirifluquinazon.

Modelos estructurales del sitio de unión mutante de G143A

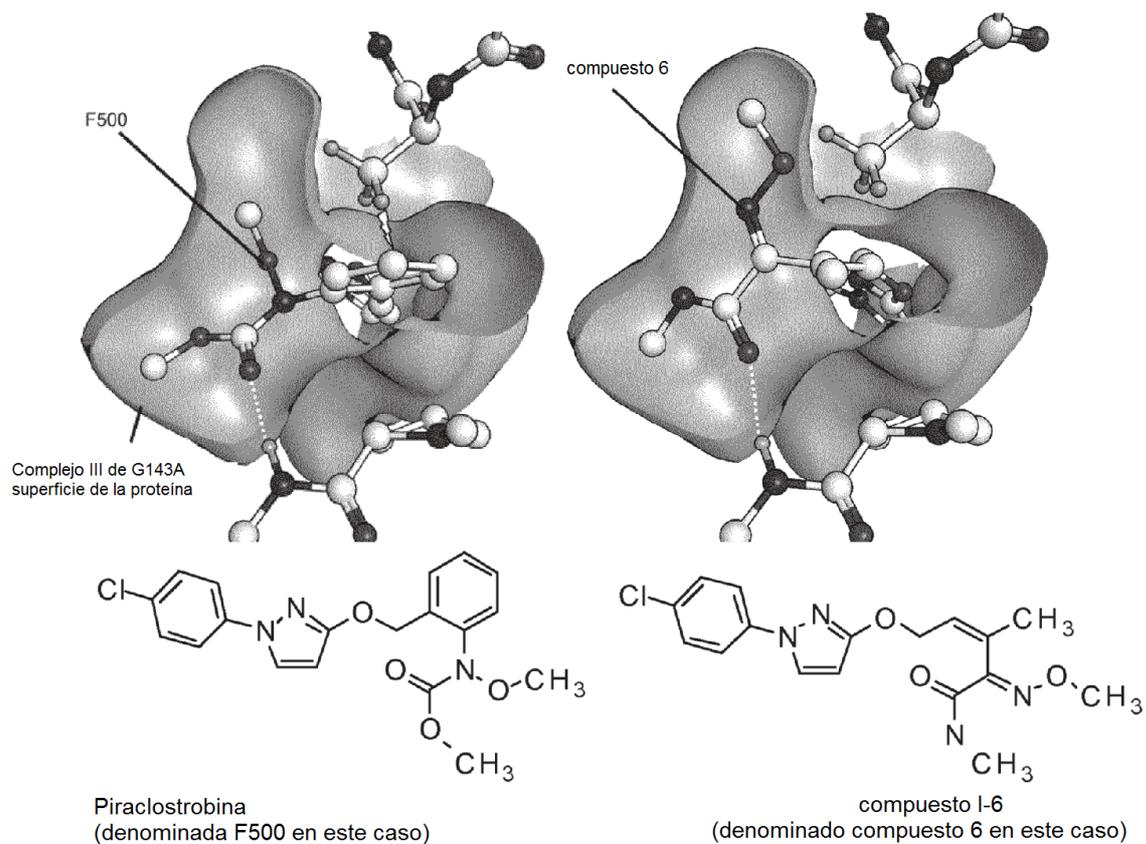


Fig. 1: El compuesto análogo de estrobilurina disponible en el comercio, Piraclostrobina, modelado en un sitio de unión Qo de complejo de citocromo bc₁ artificial muestra un choque estérico del anillo de fenilo con el grupo metilo 143A indicado mediante una flecha en la parte superior derecha de la imagen (a la izquierda). El compuesto I-6 de acuerdo con la presente invención no muestra un choque estérico (a la derecha)