

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 613 066**

51 Int. Cl.:

C07D 417/12 (2006.01)

A01N 43/78 (2006.01)

C07D 417/14 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **26.04.2011 PCT/EP2011/056594**

87 Fecha y número de publicación internacional: **03.11.2011 WO11134969**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **26.04.2011 E 11716265 (1)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **02.11.2016 EP 2563786**

54 Título: **Derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina como fungicidas**

30 Prioridad:

28.04.2010 US 328806 P
28.04.2010 EP 10161264

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
22.05.2017

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

CRISTAU, PIERRE;
HOFFMANN, SEBASTIAN;
KLUTH, JOACHIM;
SEITZ, THOMAS;
TSUCHIYA, TOMOKI;
WASNAIRE, PIERRE;
BENTING, JÜRGEN y
WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

Observaciones:

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

ES 2 613 066 T3

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

DESCRIPCIÓN

Derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina como fungicidas

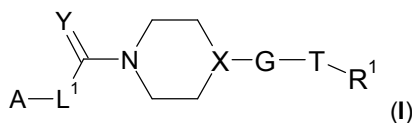
La presente invención se refiere a nuevos derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina, a los procedimientos para su preparación, a su uso para el control de microorganismos no deseados, en particular hongos fitopatógenos, en la protección de plantas, en el campo doméstico y de la higiene y en la protección de materiales y también a agentes de protección de plantas que comprenden estos derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina.

Se sabe ya que ciertos derivados de heteroarilpiperidina y -piperazina se pueden usar como agentes fungicidas de protección de plantas (véanse los documentos WO 2007/014290, WO 2008/013925, WO 2008/013622, WO 2008/091594, WO 2008/091580, WO 2009/055514, WO 2009/094407, WO 2009/094445, WO 2009/132785, WO 2010/037479, WO 2010/065579, WO 2010/149275, WO 2010/066353, WO 2011/018401 y WO 2011/018415). Sin embargo, la actividad fungicida de estos compuestos, en particular con dosis de aplicación menores, no siempre es suficiente.

Dado que las exigencias ecológicas y económicas que se hacen sobre los agentes de protección de plantas modernos se incrementan constantemente, por ejemplo con respecto al espectro de actividad, toxicidad, selectividad, dosis de aplicación, formación de residuos y fabricación favorable y que además pueden surgir problemas, por ejemplo, con las resistencias, existe una necesidad constante de desarrollar nuevos agentes de protección de plantas, en particular fungicidas que, al menos en algunas áreas, tengan ventajas sobre los ya conocidos.

Sorprendentemente, ahora se ha descubierto que los presentes derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina resuelven al menos algunos aspectos de los objetivos mencionados y son adecuados para su uso como agentes de protección de plantas, en particular como fungicidas.

La invención tiene por objeto compuestos de fórmula (I)



en la que los símbolos tienen los siguientes significados:

A representa fenilo que puede contener hasta tres sustituyentes, en el que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R²,

o

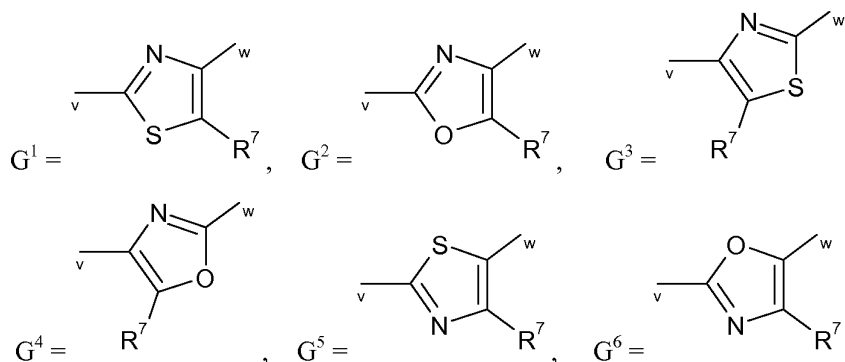
A' representa heteroarilo de 5 o 6 miembros opcionalmente benzocondensado sin sustituir o sustituido, en el que los sustituyentes en el carbono se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R³ y los sustituyentes en el nitrógeno se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R⁴,

L¹ representa NR⁵ o C(R⁶)₂,

X representa CH o nitrógeno,

Y representa azufre u oxígeno,

G representa:



en los que el enlace identificado por "v" está unido directamente a X y en los que el enlace identificado por "w" está

unido directamente a T,

- 5 T representa $^*C(=O)CH_2\#$, $^*C(=O)CH_2C(R_8)_2\#$, $^*C(=O)CH=CH\#$, $^*C(=O)C\equiv C\#$, $^*C(=O)CH_2C(=O)\#$, $^*C\equiv C(=O)\#$, $^*CH=CHC(=O)\#$, $^*CH_2CH_2C(=O)\#$, $^*C(=S)CH_2\#$, $^*C(=S)CH_2C(R_8)_2\#$, $^*C(=S)CH=CH\#$, $^*C(=S)C\equiv C\#$, $^*C\equiv C(=S)\#$, $^*CH=CHC(=S)\#$, $^*CH_2CH_2C(=S)\#$, $^*C(=NR_9)CH_2\#$, $^*C(=NR_9)CH_2C(R_8)_2\#$, $^*CH_2CH_2C(=NR_9)\#$, $^*C(=NR_9)CH=CH\#$, $^*CH=CHC(=NR_9)\#$, $^*CH=CHC(NOH)\#$ o $^*CH=CHC(NOC1-C_4\text{-alquil})CH_2\#$, en los que el enlace identificado por * está unido directamente a G y en los que el enlace identificado por # está unido directamente a R^1 ,
- 10 R^1 se selecciona entre el grupo que contiene R^1_a , R^1_b , R^1_c , R^1_d , R^1_e , R^1_f , R^1_g o R^1_h en el que
- R^1_a representa alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , alcohalquilo C_2-C_8 o cicloalcohalquilo C_5-C_9 o
- R^1_b representa cicloalquilo C_3-C_{10} sin sustituir o sustituido
- 15 en el que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre -Q o R^{10} o
- R^1_c representa cicloalqueno C_5-C_{10} sin sustituir o sustituido, en el que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{11} o
- R^1_d representa fenilo sin sustituir o sustituido,
- 20 en el que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre - L^2Q o R^{12} o
- R^1_e representa naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, indan-1-ilo, indan-2-ilo, indan-3-ilo, indan-4-ilo o indan-5-ilo sin sustituir o sustituidos,
- 25 en los que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{13} o
- R^1_f representa un radical heteroarilo de 5 o 6 miembros sin sustituir o sustituido, en el que los sustituyentes en el carbono se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre - L^2Q o R^{14} y los sustituyentes en el nitrógeno se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre - L^3Q o R^{15} o
- 30 R^1_g representa heteroarilo de 5 o 6 miembros benzocondensado sin sustituir o sustituido, en el que los sustituyentes en el carbono se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{16} y los sustituyentes en el nitrógeno se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{17} o
- 35 R^1_h representa heterociclilo C_5-C_{15} sin sustituir o sustituido, en el que los sustituyentes en el carbono se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{18} y los sustituyentes en el nitrógeno se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{19} ,
- 40 L^2 representa un enlace directo, -O-, $-C(R^{20})_2-$ o $-NR^{21}-$,
- L^3 representa un enlace directo o $-C(R^{20})_2-$,
- Q se selecciona entre el grupo que contiene Q', Q'' y Q''', en el que
- 45 Q' representa fenilo que puede contener hasta dos sustituyentes, en el que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{22} o
- Q'' representa un radical heteroarilo de 5 o 6 miembros que puede contener hasta dos sustituyentes, en el que los sustituyentes en el carbono se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{23} y los sustituyentes en el nitrógeno se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{24} o
- 50 R^2 , R^{12} y R^{22} Q''' representa cicloalquilo C_3-C_{10} saturado o parcialmente insaturado, representan, independientemente los unos de los otros, halógeno, ciano, hidroxilo, SH, amino,

- 5 nitro, fenilo, C(=O)H, C(=O)OH, CONR²⁵R²⁶, NR²⁵R²⁶, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilocicloalquilo C₆-C₁₄, halocicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, cicloalquenilo C₃-C₈, halocicloalquenilo C₃-C₈, alcoxialquilo C₂-C₆, cicloalcoxialquilo C₄-C₁₀, alcoxialcoxialquilo C₃-C₈, alquiltioalquilo C₂-C₆, alquilsulfinilalquilo C₂-C₆, alquilsulfonylalquilo C₂-C₆, alquilaminoalquilo C₂-C₆, dialquilaminoalquilo C₃-C₈, haloalquilaminoalquilo C₂-C₆, cicloalquilaminoalquilo C₄-C₁₀, alquilcarbonilo C₂-C₆, haloalquilcarbonilo C₂-C₆, cicloalquilcarbonilo C₄-C₈, alcoxycarbonilo C₂-C₆, cicloalcoxycarbonilo C₄-C₈, cicloalquilalcoxycarbonilo C₅-C₁₀, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈, cicloalquilaminocarbonilo C₄-C₈, haloalcoxialquilo C₂-C₆, hidroxialquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₈, halocicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquilalcoxi C₄-C₁₀, alqueniloxi C₃-C₆, haloalqueniloxi C₃-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, haloalquiniloxi C₃-C₆, alcoxialcoxi C₂-C₆, alquilcarboniloxi C₂-C₆, haloalquilcarboniloxi C₂-C₆, cicloalquilcarboniloxi C₄-C₈, alquilcarbonilalcoxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alquilsulfonyl C₃-C₆, alquilsulfonyl C₁-C₆, haloalquilsulfonyl C₁-C₆, cicloalquilsulfonyl C₃-C₈, tri(alquil-C₁-C₄)sililo, alquilsulfonylamino C₁-C₆ o haloalquilsulfonylamino C₁-C₆,
- 10
- 15
- 20 R³, R¹⁴, R¹⁶, R¹⁸ y R²³ representan, independientemente los unos de los otros, halógeno, ciano, hidroxilo, SH, amino, nitro, NR²⁵R²⁶, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilocicloalquilo C₆-C₁₄, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈, hidroxialquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alqueniloxi C₃-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₂-C₆, alquilcarbonilalcoxi C₂-C₆, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonyl C₁-C₄, haloalquilsulfonyl C₁-C₄, alquilsulfonyl C₁-C₄, haloalquilsulfonyl C₁-C₄, tri(alquil-C₁-C₄)sililo o fenilo,
- 25
- 30 R⁴, R¹⁵, R¹⁷, R¹⁹ y R²⁴ representan, independientemente los unos de los otros, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilocicloalquilo C₆-C₁₄, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈, hidroxialquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alqueniloxi C₃-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₂-C₆, alquilcarbonilalcoxi C₂-C₆, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfonyl C₁-C₄, haloalquilsulfonyl C₁-C₄, alquilsulfonyl C₁-C₄, haloalquilsulfonyl C₁-C₄, tri(alquil-C₁-C₄)sililo o fenilo,
- 35
- R⁵ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄,
- R⁶ representa, independientemente los unos de los otros, hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciclopropilo o halógeno,
- 40
- o los dos radicales R⁶ junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de ciclopropilo,
- R⁷ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₅ o halógeno,
- R⁸ representa, independientemente los unos de los otros, hidrógeno o alquilo C₁-C₄,
- 40 R⁹ representa OH, nitro, ciano, alquilo C₁-C₄, alquilamino C₁-C₄, dialquilamino C₂-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ o ciclopropilo
- R¹⁰ y R¹¹ representan, independientemente los unos de los otros, ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, tri(alquil-C₁-C₄)sililo, fenilo, hidroxilo, oxo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₃-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆ o haloalquiltio C₁-C₆,
- 45
- R¹³ representa, independientemente los unos de los otros, ciano, nitro, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, tri(alquil-C₁-C₄)sililo, bencilo, fenilo, hidroxilo, SH, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₃-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆ o haloalquiltio C₁-C₆,
- 50 R²⁰ representa, independientemente los unos de los otros, hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄,
- R²¹ representa alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alquilcarbonilo C₂-C₆, haloalquilcarbonilo C₂-C₆, alcoxycarbonilo C₂-C₆ o haloalcoxycarbonilo C₂-C₆,
- 55 R²⁵ y R²⁶ representan, independientemente los unos de los otros, hidrógeno, alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, bencilo o fenilo,

y también las sales agroquímicamente activas de los mismos.

La invención además tiene por objetivo el uso de los compuestos de fórmula (I) como fungicida.

Los derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina de fórmula (I) de acuerdo con la invención y sus sales agroquímicamente activas son altamente adecuados para el control de hongos fitopatógenos nocivos. Los compuestos de acuerdo con la invención mencionados anteriormente tienen en particular una potente actividad fungicida y se pueden usar tanto en la protección de plantas, como en el campo doméstico y de la higiene y en la protección de materiales.

Los compuestos de fórmula (I) pueden estar presentes tanto en forma pura como en forma de mezclas de varias formas isoméricas posibles, en particular de estereoisómeros, tales como isómeros E y Z, treo y eritro y también ópticos, tales como isómeros R y S o atropisómeros y, si fuera oportuno, también de tautómeros. Lo que se reivindica es tanto los isómeros E como los isómeros Z y también los isómeros treo y eritro y también los ópticos, cualquier mezcla de estos isómeros y también las posibles formas tautoméricas.

A representa preferentemente fenilo que puede contener hasta dos sustituyentes, en el que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre la lista de R^2 y R^2 representa preferentemente:

halógeno, ciano, hidroxilo, amino, nitro, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alcoxialquilo C_2-C_4 , alquilcarbonilo C_2-C_5 , alcoxicarbonilo C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_6 o $C(=O)H$,

A' representa además preferentemente un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo siguiente: furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, pirrol-1-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirazin-2-ilo, pirazin-3-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo o pirimidin-5-ilo que pueden contener hasta dos sustituyentes, en los que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^3 y R^4 y

R^3 representa preferentemente un sustituyente en el carbono:

halógeno, ciano, hidroxilo, amino, nitro, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalqueno C_2-C_6 , haloalquino C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquiltio C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , alcoxialquilo C_2-C_4 , alcoxicarbonilo C_2-C_6 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , $C(=O)H$ o fenilo,

R^4 representa preferentemente un sustituyente en el nitrógeno:

alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , alqueno C_3-C_6 , haloalqueno C_3-C_6 , alquino C_3-C_6 o haloalquino C_3-C_6 .

A representa de forma particularmente preferente fenilo que puede contener hasta dos sustituyentes, en el que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^2 y R^2 representa de forma particularmente preferente:

flúor, bromo, yodo, cloro, ciano, nitro, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, clorofluorometilo, diclorometilo, diclorofluorometilo, difluorometilo, triclorometilo, trifluorometilo, ciclopropilo, etoxi, 1-metiletoxi, propoxi, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, 1-metiletiltio, metiltio, etiltio, propiltio, difluorometiltio o trifluorometiltio,

A' representa de forma particularmente preferente un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo siguiente: furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, pirrol-1-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo o pirimidin-5-ilo que pueden contener hasta dos sustituyentes, en los que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^3 y R^4 y

R^3 representa de forma particularmente preferente un sustituyente en el carbono:

flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, clorofluorometilo, diclorometilo, diclorofluorometilo, difluorometilo, triclorometilo, trifluorometilo, ciclopropilo, etoxi, 1-metiletoxi, propoxi, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, 1-metiletiltio, metiltio, etiltio, propiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio o fenilo,

R^4 representa de forma particularmente preferente un sustituyente en el nitrógeno:

metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, 2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2-difluoroetilo o 2-cloro-2-fluoroetilo,

A' representa de forma muy particularmente preferente pirazol-1-ilo que puede contener hasta dos

haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilsulfinito C₁-C₆, haloalquilsulfinito C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, cicloalquilsulfonilo C₃-C₆, tri(alquil-C₁-C₄)sililo, alquilsulfonilamino C₁-C₆, haloalquilsulfonilamino C₁-C₆,

- 5 R¹_e representa preferentemente naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, indan-1-ilo, indan-2-ilo, indan-3-ilo, indan-4-ilo o indan-5-ilo sin sustituir o sustituidos, en los que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹³ y
- 10 R¹³ representa preferentemente:
ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, bencilo, fenilo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₃-C₆, alquiniloxi C₃-C₆ o alquiltio C₁-C₆,
- 15 R¹_f representa preferentemente un radical heteroarilo de 5 o 6 miembros sin sustituir o sustituido, en el que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre -L²Q o R¹⁴ y -L³Q o R¹⁵ y
- 20 R¹⁴ representa preferentemente un sustituyente en el carbono:
halógeno, ciano, hidroxilo, SH, amino, nitro, NR²⁵R²⁶, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilocicloalquilo C₆-C₁₄, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈, hidroxialquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinito C₁-C₄, haloalquilsulfinito C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, tri(alquil-C₁-C₄)sililo,
- 25 R¹⁵ representa preferentemente un sustituyente en el nitrógeno:
alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₃-C₆, haloalquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, fenilo,
- 30 R¹_g representa preferentemente un heteroarilo de 5 o 6 miembros benzocondensado sin sustituir o sustituido, en el que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹⁶ y R¹⁷ y
- 35 R¹⁶ representa preferentemente un sustituyente en el carbono:
halógeno, ciano, hidroxilo, SH, amino, nitro, NR²⁵R²⁶, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilocicloalquilo C₆-C₁₄, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈, hidroxialquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinito C₁-C₄, haloalquilsulfinito C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, tri(alquil-C₁-C₄)sililo o fenilo,
- 40 R¹⁷ representa preferentemente un sustituyente en el nitrógeno: alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₃-C₆, haloalquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀ o fenilo,
- 45 R¹_h representa preferentemente heterociclilo C₅-C₁₅ sin sustituir o sustituido, en el que los sustituyentes posibles se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹⁸ y R¹⁹ y
- 50 R¹⁸ representa preferentemente un sustituyente en el carbono:
halógeno, ciano, hidroxilo, SH, amino, nitro, NR²⁵R²⁶, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilocicloalquilo C₆-C₁₄, alquilocicloalquilalquilo C₅-C₁₀, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈, hidroxialquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarboniloxi C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinito C₁-C₄, haloalquilsulfinito C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, tri(alquil-C₁-C₄)sililo o fenilo,
- 55 R¹⁹ representa preferentemente un sustituyente en el nitrógeno:
alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₃-C₆, haloalquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilocicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀ o fenilo,
- 55 R¹_a representa de forma particularmente preferente 1,1-dimetiletilo, 3,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, pentilo, 1-etilpropilo, butilo, 2-metilpropilo, 1-metiletilo, etilo, propilo, 4-metilpentilo o hexilo,
- 60 R¹_b representa de forma particularmente preferente ciclopentilo, ciclohexilo o cicloheptilo, cada uno de los cuales puede contener hasta dos sustituyentes, en los que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹⁰ y
- R¹⁰ representa de forma particularmente preferente:

ciano, cloro, flúor, bromo, yodo, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, etenilo, fenilo, metoxi, etoxi, propiloxi, trifluorometoxi, etinilo, 2-propiniloxi, metiltio, etiltio o trifluorometiltio,

- 5 R^1_c representa de forma particularmente preferente ciclopentenilo, ciclohexenilo o cicloheptenilo, cada uno de los cuales puede contener hasta dos sustituyentes, en los que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{11} y R^{11} representa de forma particularmente preferente: metilo, etilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, etinilo, 2-propiniloxi, metiltio, etiltio o trifluorometiltio,
- 10 R^1_d representa además de forma particularmente preferente fenilo que puede contener hasta tres sustituyentes, en el que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre $-L^2Q'$ o R^{12} y R^{12} representa de forma particularmente preferente: flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1,1-dimetiletilo, 1,2-dimetiletilo, etenilo, etinilo, trifluorometilo, difluorometilo, triclorometilo, diclorometilo, ciclopropilo, metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletoxi, 1,1-dimetiletoxi, metilcarbonilo, etilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, propoxicarbonilo, 1-metiletoxicarbonilo, 1,1-dimetiletoxicarbonilo, 2-propeniloxi, 2-propiniloxi, metiltio, etiltio, metilsulfinilo o metilsulfonilo,
- 15 R^1_e representa de forma particularmente preferente naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, indan-1-ilo, indan-2-ilo, indan-3-ilo, indan-4-ilo o indan-5-ilo que pueden contener hasta tres sustituyentes, en los que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{13} y R^{13} representa de forma particularmente preferente: metilo, metoxi, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo,
- 20 R^1_f representa de forma particularmente preferente furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, pirrol-1-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-4-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo o pirazin-2-ilo, que pueden contener cada uno hasta dos sustituyentes, en los que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{14} y R^{15} y R^{14} representa de forma particularmente preferente un sustituyente en el carbono: cloro, flúor, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1,1-dimetiletilo, etenilo, etinilo, trifluorometilo, difluorometilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletoxi, 2-propiniloxi, trifluorometoxi, metilcarboniloxi, metilcarboniltio, metiltio, etiltio, trifluorometiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, trifluorometilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo o trifluorometilsulfonilo,
- 25 R^1_f R^{15} representa de forma particularmente preferente un sustituyente en el nitrógeno: metilo, etilo, propilo, ciclopropilo, ciclohexilo, fenilo o 2-propinilo,
- 30 R^1_g representa de forma particularmente preferente indol-1-ilo, indol-2-ilo, indol-3-ilo, indol-4-ilo, indol-5-ilo, indol-6-ilo, indol-7-ilo, benzoimidazol-1-ilo, benzoimidazol-2-ilo, benzoimidazol-4-ilo, benzoimidazol-5-ilo, indazol-1-ilo, indazol-3-ilo, indazol-4-ilo, indazol-5-ilo, indazol-6-ilo, indazol-7-ilo, indazol-2-ilo, 1-benzofuran-2-ilo, 1-benzofuran-3-ilo, 1-benzofuran-4-ilo, 1-benzofuran-5-ilo, 1-benzofuran-6-ilo, 1-benzofuran-7-ilo, 1-benzotiofen-2-ilo, 1-benzotiofen-3-ilo, 1-benzotiofen-4-ilo, 1-benzotiofen-5-ilo, 1-benzotiofen-6-ilo, 1-benzotiofen-7-ilo, 1,3-benzotiazol-2-ilo, 1,3-benzotiazol-4-ilo, 1,3-benzotiazol-5-ilo, 1,3-benzotiazol-6-ilo, 1,3-benzotiazol-7-ilo, 1,3-benzoxazol-2-ilo, 1,3-benzoxazol-4-ilo, 1,3-benzoxazol-5-ilo, 1,3-benzoxazol-6-ilo, 1,3-benzoxazol-7-ilo, quinolin-2-ilo, quinolin-3-ilo, quinolin-4-ilo, quinolin-5-ilo, quinolin-6-ilo, quinolin-7-ilo, quinolin-8-ilo, isoquinolin-1-ilo, isoquinolin-3-ilo, isoquinolin-4-ilo, isoquinolin-5-ilo, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo o isoquinolin-8-ilo, cada uno de los cuales puede contener hasta dos sustituyentes, en los que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{16} y R^{17} y R^{16} representa de forma particularmente preferente un sustituyente en el carbono: flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, metoxi, 2-propiniloxi, 2-propeniloxi, R^{17} representa de forma particularmente preferente un sustituyente en el nitrógeno: metilo, etilo, propilo, ciclopropilo, ciclohexilo, fenilo o 2-propinilo,
- 35 R^1_a representa de forma muy particularmente preferente 1,1-dimetiletilo,
- 40 R^1_b representa de forma muy particularmente preferente ciclohexilo, ciclopentilo, 2-metilciclohexilo, 3-metilciclohexilo o 4-metilciclohexilo,
- 45
- 50
- 55
- 60

- R^{1c} representa de forma muy particularmente preferente ciclohex-3-en-1-ilo o ciclohex-2-en-1-ilo,
- R^{1d} representa de forma muy particularmente preferente fenilo que puede contener hasta dos sustituyentes, en el que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹² y
- 5 R¹² representa de forma muy particularmente preferente:
cloro, flúor, bromo, yodo, metilo, metoxi, etoxi, trifluorometilo, difluorometilo, 2-propenilo, 2-propinilo o fenilo,
- R^{1e} representa de forma muy particularmente preferente naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, indan-1-ilo, indan-2-ilo, indan-3-ilo, indan-4-ilo o indan-5-ilo,
- R^{1f} representa de forma muy particularmente preferente furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, pirrol-1-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-4-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo o pirimidin-5-ilo,
- L² representa preferentemente un enlace directo o -O-,
- 20 L² representa de forma particularmente preferente un enlace directo,
- L³ representa preferentemente un enlace directo,
- Q' representa preferentemente fenilo que puede contener hasta dos sustituyentes, en el que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R²² y
- 25 R²² representa preferentemente:
flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, SH, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄ o haloalquiltio C₁-C₄,
- Q'' representa preferentemente furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, pirrol-1-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, tetrazol-5-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-4-ilo, tetrazol-5-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo, pirazin-2-ilo, 1,3,5-triazin-2-ilo o 1,2,4-triazin-3-ilo que puede contener hasta dos sustituyentes en cada caso, en los que los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R²³ y R²⁴ y
- 35 R²³ representa preferentemente un sustituyente en el carbono:
flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, SH, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄ o haloalquiltio C₁-C₄,
- 40 R²⁴ representa preferentemente un sustituyente en el nitrógeno:
alquilo C₁-C₆, alquénilo C₃-C₆, alquínulo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo,
- Q' representa de forma particularmente preferente fenilo,
- R⁵ representa preferentemente hidrógeno o metilo, etilo, propilo, *iso*-propilo, butilo, *iso*-butilo o *terc*-butilo,
- R⁵ representa de forma particularmente preferente hidrógeno,
- 45 R⁷ representa preferentemente hidrógeno,
- R⁸ representa preferentemente de manera independiente los unos de los otros hidrógeno, metilo o etilo,
- R⁸ representa de forma particularmente preferente hidrógeno, metilo,
- R²⁵ y R²⁶ representan preferentemente de manera independiente los unos de los otros hidrógeno, metilo, etilo, propilo, *iso*-propilo, butilo, *iso*-butilo o *terc*-butilo.
- 50 La fórmula (I) proporciona una definición general de los derivados de ácido heteroarilcarboxílico que se pueden usar de acuerdo con la invención. Las definiciones de los radicales preferentes para las fórmulas mostradas anteriormente y posteriormente se ofrecen en adelante. Estas definiciones se aplican a los productos finales de fórmula (I) y asimismo a todos los productos intermedios (véase también posteriormente en "Ilustración de los

procedimientos y los productos intermedios").

Las definiciones de radicales y las explicaciones indicadas anteriormente en general o indicadas en los intervalos preferentes también se pueden, sin embargo, combinar unas con otras según se desee, es decir entre los intervalos respectivos y los intervalos preferentes. Esto se aplica tanto a los productos finales como, en la misma medida, a los precursores y productos intermedios. Además, pueden no aplicarse definiciones individuales.

5 Se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que todos los radicales en cada caso tienen los significados preferentes mencionados anteriormente.

Se da una particular preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que todos los radicales en cada caso tienen los significados particularmente preferentes mencionados anteriormente.

10 Se da una muy particular preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que todos los radicales en cada caso tienen los significados muy particularmente preferentes mencionados anteriormente.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

A representa 3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

15 A representa 5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

A representa 2,5-dimetilfenilo.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

A representa 2-metil-5-clorofenilo.

20 Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

G representa G¹.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

T representa *-C(=O)CH₂-#.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

25 T representa *-C(=O)CH₂C(CH₃)₂-#.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

T representa *-C(=O)CH₂CH₂-#.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

T representa *-C(=O)CH=CH-#.

30 Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

T representa *-C≡CC(=O)-#.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

T representa *-CH=CHC(=O)-#.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

35 T representa *-CH₂CH₂C(=O)-#.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

T representa *-C(=NOCH₃)CH₂-#.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

T representa *-CH=CHC(=NOH)-#.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
X representa CH.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
Y representa oxígeno.

5 Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
L¹ representa NH.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
L¹ representa -CH₂-.

10 Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R⁸ representa hidrógeno.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R⁸ representa metilo.

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R⁵ representa hidrógeno.

15 Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R¹ representa ciclohexilo (R¹_b).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R¹ representa fenilo (R¹_d).

20 Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R¹ representa 2-metoxifenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R¹ representa 4-metoxifenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R¹ representa 2-etoxifenilo (R¹_d).

25 Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R¹ representa naftalen-1-ilo (R¹_e).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R¹ representa *terc*-butilo (R¹_a).

30 Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R¹ representa tiofen-2-ilo (R¹_f).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R¹ representa furan-2-ilo (R¹_f).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R¹ representa 2-clorofenilo (R¹_d).

35 Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que
R¹ representa 2,4-diclorofenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 2-bromofenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 2,6-difluorofenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

5 R¹ representa 2-yodofenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 2-metilfenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 3-metilfenilo (R¹_d).

10 Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa ciclopentilo (R¹_b).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 2-fluoro-4-metoxifenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

15 R¹ representa 2-bromo-4-fluorofenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 2,6-dimetoxifenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 2-metilciclohexilo (R¹_b).

20 Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 2-(prop-2-in-1-iloxi)fenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 2,6-diclorofenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

25 R¹ representa 2,6-dimetilfenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 2,4,6-trifluorofenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 2-cloro-5-fluorofenilo (R¹_d).

30 Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 2-cloro-6-fluorofenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 4-fluorofenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

35 R¹ representa 3-fluorofenilo (R¹_d).

Además se da preferencia a los compuestos de fórmula (I) en los que

R¹ representa 2-fluorofenilo (R¹_d).

Las definiciones de los radicales mencionados anteriormente se pueden combinar las unas con las otras según se desee. Además, pueden no aplicarse definiciones individuales.

5 Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes definidos anteriormente, los compuestos de fórmula (I) tienen propiedades ácidas o básicas y pueden formar sales, si fuera oportuno también sales internas o productos de adición con ácidos o con bases orgánicas o inorgánicas o con bases o con iones metálicos. Si los compuestos de fórmula (I) poseen amino, alquilamino u otros grupos que inducen propiedades básicas, estos compuestos se pueden hacer reaccionar con ácidos para obtener sales o se obtienen directamente en forma de sales en la síntesis. Si los compuestos de fórmula (I) poseen hidroxilo, carboxilo u otros grupos que inducen propiedades ácidas, estos compuestos se pueden hacer reaccionar con bases para obtener sales. Las bases adecuadas son, por ejemplo, 10 hidróxidos, carbonatos o hidrogenocarbonatos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos, en particular las de sodio, potasio, magnesio y calcio, además de amoníaco, aminas primarias, secundarias y terciarias con grupos alquilo C₁-C₄, mono-, di- y trialcanolaminas de alcoholes C₁-C₄, colina y también clorocolina.

Las sales que se obtienen de esta manera también poseen propiedades fungicidas, herbicidas e insecticidas.

15 Ejemplos de ácidos inorgánicos son ácidos hidrácidos de halógenos, tales como fluoruro de hidrógeno, cloruro de hidrógeno, bromuro de hidrógeno y yoduro de hidrógeno, ácido sulfúrico, ácido fosfórico y ácido nítrico y sales ácidas, tales como NaHSO₄ y KHSO₄. Los ácidos orgánicos adecuados son, por ejemplo, ácido fórmico, ácido carbónico y ácidos alcanóicos, tales como ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido tricloroacético y ácido propiónico y también ácido glicólico, ácido tiocianico, ácido láctico, ácido succínico, ácido cítrico, ácido benzoico, ácido cinámico, ácido oxálico, ácidos grasos C₆-C₂₀ saturados o mono- o diinsaturados, ésteres de monoalquilo del ácido sulfúrico, ácidos alquilsulfónicos (ácidos sulfónicos con radicales alquilo de cadena lineal o ramificada de 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilsulfónicos o ácidos arildisulfónicos (radicales aromáticos, tales como fenilo y naftilo, que tienen uno o dos grupos ácido sulfónico), ácidos alquilsulfónicos (ácidos sulfónicos con radicales alquilo de cadena lineal o ramificada de 1 a 20 átomos de carbono), ácidos arilfosfónicos o ácidos arildifosfónicos (radicales aromáticos, tales como fenilo y naftilo, que tienen uno o dos radicales ácido fosfónico), en los que los radicales alquilo y arilo pueden tener sustituyentes adicionales, por ejemplo ácido p-toluenosulfónico, ácido salicílico, ácido p-aminosalicílico, ácido 2-fenoxibenzoico, ácido 2-acetoxibenzoico, etc.

25 Iones metálicos adecuados son en particular los iones de los elementos del grupo IIa, en particular calcio y magnesio, del grupo IIIa y IVa, en particular aluminio, estaño y plomo, y también de los grupos Ib a VIIIb, en particular cromo, manganeso, hierro, cobalto, níquel, cobre, cinc y otros. Se da una preferencia particular a los iones metálicos de los elementos del cuarto período. En este caso, los metales pueden estar presentes con las diversas valencias que puedan adoptar.

Los grupos opcionalmente sustituidos pueden estar mono- o polisustituidos, en los que en el caso de las polisustituciones los sustituyentes pueden ser idénticos o diferentes.

35 En las definiciones de los símbolos ofrecidas en las fórmulas anteriores se usaron términos colectivos que son generalmente representativos de los siguientes sustituyentes:

halógeno: flúor, cloro, bromo y yodo;

40 **alquilo:** radicales hidrocarburo saturados de cadena lineal o ramificada con de 1 a 8 átomos de carbono, por ejemplo (pero no limitados a) alquilo C₁-C₆, tales como metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1-metilpentilo, 2-metilpentilo, 3-metilpentilo, 4-metilpentilo, 1,1-dimetilbutilo, 1,2-dimetilbutilo, 1,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilbutilo, 2,3-dimetilbutilo, 3,3-dimetilbutilo, 1-etilbutilo, 2-etilbutilo, 1,1,2-trimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y 1-etil-2-metilpropilo;

45 **alqueno:** radicales hidrocarburo insaturados de cadena lineal o ramificada con de 2 a 8 átomos de carbono y un doble enlace en cualquier posición, por ejemplo (pero no limitados a) alqueno C₂-C₆, tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-1-propenilo, 2-metil-1-propenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metil-1-butenilo, 2-metil-1-butenilo, 3-metil-1-butenilo, 1-metil-2-butenilo, 2-metil-2-butenilo, 3-metil-2-butenilo, 1-metil-3-butenilo, 2-metil-3-butenilo, 3-metil-3-butenilo, 1,1-dimetil-2-propenilo, 1,2-dimetil-1-propenilo, 1,2-dimetil-2-propenilo, 1-etil-1-propenilo, 1-etil-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metil-1-pentenilo, 2-metil-1-pentenilo, 3-metil-1-pentenilo, 4-metil-1-pentenilo, 1-metil-2-pentenilo, 2-metil-2-pentenilo, 3-metil-2-pentenilo, 4-metil-2-pentenilo, 1-metil-3-pentenilo, 2-metil-3-pentenilo, 3-metil-3-pentenilo, 4-metil-3-pentenilo, 1-metil-4-pentenilo, 2-metil-4-pentenilo, 3-metil-4-pentenilo, 4-metil-4-pentenilo, 1,1-dimetil-2-butenilo, 1,1-dimetil-3-butenilo, 1,2-dimetil-1-butenilo, 1,2-dimetil-2-butenilo, 1,2-dimetil-3-butenilo, 1,3-dimetil-1-butenilo, 1,3-dimetil-2-butenilo, 1,3-dimetil-3-butenilo, 2,2-dimetil-3-butenilo, 2,3-dimetil-1-butenilo, 2,3-dimetil-2-butenilo, 2,3-dimetil-3-butenilo, 3,3-dimetil-1-butenilo, 3,3-dimetil-2-butenilo, 1-etil-1-butenilo, 1-etil-2-butenilo, 1-etil-3-butenilo, 2-etil-1-butenilo, 2-etil-2-butenilo, 2-etil-3-butenilo, 1,1,2-trimetil-2-propenilo, 1-etil-1-metil-2-propenilo, 1-etil-2-metil-1-propenilo y 1-etil-2-metil-2-propenilo;

alquino: grupos hidrocarburo de cadena lineal o ramificada con de 2 a 8 átomos de carbono y un triple enlace

en cualquier posición, por ejemplo (pero no limitados a) alquinilo C₂-C₆, tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, 1-metil-2-butinilo, 1-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-1-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, 1-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-1-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-1-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, 1,1-dimetil-3-butinilo, 1,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-1-butinilo, 1-etil-2-butinilo, 1-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo y 1-etil-1-metil-2-propinilo;

alcoxi: radicales alcoxi saturados de cadena lineal o ramificada con de 1 a 8 átomos de carbono, por ejemplo (pero no limitados a) alcoxi C₁-C₆, tales como metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletoxi, butoxi, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi, 1,1-dimeteletoxi, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 2,2-dimetilpropoxi, 1-etilpropoxi, hexoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi y 1-etil-2-metilpropoxi;

alquiltio: radicales alquiltio saturados de cadena lineal o ramificada con de 1 a 8 átomos de carbono, por ejemplo (pero no limitados a) alquiltio C₁-C₆, tales como metiltio, etiltio, propiltio, 1-metileiltio, butiltio, 1-metilpropiltio, 2-metilpropiltio, 1,1-dimeteiltio, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 2,2-dimetilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio, 4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2-trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio y 1-etil-2-metilpropiltio;

alcoxicarbonilo: un grupo alcoxi con de 1 a 6 átomos de carbono (como se ha mencionado anteriormente) que está unido al esqueleto a través de un grupo carbonilo (-CO-);

alquilsulfinilo: radicales alquilsulfinilo saturados de cadena lineal o ramificada con de 1 a 8 átomos de carbono, por ejemplo (pero no limitados a) alquilsulfinilo C₁-C₆, tales como metilsulfinilo, etilsulfinilo, propilsulfinilo, 1-metiletilsulfinilo, butilsulfinilo, 1-metilpropilsulfinilo, 2-metilpropilsulfinilo, 1,1-dimeteletilsulfinilo, pentilsulfinilo, 1-metilbutilsulfinilo, 2-metilbutilsulfinilo, 3-metilbutilsulfinilo, 2,2-dimetilpropilsulfinilo, 1-etilpropilsulfinilo, hexilsulfinilo, 1,1-dimetilpropilsulfinilo, 1,2-dimetilpropilsulfinilo, 1-metilpentilsulfinilo, 2-metilpentilsulfinilo, 3-metilpentilsulfinilo, 4-metilpentilsulfinilo, 1,1-dimetilbutilsulfinilo, 1,2-dimetilbutilsulfinilo, 1,3-dimetilbutilsulfinilo, 2,2-dimetilbutilsulfinilo, 2,3-dimetilbutilsulfinilo, 3,3-dimetilbutilsulfinilo, 1-etilbutilsulfinilo, 2-etilbutilsulfinilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfinilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfinilo, 1-etil-1-metilpropilsulfinilo y 1-etil-2-metilpropilsulfinilo;

alquilsulfonilo: radicales alquilsulfonilo saturados de cadena lineal o ramificada con de 1 a 8 átomos de carbono, por ejemplo (pero no limitados a) alquilsulfonilo C₁-C₆, tales como metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, 1-metiletilsulfonilo, butilsulfonilo, 1-metilpropilsulfonilo, 2-metilpropilsulfonilo, 1,1-dimeteletilsulfonilo, pentilsulfonilo, 1-metilbutilsulfonilo, 2-metilbutilsulfonilo, 3-metilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-etilpropilsulfonilo, hexilsulfonilo, 1,1-dimetilpropilsulfonilo, 1,2-dimetilpropilsulfonilo, 1-metilpentilsulfonilo, 2-metilpentilsulfonilo, 3-metilpentilsulfonilo, 4-metilpentilsulfonilo, 1,1-dimetilbutilsulfonilo, 1,2-dimetilbutilsulfonilo, 1,3-dimetilbutilsulfonilo, 2,2-dimetilbutilsulfonilo, 2,3-dimetilbutilsulfonilo, 3,3-dimetilbutilsulfonilo, 1-etilbutilsulfonilo, 2-etilbutilsulfonilo, 1,1,2-trimetilpropilsulfonilo, 1,2,2-trimetilpropilsulfonilo, 1-etil-1-metilpropilsulfonilo y 1-etil-2-metilpropilsulfonilo;

cicloalquilo: grupos hidrocarburo saturados monocíclicos con de 3 a 10 miembros de carbono en el anillo, por ejemplo (pero no limitados a) ciclopropilo, ciclopentilo y ciclohexilo;

haloalquilo: grupos alquilo de cadena lineal o ramificada con de 1 a 8 átomos de carbono (como se ha mencionado anteriormente), en el que en estos grupos algunos o todos los átomos de hidrógeno pueden estar reemplazados por átomos de halógeno como se han mencionado anteriormente, por ejemplo (pero no limitados a) haloalquilo C₁-C₃, tales como clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo;

haloalcoxi: grupos alcoxi de cadena lineal o ramificada con de 1 a 8 átomos de carbono (como se ha mencionado anteriormente), en el que en estos grupos algunos o todos los átomos de hidrógeno pueden estar reemplazados por átomos de halógeno como se han mencionado anteriormente, por ejemplo (pero no limitados a) haloalcoxi C₁-C₃, tales como clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi y 1,1,1-trifluoroprop-2-oxi;

haloalquiltio: grupos alquiltio de cadena lineal o ramificada con de 1 a 8 átomos de carbono (como se ha mencionado anteriormente), en el que en estos grupos algunos o todos los átomos de hidrógeno pueden estar reemplazados por átomos de halógeno como se han mencionado anteriormente, por ejemplo (pero no limitados

a) haloalquiltio C₁-C₃, tales como clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, clorodifluorometiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio, pentafluoroetiltio y 1,1,1-trifluoroprop-2-iltio;

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

10 **heteroarilo de 5 miembros: que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre u oxígeno:** grupos heteroarilo de 5 miembros que, además de átomos de carbono, pueden contener de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre u oxígeno como miembros del anillo, por ejemplo (pero no limitados a) 2-furilo, 3-furilo, 2-tienilo, 3-tienilo, 2-pirrolilo, 3-pirrolilo, 3-isoxazolilo, 4-isoxazolilo, 5-isoxazolilo, 3-isotiazolilo, 4-isotiazolilo, 5-isotiazolilo, 3-pirazolilo, 4-pirazolilo, 5-pirazolilo, 2-oxazolilo, 4-oxazolilo, 5-oxazolilo, 2-tiazolilo, 4-tiazolilo, 5-tiazolilo, 2-imidazolilo, 4-imidazolilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y 1,3,4-triazol-2-ilo;

15 **heteroarilo de 5 miembros, que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno, unido a través de nitrógeno o heteroarilo 5 miembros benzocondensado, que contiene de uno a tres átomos de nitrógeno, unido a través de nitrógeno:** grupos heteroarilo de 5 miembros que, además de átomos de carbono, pueden contener de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno como miembros del anillo y en el que dos miembros de carbono del anillo adyacentes o un miembro de nitrógeno y un miembro de carbono del anillo adyacente pueden formar un puente mediante un grupo buta-1,3-dieno-1,4-diilo en el que uno o dos átomos de C pueden estar reemplazados por átomos de N, en el que uno o dos átomos de C pueden estar reemplazados por átomos de N, en el que estos anillos están unidos al esqueleto a través de uno de los miembros de nitrógeno del anillo, por ejemplo (pero no limitados a) 1-pirrolilo, 1-pirazolilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, 1-imidazolilo, 1,2,3-triazol-1-ilo y 1,3,4-triazol-1-ilo;

20 **heteroarilo de 6 miembros que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno:** grupos heteroarilo de 6 miembros que, además de átomos de carbono, puede contener de uno a tres o de uno a cuatro átomos de nitrógeno como miembros del anillo, por ejemplo (pero no limitados a) 2-piridinilo, 3-piridinilo, 4-piridinilo, 3-piridazinilo, 4-piridazinilo, 2-pirimidinilo, 4-pirimidinilo, 5-pirimidinilo, 2-pirazinilo, 1,3,5-triazin-2-ilo, 1,2,4-triazin-3-ilo y 1,2,4,5-tetrazin-3-ilo;

25 **heteroarilo de 5 miembros benzocondensado que contiene de uno a tres átomos de nitrógeno o un átomo de nitrógeno y un átomo de oxígeno o azufre:** por ejemplo (pero no limitados a) indol-1-ilo, indol-2-ilo, indol-3-ilo, indol-4-ilo, indol-5-ilo, indol-6-ilo, indol-7-ilo, benzoimidazol-1-ilo, benzoimidazol-2-ilo, benzoimidazol-4-ilo, benzoimidazol-5-ilo, indazol-1-ilo, indazol-3-ilo, indazol-4-ilo, indazol-5-ilo, indazol-6-ilo, indazol-7-ilo, indazol-2-ilo, 1-benzofuran-2-ilo, 1-benzofuran-3-ilo, 1-benzofuran-4-ilo, 1-benzofuran-5-ilo, 1-benzofuran-6-ilo, 1-benzofuran-7-ilo, 1-benzotiofen-2-ilo, 1-benzotiofen-3-ilo, 1-benzotiofen-4-ilo, 1-benzotiofen-5-ilo, 1-benzotiofen-6-ilo, 1-benzotiofen-7-ilo, 1,3-benzotiazol-2-ilo, 1,3-benzotiazol-4-ilo, 1,3-benzotiazol-5-ilo, 1,3-benzotiazol-6-ilo, 1,3-benzotiazol-7-ilo, 1,3-benzoxazol-2-ilo, 1,3-benzoxazol-4-ilo, 1,3-benzoxazol-5-ilo, 1,3-benzoxazol-6-ilo y 1,3-benzoxazol-7-ilo,

30 **heteroarilo de 6 miembros benzocondensado que contiene de uno a tres átomos de nitrógeno:** por ejemplo (pero no limitados a) quinolin-2-ilo, quinolin-3-ilo, quinolin-4-ilo, quinolin-5-ilo, quinolin-6-ilo, quinolin-7-ilo, quinolin-8-ilo, isoquinolin-1-ilo, isoquinolin-3-ilo, isoquinolin-4-ilo, isoquinolin-5-ilo, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo e isoquinolin-8-ilo;

35 **heterociclilo:** heterociclo de tres a quince miembros saturado o parcialmente insaturado que contiene de uno a cuatro heteroátomos del grupo oxígeno, nitrógeno o azufre: heterociclos mono-, bi- o tricíclicos que contienen, además de miembros de carbono en el anillo, de uno a tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o azufre o uno o dos átomos de oxígeno y/o azufre; si el anillo contiene varios átomos de oxígeno, estos no son directamente adyacentes; tales como, por ejemplo (pero no limitados a), oxiranilo, aziridinilo, 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2,4-dihidrotien-3-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-

5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropirano, 4-tetrahidropirano, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidrotiazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotiazin-3-ilo;

Cuando se mencionan combinaciones de varios radicales, tales como, por ejemplo, alquilcarbonilo Cx-Cy o alcoxilalquilo Cx-Cy, el término Cx-Cy representa en cada caso la suma de todos los átomos de carbono presentes en el fragmento completo. En este caso, X e Y representan cada uno un número entero, siendo el número Y mayor que el número X.

No se incluyen las combinaciones que atentan contra las leyes naturales y que por lo tanto el experto en la materia excluiría basándose en su conocimiento experto. Por ejemplo, se excluyen las estructuras anulares con tres o más átomos de O adyacentes.

15 **Ilustración de los procedimientos y los productos intermedios**

Los derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina de fórmula (I) se pueden preparar mediante diversas rutas. Los procedimientos viables se muestran esquemáticamente en lo sucesivo. A menos que se indique otra cosa, los radicales presentados tienen los significados ofrecidos anteriormente.

Los procedimientos de acuerdo con la invención para la preparación de compuestos de fórmula (I) se llevan a cabo, si fuera oportuno, usando uno o más coadyuvantes de reacción.

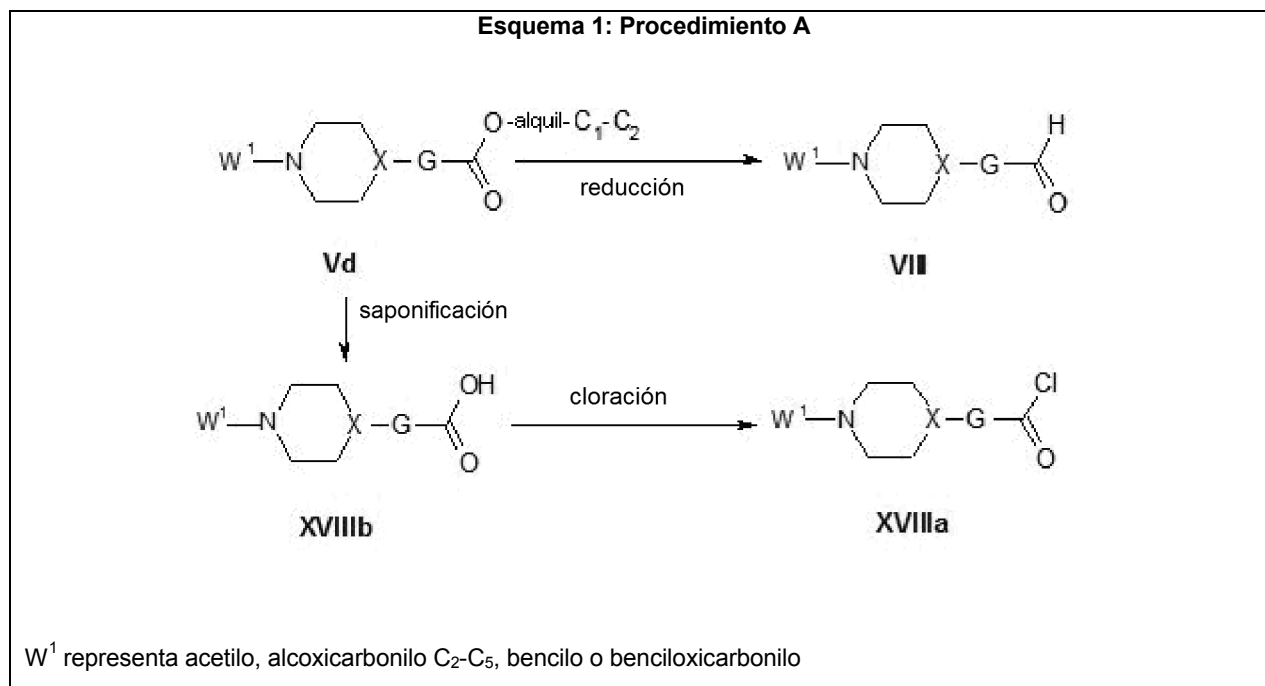
Coadyuvantes de reacción adecuados son, si fuera necesario, aceptores de ácidos o bases orgánicas o inorgánicas. Estos incluyen preferentemente acetatos, amidas, carbonatos, bicarbonatos, hidruros, hidróxidos o alcóxidos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, tales como, por ejemplo, acetato sódico, acetato potásico o acetato de calcio, amida de litio, amida sódica, amida potásica o amida de calcio, carbonato sódico, carbonato potásico o carbonato de calcio, bicarbonato sódico, bicarbonato potásico o bicarbonato de calcio, hidruro de litio, hidruro sódico, hidruro potásico o hidruro de calcio, hidróxido de litio, hidróxido sódico, hidróxido potásico o hidróxido de calcio, metóxido, etóxido, n- o i-propóxido, n-, i-, s- o t-butóxido sódico o metóxido, etóxido, n- o i-propóxido, n-, i-, s- o t-butóxido potásico; además también los compuestos orgánicos básicos de nitrógeno, tales como, por ejemplo, trimetilamina, trietilamina, tripropilamina, tributilamina, etildiisopropilamina, N,N-dimetilciclohexilamina, diciticlohexilamina, etildiciticlohexilamina, N,N-dimetil-anilina, N,N-dimetilbencilamina, piridina, 2-metil-, 3-metil-, 4-metil-, 2,4-dimetil-, 2,6-dimetil-, 3,4-dimetil- y 3,5-dimetilpiridina, 5-etil-2-metilpiridina, 4-dimetilaminopiridina, N-metilpiperidina, 1,4-diazabicyclo[2,2,2]octano (DABCO), 1,5-diazabicyclo[4,3,0]non-5-eno (DBN) o 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno (DBU).

Si fuera oportuno, los procedimientos de acuerdo con la invención se llevan a cabo usando uno o más diluyentes. Los diluyentes adecuados son prácticamente todos los disolventes orgánicos inertes. Estos incluyen, en particular, hidrocarburos alifáticos y aromáticos opcionalmente halogenados, tales como pentano, hexano, heptano, ciclohexano, éter de petróleo, bencina ligroína, benceno, tolueno, xileno, cloruro de metileno, cloruro de etileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, clorobenceno y o-diclorobenceno, éteres tales como éter dietílico y dibutil éter, glicol dimetil éter y diglicol dimetil éter, tetrahidrofurano y dioxano, cetonas, tales como acetona, metil etil cetona, metil isopropil cetona y metil isobutil cetona, ésteres, tales como acetato de metilo y acetato de etilo, nitrilos tales como, por ejemplo, acetonitrilo y propionitrilo, amidas tales como, por ejemplo, dimetilformamida, dimetilacetamida y N-metilpirrolidona y también dimetilsulfóxido, tetrametileno sulfona y hexametilfosforamida y DMPU.

En los procedimientos de acuerdo con la invención, las temperaturas de reacción pueden variar dentro de un intervalo relativamente amplio. En general, los procedimientos se llevan a cabo a temperaturas entre 0 °C y 250 °C, preferentemente a temperaturas entre 10 °C y 185 °C.

Los procedimientos de acuerdo con la invención se llevan a cabo generalmente a presión atmosférica. Sin embargo, es posible trabajar con una presión mayor o menor.

Para llevar a cabo los procedimientos de acuerdo con la invención, los materiales de partida necesarios se emplean en cada caso generalmente en cantidades aproximadamente equimolares. Sin embargo, también es posible usar un exceso relativamente grande de uno de los componentes empleados en cada caso.



En el Esquema 1 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmulas (VIII), (XVIIIb) y (XVIIIa) a partir de los correspondientes compuestos (Vd).

- Los compuestos de fórmula Vd se pueden preparar a partir de precursores disponibles en el mercado (véase, por ejemplo, la **Figura 1**) mediante procedimientos descritos en la bibliografía (véase, por ejemplo, Comprehensive Heterocyclic Chemistry, Vol. 4-6, A. R. Katritzky y C. W. Rees editores, Pergamon Press, Nueva York, 1984; Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, Vol. 2-4, A. R. Katritzky, C. R. Rees y E. F. Scruebe editores, Pergamon Press, Nueva York, 1996; y las series, The Chemistry of Heterocyclic Compounds, E. C. Taylor, editor, Wiley, Nueva York; los documentos WO 2008/064474; WO 2008/006794; WO 2006/133216; US 5,234,033 A; WO 2007/039177; WO 2007/014290; Org. Biomol. Chem., 2008, 1904.)

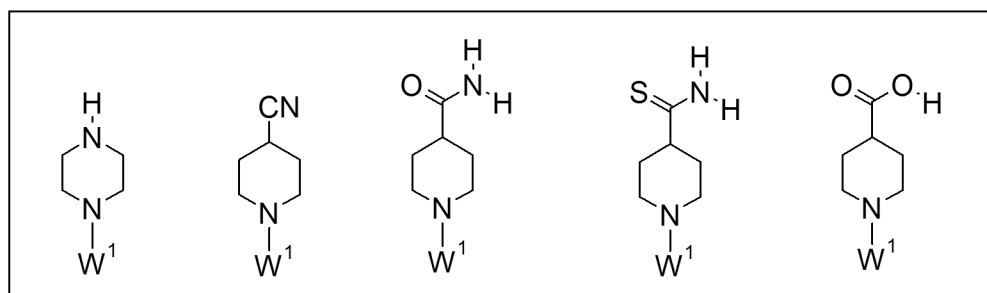
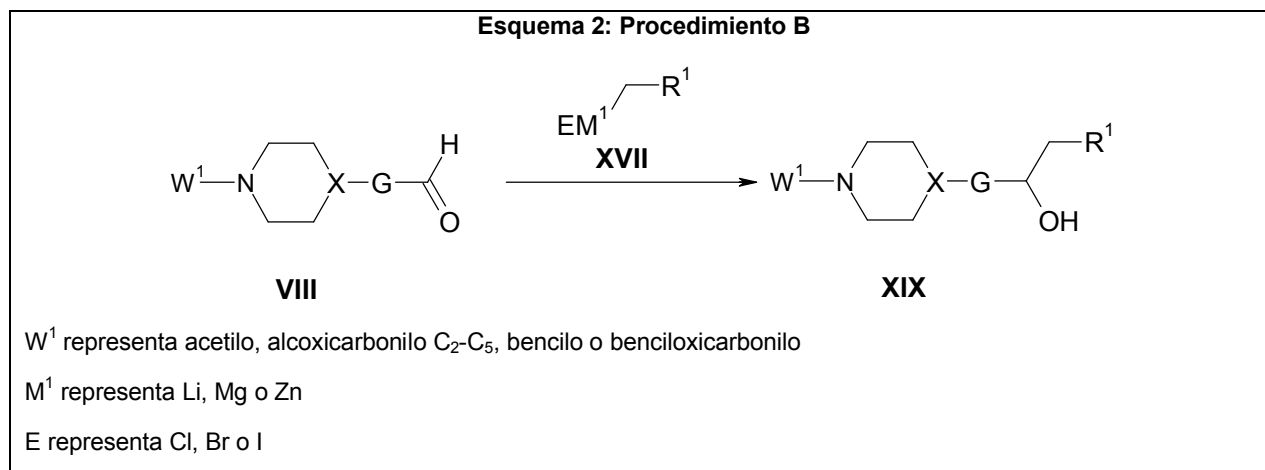


Figura 1

- El aldehído de fórmula (VIII) se puede preparar a partir de ésteres de alquilo C_1-C_2 de fórmula (Vd) por reducción con agentes reductores (por ejemplo hidruro de diisobutilaluminio). La reacción se lleva a cabo preferentemente en tetrahidrofurano a $-78^\circ C$, en atmósfera inerte (véase, por ejemplo, J. Med. Chem., 2001, 2319).

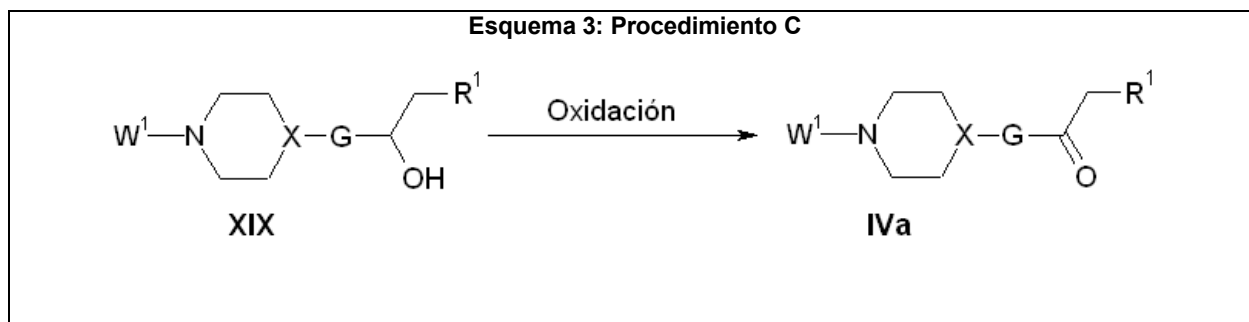
El ácido carboxílico de fórmula (XVIIIb) se puede preparar por hidrólisis del correspondiente éster de alquilo C_1-C_2 de fórmula (Vd) (véase, por ejemplo, el documento WO 2007/014290).

- Los compuestos de fórmula general (XVIIIa) se preparan a partir de los correspondientes ácidos de fórmula (XVIIIb) por cloración usando procedimientos conocidos en la literatura (por ejemplo Tetrahedron 2005, 61, 10827-10852 y la bibliografía citada en el mismo).



En el Esquema 2 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (XIX) a partir de los correspondientes compuestos (VIII) usando los reactivos organometálicos (XVII).

- 5 Los compuestos de fórmula (XIX) se preparan a partir del aldehído de fórmula (VIII) por adición del reactivo organometálico R¹-CH₂M¹E (XVII), M¹ = Mg, Li o Zn, E = Cl, Br o I). La reacción se lleva a cabo preferentemente en tetrahidrofurano o éter dietílico a -78 °C – 35 °C. De forma particularmente preferente, la reacción se lleva a cabo en tetrahidrofurano a -78 °C, en atmósfera inerte (véanse, por ejemplo, los documentos WO 2007/039177, WO 2006/066109). En el caso de compuestos de organocinc, se da preferencia al uso de ácidos de Lewis (por ejemplo BF₃·Et₂O).
- 10 El reactivo organometálico (XVII) está disponible en el mercado o se puede preparar a partir de precursores disponibles en el mercado mediante procedimientos descritos en la bibliografía (véase, por ejemplo, "Handbook of Functionalized Organometallics Vol. 1 y 2", Ed. P. Knochel, Weinheim, Wiley-VCH, 2005 y las referencias citadas en el mismo).
- 15 El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y la temperatura de reacción, pero es generalmente entre un par de minutos y 48 horas. Después de que la reacción haya finalizado, el compuesto (XIX) se separa de la mezcla de reacción usando una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía o, si fuera oportuno, también se pueden usar para la siguiente etapa sin purificación previa.



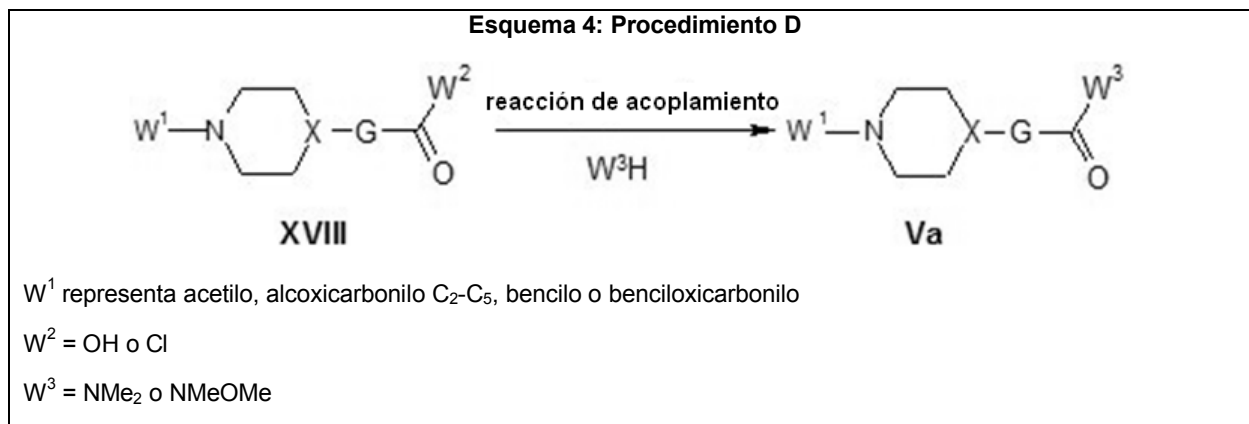
- 20 En el Esquema 3 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (IVa) a partir de los compuestos (XIX).

25 Los compuestos de fórmula (IVa) se preparan por oxidación del alcohol (XIX). Se pueden encontrar en la bibliografía numerosos procedimientos para la preparación de cetonas a partir de alcoholes secundarios (véase, por ejemplo, "Oxidation of Alcohols to Aldehydes and Ketones", Gabriel Tojo, Marcos Fernández, Springer Berlín, 2006, páginas 1-97 y la bibliografía citada en el mismo). La oxidación se lleva a cabo preferentemente en condiciones de Swern o usando peryodinato de Dess-Martin (véase, por ejemplo, J. Am. Chem. Soc. 1991, 113, 7277).

Son adecuados todos los disolventes que no son oxidados por un agente oxidante, tales como, por ejemplo, diclorometano, cloroformo o acetonitrilo, si fuera oportuno en presencia de un coadyuvante de reacción, por ejemplo un ácido (por ejemplo, ácido sulfúrico o ácido clorhídrico) o bien una base (por ejemplo, trietilamina o piridina).

La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperatura ambiente. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

Después de que la reacción haya finalizado, el compuesto (**IVa**) se retira de la mezcla de reacción usando una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía o, si fuera oportuno, también se pueden usar para la siguiente etapa sin purificación previa.



En el Esquema 4 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (**Va**) a partir de los correspondientes compuestos (**XVIII**).

10 Un compuesto de fórmula general (**Va**) se prepara mediante una reacción de acoplamiento de un compuesto de fórmula general (**XVIIIa**) (en la que W^2 es cloro) con uno de los compuestos siguientes: N,O-dimetilhidroxamina, sal de HCl de N,O-dimetilhidroxamina, sal de HCl de dialquilamina o dialquilamina, si fuera oportuno en presencia de un neutralizador de ácido/una base (véanse, por ejemplo, los documentos WO 2008/013622, WO 2008/013925 y WO 2006/018188).

15 Se emplea al menos un equivalente de un neutralizador de ácido/una base (por ejemplo base de Hünig, trietilamina o neutralizadores poliméricos de ácido disponibles en el mercado), basado en el material de partida de fórmula general (**XVIIIa**). Si el material de partida es una sal, se requieren al menos dos equivalentes del neutralizador de ácido.

20 La reacción se lleva a cabo habitualmente a temperaturas de 0 °C a 100 °C y preferentemente de 20 °C a 30 °C, pero también se puede llevar a cabo a la temperatura de reflujo de la mezcla de reacción. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

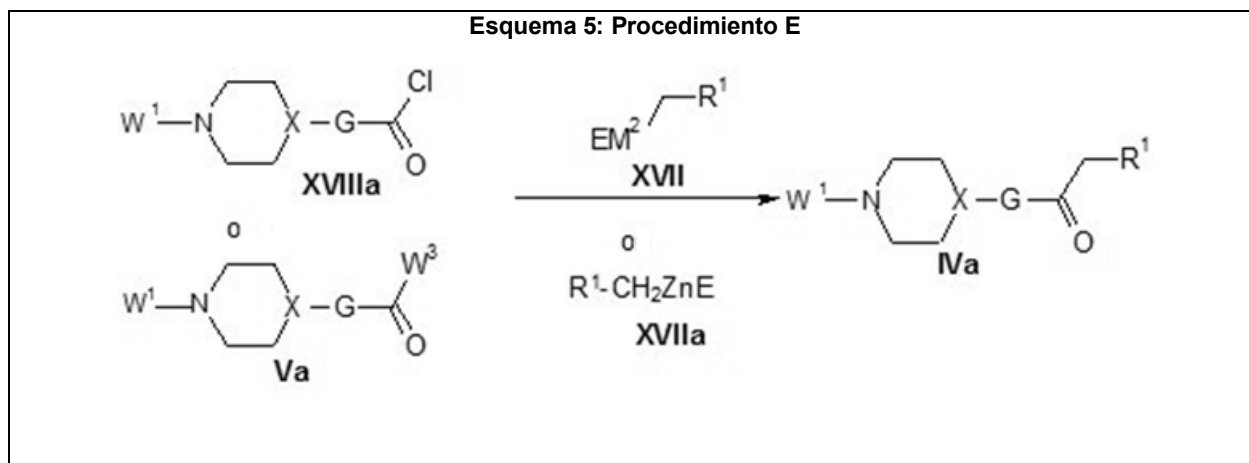
25 De forma alternativa, un compuesto de fórmula (**Va**) se puede sintetizar a partir del correspondiente compuesto de fórmula (**XVIIIb**) (en el que W^2 representa hidroxilo) usando N,O-dimetilhidroxamina, sal de HCl de N,O-dimetilhidroxamina, dialquilamina o sal de HCl de dialquilamina en presencia de un reactivo de acoplamiento, de forma análoga a los procedimientos descritos en la bibliografía (por ejemplo Tetrahedron, 2005, 61, 10827 y las referencias citadas en el mismo).

30 Los reactivos de acoplamiento adecuados son, por ejemplo, reactivos de acoplamiento peptídico (por ejemplo N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida mezclada con 4-dimetilaminopiridina, N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida mezclada con 1-hidroxibenzotriazol, hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio, hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio, etc.).

Si fuera oportuno, se puede emplear en la reacción una base, tal como, por ejemplo, trietilamina o base de Hünig.

35 La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperaturas de 0 °C a 100 °C y de forma particularmente preferente de 0 °C a 30 °C. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

40 El procedimiento D de acuerdo con la invención se lleva a cabo preferentemente usando uno o más diluyentes. Después de que la reacción haya finalizado, los compuestos (**Va**) se retiran de la mezcla de reacción usando una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía o, si fuera oportuno, también se pueden usar para la siguiente etapa sin purificación previa.



En el Esquema 5 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula **(IVa)** a partir de los correspondientes compuestos **(Va)** o **(XVIIIa)** usando un reactivo organometálico **(XVII o XVIIa)**.

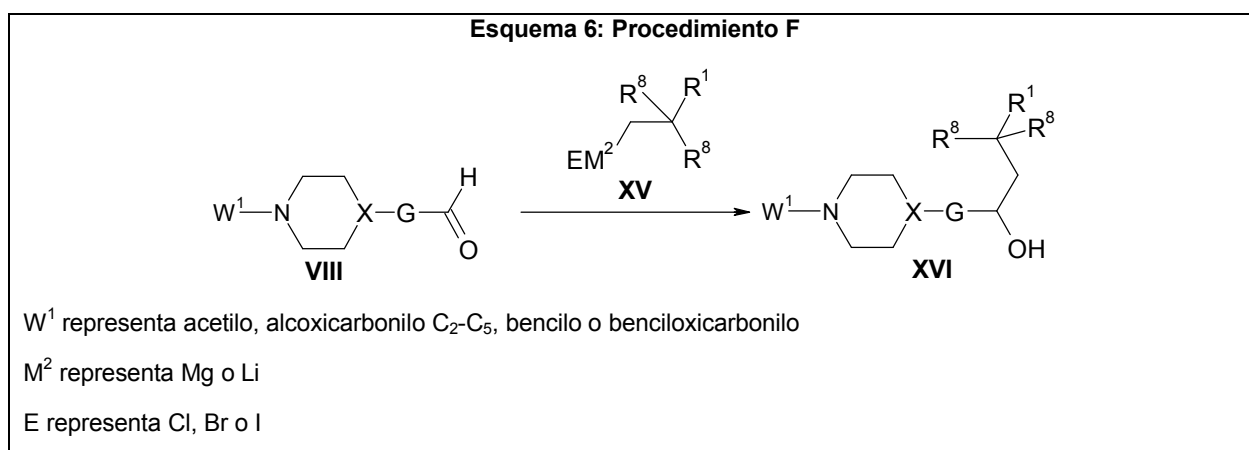
5 Los compuestos de fórmula **(IVa)** se preparan a partir de la amida **(Va)**, en la que W^3 representa NMeOMe o NMe₂ por adición de un reactivo organometálico $R^1-CH_2M^2E$ **(XVII)**, $M^2 = Mg$ o Li . La reacción se lleva a cabo preferentemente en tetrahidrofurano a $-78^\circ C$, en atmósfera inerte (véase, por ejemplo, J. Med. Chem., 2009, 52, 1701).

10 Se emplean **(Va)** y el reactivo organometálico (en el que $M^2 = Mg$ o Li) en cantidades equimolares; sin embargo, si fuera oportuno, también se puede usar el reactivo organometálico en exceso. La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperatura ambiente. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

15 De forma alternativa, los compuestos de fórmula **(IVa)** se preparan a partir del cloruro **(XVIIIa)** por adición de un reactivo de organocinc **(XVIIa)**, R^1-CH_2ZnE ($E = Cl, Br$ o I), si fuera oportuno en presencia de un catalizador de paladio. Preferentemente, la reacción se lleva a cabo en presencia de $Pd(PPh_3)_4$ o $PdCl_2$ en tetrahidrofurano a temperatura ambiente, en atmósfera inerte (véanse, por ejemplo, el documento WO 2007/070818; Org. Lett., 2008, 10, 1107). La cantidad de catalizador usada es del 0,1-90 % en moles basado en el material de partida; preferentemente, se usa el 1-30 % en moles de catalizador, basado en el material de partida.

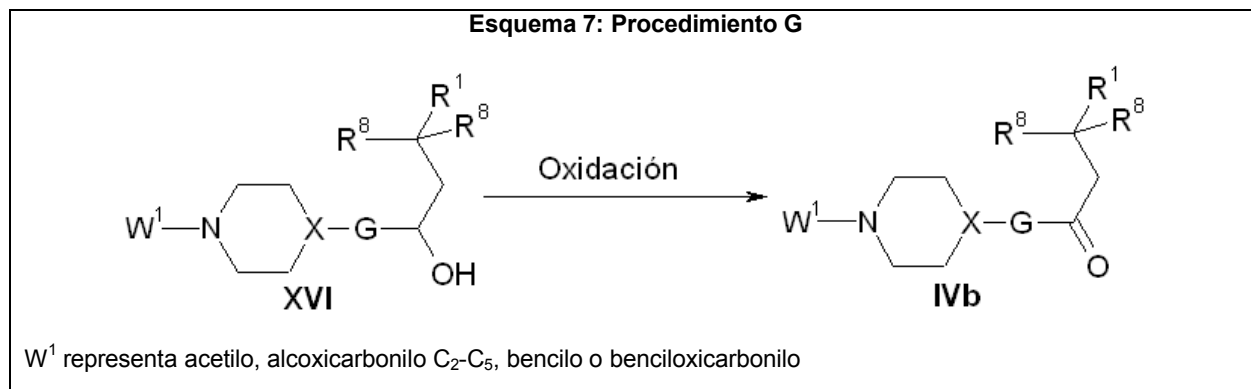
20 Se usan **(XVIIIa)** y el compuesto de organocinc en cantidades equimolares. Sin embargo, el compuesto de organocinc también se puede usar en exceso. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

25 El procedimiento E de acuerdo con la invención se lleva a cabo preferentemente usando uno o más diluyentes. Después de que la reacción haya finalizado, el compuesto **(IVa)** se retira de la mezcla de reacción usando una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía o, si fuera oportuno, también se pueden usar para la siguiente etapa sin purificación previa.



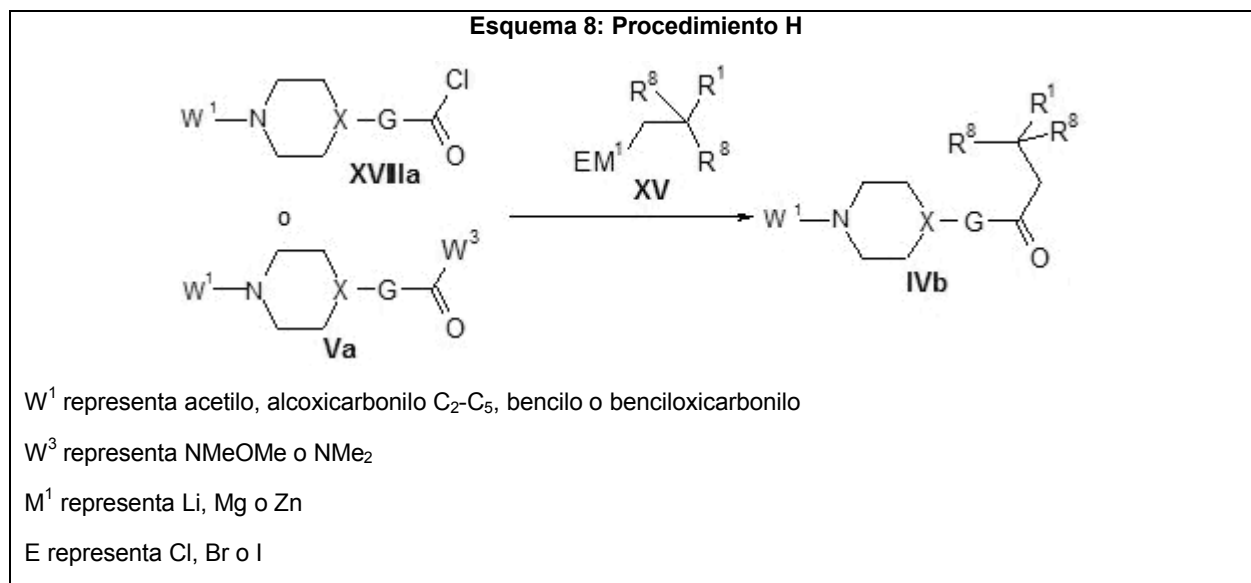
En el Esquema 6 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (XVI) a partir de los correspondientes compuestos (VIII) usando un reactivo organometálico (XV).

El procedimiento F se lleva a cabo de forma análoga al procedimiento B (véase anteriormente).



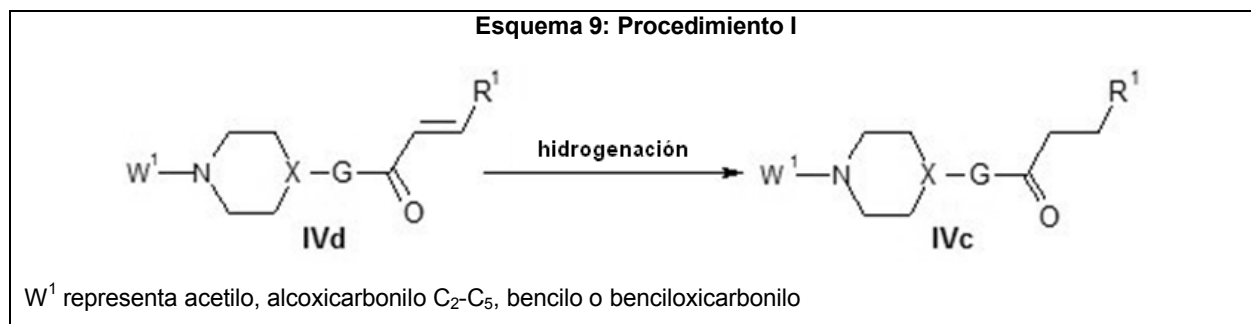
5 En el Esquema 7 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (IVb) a partir de los correspondientes compuestos (XVI).

El procedimiento G se lleva a cabo de forma análoga al procedimiento C (véase anteriormente).



10 En el Esquema 8 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (IVb) a partir de los correspondientes compuestos (Va o XVIIIa) usando un reactivo organometálico (XV).

El procedimiento H se lleva a cabo de forma análoga al procedimiento E (véase anteriormente).



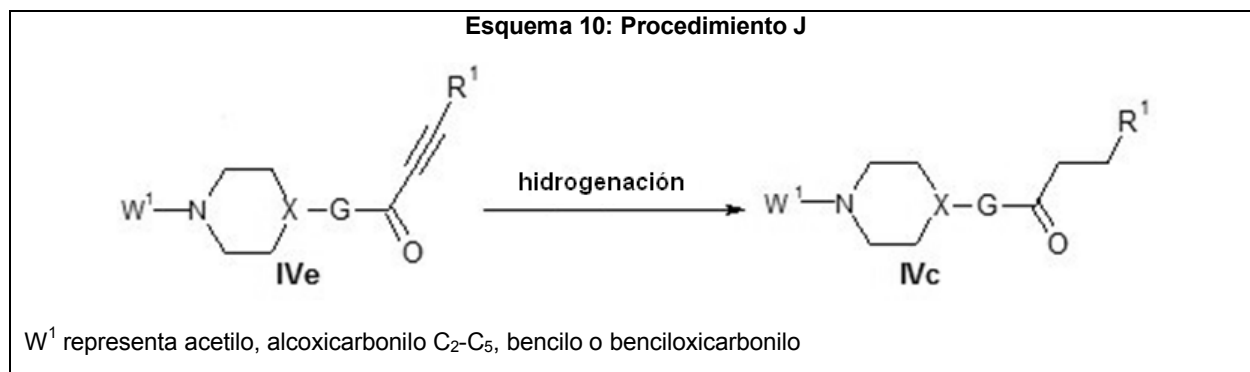
En el Esquema 9 se muestra una manera de preparar el producto intermedio (**IVc**) a partir del compuesto (**IVd**).

Se convierte un doble enlace en un enlace sencillo por hidrogenación usando un catalizador adecuado. El catalizador para el procedimiento I se selecciona entre los catalizadores de hidrogenación conocidos en la bibliografía de los procedimientos de hidrogenación ("Reductions in Organic Chemistry", Miloš Hudlický, John Wiley & Sons, 1984), tales como, por ejemplo, paladio sobre carbono activado o catalizador de Pearlmans ($\text{Pd}(\text{OH})_2$ sobre carbono activado).

El procedimiento I de acuerdo con la invención se lleva a cabo preferentemente usando uno o más diluyentes. Los disolventes preferentes son *N,N*-dimetilformamida, acetato de etilo y etanol.

La cantidad de catalizador usada es del 0,1-90 % en moles basado en el material de partida; preferentemente, se usa el 1-30 % en moles de catalizador, basado en el material de partida. La reacción puede llevarse a cabo a presión superatmosférica (100-100000 kPa) o preferentemente a presión atmosférica. La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperaturas de 0 °C – 150 °C y de forma particularmente preferente a temperatura ambiente. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre media hora y 72 horas.

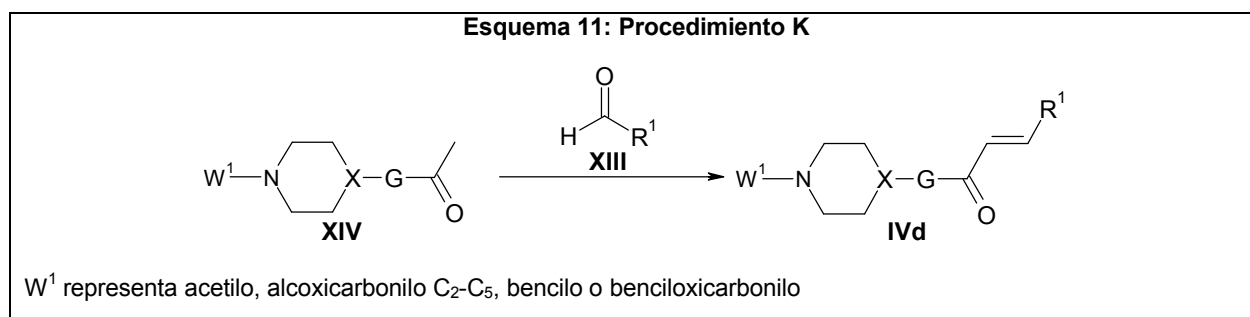
Después de que la reacción haya finalizado, los compuestos (**IVc**) se separan de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía o, si fuera oportuno, también se pueden usar para la siguiente etapa sin purificación previa.



En el Esquema 10 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (**IVc**) a partir de los correspondientes compuestos (**IVe**).

Se convierte un triple enlace en un enlace sencillo por hidrogenación usando un catalizador adecuado.

Se emplea el mismo procedimiento que ya se ha descrito en el Esquema 9 (procedimiento I).



En el Esquema 11 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (**IVd**) a partir de los correspondientes compuestos (**XIV**) usando un aldehído (**XIII**).

Los compuestos (**XIV**) se pueden sintetizar a partir de los compuestos (**VIII**) aplicando inicialmente el procedimiento B y a continuación el procedimiento C a los compuestos de fórmula (**XIII**).

Los compuestos (**XIV**) se pueden sintetizar a partir de los compuestos (**Va**) aplicando inicialmente el procedimiento E a los compuestos de fórmula (**Va**).

El aldehído (**XIII**) está disponible en el mercado o se puede preparar a partir de precursores disponibles en el mercado mediante procedimientos descritos en la bibliografía.

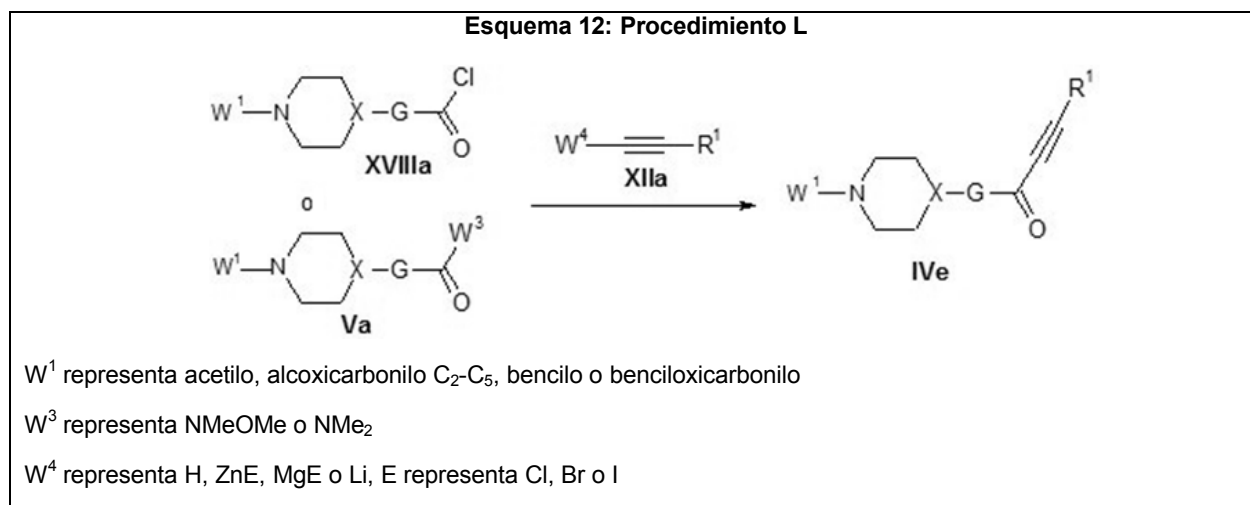
5 Un compuesto de fórmula general (**IVd**) se puede sintetizar por condensación aldólica de un compuesto que tiene la correspondiente fórmula general (**XIV**) con un aldehído (**XIII**) en presencia de un ácido o una base (véanse, por ejemplo, Synthetic Communications, 2009, 39, 2789; Organic Letters, 2009, 11, 3562; Pharmazie, 1988, 43, 82).

Las bases adecuadas son, por ejemplo, LiOH, NaOH o KOH, por ejemplo en presencia de agua junto con un cosolvente, preferentemente THF, tolueno y/o metanol, para facilitar la disolución del éster. El material de partida y la base se emplean en cantidades equimolares; sin embargo, la base también se puede usar, si fuera necesario, en exceso o en cantidades catalíticas.

10 Los ácidos adecuados son, por ejemplo, H₂SO₄ o HCl, por ejemplo en presencia de agua junto con un cosolvente, preferentemente THF, tolueno y/o metanol, para facilitar la disolución del éster. El material de partida y el ácido se emplean en cantidades equimolares; sin embargo, el ácido también se puede usar, si fuera necesario, en exceso o en cantidades catalíticas.

15 Se usan (**XIV**) y (**XIII**) en cantidades equimolares. Sin embargo, si fuera oportuno, el aldehído (**XIII**) también se puede usar en exceso. La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperaturas de 0 °C a 100 °C y de forma particularmente preferente a temperatura ambiente. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

20 El procedimiento K de acuerdo con la invención se lleva a cabo preferentemente usando uno o más diluyentes. Después de que la reacción haya finalizado, el compuesto (**IVd**) se retira de la mezcla de reacción usando una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía o, si fuera oportuno, también se pueden usar para la siguiente etapa sin purificación previa.



25 En el Esquema 12 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (**IVe**) a partir de los correspondientes compuestos (**Va** o **XVIIIa**) usando un alquino de fórmula (**XIIa**).

De forma análoga al procedimiento descrito anteriormente (procedimiento E), es posible sintetizar los compuestos (**IVe**) a partir de los compuestos (**Va**), usando un reactivo organometálico (**XVIIa**), en el que W⁴ representa ZnE, MgE o Li.

30 El reactivo organometálico (**XIIA**) está disponible en el mercado o se puede preparar a partir de precursores disponibles en el mercado mediante procedimientos descritos en la bibliografía (véase, por ejemplo, "Handbook of Functionalized Organometallics Vol. 1 y 2", Ed. P. Knochel, Weinheim, Wiley-VCH, 2005 y las referencias citadas en el mismo).

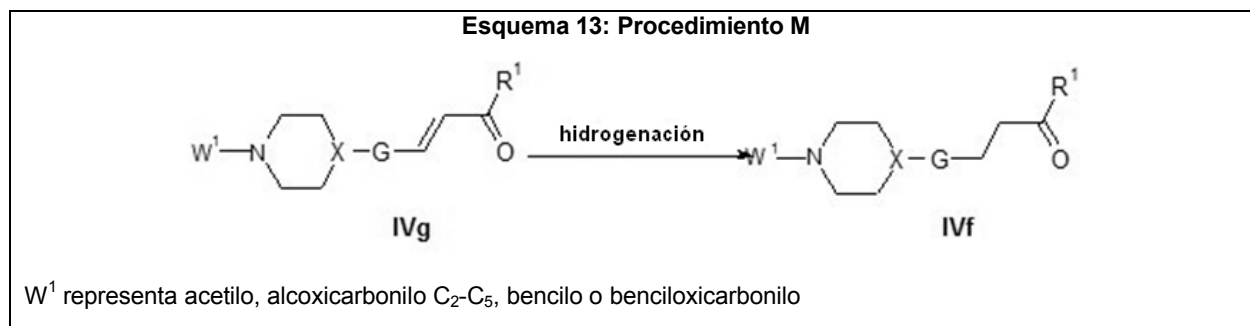
35 De forma alternativa, se puede preparar un compuesto de fórmula general (**IVe**) a partir del material de partida de fórmula (**XVIIIa**) por acoplamiento cruzado catalizado con paladio de forma análoga a los procedimientos descritos en la bibliografía (véase, por ejemplo, Synthesis, 2003, 2815). Preferentemente, (**XVIIIa**) se convierte en la cetona (**IVe**) usando un alquino de fórmula (**XIIa**), en el que W⁴ es H, en presencia de un catalizador tal como, por ejemplo, [(n-ali)PdCl]₂, Pd(OAc)₂, PdCl₂(CH₃CN)₂, Pd(PPh₃)₄ o PdCl₂(PPh₃)₂ y también, si fuera oportuno, en presencia de cocatalizadores adicionales tales como, por ejemplo, CuI, Cs₂CO₃ y trietilamina, por ejemplo en una mezcla de disolventes de DMF o THF a 0-80 °C y en atmósfera inerte. La cantidad de catalizador usada es del 0,1-90 % en moles basado en el material de partida; preferentemente, se usa el 0,5-30 % en moles de catalizador, basado en el

40

material de partida.

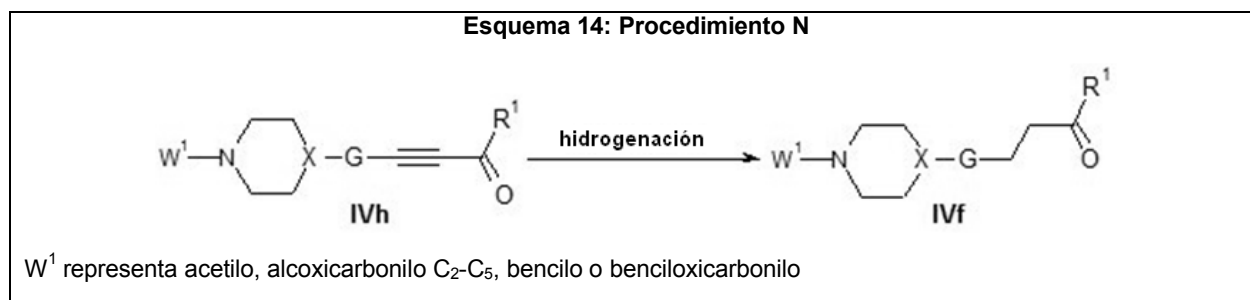
El alquino (**XIIa**) está disponible en el mercado o se puede preparar a partir de precursores disponibles en el mercado mediante procedimientos descritos en la bibliografía.

- 5 El procedimiento L de acuerdo con la invención se lleva a cabo preferentemente usando uno o más diluyentes. Después de que la reacción haya finalizado, el compuesto (**IVe**) se retira de la mezcla de reacción usando una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía o, si fuera oportuno, también se pueden usar para la siguiente etapa sin purificación previa.



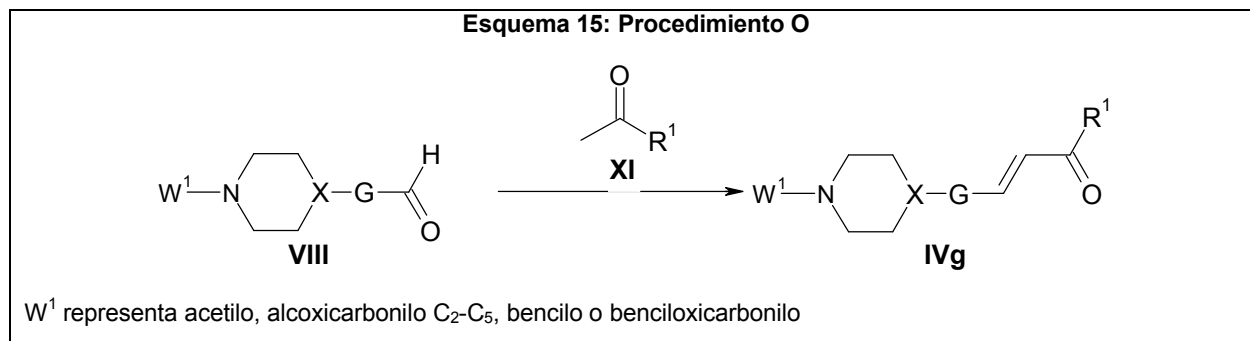
- 10 En el Esquema 13 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (**IVf**) a partir de los correspondientes compuestos (**IVg**).

Se emplea el mismo procedimiento que ya se ha descrito en el Esquema 9 (procedimiento I).



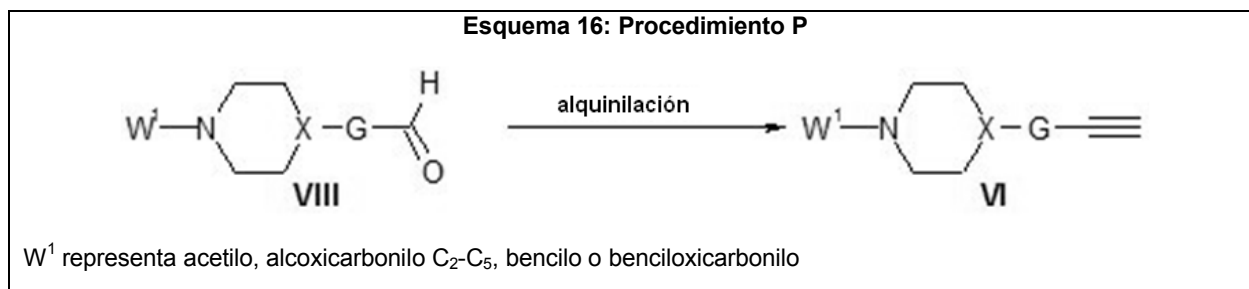
- 15 En el Esquema 14 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (**IVf**) a partir de los correspondientes compuestos (**IVh**).

Se emplea el mismo procedimiento que ya se ha descrito en el Esquema 9 (procedimiento I).



En el Esquema 15 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (**IVg**) a partir de los correspondientes compuestos (**VIII**) usando una cetona (**XI**).

- 20 El procedimiento O se lleva a cabo de forma análoga al procedimiento K.



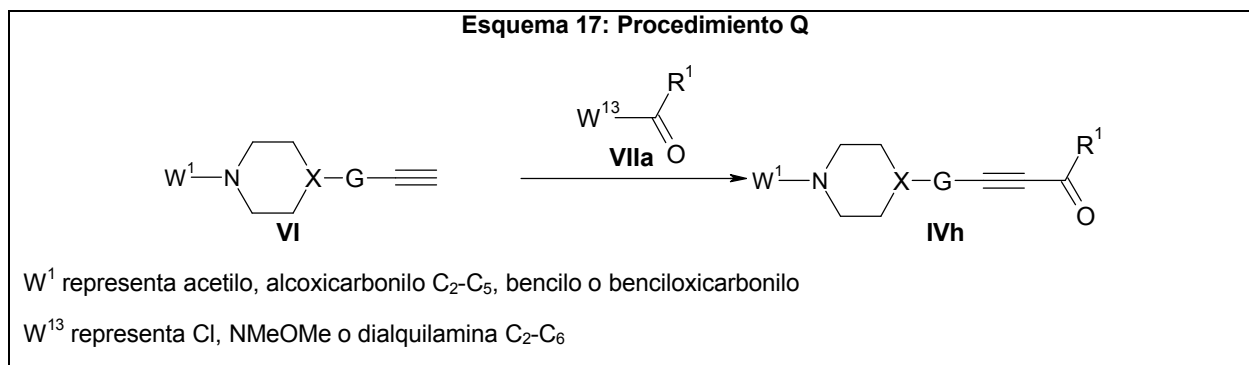
En el Esquema 16 se muestra una manera de preparar el producto intermedio (VI) a partir del compuesto (VIII).

Se conoce en la bibliografía que la alquilación de aldehídos se puede llevar a cabo mediante una reacción de Corey-Fuchs (Tetrahedron Lett., 1972, 36, 3769) o una homologación de Seyferth-Gilbert (véase, por ejemplo, J. Org. Chem., 1996, 61, 2540). De forma alternativa, el alquino (VI) también se puede preparar a partir del aldehído (VIII) usando el reactivo de Bestmann-Ohira de forma análoga a los procedimientos de la bibliografía (véase, por ejemplo, Synthesis, 2004, 59). Preferentemente, las alquilaciones se llevan a cabo usando el reactivo de Bestmann-Ohira en metanol o etanol en presencia de carbonato potásico o carbonato sódico.

El procedimiento P de acuerdo con la invención se lleva a cabo preferentemente usando uno o más diluyentes. Se pueden usar en la reacción todas las bases conocidas. Se tiene que añadir al menos un equivalente de la base (por ejemplo óxidos, hidróxidos y carbonatos de metales alcalinos y metales alcalinotérreos) al reactivo de Bestmann-Ohira y la base se puede usar en exceso, si fuera oportuno.

El aldehído (VIII) y el reactivo de alquilación se emplean en cantidades equimolares; sin embargo, el reactivo de Bestmann-Ohira se puede usar, si fuera oportuno, en exceso. La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperaturas de $-100\text{ }^\circ\text{C}$ a $60\text{ }^\circ\text{C}$ y de forma particularmente preferente de $-78\text{ }^\circ\text{C}$ a $40\text{ }^\circ\text{C}$. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

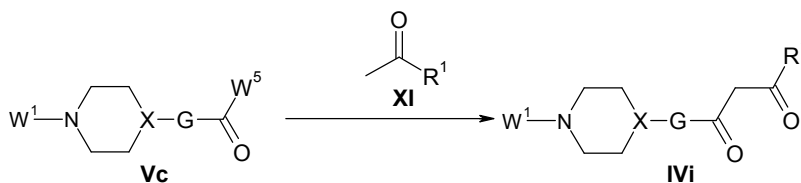
Después de que la reacción haya finalizado, los compuestos (VI) se retiran de la mezcla de reacción usando una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía o, si fuera oportuno, también se pueden usar para la siguiente etapa sin purificación previa.



En el Esquema 17 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (IVh) a partir de los correspondientes compuestos (VI) usando un compuesto de fórmula (VIIa).

El procedimiento Q se lleva a cabo de forma análoga al procedimiento L.

Esquema 18: Procedimiento R



W^1 representa acetilo, alcoxicarbonilo C_2-C_5 , bencilo o benciloxicarbonilo

W^5 representa metoxi, etoxi, cloro, $N(Me)OMe$

En el Esquema 18 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (IVi) a partir de los correspondientes compuestos (Vc) usando una cetona (XI).

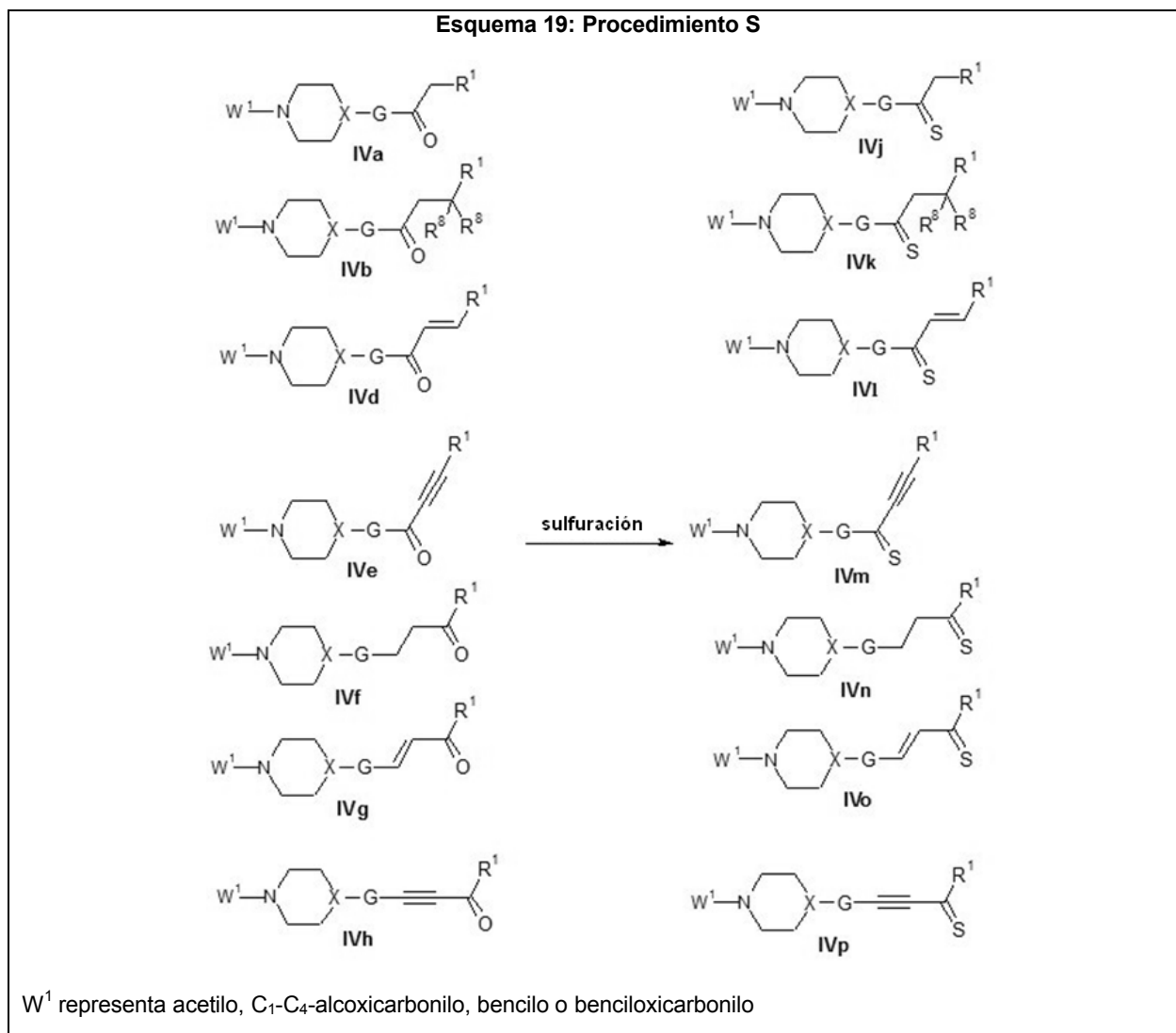
5 Un compuesto de fórmula general (IVi) se puede sintetizar por reacción de un compuesto que tiene la correspondiente fórmula general (Vc) con una cetona (XI) en presencia de una base (véanse, por ejemplo, el documento WO 2008/004100; Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 2008, 18(17), 4859).

10 Se pueden emplear todas las bases adecuadas conocidas. Se da preferencia al uso de hexametildisilazida de litio, hexametildisilazida sódica, hexametildisilazida potásica, metóxido sódico, metóxido potásico, etóxido sódico, metóxido potásico y diisopropilamida de litio para la reacción. Preferentemente, se tiene que añadir al menos un equivalente de la base a la cetona de fórmula general (XI); si fuera oportuno, la base se puede añadir en exceso.

El procedimiento R de acuerdo con la invención se lleva a cabo preferentemente usando uno o más diluyentes.

15 El compuesto (Vc) y la cetona (XI) se emplean en cantidades equimolares. La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperaturas de $-100\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $100\text{ }^{\circ}\text{C}$ y de forma particularmente preferente de $-78\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $40\text{ }^{\circ}\text{C}$. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

Después de que la reacción haya terminado, los compuestos (IVi) se separan de la mezcla de reacción mediante una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía o, si fuera oportuno, también se pueden usar para la siguiente etapa sin purificación previa.



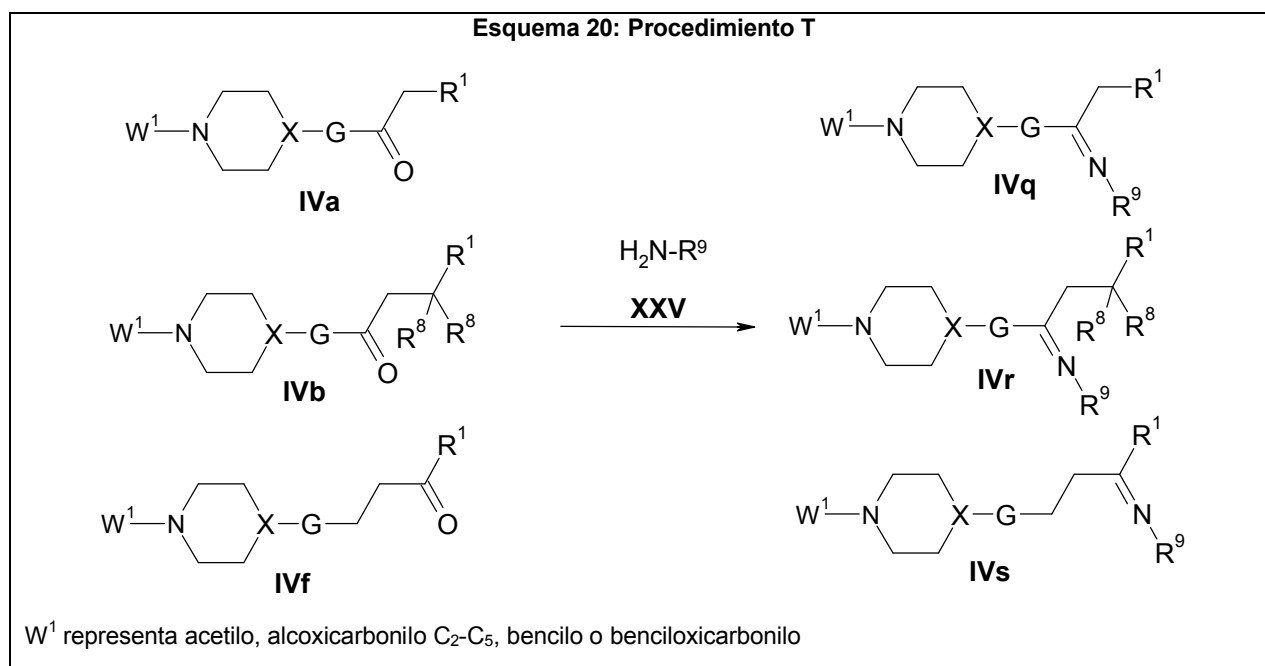
En el Esquema 19 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmulas (IVj)-(IVp) a partir de los correspondientes compuestos (IVa), (IVb), (IVd)-(IVh).

5 El procedimiento S de acuerdo con la invención se lleva a cabo preferentemente usando uno o más diluyentes. Los disolventes preferentes son cloroformo y 1,2-dimetoxietano.

Los reactivos azufrantes adecuados son, por ejemplo el reactivo de Lawesson (véanse Tetrahedron 1986, 42, 6555-6564, Tetrahedron Lett. 1993, 46, 7459-7462) y pentasulfuro de fósforo. El material de partida y el reactivo azufrante se emplean en cantidades equimolares; sin embargo, el reactivo azufrante también se puede usar, si fuera oportuno, en exceso.

10 La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperaturas de 0 °C – 150 °C y de forma particularmente preferente de 0 °C a 100 °C. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

15 Después de que la reacción haya finalizado, los compuestos (IVj)-(IVp) se retiran de la mezcla de reacción usando una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía.



Un compuesto de fórmula general (IVq)-(IVs) se puede sintetizar mediante una reacción de condensación de un compuesto de la correspondiente fórmula general (IVa), (IVb) o (IVf) con un sustrato de fórmula general (XXV), si fuera oportuno en presencia de un ácido, un neutralizador de ácido/una base o un intercambiador iónico básico.

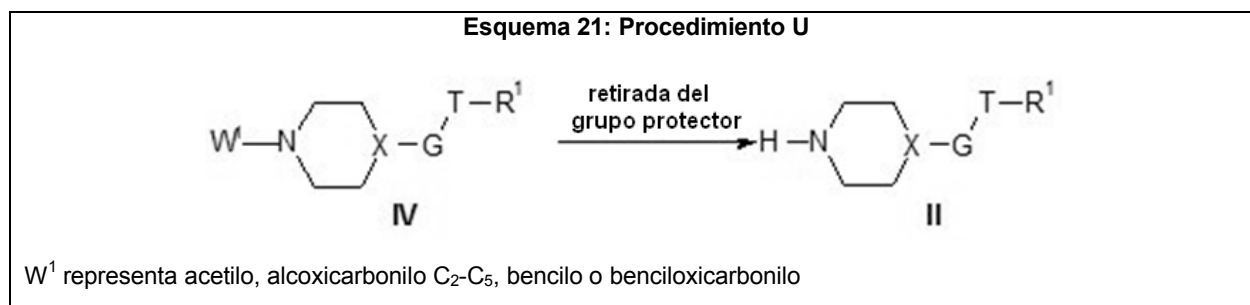
- 5 El compuesto (XXV) o las correspondientes sales de ácido clorhídrico están disponibles en el mercado o se pueden preparar mediante procedimientos descritos en la bibliografía (véanse, por ejemplo, Chem. Eur. J. 2005, 11, 6974-6981 y Chem. Soc. Rev., 2001, 30, 205-213).

Si fuera oportuno, se puede usar en la reacción un ácido tal como, por ejemplo, ácido clorhídrico o una base tal como, por ejemplo, trietilamina, base de Hünig o un intercambiador iónico básico tal como, por ejemplo, Amberlyst A21.

El procedimiento T de acuerdo con la invención se lleva a cabo preferentemente usando uno o más diluyentes. El disolvente preferente es etanol.

La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperaturas de 0 °C – 100 °C y de forma particularmente preferente de 0 °C – 30 °C. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

Después de que la reacción haya finalizado, los compuestos (IVq)-(IVs) se retiran de la mezcla de reacción usando una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía o, si fuera oportuno, también se pueden usar para la siguiente etapa sin purificación previa.



20 En el Esquema 21 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (II) a partir de los correspondientes compuestos (IV).

Un compuesto de fórmula (II) se convierte en un compuesto de fórmula (IV) usando procedimientos adecuados para la retirada de grupos protectores, cuyos procedimientos se describen en la bibliografía ("Protective Groups in

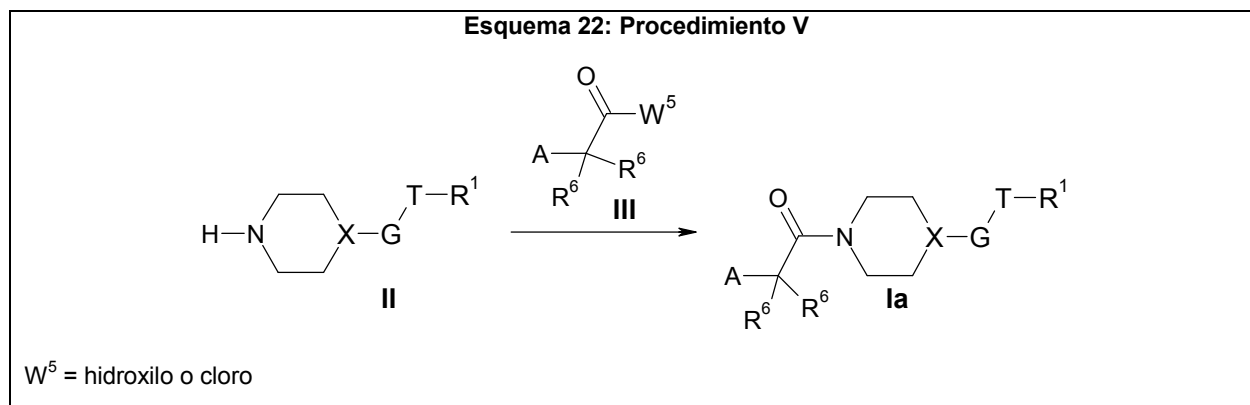
Organic Synthesis"; Tercera Edición; 1999, 494 y la bibliografía citada en el mismo).

5 Los grupos protectores terc-butoxicarbonilo y benciloxicarbonilo se pueden retirar en medio ácido (por ejemplo usando ácido clorhídrico o ácido trifluoroacético). Los grupos protectores acetilo se pueden retirar en condiciones básicas (usando, por ejemplo, carbonato potásico o carbonato de cesio). Los grupos protectores bencilicos se pueden retirar hidrogenolíticamente usando hidrógeno en presencia de un catalizador (por ejemplo paladio sobre carbono activado).

Los ácidos que se pueden usar para esta reacción de desprotección de los grupos t-butoxicarbonilo y benciloxicarbonilo son, por ejemplo, ácido trifluoroacético, ácido clorhídrico u otros ácidos, como se describe en la bibliografía (por ejemplo "Protective Grupos in Organic Synthesis"; Tercera Edición; 1999; p. 494).

10 El procedimiento U de acuerdo con la invención se lleva a cabo preferentemente usando uno o más diluyentes. La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperaturas de 0 °C a +150 °C y de forma particularmente preferente a temperatura ambiente. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre media hora y 72 horas.

15 Después de que la reacción haya finalizado, los compuestos (II) se retiran de la mezcla de reacción usando una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía o, si fuera oportuno, también se pueden usar para la siguiente etapa sin purificación previa. Además, es posible aislar el compuesto de fórmula general (II) en forma de una sal, por ejemplo en forma de clorhidrato o trifluoroacetato.



20 En el Esquema 22 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (Ia) a partir de los correspondientes compuestos (II) usando los compuestos (III).

Los compuestos (III) se pueden preparar mediante procedimientos descritos en la bibliografía (véanse, por ejemplo, los documentos WO 2008/013622 y WO 2008/013925).

25 Un compuesto de fórmula general (Ia) se puede sintetizar de forma análoga a los procedimientos descritos en la bibliografía (véase, por ejemplo, el documento WO 2007/147336) por reacción de acoplamiento de un compuesto de la correspondiente fórmula general (II) con un sustrato de fórmula general (III), en el que W⁵ representa cloro, si fuera oportuno en presencia de un neutralizador de ácido/una base.

30 Se emplea al menos un equivalente de un neutralizador de ácido/una base (por ejemplo base de Hünig, trietilamina o neutralizadores poliméricos de ácido disponibles en el mercado), basado en el material de partida de fórmula general (II). Si el material de partida es una sal, se requieren al menos dos equivalentes del neutralizador de ácido.

Los materiales de partida se emplean en cantidades equimolares. La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperaturas de 0 °C a 100 °C y de forma particularmente preferente de 20 °C a 30 °C. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

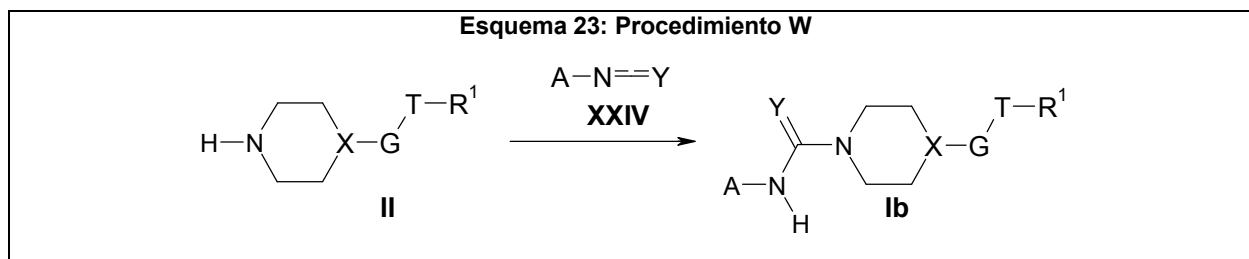
35 De forma alternativa, un compuesto de fórmula (Ia) también se puede sintetizar a partir del correspondiente compuesto de fórmula (II) usando un sustrato de fórmula (III), en el que W⁵ representa hidroxilo, en presencia de un agente de acoplamiento de forma análoga a los procedimientos descritos en la bibliografía (por ejemplo Tetrahedron 2005, 61, 10827-10852 y las referencias citadas en el mismo).

40 Los agentes de acoplamiento adecuados son, por ejemplo, agentes de acoplamiento peptídico (por ejemplo N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida mezclada con 4-dimetilaminopiridina, N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida mezclada con 1-hidroxibenzotriazol, hexafluorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio,

hexafluorofosfato de O-(7-azabenzotriazol-1-il)-N,N,N',N'-tetrametiluronio, etc.).

La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperaturas de 0 °C a 100 °C y de forma particularmente preferente de 0 °C a 30 °C. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

- 5 El procedimiento V de acuerdo con la invención se lleva a cabo preferentemente usando uno o más diluyentes. Después de que la reacción haya finalizado, los compuestos (**la**) se retiran de la mezcla de reacción usando una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía.



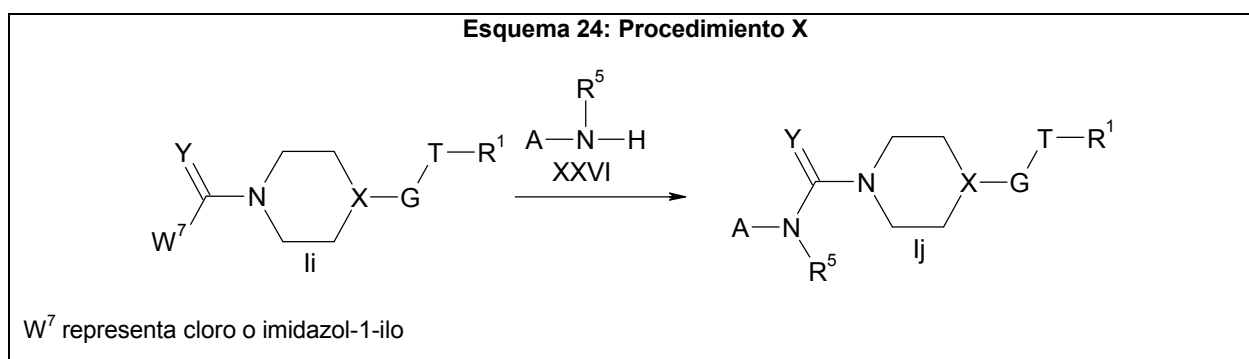
- 10 En el Esquema 23 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (**lb**) a partir de los correspondientes compuestos (**II**) usando los compuestos (**XXIV**).

- 15 Un compuesto de fórmula general (**lb**) se puede sintetizar de forma análoga a los procedimientos descritos en la bibliografía (véase, por ejemplo, el documento WO 2009/055514) por reacción de acoplamiento de un compuesto de la correspondiente fórmula general (**II**) con un sustrato de fórmula general (**XXIV**), si fuera oportuno en presencia de un neutralizador de ácido/una base tal como, por ejemplo, trietilamina, 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno o base de Hünig.

El procedimiento W de acuerdo con la invención se lleva a cabo preferentemente usando uno o más diluyentes.

- 20 Los materiales de partida se emplean en cantidades equimolares. La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperaturas de 0 °C a 100 °C y de forma particularmente preferente de 20 °C a 30 °C. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

Después de que la reacción haya finalizado, los compuestos (**lb**) se retiran de la mezcla de reacción usando una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía.

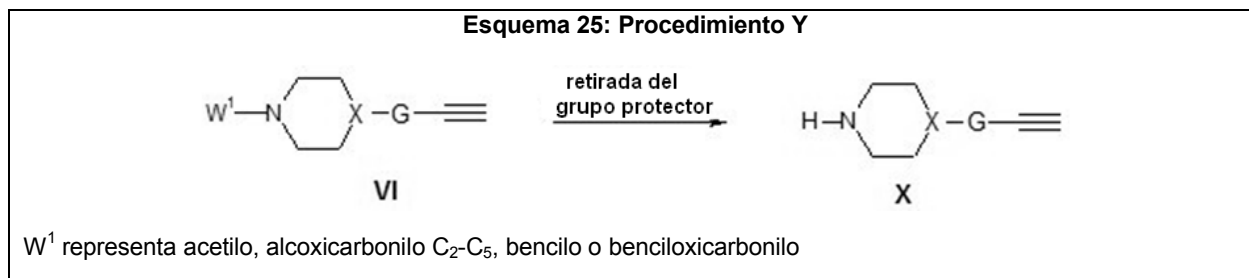


- 25 Los cloruros de carbamoilo y tiocarbamoilo de fórmula (**II**, W⁷ = cloro) necesarios como materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento de acuerdo con la invención se pueden preparar mediante procedimientos descritos en la bibliografía (véanse, por ejemplo, Tetrahedron, 2008, 7605; Journal of Organic Chemistry, 2004, 3787; Journal of Organic Chemistry, 1983, 4750; European Journal of Organic Chemistry, 2006, 1177). Normalmente, los compuestos de fórmula (**II**, W⁷ = cloro) se preparan a partir de aminas de fórmula (**II**) y fosgeno, tiofosgeno o equivalentes de los mismos. Los carbamoil y tiocarbamoilimidazoles de fórmula (**II**, W⁷ = imidazol-1-ilo) necesarios como materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento X de acuerdo con la invención se pueden preparar mediante procedimientos descritos en la bibliografía (véanse, por ejemplo, Tetrahedron Letters, 2008, 5279; Tetrahedron, 2005, 7153). Normalmente, los compuestos de fórmula (**II**, W⁷ = imidazol-1-ilo) se preparan a partir de aminas de fórmula (**II**) y 1,1'-carbonildiimidazoles o 1,1'-tiocarbonildiimidazoles. El procedimiento X describe la preparación de compuestos de estructura (**Ij**) por reacción de compuestos de estructura (**II**, W⁷ = cloro o imidazol-1-

ilo) y aminas (**XXVI**). Si fuera oportuno, el procedimiento X se lleva a cabo en presencia de un aceptor de ácido adecuado. Los aceptores de ácido adecuados son todas las bases orgánicas o inorgánicas habituales. Estas incluyen preferentemente los hidruros, hidróxidos, amidas, alcóxidos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinotérreos o metales alcalinos, tales como, por ejemplo, hidruro sódico, amida sódica, diisopropilamida de litio, metóxido sódico, etóxido sódico, terc-butóxido potásico, hidróxido sódico, hidróxido potásico, acetato sódico, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico o carbonato amónico y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-diisopropiletilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilbencilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU). De forma alternativa, algunos de los compuestos (**Ij**) obtenidos cuando se lleva a cabo el procedimiento X de acuerdo con la invención también se pueden obtener sin el uso de un aceptor de ácido como los correspondientes cloruros de ácido [(**Ij**)-HCl] (material de partida: $W^7 = Cl$). Si fuera necesario, los compuestos (**Ij**) se preparan por procedimientos habituales.

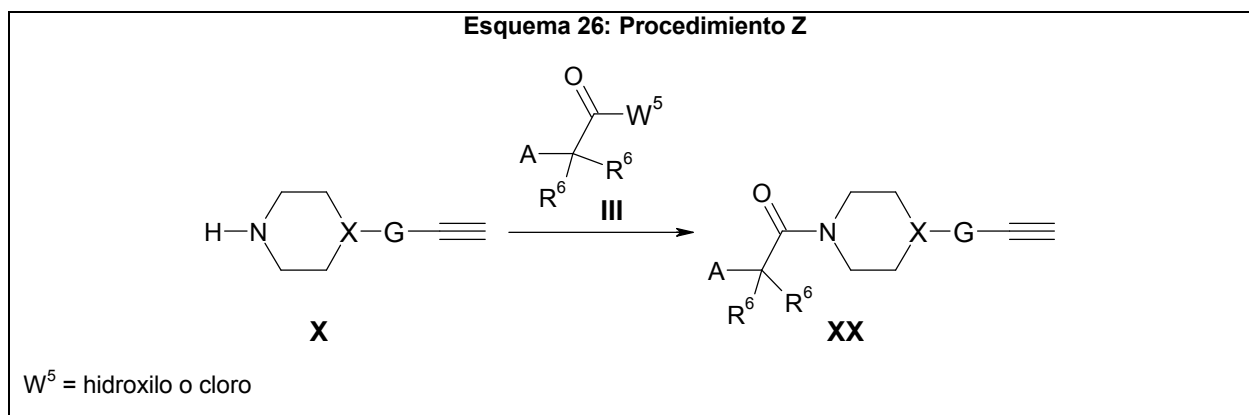
El procedimiento X de acuerdo con la invención se lleva a cabo preferentemente usando uno o más diluyentes. Los materiales de partida se emplean en cantidades equimolares. La reacción se lleva a cabo preferentemente a temperaturas de 0 °C a 100 °C y de forma particularmente preferente de 20 °C a 30 °C. El tiempo de reacción varía dependiendo de la escala de la reacción y de la temperatura de reacción, pero es generalmente entre unos pocos minutos y 48 horas.

Después de que la reacción haya finalizado, los compuestos (**Ij**) se retiran de la mezcla de reacción usando una de las técnicas de separación habituales. Si fuera necesario, los compuestos se purifican por recristalización, destilación o cromatografía.



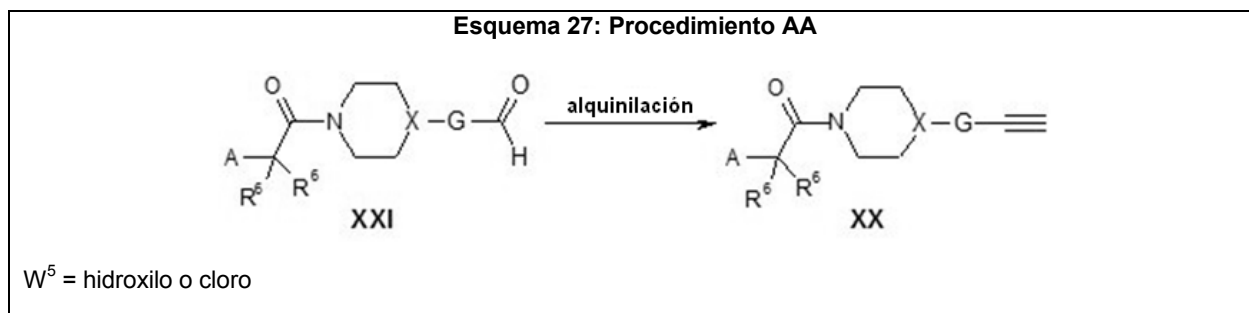
En el Esquema 25 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (**X**) a partir de los correspondientes compuestos (**VI**).

El procedimiento Y se lleva a cabo de forma análoga al procedimiento L.



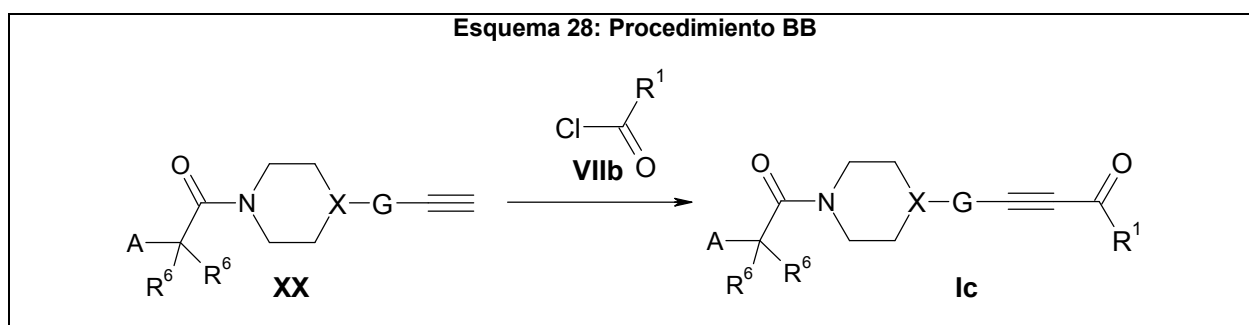
En el Esquema 26 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (**XX**) a partir de los correspondientes compuestos (**X**).

Se lleva a cabo el mismo procedimiento que ya se ha descrito en el Esquema 22 (procedimiento V).



En el Esquema 27 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula **(XX)** a partir de los correspondientes compuestos **(XXI)**.

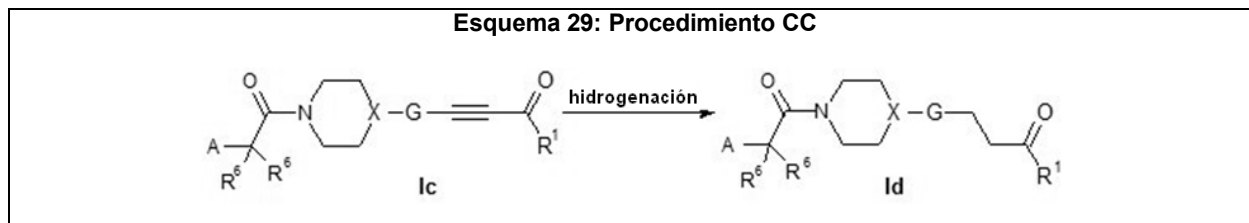
Se emplea el mismo procedimiento que ya se ha descrito en el Esquema 16 (procedimiento P).



5

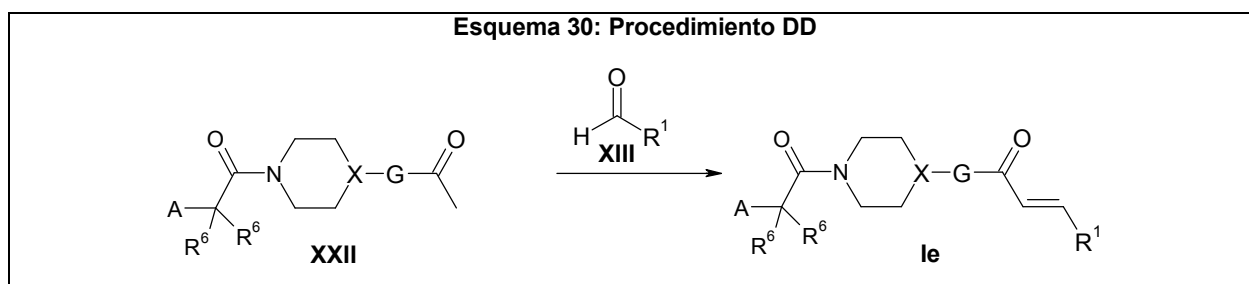
En el Esquema 28 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula **(Ic)** a partir de los correspondientes compuestos **(XX)**.

Se emplea el mismo procedimiento que ya se ha descrito en el Esquema 12 (procedimiento I).



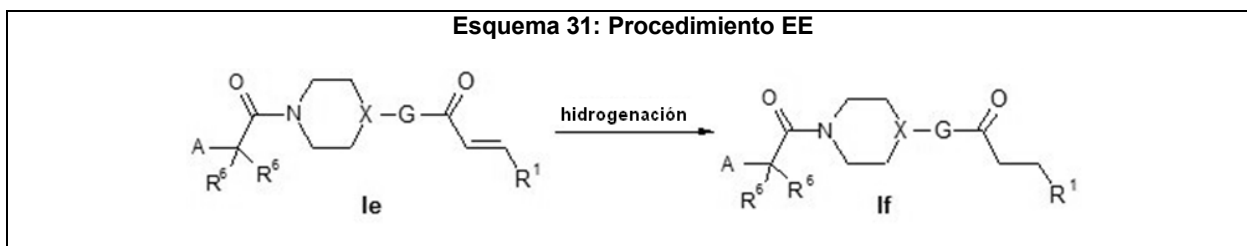
10 En el Esquema 29: procedimiento CC se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula **(Id)** a partir de los correspondientes compuestos **(Ic)**.

Se emplea el mismo procedimiento que ya se ha descrito en el Esquema 9 (procedimiento I).



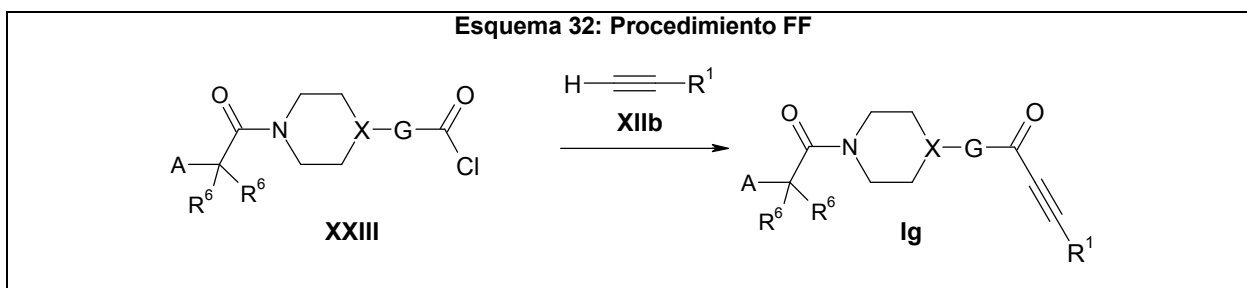
15 En el Esquema 30 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula **(Ie)** a partir de los correspondientes compuestos **(XXII)** usando un compuesto de fórmula **(XIII)**.

Se emplea el mismo procedimiento que ya se ha descrito en el Esquema 11 (procedimiento K).



En el Esquema 31 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (1f) a partir de los correspondientes compuestos (1e).

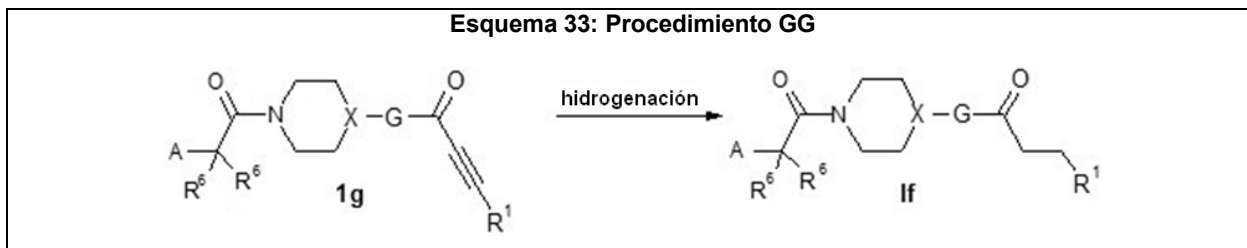
Se emplea el mismo procedimiento que ya se ha descrito en el Esquema 9 (procedimiento I).



5

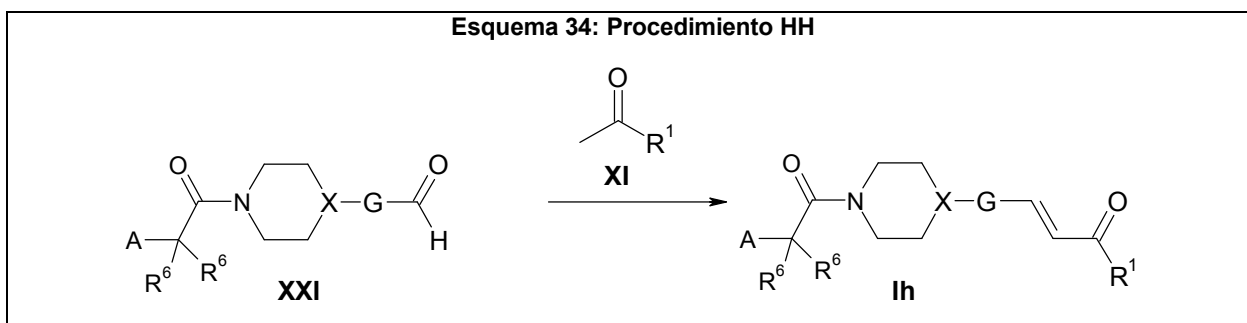
En el Esquema 32 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (1g) a partir de los correspondientes compuestos (XXIII) usando un compuesto de fórmula (XIIb).

Se emplea el mismo procedimiento que ya se ha descrito en el Esquema 12 (procedimiento L).



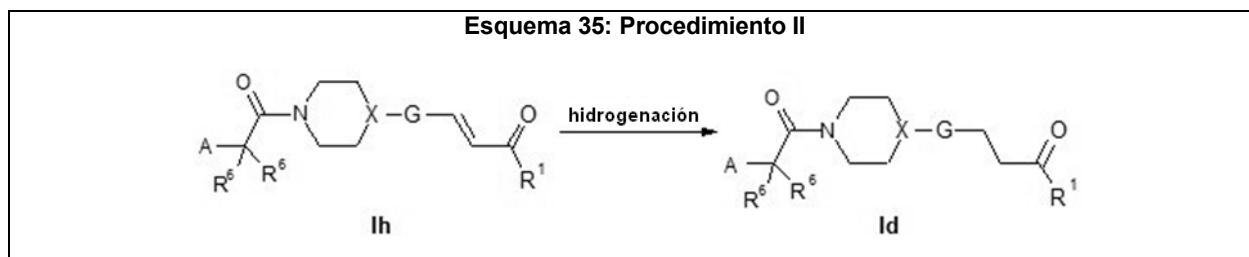
10 En el Esquema 33 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (1f) a partir de los correspondientes compuestos (1g).

Se emplea el mismo procedimiento que ya se ha descrito en el Esquema 9 (procedimiento I).



15 En el Esquema 34 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (1h) a partir de los correspondientes compuestos (XXI) usando una cetona (XI).

Se emplea el mismo procedimiento que ya se ha descrito en el Esquema 11 (procedimiento K).



En el Esquema 35 se muestra una manera de preparar los compuestos de fórmula (Id) a partir de los correspondientes compuestos (Ih).

Se emplea el mismo procedimiento que ya se ha descrito en el Esquema 9 (procedimiento I).

- 5 La presente invención además proporciona el uso no medicinal de los derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina para el control de microorganismos no deseados.

La presente invención además se refiere a un agente para la protección de plantas para el control de hongos no deseados que comprende al menos uno de los derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina de fórmula (I). Estos son preferentemente agentes fungicidas que comprenden auxiliares, disolventes, vehículos, tensioactivos o diluyentes agriculturalmente adecuados.

Además, la invención se refiere a un procedimiento para el control de microorganismos no deseados, caracterizado porque los derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina de fórmula (I) de acuerdo con la invención se aplican a los hongos fitopatógenos y/o a su hábitat.

De acuerdo con la invención, un vehículo es una sustancia orgánica o inorgánica natural o sintética con la que los principios activos se mezclan o unen para una mejor aplicabilidad, en particular para la aplicación a plantas o partes de plantas o semillas. El vehículo, que puede ser sólido o líquido, es generalmente inerte y debería ser adecuado para su uso en agricultura.

Los vehículos sólidos o líquidos adecuados son: por ejemplo sales de amonio y minerales naturales molidos, tales como caolines, arcillas, talco, caliza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y minerales sintéticos molidos, tales como sílice finamente dividida, alúmina y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, agua, alcoholes, especialmente butanol, disolventes orgánicos, aceites minerales y vegetales y derivados de los mismos. También se pueden usar las mezclas de tales vehículos. Los vehículos sólidos adecuados para gránulos son: por ejemplo rocas naturales trituradas y fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita y gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas y también gránulos de material orgánico tal como serrín, cáscara de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco.

Los diluyentes o vehículos gaseosos licuados adecuados son líquidos que son gaseosos a temperatura ambiente y a presión atmosférica, por ejemplo propelentes de aerosoles, tales como hidrocarburos halogenados y también butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

Se pueden usar en las formulaciones adhesivos tales como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico y acetato de polivinilo o también se pueden usar en las formulaciones fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Otros posibles aditivos son aceites minerales y vegetales.

Si el diluyente usado es agua, también es posible emplear como disolventes auxiliares, por ejemplo, disolventes orgánicos. Básicamente, los disolventes líquidos adecuados son: compuestos aromáticos tales como xileno, tolueno o alquilnaftaleno, compuestos aromáticos clorados e hidrocarburos alifáticos clorados tales como clorobencenos, cloroetilenos o diclorometano, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo fracciones de aceite mineral, aceites minerales y vegetales, alcoholes tales como butanol o glicol y sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido y también agua.

Los agentes de acuerdo con la invención pueden comprender otros componentes adicionales, tales como, por ejemplo, tensioactivos. Los tensioactivos adecuados son emulsionantes y/o formadores de espumas, dispersantes o agentes humectantes que tienen características iónicas o no iónicas o las mezclas de estos tensioactivos. Los ejemplos de los mismos son sales del ácido poliácrico, sales del ácido lignosulfónico, sales del ácido fenolsulfónico o del ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (preferentemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfosuccínicos, derivados de taurina (preferentemente tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polietoxilados, ésteres grasos de polioles y derivados de los compuestos que contienen sulfatos, sulfonatos y fosfatos, por ejemplo alquilaril poliglicol éteres, alquilsulfonatos, sulfatos de alquilo, arilsulfonatos, hidrolizados de proteína, licores

residuales de lignosulfito y metilcelulosa. Se necesita la presencia de un tensioactivo si uno de los principios activos y/o uno de los vehículos inertes es insoluble en agua y cuando la aplicación tiene lugar en agua. La proporción de los tensioactivos es entre un 5 y un 40 por ciento en peso del agente de acuerdo con la invención.

5 Es posible usar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio y Azul de Prusia y colorantes orgánicos tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y colorantes de ftalocianina metálica y oligoelementos tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

10 Si fuera oportuno, también pueden estar presentes otros componentes adicionales, por ejemplo coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, sustancias tixotrópicas, penetrantes, estabilizantes, agentes secuestradores y formadores de complejos. En general, los principios activos se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido usado habitualmente para propósitos de formulación.

Las formulaciones comprenden generalmente entre un 0,05 y un 99 % en peso, entre un 0,01 y un 98 % en peso, preferentemente entre un 0,1 y un 95 % en peso, de forma particularmente preferente entre un 0,5 y un 90 % y de forma muy particularmente preferente entre un 10 y un 70 % en peso de principio activo.

15 Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención se pueden usar como tales o, dependiendo de sus respectivas propiedades físicas y/o químicas, en forma de sus formulaciones para el uso de formas preparadas de los mismos, tales como aerosoles, suspensiones en cápsulas, concentrados de nebulización en frío, concentrados de nebulización en caliente, gránulos encapsulados, gránulos finos, concentrados fluidos para el tratamiento de semillas, soluciones listas para el uso, polvos para espolvorear, concentrados emulsionantes, emulsiones de aceite en agua, emulsiones de agua en aceite, macrogránulos, microgránulos, polvos dispersables en aceite, concentrados 20 fluidos miscibles en aceite, líquidos miscibles en aceite, espumas, pastas, semillas recubiertas de pesticidas, concentrados para suspensión, concentrados para suspoemulsión, concentrados solubles, suspensiones, polvos para humedecer, polvos solubles, polvos y gránulos, gránulos o comprimidos solubles en agua, polvos solubles en agua para el tratamiento de semillas, polvos para humedecer, productos naturales y sustancias sintéticas impregnadas con el principio activo y también microencapsulaciones en sustancias poliméricas y en materiales de recubrimiento para semillas y también formulaciones ULV de nebulización en frío y nebulización en caliente.

25 Las formulaciones mencionadas se pueden preparar de una forma conocida por sí misma, por ejemplo mediante la mezcla de los principios activos con al menos un diluyente o disolvente, emulsionante, dispersante, y/o aglutinante o fijador, agente humectante, repelente de agua, si fuera oportuno desecantes y estabilizantes UV y, si fuera oportuno, tintes y pigmentos, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, giberelinas y también otras sustancias de procedimiento auxiliares adicionales.

30 Los agentes de acuerdo con la invención incluyen no solo las formulaciones que ya están listas para su uso y se pueden aplicar con un aparato adecuado a la planta o a la semilla, sino también los concentrados comerciales que se tienen que diluir en agua antes de su uso.

35 Los principios activos de acuerdo con la invención pueden estar presentes como tales o en sus formulaciones (comerciales) y en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones en forma de una mezcla con otros principios activos (conocidos), tales como insecticidas, atrayentes, esterilizantes, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, herbicidas, fertilizantes, protectores y/o semioquímicos.

40 El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y las partes de las plantas con los principios activos o agentes se lleva a cabo directamente o por acción en sus alrededores, hábitat o lugar de almacenamiento usando procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo mediante inmersión, pulverización, atomización, irrigación, evaporación, espolvoreo, nebulización, sembrado a voleo, espumación, pintado, diseminación, regado (empapando), irrigación por goteo y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, además en forma de polvo para tratamiento de semillas secas, solución para el tratamiento de semillas, polvo soluble en agua para el 45 tratamiento por suspensión, por incrustación, por recubrimiento con uno o más recubrimientos, etc. Además es posible aplicar los principios activos mediante un procedimiento de volumen muy bajo o inyectar la preparación del principio activo o el principio activo en sí mismo en el suelo.

La presente invención además incluye un procedimiento para el tratamiento de semillas.

50 La presente invención además se refiere a una semilla que se ha tratado de acuerdo con uno de los procedimientos descritos en los párrafos anteriores. Las semillas de acuerdo con la invención se usan en procedimientos para la protección de semillas de hongos no deseados. En estos procedimientos, se emplea una semilla tratada con al menos un principio activo de acuerdo con la invención.

55 Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención también son adecuados para el tratamiento de semillas. Una gran parte del daño que los organismos nocivos causan a las plantas de los cultivos se desencadena por la infección de la semilla durante el almacenamiento o después de la siembra tanto durante como después de la germinación de la planta. Esta fase es particularmente crítica dado que las raíces y los brotes de la planta en crecimiento son particularmente sensibles, e incluso un pequeño daño puede dar como resultado la muerte de la planta. Por lo tanto, existe un gran interés en la protección de las semillas y de la germinación de la planta mediante

el uso de agentes apropiados.

El control de los hongos fitopatógenos para el tratamiento de las semillas de las plantas se conoce desde hace mucho tiempo y es objeto de continuas mejoras. Sin embargo, el tratamiento de la semilla acarrea una serie de problemas que no siempre se pueden resolver de forma satisfactoria. De esta manera, es deseable el desarrollo de procedimientos para la protección de la semilla y la germinación de la planta que prescindan de o al menos reduzca de forma considerable, la aplicación adicional de agentes de protección de cultivo después de la siembra o después de la aparición de las plantas. Además es deseable la optimización de la cantidad de principio activo empleado de modo que proporcione una protección óptima para la semilla y la germinación de la planta del ataque de hongos fitopatógenos, pero sin que el principio activo empleado dañe la planta en sí misma. En particular, los procedimientos para el tratamiento de semillas también deberían tener en consideración las propiedades fungicidas intrínsecas de las plantas transgénicas para conseguir una protección óptima de la semilla y la planta germinada con el mínimo empleo de agentes de protección de cultivo.

Por lo tanto, la presente invención también se refiere a un procedimiento para la protección de las semillas y las plantas germinadas, del ataque de hongos fitopatógenos, mediante el tratamiento de la semilla con un agente de acuerdo con la invención. La invención también se refiere al uso de los agentes de acuerdo con la invención para el tratamiento de semillas para la protección de la semilla y de la planta germinada frente a hongos fitopatógenos. Además, la invención se refiere a una semilla tratada con un agente de acuerdo con la invención para la protección frente a hongos fitopatógenos.

El control de hongos fitopatógenos que dañan las plantas tras su aparición se lleva a cabo principalmente por tratamiento del suelo y las partes de las plantas sobre el suelo con agentes de protección de cultivo. Debido a la preocupación que produce el posible impacto de los agentes de protección de cultivo en el medio ambiente y en la salud humana y animal, se están realizando esfuerzos para reducir la cantidad de los principios activos aplicados.

Una de las ventajas de la presente invención es que las particulares propiedades sistémicas de los principios activos o agentes de acuerdo con la invención hacen que el tratamiento de la semilla con estos principios activos y agentes no solo protejan la semilla en sí misma, sino también las plantas resultantes después de la aparición, de los hongos fitopatógenos. De esta manera, se puede prescindir del tratamiento inmediato del cultivo mientras se realiza la siembra o poco después de la misma.

También se considera como ventajoso que los principios activos o agentes de acuerdo con la invención también se puedan usar en particular para semillas transgénicas en las que el crecimiento de la planta a partir de estas semillas es capaz de expresar una proteína que actúa contra las plagas. Mediante el tratamiento de tales semillas con los principios activos o agentes de acuerdo con la invención se pueden controlar ciertas plagas incluso mediante la expresión de, por ejemplo, la proteína insecticida. De forma sorprendente, en este punto se puede observar un efecto sinérgico adicional, que aumenta adicionalmente la eficacia de la protección contra el ataque de plagas.

Los agentes de acuerdo con la invención son adecuadas para la protección de semillas de cualquier variedad de planta que se emplee en agricultura, en invernadero, en bosques o en horticultura y viticultura. En particular, toman la forma de semillas de cereales (tales como trigo, cebada, centeno, triticale, sorgo/mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, patata, girasol, judía, café, remolacha (por ejemplo remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuete, colza oleaginosa, amapola, olivo, coco, cacao, caña de azúcar, tabaco, hortalizas (tales como tomate, pepino, cebolla y lechuga), césped y ornamentales (véase también posteriormente en el presente documento). Es de particular importancia el tratamiento de la semilla de cereales (tales como trigo, cebada, centeno, triticale y avena), maíz y arroz.

Como también se describe posteriormente de forma adicional, es de particular importancia el tratamiento de una semilla transgénica con los principios activos o agentes de acuerdo con la invención. Esto se refiere a las semillas de las plantas que contienen al menos un gen heterólogo que permite la expresión de un polipéptido o una proteína que tiene propiedades insecticidas. Se puede originar el gen heterólogo en las semillas transgénicas, por ejemplo, a partir de microorganismos de la especie Bacillus, Rhizobium, Pseudomonas, Serratia, Trichoderma, Clavibacter, Glomus o Gliocladium. Preferentemente, este gen heterólogo proviene de Bacillus sp., teniendo el producto génico actividad frente al taladro europeo del maíz y/o el gusano occidental de la raíz del maíz. De forma particularmente preferente, el gen heterólogo se origina a partir de Bacillus thuringiensis.

Dentro del contexto de la presente invención, el agente de acuerdo con la invención se aplica a la semilla aisladamente o en una formulación adecuada. Preferentemente, la semilla se trata en un estado en el que es lo suficientemente estable para evitar el daño durante el tratamiento. En general, la semilla se puede tratar en cualquier punto en el tiempo entre la recolección y la siembra. La semilla que se usa habitualmente se ha separado de la planta y liberado de mazorcas, cáscaras, tallos, cubiertas, pelos o la pulpa de las frutas. De esta manera, es posible usar, por ejemplo, una semilla que se ha recolectado, limpiado y secado hasta un contenido de humedad menor de un 15 % en peso. De forma alternativa, también es posible usar una semilla que, después de su secado, se ha tratado, por ejemplo, con agua y después se ha secado de nuevo.

Cuando se trata la semilla, generalmente se debe tener cuidado de que la cantidad del agente de acuerdo con la invención aplicada a la semilla y/o la cantidad de aditivos adicionales se elijan de modo que la germinación de las semillas no se vea afectada de forma adversa o que no se dañe la planta resultante. Esto se debe tener presente en el caso particular de principios activos que puedan tener efectos fitotóxicos a determinadas dosis de aplicación.

5 Los agentes de acuerdo con la invención se pueden aplicar directamente, es decir sin contener ningún otro componente y sin diluir. En general, es preferente aplicar los agentes a la semilla en forma de una formulación adecuada. Los expertos en la materia conocen las formulaciones y los procedimientos adecuados para el tratamiento de semillas y se describen, por ejemplo, en los siguientes documentos: US 4.272.417 A, US 4.245.432 A, US 4.808.430 A, US 5.876.739 A, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675 A1, WO 2002/028186 A2.

10 Los principios activos que se pueden usar de acuerdo con la invención se pueden convertir en formulaciones del tratamiento de semillas habituales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, pastas u otras composiciones de recubrimiento de semillas y también formulaciones ULV.

15 Estas formulaciones se preparan de una forma conocida, por mezcla de los principios activos con aditivos habituales tales como, por ejemplo, diluyentes habituales y también disolventes o diluyentes, colorantes, agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también agua.

20 Colorantes que pueden estar presentes en las formulaciones de tratamiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todos los colorantes que son habituales para tales propósitos. En este contexto, se pueden usar no solo pigmentos, que son poco solubles en agua, sino también tintes, que son solubles en agua. Los ejemplos que se pueden mencionar son los colorantes conocidos por los nombres de Rodamina B, Pigmento Rojo C.I. 112 y Disolvente Rojo C.I. 1.

25 Agentes humectantes adecuados que pueden estar presentes en las formulaciones de tratamiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todas las sustancias que promueven la humedad y que se usan de forma convencional para la formulación de compuestos agroquímicamente activos. Se da preferencia al uso de alquilnaftalenosulfonatos, tales como diisopropil o diisobutilnaftalenosulfonatos.

30 Dispersantes y/o emulsionantes adecuados que pueden estar presentes en las formulaciones de tratamiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos que se usan de forma convencional para la formulación de compuestos agroquímicamente activos. Se da preferencia al uso de dispersantes no iónicos o aniónicos o a mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Los dispersantes no iónicos adecuados que se pueden mencionar son, en particular, polímeros en bloque de óxido de etileno/óxido de propileno, alquilfenol poliglicol éteres y triestirilfenol poliglicol éter y sus derivados fosfatados o sulfatados. Los dispersantes aniónicos adecuados son, en particular, lignosulfonatos, sales del ácido poliacrílico y condensados arilsulfonato/formaldehído.

35 Antiespumantes que pueden estar presentes en las formulaciones de tratamiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todas las sustancias inhibidoras de la espuma que se usan convencionalmente por la formulación de compuestos agroquímicamente activos. Se pueden usar preferentemente los antiespumantes de silicona y estearato de magnesio.

40 Conservantes que pueden estar presentes en las formulaciones de tratamiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todas las sustancias que se pueden emplear para tales propósitos en los agentes agroquímicos. Se pueden mencionar a modo de ejemplo diclorofeno y alcohol bencílico hemiformal.

Espesantes secundarios que pueden estar presentes en las formulaciones de tratamiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todas las sustancias que se pueden emplear para tales propósitos en los agentes agroquímicos. Son preferentes los derivados de celulosa, los derivados de ácido acrílico, xantano, arcillas modificadas y sílice finamente dividida.

45 Adhesivos que pueden estar presentes en las formulaciones de tratamiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son todos los aglutinantes habituales que se pueden emplear en productos de tratamiento de semillas. Se pueden mencionar como preferentes polivinilpirrolidona, acetato de polivinilo, alcohol polivinílico y tilosa.

50 Giberelinas que pueden estar presentes en las formulaciones de tratamiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención son preferentemente las giberelinas A1, A3 (= ácido giberélico), A4 y A7; se usa el ácido giberélico de forma especialmente preferente. Las giberelinas son conocidas (véase R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz- und Schädlingsbekämpfungsmittel", vol. 2, Springer Verlag, 1970, p. 401-412).

55 Las formulaciones de tratamiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención se pueden emplear para el tratamiento de un amplio intervalo de semillas, incluyendo las semillas de plantas transgénicas, bien directamente o bien después de haberse diluido previamente con agua. En este contexto, también pueden aparecer efectos sinérgicos adicionales en cooperación con las sustancias formadas en la expresión.

- 5 Todos los mezcladores que se pueden emplear de forma convencional para la operación de tratamiento de semillas son adecuados para el tratamiento de la semilla con las formulaciones de tratamiento de semillas que se pueden usar de acuerdo con la invención o con las preparaciones preparadas a partir de las mismas mediante la adición de agua. De forma específica, se sigue un procedimiento durante la operación de tratamiento de la semilla en el que la semilla se coloca en un mezclador, se añade la cantidad específica deseada de formulaciones de tratamiento de semillas, bien como tales o bien después de haberse diluido previamente con agua y se mezcla todo hasta que la formulación se distribuye de forma uniforme sobre la semilla. Si fuera oportuno, esto es seguido de un procedimiento de secado.
- 10 Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención tienen una potente actividad fungicida y se pueden emplear para el control de hongos no deseados en la protección de plantas y en la protección de materiales.
- Los derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina de acuerdo con la invención se pueden emplear en la protección de plantas para el control de Plasmodioforomicetos, Oomicetos, Quitridiomycetos, Cigomicetos, Ascomycetos, Basidiomicetos y Deuteromicetos.
- 15 Los agentes fungicidas de acuerdo con la invención se pueden usar para la curación o el control de protección de hongos fitopatógenos. Por lo tanto, la invención también se refiere a procedimientos de curación y protección para el control de hongos fitopatógenos usando los principios activos o agentes de acuerdo con la invención, que se aplican a la semilla, a la planta o a partes de la planta, a la fruta o al suelo en el que las plantas crecen.
- 20 Los agentes de acuerdo con la invención para el control de hongos fitopatógenos en la protección de plantas comprenden en una cantidad eficaz, pero no fitotóxica, de los principios activos de acuerdo con la invención. "Cantidad eficaz, pero no fitotóxica" significa una cantidad del agente de acuerdo con la invención que es suficiente para el control de la enfermedad fúngica de la planta de una forma satisfactoria o para erradicar la enfermedad fúngica completamente y que, al mismo tiempo, no causa ningún síntoma significativo de fitotoxicidad. En general, esta dosis de aplicación puede variar dentro de un intervalo relativamente amplio. Esto depende de una pluralidad de factores, por ejemplo de los hongos que se van a controlar, de la planta, de las condiciones climáticas y de los ingredientes de los agentes de acuerdo con la invención.
- 25 El hecho de que los principios activos se toleren bien por las plantas en las concentraciones necesarias para el control de las enfermedades de la planta permite el tratamiento de partes de las plantas sobre tierra, del tronco de propagación y las semillas y del suelo.
- 30 Se pueden tratar todas las plantas y todas las partes de las plantas de acuerdo con la invención. En este punto se entiende por plantas todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas salvajes o plantas de cultivo deseadas o no deseadas (incluyendo las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante procedimientos de reproducción y optimización convencionales o mediante procedimientos de ingeniería biotecnológica y genética o mediante combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las variedades de plantas que pueden estar o no estar protegidas por los derechos de la propiedad varietal. Se debe entender por partes de plantas todas las partes y órganos de las plantas por encima y por debajo del suelo, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose mencionar como ejemplos, agujas, tallos, pedúnculos, flores, cuerpos frutales, frutas, semillas, raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de las plantas también incluyen cultivos cosechados y material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo semilleros, tubérculos, rizomas, esquejes y semillas.
- 35 Los principios activos de acuerdo con la invención son adecuados para la protección de plantas y órganos de plantas, para el incremento de los rendimientos de la cosecha, para la mejora de la calidad del cultivo cosechado, a la vez que son bien tolerados por las plantas, teniendo una toxicidad favorable hacia las especies de sangre caliente y no siendo dañinos para el medio ambiente. Se pueden emplear preferentemente como agentes de protección de plantas. Son activos frente a especies normalmente sensibles y resistentes y también frente a todos o algunos estadios de desarrollo.
- 40 Se pueden mencionar las siguientes plantas como plantas que se pueden tratar de acuerdo con la invención: algodón, lino, vid, frutales, hortalizas, tales como *Rosaceae sp.* (por ejemplo pomos tales como manzanas y peras, pero también frutas con hueso tales como albaricoques, cerezas, almendras y melocotones y bayas tales como fresas), *Ribesioideae sp.*, *Juglandaceae sp.*, *Betulaceae sp.*, *Anacardiaceae sp.*, *Fagaceae sp.*, *Moraceae sp.*, *Oleaceae sp.*, *Actinidaceae sp.*, *Lauraceae sp.*, *Musaceae sp.* (por ejemplo plataneras y plantaciones de plátanos), *Rubiaceae sp.* (por ejemplo café), *Theaceae sp.*, *Sterculiaceae sp.*, *Rutaceae sp.* (por ejemplo limones, naranjas y pomelos); *Solanaceae sp.* (por ejemplo tomates), *Liliaceae sp.*, *Asteraceae sp.* (por ejemplo lechuga), *Umbelliferae sp.*, *Cruciferae sp.*, *Chenopodiaceae sp.*, *Cucurbitaceae sp.* (por ejemplo pepino), *Alliaceae sp.* (por ejemplo puerros, cebollas), *Papilionaceae sp.* (por ejemplo guisantes); plantas de cultivos importantes tales como *Graminae sp.* (por ejemplo maíz, pasto, cereales tales como trigo, centeno, arroz, cebada, avena, mijo y triticale), *Poaceae sp.* (por ejemplo caña de azúcar), *Asteraceae sp.* (por ejemplo girasol), *Brassicaceae sp.* (por ejemplo col, lombarda, brócoli, coliflor, coles de Bruselas, pak choi, colirrábano, rabanitos y también colza oleaginosa, mostaza, rábano picante y berro), *Fabaceae sp.* (por ejemplo judías, cacahuetes), *Papilionaceae sp.* (por ejemplo soja), *Solanaceae sp.* (por ejemplo patatas), *Chenopodiaceae sp.* (por ejemplo remolacha azucarera, remolacha forrajera, acelga, remolacha);
- 45
- 50
- 55

plantas útiles y plantas ornamentales en jardines y bosques; y en cada caso los tipos modificados genéticamente de estas plantas.

Como ya se mencionó anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención. En una realización preferente, se tratan las especies de plantas salvajes y las variedades de cultivo o las obtenidas mediante procedimientos de reproducción biológica convencional, tales como cruzamiento o fusión del protoplasto y también las partes de las mismas. En una realización preferente adicional, se tratan las plantas transgénicas y las variedades de cultivo obtenidas por ingeniería genética, si fuera oportuno junto con procedimientos convencionales (Organismos Modificados Genéticamente) y las partes de las mismas. El término "partes" o "partes de plantas" se ha explicado anteriormente. De forma particularmente preferente, se tratan de acuerdo con la invención las plantas de las variedades de cultivo que en cada caso están disponibles en el mercado o en uso. Se entiende que las variedades de cultivo se refieren a plantas que tienen nuevas propiedades ("rasgos") y que se han obtenido por reproducción convencional, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinante. Pueden ser variedades de cultivo, variegales, bio- o genotipos.

El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la invención se puede usar en el tratamiento de organismos modificados genéticamente (OMG), por ejemplo plantas o semillas. Las plantas modificadas genéticamente (o plantas transgénicas) son plantas en las que se ha integrado de forma estable un gen heterólogo en el genoma. La expresión "gen heterólogo" significa esencialmente un gen que se proporciona o que se recopila del exterior de la planta y cuando se introduce en el genoma nuclear, cloroplástico o mitocondrial otorga a la planta transformada propiedades agronómicas nuevas o mejoradas u otras propiedades mediante la expresión de una proteína o un polipéptido de interés o mediante la regulación corriente abajo o el silenciamiento de otro u otros genes que están presentes en la planta (usando por ejemplo tecnología antisentido, tecnología de cosupresión o tecnología de ARNi [ARN de interferencia]). Un gen heterólogo que está localizado en el genoma también se denomina transgén. Un transgén que se define por su localización particular en el genoma de la planta se denomina suceso de transformación o transgénico.

Dependiendo de las especies de plantas o de las variedades de plantas, su localización y condiciones de crecimiento (suelos, climas, período vegetativo, dieta), el tratamiento de acuerdo con la invención puede dar como resultado efectos superaditivos ("sinérgicos"). De esta manera son posibles, por ejemplo, los siguientes efectos que exceden los efectos que en realidad se esperaban: reducción de las dosis de aplicación y/o ampliación del espectro de actividad y/o aumento de la actividad de los principios activos y las composiciones que se pueden usar de acuerdo con la invención, mejor crecimiento de la planta, aumento de la tolerancia a altas o bajas temperaturas, aumento de la tolerancia a la sequía o al agua o contenido salino del suelo, aumento del rendimiento de floración, facilidad de cosecha, maduración acelerada, mayores rendimientos de cosecha, frutos más grandes, aumento de altura la planta, aumento del verdor de las hojas, floración más temprana, mayor calidad y/o mayor valor nutricional de los productos cosechados, mayor concentración de azúcar en los frutos, mejor estabilidad de almacenamiento y/o capacidad de procesamiento de los productos cosechados.

A determinadas dosis de aplicación, las combinaciones de principio activo de acuerdo con la invención también pueden causar un efecto de fortalecimiento en las plantas. Por lo tanto, son adecuados para la movilización del sistema de defensa de la planta frente a un ataque de hongos fitopatógenos no deseados y/o microorganismos y/o virus. Esta puede ser, si fuera oportuno, una de las razones del aumento de actividad de las combinaciones de acuerdo con la invención, por ejemplo frente a hongos. Se entiende que las sustancias de fortalecimiento de plantas (inducción la resistencia) también se refieren, en el presente contexto, a las sustancias o combinaciones de sustancias que son capaces de estimular el sistema de defensa de las plantas de modo que, cuando se inoculan posteriormente con hongos fitopatógenos no deseados, las plantas tratadas manifiestan un considerable grado de resistencia a estos hongos fitopatógenos no deseados. De esta manera, las sustancias de acuerdo con la invención se pueden emplear para la protección de las plantas contra los ataques de los patógenos mencionados anteriormente dentro de un determinado periodo de tiempo después del tratamiento. El periodo dentro del que se proporciona protección se extiende generalmente de 1 a 10 días, preferentemente de 1 a 7 días, después del tratamiento de las plantas con los principios activos.

Plantas y variedades de plantas que se tratan preferentemente de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que tienen material genético que proporciona rasgos particularmente ventajosos y útiles a dichas plantas (tanto si se obtiene por medios reproductivos y/o biotecnológicos).

Plantas y variedades de plantas que también se tratan preferentemente de acuerdo con la invención son resistentes frente a uno o más factores de estrés biótico, es decir plantas que poseen una mejor defensa frente a plagas animales y microbianas, tales como frente a nematodos, insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias, virus y/o viroides.

Plantas y variedades de plantas que también se pueden tratar de acuerdo con la invención son las plantas que son resistentes a uno o más factores de estrés abiótico. Las condiciones de estrés abiótico pueden incluir, por ejemplo, sequía, exposición a temperaturas frías, exposición al calor, estrés osmótico, anegamiento, aumento de la salinidad del suelo, aumento de la exposición a minerales, exposición al ozono, exposición a luz intensa, disponibilidad limitada de nutrientes de nitrógeno, disponibilidad limitada de nutrientes de fósforo o evitación de la sombra.

Plantas y variedades de plantas que también se pueden tratar de acuerdo con la invención son las plantas caracterizadas por una mejora en las características de rendimiento. El aumento del rendimiento en dichas plantas puede ser el resultado, por ejemplo, de la mejora de la fisiología, crecimiento y desarrollo de la planta, tal como la eficacia del uso del agua, la eficacia de retención de agua, la mejora del uso de nitrógeno, el aumento de la asimilación de carbono, la mejora en la fotosíntesis, la mejora en la eficacia de germinación y la maduración acelerada. Además el rendimiento se puede ver afectado por la mejora de la arquitectura de la planta (bajo condiciones de estrés y sin estrés), incluyendo la floración temprana, el control de la floración para la producción de semillas híbridas, el vigor en el semillero, el tamaño de la planta, el número y distancia de internodos, el crecimiento de la raíz, el tamaño de la semilla, el tamaño del fruto, del tamaño de la vaina, el número de vainas o espigas, el número de semillas por vaina o espiga, la masa de la semilla, el aumento del relleno de las semillas, la reducción de la dispersión de las semilla, la reducción de la dehiscencia de la vaina y la resistencia a la caída por efecto del viento o la lluvia. Los rasgos de rendimiento adicionales incluyen la composición de la semilla, tales como el contenido de hidratos de carbono, el contenido de proteínas, el contenido y composición de aceites, el valor nutricional, la reducción de los compuestos antinutricionales, la mejora de la capacidad de procesamiento y la mejora de la estabilidad de almacenamiento.

Plantas que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas híbridas que ya expresan las características de heterosis o efecto híbrido, que resulta generalmente en un mayor rendimiento, vigor, salud y resistencia frente a factores de estrés biótico y abiótico. Tales plantas se consiguen normalmente mediante el cruzamiento de una línea progenitora endogámica con esterilización masculina (el progenitor femenino) con otra línea progenitora endogámica con esterilización femenina (el progenitor masculino). La semilla híbrida se cosecha normalmente a partir de las plantas con esterilización masculina y se vende a los productores. A veces se pueden producir las plantas con esterilización masculina (por ejemplo, en el maíz) mediante el desespigamiento (es decir la eliminación mecánica de los órganos reproductores masculinos o flores masculinas) pero, más normalmente, la esterilidad masculina es el resultado de determinantes genéticos del genoma de la planta. En ese caso y especialmente cuando la semilla es el producto deseado que se cosecha a partir de plantas híbridas, es normalmente útil asegurar que se restablece completamente la fertilidad masculina en las plantas híbridas, que contienen los determinantes genéticos responsables de la esterilidad masculina. Esto se puede conseguir asegurando que los progenitores masculinos tienen los genes apropiados de restablecimiento de la fertilidad que son capaces de restablecer la fertilidad masculina en las plantas híbridas que contienen los determinantes genéticos responsables de la esterilidad masculina. Los determinantes genéticos de la esterilidad masculina se pueden localizar en el citoplasma. Se describen ejemplos de esterilidad masculina citoplasmática (CMS) por ejemplo para las especies de Brassica. Sin embargo, los determinantes genéticos de la esterilidad masculina también se pueden localizar en el genoma nuclear. Las plantas con esterilidad masculina también se pueden obtener mediante procedimientos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética. Un medio particularmente útil de obtener plantas con esterilidad masculina se describe en el documento WO 89/10396 en el que, por ejemplo, se expresa de forma selectiva una ribonucleasa tal como una barnasa en las células de tapete de los estambres. A continuación se puede restablecer la fertilidad mediante la expresión en las células de tapete de un inhibidor de ribonucleasa tal como barstar.

Plantas o variedades de plantas (obtenidas por procedimientos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas tolerantes a los herbicidas, es decir plantas hechas para tolerar uno o más herbicidas determinados. Tales plantas se pueden obtener bien por transformación genética o bien por selección de plantas que contienen una mutación que proporciona tal tolerancia a los herbicidas.

Las plantas tolerantes a los herbicidas son por ejemplo plantas tolerantes al glifosato, es decir plantas hechas para tolerar el herbicida glifosato o las sales del mismo. Por ejemplo, se pueden obtener plantas tolerantes al glifosato mediante la transformación de la planta con un gen que codifica la enzima 5-enolpiruvilshikimato-3-fosfato sintetasa (EPSPS). Los ejemplos de tales genes EPSPS son un gen AroA (mutación CT7) de la bacteria *Salmonella typhimurium*, el gen CP4 de la bacteria *Agrobacterium sp.* y los genes que codifican una EPSPS de petunia, una EPSPS de tomate o una EPSPS de Eleusine. También puede ser una mutación de EPSPS. Las plantas tolerantes al glifosato también se pueden obtener mediante la expresión de un gen que codifica una enzima glifosato oxidorreductasa. Las plantas tolerantes al glifosato también se pueden obtener mediante la expresión de un gen que codifica una enzima glifosato acetiltransferasa. Las plantas tolerantes al glifosato también se pueden obtener mediante la selección de plantas que contienen mutaciones que ocurren de forma natural de los genes mencionados anteriormente.

Otras plantas resistentes a los herbicidas son por ejemplo las plantas que se han hecho tolerantes a los herbicidas que inhiben la enzima glutamina sintetasa, tales como bialafos, fosfinotricina o glufosinato. Tales plantas se pueden obtener mediante la expresión de una enzima que detoxifica el herbicida o una mutación de la enzima glutamina sintetasa que es resistente a la inhibición. Una de tales enzimas detoxificantes eficaces es, por ejemplo, una enzima que codifica una fosfinotricina acetiltransferasa (tal como la proteína bar o pat de las especies de *Streptomyces*). También se han descrito las plantas que expresan una fosfinotricina acetiltransferasa exógena.

Otras plantas tolerantes a los herbicidas son también las plantas que se han hecho tolerantes a los herbicidas que inhiben la enzima hidroxifenilpiruvatodioxigenasa (HPPD). Las hidroxifenilpiruvatodioxigenasas son enzimas que catalizan la reacción en la que se transforma para-hidroxifenilpiruvato (HPP) en homogentisato. Las plantas tolerantes a inhibidores de HPPD se pueden transformar con un gen que codifica una enzima resistente a HPPD de

origen natural o un gen que codifica una mutación de la enzima HPPD. La tolerancia a los inhibidores de HPPD también se puede obtener mediante la transformación de las plantas con genes que codifican determinadas enzimas que posibilitan la formación de homogentisato a pesar de la inhibición de la enzima HPPD nativa por el inhibidor de HPPD. La tolerancia de las plantas a los inhibidores de HPPD también se puede mejorar mediante la transformación de las plantas con un gen que codifica una enzima prefenato deshidrogenasa además de un gen que codifica una enzima tolerante a la HPPD.

Otras plantas resistentes a los herbicidas son las plantas que se han hecho tolerantes a los inhibidores de la acetolactato sintetasa (ALS). Los inhibidores de la ALS conocidos incluyen, por ejemplo, los herbicidas de sulfonilurea, imidazolinona, triazolopirimidinas, pirimidinil oxo(tio)benzoatos, y/o sulfonilaminocarbonilimidazolinona. Se conoce que diferentes mutaciones en la enzima ALS (también conocidas como ácido acetohidroxi sintetasa, AHAS) confieren tolerancia a diferentes herbicidas y grupos de herbicidas. Se ha descrito la producción de plantas tolerantes a sulfonilurea y plantas tolerantes a imidazolinona en el documento de publicación de patente internacional WO 1996/033270. También se han descrito otras plantas tolerantes a sulfonilurea y a imidazolinona, por ejemplo en documento WO 2007/024782.

Otras plantas tolerantes a imidazolinona y/o sulfonilurea se pueden obtener por mutagénesis inducida, por selección de cultivos celulares en presencia de pesticidas o por reproducción de mutaciones.

Plantas o variedades de plantas (obtenidas por procedimientos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas transgénicas resistentes a insectos, es decir plantas hechas resistentes a los ataques de determinados insectos diana.

Tales plantas se pueden obtener por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que confiere dicha resistencia a insectos.

En el presente contexto, el término "planta transgénica resistente a insectos" incluye cualquier planta que contenga al menos un transgén que comprende una secuencia codificante que codifica:

1) una proteína cristalina insecticida de *Bacillus thuringiensis* o una parte insecticida de la misma, tal como las proteínas cristalinas insecticidas listadas en línea:

http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/ o las partes insecticidas de las mismas, por ejemplo las proteínas Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry2Ab, Cry3Ae o Cry3Bb de la clase de proteínas Cry o las partes insecticidas las mismas; o

2) una proteína cristalina de *Bacillus thuringiensis* o una parte de la misma que sea insecticida en presencia de otra segunda proteína cristalina de *Bacillus thuringiensis* o una parte de la misma, tal como la toxina binaria que comprende las proteínas cristalinas Cy34 y Cy35; o

3) una proteína insecticida híbrida que comprende partes de dos proteínas cristalinas insecticidas diferentes de *Bacillus thuringiensis*, tal como un híbrido de las proteínas de 1) citadas anteriormente o un híbrido de las proteínas de 2) citadas anteriormente, por ejemplo la proteína Cry1A.105 producida por el suceso MON98034 del maíz (documento WO 2007/027777); o

4) una proteína de uno cualquiera de los puntos 1) a 3) anteriores en la que se han reemplazado algunos aminoácidos, particularmente de 1 a 10, por otros aminoácidos para obtener una mayor actividad insecticida frente a una especie de insecto diana, y/o para ampliar el intervalo de las especies de insectos diana afectadas, y/o debido a cambios inducidos en la codificación del ADN durante la clonación o transformación, tal como la proteína Cry3Bb1 de los sucesos MON863 o MON88017 del maíz o la proteína Cry3A del suceso MIR 604 del maíz;

5) una proteína insecticida secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus* o una parte insecticida de la misma, tal como las proteínas insecticidas vegetativas (VIP) listadas en: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html, por ejemplo proteínas de la clase de proteínas VIP3Aa; o

6) una proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus* que sea insecticida en presencia de una segunda proteína secretada de *Bacillus thuringiensis* o *B. cereus*, tal como la toxina binaria que comprende las proteínas VIP1A y VIP2A;

7) una proteína insecticida híbrida que comprende partes de diferentes proteínas secretadas de *Bacillus thuringiensis* o *Bacillus cereus*, tal como un híbrido de las proteínas de 1) citadas anteriormente o un híbrido de las proteínas de 2) citadas anteriormente; o

8) una proteína de uno cualquiera de los puntos 1) a 3) citados anteriormente en la que se han reemplazado algunos aminoácidos, particularmente de 1 a 10, por otros aminoácidos para obtener una mayor actividad insecticida frente a una especie de insecto diana, y/o para ampliar el intervalo de las especies de insectos diana

afectadas, y/o debido a cambios inducidos en la codificación del ADN durante la clonación o transformación (mientras todavía codifica una proteína insecticida), tal como la proteína VIP3Aa del suceso COT 102 del algodón.

5 Por supuesto, las plantas transgénicas resistentes a insectos, como se usa en el presente documento, también incluyen cualquier planta que comprenda una combinación de los genes que codifican las proteínas de una cualquiera de las clases 1 a 8 citadas anteriormente. En una realización, una planta resistente a insectos contiene más de un transgén que codifica una proteína de una cualquiera de las clases 1 a 8 citadas anteriormente, para ampliar el intervalo de las especies de insectos diana afectadas o para retrasar el desarrollo de la resistencia a insectos de las plantas, mediante el uso de diferentes proteínas insecticidas frente a las mismas especies de insecto objetivo pero ejerciendo un modo de acción diferentes, tal como la unión a diferentes sitios de unión del receptor en el insecto.

10 Plantas o variedades de plantas (obtenidas por procedimientos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también se pueden tratar de acuerdo con la invención son tolerantes a factores de estrés abiótico. Tales plantas se pueden obtener por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que confiere dicha resistencia al estrés. Las plantas tolerantes al estrés particularmente útiles incluyen las siguientes:

- a. Plantas que contienen un transgén capaz de reducir la expresión y/o la actividad del gen poli(ADP-ribosa)polimerasa (PARP) en las células de la planta o en las plantas;
- 20 b. Plantas que contienen un transgén de aumento de tolerancia al estrés capaz de reducir la expresión y/o la actividad de los genes que codifican PARG de las plantas o de las células de las plantas;
- c. Plantas que contienen un transgén de aumento de la tolerancia al estrés que codifican una enzima funcional de planta de la ruta de biosíntesis salvaje de la nicotinamida adenina dinucleótido, incluyendo nicotinamidas, nicotinato fosforibosiltransferasa, ácido nicotínico mononucleótido adeniltransferasa, nicotinamida adenina dinucleótido sintetasa o nicotinamida fosforibosiltransferasa.

25 Plantas o variedades de plantas (obtenidas por procedimientos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también se pueden tratar de acuerdo con la invención muestran una alteración de la cantidad, calidad y/o capacidad de almacenamiento del producto cosechado y/o una alteración de las propiedades de los ingredientes específicos del producto cosechado tales como, por ejemplo:

- 30 1) Plantas transgénicas que sintetizan un almidón modificado que está alterado con respecto a sus rasgos quimicofísicos, en particular el contenido de amilosa o la relación amilosa/amilopectina, el grado de ramificación, la longitud de cadena promedio, la distribución de las cadenas laterales, el comportamiento de la viscosidad, la resistencia al gel, el tamaño del grano y/o la morfología del grano del almidón en comparación con el almidón sintetizado en células de plantas o plantas de tipo salvaje, de modo que dicho almidón modificado es más adecuado para determinadas aplicaciones.
- 35 2) Plantas transgénicas que sintetizan polímeros de hidratos de carbono que no son almidón o que sintetizan polímeros de hidratos de carbono que no son almidón con propiedades alteradas en comparación con las plantas de tipo salvaje sin modificación genética. Los ejemplos son plantas que producen polifruktosa, especialmente del tipo inulina y levana, plantas que producen alfa-1,4-glucanos, plantas que producen alfa-1,4-glucanos alfa-1,6-ramificados y plantas que producen alternano.
- 40 3) Plantas transgénicas que producen hialuronano.

Plantas o variedades de plantas (obtenidas por procedimientos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas, tales como plantas de algodón, con una alteración de las características de la fibra. Tales plantas se pueden obtener por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que confiere tales características de fibra alteradas e incluyen:

- 45 a) plantas, tales como plantas de algodón, que contienen una forma alterada en los genes de celulosa sintasa;
- b) plantas, tales como plantas de algodón, que contienen una forma alterada de los ácidos nucleicos homólogos rsw2 o rsw3;
- c) plantas, tales como plantas de algodón, con un aumento de la expresión de sacarosa fosfato sintasa;
- d) plantas, tales como plantas de algodón, con un aumento de la expresión de sacarosa sintasa;
- 50 e) plantas, tales como plantas de algodón, en las que se altera el tiempo de apertura plasmodesmal en la base de la célula de fibra, por ejemplo a través de la regulación corriente abajo de β -1,3-glucanasa selectiva de la fibra;
- f) plantas, tales como plantas de algodón, que tienen fibras con una alteración de la reactividad, por ejemplo a

través de la expresión del gen de N-acetilglucosaminotransferasa que incluye nodC y los genes de quitina sintetasa.

5 Plantas o variedades de cultivo (obtenidas por procedimientos de biotecnología de plantas tales como ingeniería genética) que también se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas, tales como la colza oleaginosa o plantas de Brassica relacionadas, con una alteración de las características del perfil del aceite. Tales plantas se pueden obtener por transformación genética o por selección de plantas que contienen una mutación que confiere tales características de aceite alteradas e incluyen:

a) plantas, tales como plantas de colza oleaginosa, que producen un aceite que tiene un alto contenido de ácido oleico;

10 b) plantas, tales como plantas de colza oleaginosa, que producen un aceite que tiene un bajo contenido de ácido linoléico;

c) plantas, tales como plantas de colza oleaginosa, que producen un aceite que tiene un bajo nivel de ácidos grasos saturados.

15 Las plantas transgénicas particularmente útiles que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas que comprenden uno o más genes que codifican una o más toxinas y son las plantas transgénicas disponibles bajo los siguientes nombres comerciales: YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón y soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), BiteGard® (por ejemplo maíz), BT-Xtra® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón), Nucotn 33B® (algodón), NatureGard® (por ejemplo maíz), Protecta® y NewLeaf® (patata). Los ejemplos de plantas tolerantes a herbicidas que se pueden mencionar son variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que están disponibles bajo los siguientes nombres comerciales: Roundup Ready® (tolerancia a glifosato, por ejemplo maíz, algodón y soja), Liberty Link® (tolerancia a fosfotricina, por ejemplo colza oleaginosa), IMI® (tolerancia a imidazolinona) y SCS® (tolerancia a sulfonilurea, por ejemplo maíz). Las plantas resistentes a herbicidas (plantas criadas de manera convencional para la tolerancia a herbicidas) que se pueden mencionar incluyen las variedades comercializadas bajo el nombre Clearfield® (por ejemplo maíz).

25 Las plantas transgénicas particularmente útiles que se pueden tratar de acuerdo con la invención son plantas que contienen sucesos de transformación o una combinación de sucesos de transformación y que se listan por ejemplo en las bases de datos de diversas agencias reguladoras nacionales o regionales (véanse por ejemplo http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx y <http://www.agbios.com/dbase.php>).

30 Además, en la protección de materiales, los principios activos o agentes de acuerdo con la invención se pueden emplear para la protección de materiales industriales frente al ataque y a la destrucción por microorganismos no deseados, tales como, por ejemplo, hongos.

35 En el presente contexto se entiende que los materiales industriales se refieren a materiales inanimados que se han preparado para su uso en la industria. Por ejemplo, los materiales industriales que se pretende que se protejan por los principios activos de acuerdo con la invención del cambio o la destrucción por hongos pueden ser adhesivos, encolados, papel, papel pintado y tablones, textiles, alfombras, cuero, madera, pinturas y artículos plásticos, lubricantes de refrigeración y otros materiales que se pueden infectar con o destruir por microorganismos. Las partes de plantas y edificios de producción, por ejemplo circuitos de refrigeración de agua, sistemas de refrigeración y calentamiento y unidades de ventilación y aire acondicionado, que se pueden ver afectadas por la proliferación de microorganismos también se pueden mencionar dentro del alcance de los materiales a ser protegidos. Los materiales industriales que se pueden mencionar dentro del alcance de la presente invención son preferentemente adhesivos, encolados, papel y tablones, cuero, madera, pinturas, lubricantes de refrigeración y líquidos de transferencia de calor, de forma particularmente preferente madera. Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención pueden prevenir los efectos no ventajosos, tales como podredumbre, descomposición, decoloración o formación de moho. Además, los compuestos de acuerdo con la invención se pueden emplear para la protección frente al deterioro de objetos que están en contacto con agua salada o agua salobre, en particular cascos, pantallas, redes, edificios, amarraderos y sistemas de señalización.

45 El procedimiento de acuerdo con la invención para el control de hongos no deseados también se puede emplear para la protección de mercancías de almacenamiento. En este punto, se entiende que mercancías de almacenamiento se refiere a sustancias naturales de origen vegetal o animal o a productos procesados de los mismos de origen natural, para los que se desea una protección a largo plazo. Las mercancías de almacenamiento de origen vegetal, tales como, por ejemplo, plantas o partes de plantas, tales como tallos, hojas, tubérculos, semillas, frutas, granos, se pueden proteger recién cosechadas o después del procesamiento por (pre)secado, humedecimiento, trituración, molienda, prensado o asado. Las mercancías de almacenamiento también incluyen madera, tanto no procesada, tal como madera de construcción, postes de electricidad y vallas, como en forma de productos finales, tales como muebles. Las mercancías de almacenamiento de origen animal son, por ejemplo, pieles, cuero y pelo. Los principios activos de acuerdo con la invención pueden prevenir de efectos no ventajosos, tales como podredumbre, descomposición, decoloración o formación de moho.

Algunos patógenos de enfermedades fúngicas que se pueden tratar de acuerdo con la invención se pueden mencionar a modo de ejemplo, pero no a modo de limitación:

5 enfermedades causadas por patógenos del oídio verdadero, tales como, por ejemplo, las especies de *Blumeria*, tales como, por ejemplo, *Blumeria graminis*; las especies de *Podosphaera*, tales como, por ejemplo, *Podosphaera leucotricha*; las especies de *Sphaerotheca*, tales como, por ejemplo, *Sphaerotheca fuliginea*; las especies de *Uncinula*, tales como, por ejemplo, *Uncinula necator*;

10 enfermedades causadas por patógenos de enfermedades de la roya, tales como, por ejemplo, las especies de *Gymnosporangium*, tales como, por ejemplo, *Gymnosporangium sabinae*; las especies de *Hemileia*, tales como, por ejemplo, *Hemileia vastatrix*; las especies de *Phakopsora*, tales como, por ejemplo, *Phakopsora pachyrhizi* y *Phakopsora meibomia*; las especies de *Puccinia*, tales como, por ejemplo, *Puccinia recondita* o *Puccinia tritici*; las especies de *Uromyces*, tales como, por ejemplo, *Uromyces appendiculatus*;

15 enfermedades causadas por patógenos del grupo de los Oomicetos, tales como, por ejemplo, las especies de *Bremia*, tales como, por ejemplo, *Bremia lactucae*; las especies de *Peronospora*, tales como, por ejemplo, *Peronospora pisi* o *P. brassicae*; las especies de *Phytophthora*, tales como, por ejemplo, *Phytophthora infestans*; las especies de *Plasmopara*, tales como, por ejemplo, *Plasmopara viticola*; las especies de *Pseudoperonospora*, tales como, por ejemplo, *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*; las especies de *Pythium*, tales como, por ejemplo, *Pythium ultimum*;

20 enfermedades de las manchas de las hojas y enfermedades de las hojas marchitas causadas, por ejemplo, por las especies de *Alternaria*, tales como, por ejemplo, *Alternaria solani*; las especies de *Cercospora*, tales como, por ejemplo, *Cercospora beticola*; las especies de *Cladosporium*, tales como, por ejemplo, *Cladosporium cucumerinum*; las especies de *Cochliobolus*, tales como, por ejemplo, *Cochliobolus sativus* (forma de conidio: *Drechslera*, sin: *Helminthosporium*); las especies de *Colletotrichum*, tales como, por ejemplo, *Colletotrichum lindemuthianum*; las especies de *Cicloconium*, tales como, por ejemplo, *Cicloconium oleaginum*; las especies de *Diaporthe*, tales como, por ejemplo, *Diaporthe citri*; las especies de *Elsinoe*, tales como, por ejemplo, *Elsinoe fawcettii*; las especies de *Gloeosporium*, tales como, por ejemplo, *Gloeosporium laeticolor*; las especies de *Glomerella*, tales como, por ejemplo, *Glomerella cingulata*; las especies de *Guignardia*, tales como, por ejemplo, *Guignardia bidwellii*; las especies de *Leptosphaeria*, tales como, por ejemplo, *Leptosphaeria maculans*; las especies de *Magnaporthe*, tales como, por ejemplo, *Magnaporthe grisea*; las especies de *Microdochium*, tales como, por ejemplo, *Microdochium nivale*; las especies de *Mycosphaerella*, tales como, por ejemplo, *Mycosphaerella graminicola* y *M. fijiensis*; las especies de *Phaeosphaeria*, tales como, por ejemplo, *Phaeosphaeria nodorum*; las especies de *Pirenophora*, tales como, por ejemplo, *Pirenophora teres*; las especies de *Ramularia*, tales como, por ejemplo, *Ramularia collo-cygni*; las especies de *Rhynchosporium*, tales como, por ejemplo, *Rhynchosporium secalis*; las especies de *Septoria*, tales como, por ejemplo, *Septoria apii*; las especies de *Typhula*, tales como, por ejemplo, *Typhula incarnata*; las especies de *Venturia*, tales como, por ejemplo, *Venturia inaequalis*;

35 enfermedades de raíces y tallos causadas, por ejemplo, por las especies de *Corticium*, tales como, por ejemplo, *Corticium graminarum*; las especies de *Fusarium*, tales como, por ejemplo, *Fusarium oxysporum*; las especies de *Gaeumannomyces*, tales como, por ejemplo, *Gaeumannomyces graminis*; las especies de *Rhizoctonia*, tales como, por ejemplo *Rhizoctonia solani*; las especies de *Tapesia*, tales como, por ejemplo, *Tapesia acuformis*; las especies de *Thielaviopsis*, tales como, por ejemplo, *Thielaviopsis basicola*;

40 enfermedades de espigas y panojas (incluyendo mazorcas de maíz) causadas, por ejemplo, por las especies de *Alternaria*, tales como, por ejemplo, *Alternaria* spp.; las especies de *Aspergillus*, tales como, por ejemplo, *Aspergillus flavus*; las especies de *Cladosporium*, tales como, por ejemplo, *Cladosporium cladosporioides*; las especies de *Claviceps*, tales como, por ejemplo, *Claviceps purpurea*; las especies de *Fusarium*, tales como, por ejemplo, *Fusarium culmorum*; las especies de *Gibberella*, tales como, por ejemplo, *Gibberella zeae*; las especies de *Monographella*, tales como, por ejemplo, *Monographella nivalis*; las especies de *Septoria*, tales como, por ejemplo, *Septoria nodorum*;

45 enfermedades causadas por hongos de la suciedad, tales como, por ejemplo, las especies de *Sphacelotheca*, tales como, por ejemplo, *Sphacelotheca reiliana*; las especies de *Tilletia*, tales como, por ejemplo, *Tilletia caries*, *T. controversa*; las especies de *Urocystis*, tales como, por ejemplo, *Urocystis occulta*; las especies de *Ustilago*, tales como, por ejemplo, *Ustilago nuda*, *U. nuda tritici*;

50 fruta podrida causada, por ejemplo, por las especies de *Aspergillus*, tales como, por ejemplo, *Aspergillus flavus*; las especies de *Botrytis*, tales como, por ejemplo, *Botrytis cinerea*; las especies de *Penicillium*, tales como, por ejemplo, *Penicillium expansum* y *P. purpurogenum*; las especies de *Sclerotinia*, tales como, por ejemplo, *Sclerotinia sclerotiorum*;

las especies de *Verticillium*, tales como, por ejemplo, *Verticillium albo-atrum*;

enfermedades de podredumbre y marchitamiento transmitidas por las semillas y el suelo y también enfermedades de los semilleros, causadas, por ejemplo, por las especies de *Fusarium*, tales como, por ejemplo,

Fusarium culmorum; las especies de Phytophthora, tales como, por ejemplo, Phytophthora cactorum; las especies de Pythium, tales como, por ejemplo, Pythium ultimum; las especies de Rhizoctonia, tales como, por ejemplo, Rhizoctonia solani; las especies de Sclerotium, tales como, por ejemplo, Sclerotium rolfsii;

5 enfermedades cancerosas, agallas y escoba de brujas causadas, por ejemplo, por las especies de Nectria, tales como, por ejemplo, Nectria galligena;

enfermedades de marchitamiento causadas, por ejemplo, por las especies de Monilinia, tales como, por ejemplo, Monilinia laxa;

deformaciones de las hojas, flores y frutos causadas, por ejemplo, por las especies de Taphrina, tales como, por ejemplo, Taphrina deformans;

10 enfermedades degenerativas de las plantas leñosas causadas, por ejemplo, por las especies de Esca, tales como, por ejemplo, Phaeomoniella chlamydospora y Phaeoacremonium aleophilum y Fomitiporia mediterranea;

enfermedades de flores y semillas causadas, por ejemplo, por las especies de Botrytis, tales como, por ejemplo, Botrytis cinerea;

15 enfermedades de tubérculos de plantas causadas, por ejemplo, por las especies de Rhizoctonia, tales como, por ejemplo, Rhizoctonia solani; las especies de Helminthosporium, tales como, por ejemplo, Helminthosporium solani;

20 enfermedades causadas por patógenos bacterianos, tales como, por ejemplo, las especies de Xanthomonas, tales como, por ejemplo, Xanthomonas campestris pv. oryzae; las especies de Pseudomonas, tales como, por ejemplo, Pseudomonas syringae pv. lachrymans; las especies de Erwinia, tales como, por ejemplo, Erwinia amilovorora.

Se da preferencia al control de las siguientes enfermedades de la soja:

25 enfermedades fúngicas en hojas, tallos, vainas y semillas causadas, por ejemplo, por mancha de la hoja de Alternaria (Alternaria spec. atrans tenuissima), antracnosa (Colletotrichum gloeosporoides dematium var. truncatum), mancha marrón (Septoria glicinas), mancha y chancro de la hoja de Cercospora (Cercospora kikuchii), chancro de la hoja de Choanephora (Choanephora infundibulifera trispora (Syn.)), mancha de la hoja de Dactuliophora (Dactuliophora glicinas), mildiú (Peronospora manshurica), chancro de Drechslera (Drechslera glicini), mancha de la hoja de ojo de rana (Cercospora sojina), mancha de la hoja de Leptosphaerulina (Leptosphaerulina trifolii), mancha de la hoja de Phyllosticta (Phyllosticta sojaecola), chancro de vaina y tallo (Phomopsis sojiae), oídio (Microsphaera diffusa), mancha de la hoja de Pyrenochaeta (Pyrenochaeta glicinas), chancro aéreo, de follaje y de tela de araña de Rhizoctonia (Rhizoctonia solani), roya (Phakopsora pachyrhizi, Phakopsora meibomiae), sarna (Sphaceloma glicinas), chancro de hoja de Stemphylium (Stemphylium botryosum), mancha en diana (Corynespora cassiicola).

35 Las enfermedades fúngicas en la raíces y la base del tallo causadas, por ejemplo, por podredumbre negra de la raíz (Calonectria crotalariae), podredumbre de carbón vegetal (Macrophomina phaseolina), podredumbre de la vaina y collar, podredumbre de la raíz, chancro o marchitez por Fusarium (Fusarium oxisporum, Fusarium ortoceras, Fusarium semitectum, Fusarium equiseti), podredumbre de la raíz por Mycoleptodiscus (Mycoleptodiscus terrestris), neocosmospora (Neocosmospora vasinfecta), chancro de vaina y tallo (Diaporthe phaseolorum), antracnosis de tallo (Diaporthe phaseolorum var. caulivora), podredumbre por Phytophthora (Phytophthora megasperma), podredumbre marrón de tallo (Phialophora gregata), podredumbre por Pythium (Pythium aphanidermatum, Pythium irregulare, Pythium debaryanum, Pythium myriotylum, Pythium ultimum), podredumbre de la raíz, descomposición del tallo y podredumbre de las semillas por Rhizoctonia (Rhizoctonia solani), descomposición del tallo por Sclerotinia (Sclerotinia sclerotiorum), chancro del sur por Sclerotinia (Sclerotinia rolfsii), podredumbre de la raíz por Thielaviopsis (Thielaviopsis basicola).

45 Los organismos que pueden provocar la degradación o la modificación de los materiales industriales y que se pueden mencionar son hongos. Los principios activos de acuerdo con la invención actúan preferentemente frente a hongos, en particular mohos, hongos de decoloración de la madera y hongos de destrucción de la madera (Basidiomicetos). Se pueden mencionar los hongos de los siguientes géneros como ejemplos: Alternaria, tal como Alternaria tenuis; Aspergillus, tal como Aspergillus niger; Chaetomium, tal como Chaetomium globosum; Coniophora, tal como Coniophora puetana; Lentinus, tal como Lentinus tigrinus; Penicillium, tal como Penicillium glaucum; Polyporus, tal como Polyporus versicolor; Aureobasidium, tal como Aureobasidium pullulans; Sclerophoma, tal como Sclerophoma pityophila; Trichoderma, tal como Trichoderma viride.

55 Además, los principios activos de acuerdo con la invención también tienen una actividad antimicótica muy buena. Tienen un espectro muy amplio de actividad antimicótica, en particular frente a dermatofitos y levaduras y mohos y hongos difásicos (por ejemplo frente a las especies de Candida, tales como Candida albicans, Candida glabrata) y Epidermophyton floccosum, las especies de Aspergillus, tales como Aspergillus niger y Aspergillus fumigatus, las especies de Trichophyton, tales como Trichophyton mentagrophytes y las especies de Microsporon tales como Microsporon canis y audouinii. La lista de estos hongos no significa una limitación en el espectro micótico cubierto,

sino que es solamente a efectos de ilustración.

Cuando se usan los principios activos de acuerdo con la invención como fungicidas, se pueden variar las dosis de aplicación dentro de un intervalo relativamente amplio, dependiendo de la clase de aplicación. La dosis de aplicación de los principios activos de acuerdo con la invención es

- 5 cuando se tratan partes de plantas, por ejemplo hojas: de 0,1 a 10000 g/ha, preferentemente de 10 a 1000 g/ha, de forma particularmente preferente de 50 a 300 g/ha (cuando aplicación se lleva a cabo mediante irrigación o empapado, es posible incluso una reducción en la dosis de aplicación, especialmente cuando se usan sustratos inertes tales como lana de roca o perlita);
 10 cuando se tratan semillas: de 2 a 200 g por 100 kg de semillas, preferentemente de 3 a 150 g por 100 kg de semillas, de forma particularmente preferente de 2,5 a 25 g por 100 kg de semillas, de forma muy particularmente preferente de 2,5 a 12,5 g por 100 kg de semillas; cuando se trata el suelo: de 0,1 a 10000 g/ha, preferentemente de 1 a 5000 g/ha.

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

- 15 Los principios activos o agentes de acuerdo con la invención se pueden emplear de esta manera para la protección de plantas durante un determinado período de tiempo después del tratamiento frente al ataque de los patógenos mencionados. El periodo para el que se proporciona protección se extiende generalmente de 1 a 28 días, preferentemente de 1 a 14 días, de forma particularmente preferente de 1 a 10 días, de forma muy particularmente preferente de 1 a 7 días después del tratamiento de las plantas con los principios activos o hasta 200 días después
 20 del tratamiento de las semillas.

- Además, mediante el tratamiento de acuerdo con la invención es posible reducir el contenido de micotoxinas en el material cosechado y en las sustancias comestibles y piensos preparados a partir de los mismos. En este punto se puede realizar una mención particular, pero no exclusiva, de las siguientes micotoxinas: desoxinivalenol (DON),
 25 nivalenol, 15-Ac-DON, 3-Ac-DON, T2- y HT2-toxina, fumonisinas, zearalenon, moniliformina, fusarina, diacetoxiscirpenol (DAS), beauvericina, enniatina, fusaroproliferina, fusarenol, ocratoxinas, patulina, alcaloides del cornezuelo y aflatoxinas producidas, por ejemplo, por los siguientes hongos: *Fusarium spec.*, tales como *Fusarium acuminatum*, *F. avenaceum*, *F. crookwellense*, *F. culmorum*, *F. graminearum* (*Gibberella zeae*), *F. equiseti*, *F. fujikoro*, *F. musarum*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. poae*, *F. pseudograminaarum*, *F. sambucinum*, *F. scirpi*, *F. semitectum*, *F. solani*, *F. sporotrichoides*, *F. langsetiae*, *F. subglutinans*, *F. tricinctum*, *F. verticillioides*, entre otros y también por *Aspergillus spec.*, *Penicillium spec.*, *Claviceps purpurea*, *Stachybotrys spec.*, entre otros.
 30

- Las plantas listadas se pueden tratar de acuerdo con la invención de una forma particularmente ventajosa con los derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina de fórmula (I) o los agentes de acuerdo con la invención. Los intervalos preferentes indicados anteriormente para los principios activos o los agentes también se aplican para el tratamiento de estas plantas. Se hace un énfasis particular en el tratamiento de plantas con los compuestos o
 35 agentes mencionados específicamente en el presente documento.

La preparación y el uso de los principios activos de fórmula (I) de acuerdo con la invención se ilustran mediante los siguientes ejemplos. Sin embargo, la invención no se limita a estos ejemplos.

- Nota general: A menos que se indique otra cosa, todas las etapas de purificación por cromatografía y separación se llevan a cabo sobre gel de sílice y con un gradiente de disolvente de acetato de etilo/ciclohexano 0:100 a acetato de
 40 etilo/ciclohexano 100:0.

Ejemplos:

Preparación de (I-24):

Etapas 1

4-{4-[Metoxi(metil)carbamoil]-1,3-tiazol-2-il}piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (V-1)

- 45 A temperatura ambiente, se añadió trietilamina (324 mg) a una suspensión de ácido 2-[1-(*terc*-butoxicarbonil)piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-carboxílico (1,0 g) en diclorometano (30 ml). Después de diez minutos de agitación, se añadieron cloruro de metoxi(metil)amonio (312 mg), 4-dimetilaminopiridina (39 mg) y sal de HCl de 1-etil-3-(3'-dimetilaminopropil)carbodiimida (675 mg). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante una noche y a continuación se añadió agua. La fase acuosa se separó y se extrajo con acetato de etilo. Las fases orgánicas
 50 combinadas se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía. Esto proporcionó 4-{4-[metoxi(metil)carbamoil]-1,3-tiazol-2-il}piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (1,0 g).
 logP (pH 2,7): 2,40
 RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,41 (s, 9H), 1,52-1,63 (m, 2H), 2,02-2,08 (m, 2H), 2,90 (s a, 2H), 3,19-3,30 (1H), 3,29 (s, 3H), 3,32 (s, 3H), 3,96-4,04 (m, 2H), 8,09 (s, 1H)
 55 EM (IEN): 356 ([M+H]⁺)

Etapa 2**4-[4-(Ciclohexilacetil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (IV-1)**

En atmósfera de argón y a -78 °C, se añadió gota a gota cloruro de ciclohexilmetilmagnesio 0,5 M en éter dietílico (2,7 ml) a una solución de 4-[4-[metoxi(metil)carbamoil]-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (480 mg) en tetrahidrofurano (5 ml). La mezcla de reacción se agitó a -78 °C durante una hora. A continuación, la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante una hora. Se añadió a continuación una solución saturada de cloruro de amonio a la mezcla de reacción y la fase acuosa se separó. Después de la extracción de la fase acuosa con acetato de etilo, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato sódico y el disolvente se retiró a presión reducida. Esto proporcionó 4-[4-(ciclohexilacetil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (335 mg).

logP (pH 2,7): 5,43

RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 0,98-1,05 (m, 2H), 1,14-1,22 (m, 1H), 1,22-1,31 (m, 2H), 1,44 (s, 9H), 1,61-1,76 (m, 8H), 2,05-2,10 (m, 2H), 2,87 (d, 2H), 2,90 (s a, 2H), 3,18-3,26 (m, 1H), 4,07-4,15 (m, 2H), 8,10 (s, 1H)

EM (IEN): 337 ([M-(CH₃)₃C+H]⁺)

Etapa 3**Cloruro de 4-[4-(ciclohexilacetil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (II-1)**

En atmósfera de argón y a 0 °C, se añadió una solución de cloruro de hidrógeno en dioxano (4 M, 1 ml) a una solución de 4-[4-(ciclohexilacetil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (5,0 g) en éter dietílico (1 ml). La mezcla se agitó a 0 °C y a continuación se calentó lentamente a temperatura ambiente. Después de agitar durante una noche, se retiraron el exceso de ácido y el disolvente a presión reducida. Esto proporcionó cloruro de 4-[4-(ciclohexilacetil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (315 mg).

logP (pH 2,7): 1,35

EM (IEN): 293 ([M-Cl]⁺)

Etapa 4**2-[3,5-Bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-[4-(ciclohexilacetil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona (I-24)**

Se añadieron cloruro de oxalilo (116 mg) y una gota de N,N-dimetilformamida a una solución de ácido [3,5-(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (69 mg) en diclorometano (5 ml). A continuación, la mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos. A continuación se retiró el exceso de cloruro de oxalilo a presión reducida y el residuo se disolvió de nuevo en diclorometano (2 ml). A continuación se añadió la solución a una solución de cloruro de 4-[4-(ciclohexilacetil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (100 mg) en diclorometano (5 ml) y trietilamina (92 mg). La mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos. Se retiraron el disolvente y la trietilamina a presión reducida. La purificación del residuo por cromatografía en columna proporcionó 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-[4-(ciclohexilacetil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona (105 mg).

logP (pH 2,7): 4,02

RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 0,95-1,02 (m, 2H), 1,10-1,26 (m, 3H), 1,54-1,69 (m, 6H), 1,77-1,91 (m, 2H), 2,06-2,15 (m, 2H), 2,82-2,87 (m, 1H), 2,89 (d, 2H), 3,25-3,30 (m, 1H), 3,35-3,41 (m, 1H), 3,94-3,99 (m, 1H), 4,33-4,37 (m, 1H), 5,36 (d, 1H), 5,45 (d, 1H), 6,91 (s, 1H), 7,04 (t, 1H), 7,18 (t, 1H), 8,44 (s, 1H)

EM (IEN): 501 ([M+H]⁺)

Preparación del compuesto (I-25)**Etapa 1****N-(5-Cloro-2-metilfenil)-4-[4-(ciclohexilacetil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxamida (I-25)**

Se añadió trietilamina (0,047 ml) a una mezcla de cloruro de 4-[4-(ciclohexilacetil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (100 mg) en diclorometano (1 ml). Después de disolver el sólido completamente, se añadieron 4-cloro-2-isocianato-1-metilbenceno (51 mg) y una gota de 1,8-diazabicyclo[5,4,0]undec-7-eno. A continuación, la mezcla de reacción se agitó durante 5 minutos. Se retiraron el disolvente y la trietilamina a presión reducida. La purificación del residuo por cromatografía en columna proporcionó N-(5-cloro-2-metilfenil)-4-[4-(ciclohexilacetil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxamida (128 mg).

logP (pH 2,7): 4,51

RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 0,94-1,05 (m, 2H), 1,10-1,26 (m, 4H), 1,56-1,73 (m, 6H), 1,83-1,92 (m, 1H), 2,06-2,13 (m, 2H), 2,16 (s, 3H), 2,88 (d, 2H), 2,98-3,06 (m, 2H), 3,30-3,38 (m, 1H), 4,11-4,18 (m, 2H), 7,07 (dd, 1H), 7,19 (d, 1H), 7,33 (d, 1H), 8,12 (s, 1H), 8,04 (s, 1H)

EM (IEN): 460 ([M+H]⁺)

Preparación del compuesto (I-58)**Etapas 1****1-[2-(1-{2-[3,5-Bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanotioil})piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-2-ciclohexiletanona (I-58)**

- 5 A temperatura ambiente, se añadió 2,4-disulfuro de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3,2,4-ditiadifosfetano (194 mg) a una solución de 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(ciclohexilacetil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona (200 mg) en tolueno (2 ml). La mezcla de reacción se agitó a 60 °C durante 2 horas. Después de retirar el disolvente a presión reducida, el residuo se purificó mediante cromatografía. Esto proporcionó 1-[2-(1-{2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanotioil})piperidin-4-il]-1,3-tiazol-4-il]-2-ciclohexiletanona (101 mg, 49 %).
- 10 logP (pH 2,7): 4,63
 RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 0,94-1,05 (m, 2H), 1,10-1,30 (m, 4H), 1,56-1,80 (m, 6H), 1,83-1,95 (m, 1H), 2,06-2,15 (m, 2H), 2,88 (d, 2H), 3,30-3,42 (m, 1H), 3,51-3,61 (m, 2H), 4,42-4,49 (m, 1H), 5,26-5,33 (m, 1H), 5,55 (d, 1H), 5,59 (d, 1H), 6,89 (s, 1H), 7,02 (t, 1H), 7,20 (t, 1H), 8,04 (s, 1H)
 EM (IEN): 517 ([M+H]⁺)

15 Preparación del compuesto (I-60)**Etapas 1****4-[4-(2-Ciclohexil-N-metoxietanimidoil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo**

- A temperatura ambiente, se añadió cloruro de metoxiamonio (171 mg) a una solución de 4-[4-[metoxi(metil)carbamoil]-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (403 mg) en etanol (2 ml). La mezcla de reacción se agitó a 50 °C durante 24 horas y a continuación se añadió agua. La fase acuosa se separó y se extrajo con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato sódico y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía. Esto proporcionó 4-[4-(2-ciclohexil-N-metoxietanimidoil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (361 mg).
- 20

Etapas 2**25 2-[3,5-Bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(2-ciclohexil-N-metoxietanimidoil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona (I-60)**

- En atmósfera de argón y a 0 °C, se añadió una solución de cloruro de hidrógeno en dioxano (4 M, 2,6 ml) a una suspensión de 4-[4-(2-ciclohexil-N-metoxietanimidoil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (287 mg). La mezcla se agitó a 0 °C y a continuación se calentó lentamente a temperatura ambiente. Después de agitar durante una noche, se retiraron el exceso de ácido y el disolvente a presión reducida. Esto proporcionó cloruro de 4-[4-(2-ciclohexil-N-metoxietanimidoil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio.
- 30

- A temperatura ambiente, se añadieron ácido [3,5-(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (225 mg), dimetilaminopiridina (12 mg) y 1-etil-3-(3'-dimetilaminopropil)carbodiimida (89 mg) a una solución de cloruro de 4-[4-(2-ciclohexil-N-metoxietanimidoil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (357 mg) en diclorometano (3 ml) y trietilamina (101 mg). La mezcla se agitó durante 3 horas y a continuación se añadió agua. La fase acuosa se retiró y se extrajo con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato sódico. El sólido se retiró mediante filtración y el disolvente eliminó mediante destilación. El residuo se purificó mediante cromatografía. Esto proporcionó 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(2-ciclohexil-N-metoxietanimidoil)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona (182 mg, 70 %).
- 35
- 40 logP (pH 2,7): 4,80
 EM (IEN): 530 ([M+H]⁺)

Preparación del compuesto (I-14)**Etapas 1****4-[4-(1-Hidroxi-3-fenilpropil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (XVI-1)**

- 45 En atmósfera de argón y a -78 °C, se añadió gota a gota cloro(2-feniletil)magnesio (1 M en éter dietílico, 3,77 ml) a una solución de 4-(4-formil-1,3-tiazol-2-il)piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (1,0 g) en tetrahidrofurano (10 ml). La mezcla de reacción se agitó a -78 °C durante una hora y a continuación se añadió gota a gota más cloro(2-feniletil)magnesio (3 M en éter dietílico, 0,20 ml). A continuación, la mezcla de reacción se agitó durante 20 minutos. A continuación se añadió una solución saturada de cloruro de amonio a la mezcla de reacción y la fase acuosa se separó. Después de la extracción de la fase acuosa con acetato de etilo, las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato sódico y se retiró el disolvente a presión reducida. Esto proporcionó 4-[4-(1-hidroxi-3-fenilpropil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (790 mg).
- 50
- logP (pH 2,7): 3,79
 RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,41 (s, 9H), 1,48-1,61 (m, 2H), 1,90-2,11 (4H), 2,62-2,67 (m, 2H), 2,87-2,95 (m,

2H), 3,15-3,20 (m, 1H), 3,94-4,00 (2H), 4,62-4,67 (m, 1H), 5,09-5,12 (m, 1H), 7,11-7,18 (m, 3H), 7,22-7,27 (m, 3H)
EM (IEN): 347 ([M-C(CH₃)₃+2H]⁺)

Etapa 2

4-[4-(3-Fenilpropanoil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (IV-2)

5 A temperatura ambiente, se añadió gota a gota 1,1,1-triacetoxi-1,1-dihidro-1,2-benziodoxol-3(1H)-ona (solución al 15 % en diclorometano, 8,3 g) a una solución de 4-[4-(1-hidroxi-3-fenilpropil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (790 mg) en diclorometano (7,9 ml). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante una noche. A continuación se añadieron 5 g de gel de sílice y el disolvente se retiró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía. Esto proporcionó 4-[4-(3-fenilpropanoil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (545 mg).

logP (pH 2,7): 4,54

RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,41 (s, 9H), 1,54-1,65 (m, 2H), 2,00-2,08 (m, 2H), 2,88-2,97 (m, 4H), 3,20-3,30 (m, 1H), 3,31 (t, 2H), 3,96-4,02 (m, 2H), 7,12-7,18 (m, 1H), 7,21-7,28 (m, 4H), 8,35 (s, 1H)

EM (IEN): 345 ([M-C(CH₃)₃+2H]⁺)

15 Etapa 3

Cloruro de 4-[4-(3-fenilpropanoil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (II-2)

Se hizo reaccionar 4-[4-(3-fenilpropanoil)-1,3-tiazol-2-il]piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (550 mg) de forma análoga a **II-1** (etapa 3) con cloruro de hidrógeno en éter dietílico (2 M, 11 ml). Esto proporcionó cloruro de 4-[4-(3-fenilpropanoil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (500 mg).

logP (pH 2,7): 1,19

RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,95-2,05 (m, 2H), 2,18-2,25 (m, 2H), 2,96 (t, 2H), 3,00-3,08 (m, 2H), 3,29-3,36 (m, 4H), 3,36-3,46 (m, 1H), 7,13-7,18 (m, 1H), 7,22-7,30 (m, 4H), 8,40 (s, 1H), 8,99 (s a, 1H), 9,22 (s a, 1H)

EM (IEN): 301 ([M-Cl]⁺)

Etapa 4

25 1-[2-(1-[[5-Metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-3-fenilpropan-1-ona

Se hizo reaccionar cloruro de 4-[4-(3-fenilpropanoil)-1,3-tiazol-2-il]piperidinio (502 mg) de forma análoga a **I-24** (etapa 4) con ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (310 mg). Esto proporcionó 1-[2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-3-fenilpropan-1-ona (495 mg).

logP (pH 2,7): 3,64

30 RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,65 (s a, 1H), 1,80 (s a, 1H), 2,08-2,17 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,90 (s a, 1H), 2,96 (t, 2H), 3,20-3,42 (m, 2H), 3,33 (t, 2H), 3,99 (s a, 1H), 4,33 (s a, 1H), 5,15-5,25 (m, 2H), 6,44 (s, 1H), 7,14-7,18 (m, 1H), 7,21-7,30 (m, 4H), 8,37 (s, 1H)

EM (IEN): 491 ([M+H]⁺)

Preparación del compuesto (I-12)

35 Etapa 1

Clorhidrato de 1-[2-(piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]etanona

En atmósfera de argón y a 0 °C, se añadió gota a gota ácido clorhídrico (2 M en éter dietílico, 23 ml) a una solución de 4-(4-acetil-1,3-tiazol-2-il)piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (920 mg) en éter dietílico (2 ml). La mezcla de reacción se agitó durante 24 horas. Se retiraron el disolvente y el exceso de ácido a presión reducida. Esto proporcionó clorhidrato de 1-[2-(piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]etanona (1,05 g) en forma de un sólido de color blanco altamente higroscópico que se procesó de forma adicional inmediatamente.

40 RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 2,01 (cd, 2H), 2,28-2,20 (m, 2H), 2,55 (s, 3H), 3,02 (c, 2H), 3,38-3,27 (m, 2H), 3,42 (m, 1H), 8,39 (s, 1H), 9,06 (s a, 1H), 9,25 (s a, 1H)

EM (IEN): 211 ([M+H-Cl]⁺)

45 Etapa 2

1-[4-(4-Acetil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (XXII-1)

Se añadieron cloruro de oxalilo (1,74 g) y una gota de N,N-dimetilformamida a una solución de ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (1,00 g) en diclorometano (10 ml). A continuación, la mezcla de reacción se agitó durante 24 horas. A continuación se retiró el exceso de cloruro de oxalilo a presión reducida y el residuo se disolvió de nuevo en diclorometano (10 ml). A continuación se añadió la solución, con refrigeración en un baño de hielo, a una suspensión de clorhidrato de 1-[2-(piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]etanona (1,13 g) en diclorometano (10 ml) y N,N-diisopropiletilamina (1,77 g). A continuación se dejó calentar la mezcla de reacción a temperatura ambiente y se agitó durante otras 2 horas. A continuación se añadió una solución acuosa saturada de cloruro de amonio (5 ml) a

50

la mezcla de reacción. La fase acuosa se separó y se extrajo con diclorometano. Se combinaron todas las fases orgánicas y se secaron con sulfato sódico anhidro. A continuación se retiró el sólido mediante filtración y el disolvente se retiró a presión reducida. La purificación por cromatografía en columna (gel de sílice, gradiente de elución de 0 % - 100 % de acetato de etilo: hexano) proporcionó 1-[4-(4-acetil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (1,00 g).

logP (pH 2,7): 2,25

RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,65 (s a, 1H), 1,80 (s a, 1H), 2,18-2,11 (m, 2H), 2,23 (s, 3H), 2,55 (s, 3H), 2,90 (s a, 1H), 3,28 (s a, 1H), 3,39 (m, 1H), 4,00 (s a, 1H), 4,33 (s a, 1H), 5,22 (s a, 2H), 6,45 (s, 1H), 8,36 (s, 1H)

EM (IEN): 401 ([M+H]⁺)

10 Etapa 3

(2E)-3-(2,6-Difluorofenil)-1-[2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]prop-2-en-1-ona (I-12)

A temperatura ambiente, se añadió una solución de hidróxido sódico (19 mg) en metanol (0,25 ml) y agua (0,05 ml) a una solución de 1-[4-(4-acetil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (190 mg) y 2,6-difluorobenzaldehído (67 mg) en metanol (0,12 ml). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante una noche. Después de un procedimiento acuoso, la mezcla se extrajo con acetato de etilo y los extractos se secaron con sulfato sódico y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía. Esto proporcionó (2E)-3-(2,6-difluorofenil)-1-[2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]prop-2-en-1-ona (160 mg).

logP (pH 2,7): 3,83

RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,56-1,68 (m, 1H), 1,78-1,91 (m, 1H), 2,10-2,21 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,84-2,92 (m, 1H), 3,20-3,50 (m, 2H), 3,95-4,05 (m, 1H), 4,36-4,92 (m, 1H), 5,23 (d, 1H), 5,34 (d, 1H), 6,50 (s, 1H), 7,26 (d, 1H), 7,28 (d, 1H), 7,58 (m, 1H), 7,81 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 8,626 (s, 1H)

EM (IEN): 525 ([M+H]⁺)

25 Preparación del compuesto (I-11)

Etapa 1

4-(4-Etinil-1,3-tiazol-2-il)piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (VI-1)

En atmósfera de argón, se disolvió 4-(4-formil-1,3-tiazol-2-il)piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (600 mg) en metanol y se añadieron carbonato potásico (839 mg) y 1-diazo-2-oxopropilfosfonato de dimetilo (786 mg). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. Después de un procedimiento acuoso, la mezcla se extrajo con acetato de etilo, los extractos se secaron con sulfato sódico y el disolvente se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía. Esto proporcionó 4-(4-etinil-1,3-tiazol-2-il)piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (493 mg).

logP (pH 2,7): 3,10

RMN ¹H (CD₃CN): δ_{ppm} 7,51 (s, 1H), 4,07 (d, 2H), 3,36 (s, 1H), 3,16 (m, 1H), 2,90 (t, 2H), 2,10-2,00 (m, 2H), 1,65 (cd, 2H), 1,43 (s, 9H) ppm

EM (IEN): 237 ([M+2H-C(CH₃)₃]⁺)

Etapa 2

1-[4-(4-Etinil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (XX-1)

A temperatura ambiente, una solución de ácido trifluoroacético (30 % en diclorometano, 2 ml) se añadió a 4-(4-etinil-1,3-tiazol-2-il)piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (100 mg). Después de 30 minutos de agitación, se añadió trietilamina (2 ml) a la mezcla de reacción.

Se añadieron cloruro de oxalilo (130 mg) y una gota de N,N-dimetilformamida a una solución de ácido [5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (71 mg) en diclorometano (2 ml). A continuación, la mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos. A continuación se retiró el exceso de cloruro de oxalilo a presión reducida y el residuo se disolvió de nuevo en diclorometano (2 ml). A continuación la solución se añadió a la primera solución. La mezcla de reacción se agitó durante 1 hora. Se retiraron el disolvente y la trietilamina a presión reducida y el residuo se purificó a continuación mediante cromatografía. Esto proporcionó 1-[4-(4-etinil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (130 mg).

logP (pH 2,7): 2,61

RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,60 (s a, 1H), 1,76 (s a, 1H), 2,05-2,12 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,88 (s a, 1H), 3,20-3,35 (m, 2H), 3,98 (s a, 1H), 4,08 (s, 1H), 4,32 (s a, 1H), 5,20 (s a, 2H), 6,45 (s, 1H), 7,86 (s, 1H)

EM (IEN): 383 ([M+H]⁺)

Etapa 3**1-(2-Etoxifenil)-3-[2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]prop-2-in-1-ona (I-11)**

5 A temperatura ambiente y en atmósfera de argón, se añadieron cloruro de paladio (II) (5,8 mg) y yoduro de cobre (I) a una solución de 1-[4-(4-etinil-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (250 mg) y cloruro de 2-etoxibenzoílo en tetrahidrofurano. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 minuto y a continuación se añadió trietilamina (83 mg). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante una noche. A continuación se añadieron 5 g de gel de sílice y el disolvente se retiró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía. Esto proporcionó 1-(2-etoxifenil)-3-[2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]prop-2-in-1-ona (244 mg).

10 logP (pH 2,7): 3,78

RMN ¹H (CD₃CN, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,44 (t, 3H), 1,65-1,95 (m, 2H), 2,12-2,21 (m, 2H), 2,24 (s, 3H), 2,90 (s a, 1H), 3,25-3,38 (m, 2H), 3,95 (s a, 1H), 4,22 (c, 2H), 4,43 (1H), 5,04 (s a, 2H), 6,37 (s, 1H), 7,02-7,18 (m, 2H), 7,54-7,60 (m, 1H), 7,87 (dd, 1H), 7,89 (s, 1H)

15 EM (IEN): 531 ([M+H]⁺)

Preparación del compuesto (I-20)**Etapa 1****1-(2-Etoxifenil)-3-[2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]propan-1-ona (I-20)**

20 Se disolvió 1-(2-etoxifenil)-3-[2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]prop-2-in-1-ona (130 mg) en metanol y se hidrogenó a 40 °C y a una presión de H₂ de 1000 kPa y en presencia de Pd/C (10 %). Esto proporcionó, después la filtración y la eliminación del disolvente a presión reducida, 1-(2-etoxifenil)-3-[2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]propan-1-ona (40 mg).

25 logP (pH 2,7): 3,70

RMN ¹H (CD₃CN, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,44 (t, 3H), 1,58-1,70 (m, 1H), 1,75-1,86 (m, 1H), 2,06-2,18 (m, 2H), 2,25 (s, 3H), 2,82-2,90 (m, 1H), 3,09 (t, 2H), 3,20-3,32 (m, 2H), 3,42 (t, 2H), 3,88-3,95 (m, 1H), 4,16 (c, 2H), 4,42-4,47 (m, 1H), 5,04 (d, 1H), 5,11 (d, 1H), 6,42 (s, 1H), 6,95 (s, 1H), 7,01 (t, 1H), 7,09 (d, 1H), 7,47-7,53 (m, 1H), 5,59 (dd, 1H)

EM (IEN): 535 ([M+H]⁺)

Preparación del compuesto (I-22)**Etapa 1****4-{4-[(1E)-3-(2,6-difluorofenil)-3-oxoprop-1-en-1-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (IV-3)**

35 Se hizo reaccionar 4-(4-formil-1,3-tiazol-2-il)piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (500 mg) de forma análoga a **I-12 (etapa 3)** con 1-(2,6-difluorofenil)etanona (263 mg). Esto proporcionó 4-{4-[(1E)-3-(2,6-difluorofenil)-3-oxoprop-1-en-1-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (720 mg).

logP (pH 2,7): 4,30

RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,41 (s, 9H), 1,51-1,61 (m, 2H), 2,00-2,08 (m, 2H), 2,90 (s a, 2H), 3,80-4,04 (m, 3H), 7,15 (d, 1H), 7,27 (t, 2H), 7,47 (d, 1H), 7,60-7,70 (m, 1H), 8,16 (s, 1H)

EM (IEN): 335 ([M-C=OOC(CH₃)₃+2H]⁺)

Etapa 2**(2E)-3-[2-(1-[[3,5-Bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-1-(2,6-difluorofenil)prop-2-en-1-ona (I-22)**

40 Se hizo reaccionar 4-{4-[(1E)-3-(2,6-difluorofenil)-3-oxoprop-1-en-1-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidina-1-carboxilato de *terc*-butilo (720 mg) de forma análoga a **II-1 (etapa 3)**. Esto proporcionó cloruro de 4-{4-[(1E)-3-(2,6-difluorofenil)-3-oxoprop-1-en-1-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidinio (800 mg).

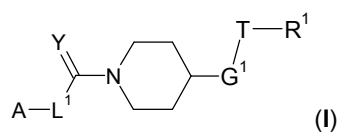
45 Se hizo reaccionar cloruro de 4-{4-[(1E)-3-(2,6-difluorofenil)-3-oxoprop-1-en-1-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidinio (300 mg) de forma análoga a **I-24 (etapa 4)** con ácido [3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acético (183 mg). Esto proporcionó (2E)-3-[2-(1-[[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-1-(2,6-difluorofenil)prop-2-en-1-ona (100 mg).

logP (pH 2,7): 3,35

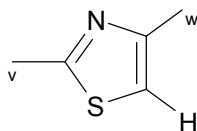
50 RMN ¹H (DMSO-d₆, 400 MHz): δ_{ppm}: 1,51-1,63 (m, 1H), 1,75-1,88 (m, 1H), 2,05-2,16 (m, 2H), 2,80-2,88 (m, 1H), 3,20-3,42 (m, 2H), 3,92-4,01 (m, 1H), 4,30-4,46 (m, 1H), 5,35 (d, 1H), 5,44 (d, 1H), 6,88 (s, 1H), 7,04 (t, 1H), 7,15-7,20 (m, 1H), 7,18 (t, 1H), 7,24-7,32 (m, 2H), 7,49 (d, 1H), 7,60-7,70 (m, 1H), 8,17 (s, 1H)

EM (IEN): 543 ([M-H]⁺)

Los compuestos de fórmula (I) listados en la siguiente Tabla 1 se pueden obtener de forma análoga a los procedimientos proporcionados anteriormente:



Para todos los ejemplos de la Tabla 1, G¹ =



5

en el que el enlace identificado por "v" está unido directamente al anillo de piperidina y en el que el enlace identificado por "w" está unido directamente a T. El enlace de T identificado por "*" está unido a G¹ y el enlace identificado por "#" está unido a R¹.

Tabla 1:

Ej.	A	L ¹	Y	T	R ¹	log P
1-1	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C≡C-CO-#	fenilo	3,58 ^[a]
1-2	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C≡C-CO-#	2-metoxifenilo	3,35 ^[a] , 3,36 ^[b]
1-3	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C≡C-CO-#	naftalen-1-ilo	4,25 ^[a]
1-4	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C≡C-CO-#	ciclohexilo	4,15 ^[a]
1-5	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C≡C-CO-#	2-clorofenilo	3,79 ^[a]
1-6	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C≡C-CO-#	2,4-diclorofenilo	4,31 ^[a]
1-7	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C≡C-CO-#	4-metoxifenilo	3,54 ^[a]
1-8	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C≡C-CO-#	terc-butilo	3,68 ^[a]
1-9	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C≡C-CO-#	tiofen-2-ilo	3,29 ^[a]
1-10	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C≡C-CO-#	furan-2-ilo	2,92 ^[a]
1-11	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C≡C-CO-#	2-etoxifenilo	3,76 ^[a]
1-12	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CO-CH=CH-[E]-#	2,6-difluorofenilo	3,83 ^[a]
1-13	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CO-CH ₂ -#	2-bromofenilo	3,67 ^[a] , 3,71 ^[b]
1-14	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-COCH ₂ CH ₂ -#	fenilo	3,64 ^[a]
1-15	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CO-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -#	fenilo	4,08 ^[a]
1-16	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CO-CH ₂ -#	fenilo	3,36 ^[a]
1-17	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CO-CH ₂ -#	ciclohexilo	4,13 ^[a] , 4,24 ^[b]
1-18	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CO-CH ₂ -#	naftalen-1-ilo	3,87 ^[a]
1-19	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH ₂ CH ₂ -CO-#	2-metoxifenilo	3,34 ^[a]
1-20	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH ₂ CH ₂ -CO-#	2-etoxifenilo	3,7 ^[a] , 3,68 ^[b]

(continuación)

Ej.	A	L1	Y	T	R1	log P
I-21	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH ₂ CH ₂ -CO-#	2-clorofenilo	3,6 ^[a] , 3,63 ^[b]
I-22	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CH-CO-[E]-#	2,6-difluorofenilo	3,35 ^[a]
I-23	2,5-dimetilfenilo	NH	O	*-CH=CH-CO-[E]-#	2,6-difluorofenilo	3,56 ^[a]
I-24	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CO-CH ₂ -#	ciclohexilo	4,02 ^[a] , 4,09 ^[b]
I-25	5-cloro-2-metilfenilo	NH	O	*-CO-CH ₂ -#	ciclohexilo	4,51 ^[a] , 4,55 ^[b]
I-26	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C(Cl)=CHCO-[E y/o Z]-#	fenilo	4 ^[a]
I-29	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2-bromofenilo	3,51 ^[a] , 3,49 ^[b]
I-30	2,5-bis(difluorometil)fenilo	-NH-	O	*-COCH ₂ -#	ciclohexilo	4,3 ^[a] , 4,34 ^[b]
I-33	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2-yodofenilo	3,65 ^[a] , 3,64 ^[b]
I-34	3,5-Bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2-bromo-4-fluorofenilo	3,7 ^[a] , 3,68 ^[b]
I-35	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2-cloro-5-fluorofenilo	3,64 ^[a] , 3,6 ^[b]
I-36	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2-cloro-6-fluorofenilo	3,54 ^[a] , 3,51 ^[b]
I-37	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	fenilo	3,31 ^[a] , 3,31 ^[b]
I-38	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	3-metilfenilo	3,64 ^[a] , 3,63 ^[b]
I-39	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2,6-dimetoxifenilo	3,04 ^[a]
I-40	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	4-fluorofenilo	3,43 ^[a]
I-41	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	3-fluorofenilo	3,48 ^[a]
I-42	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2-clorofenilo	3,51 ^[a]
I-43	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2,6-diclorofenilo	3,7 ^[a]
I-44	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	ciclohexilo	3,89 ^[a]

(continuación)

Ej.	A	L1	Y	T	R1	log P
I-45	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2-metilfenilo	3,56 ^[a]
I-46	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	naftalen-1-ilo	2,84 ^[a]
I-47	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	ferroc-butilo	3,45 ^[a]
I-48	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2-fluoro-4-metoxifenilo	3,45 ^[a]
I-49	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	ciclopentilo	3,52 ^[a]
I-50	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2-metilciclohexilo	4,11 ^[a]
I-51	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH(CH ₃)CH ₂ CO-#	2,6-difluorofenilo	
I-52	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2-fluorofenilo	3,35 ^[a]
I-55	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2-(prop-2-in-1-ilo)fenilo	3,28 ^[a]
I-57	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2,4,6-trifluorofenilo	3,51 ^[a] , 3,5 ^[b]
I-58	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	S	*-COCH ₂ -#	ciclohexilo	4,63 ^[a] , 4,56 ^[b]
I-59	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-COCH ₂ -#	2,3-dimetilfenilo	3,71 ^[a]
I-60	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C(=NOCH ₃)CH ₂ -[Z]-#	ciclohexilo	4,8 ^[a]
I-61	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C(=NOCH ₃)CH ₂ -[Z]-#	2,3-dimetilfenilo	4,33 ^[a]
I-62	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-COCH=CH-[E]-#	2,6-difluorofenilo	3,68 ^[a] , 3,59 ^[b]
I-63	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHCO-[E]-#	2,6-dimetilfenilo	3,65 ^[a] , 3,64 ^[b]
I-64	3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-CH=CHC(=NOH)-[E,E]-#	2-(prop-2-in-1-ilo)fenilo	3,08 ^[a] , 3,30 ^[a] , 3,30 ^[a] , 3,30 ^[a]
I-65	5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-ilo	CH ₂	O	*-C(Cl)=CHCO-[E y/o Z]-#	2-metoxifenilo	3,96 ^[a] , 3,79 ^[a] , 3,79 ^[a]

^[a] isómero mayoritario; ^[b] isómero minoritario

Los valores de logP se determinaron de acuerdo con la directiva EEC 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (Cromatografía Líquida de Alto Rendimiento) en columnas de fase inversa (C 18), usando los siguientes procedimientos:

- 5 [a] La determinación de EM-CL en el intervalo ácido se lleva a cabo a pH 2,7 usando fases móviles de ácido fórmico acuoso al 0,1 % y acetonitrilo (contiene ácido fórmico al 0,1 %); gradiente lineal de un 10 % de acetonitrilo a un 95 % de acetonitrilo
- [b] La determinación de EM-CL en el intervalo neutro se lleva a cabo a pH 7,8 usando fases móviles de solución de hidrogenocarbonato de amonio acuoso 0,001 molar y acetonitrilo; gradiente lineal de un 10 % de acetonitrilo a un 95 % de acetonitrilo.
- 10 La calibración se lleva a cabo usando alcan-2-onas no ramificadas (con de 3 a 16 átomos de carbono) con valores conocidos de logP (los valores de logP se determinan a partir de los tiempos de retención usando interpolación lineal entre dos alcanonas consecutivas).

Los valores de $\lambda_{\text{máx}}$ se determinaron en los máximos de las señales cromatográficas usando los espectros de UV de 200 nm a 400 nm.

15 **Datos de RMN de los ejemplos seleccionados**

Ej.	Datos de RMN
I-1	RMN ¹ H (CD ₃ CN, 400 MHz): δ_{ppm} : 1,65-1,76 (m, 1H), 1,83-1,95 (m, 1H), 2,10-2,21 (m, 2H), 2,23 (s, 3H), 2,82-2,91 (m, 1H), 3,25-3,40 (m, 2H), 3,90-3,98 (m, 1H), 4,45-4,53 (m, 1H), 5,04 (d, 1H), 5,11 (d, 1H), 6,40 (s, 1H), 7,56-7,63 (m, 2H), 7,70-7,75 (m, 1H), 8,08 (s, 1H), 8,18-8,22 (m, 2H)
I-2	RMN ¹ H (CD ₃ CN, 400 MHz): δ_{ppm} : 1,65-1,76 (m, 1H), 1,83-1,95 (m, 1H), 2,10-2,20 (m, 2H), 2,23 (s, 3H), 2,82-2,91 (m, 1H), 3,25-3,39 (m, 2H), 3,90-3,97 (m, 1H), 3,95 (s, 3H), 4,45-4,51 (m, 1H), 5,04 (d, 1H), 5,11 (d, 1H), 6,39 (s, 1H), 7,08 (t, 1H), 7,17 (d, 1H), 7,60-7,65 (m, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,97-8,00 (m, 1H)
I-3	RMN ¹ H (CD ₃ CN, 400 MHz): δ_{ppm} : 1,65-1,78 (m, 1H), 1,82-1,95 (m, 1H), 2,13-2,20 (m, 2H), 2,23 (s, 3H), 2,80-2,90 (m, 1H), 3,25-3,40 (m, 2H), 3,90-3,98 (m, 1H), 4,45-4,53 (m, 1H), 5,04 (d, 1H), 5,11 (d, 1H), 6,40 (s, 1H), 7,10-7,25 (m, 3H), 8,02 (d, 1H), 8,06 (s, 1H), 8,23 (d, 1H), 8,69 (d, 1H), 9,15 (d, 1H)
I-4	RMN ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ_{ppm} : 1,15-1,48 (m, 5H), 1,50-1,88 (m, 5H), 1,92-1,99 (m, 2H), 2,07-2,15 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,50-2,59 (m, 1H), 2,88 (s a, 1H), 3,20-3,41 (m, 2H), 3,99 (s a, 1H), 4,32 (s a, 1H), 5,21 (s a, 2H), 6,45 (s, 1H), 8,31 (a, 1H)
I-5	RMN ¹ H (CD ₃ CN, 400 MHz): δ_{ppm} : 1,70-1,95 (m, 2H), 2,18-2,25 (m, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,97 (s a, 1H), 3,25-3,44 (m, 2H), 4,01 (s a, 1H), 4,50 (s a, 1H), 5,10 (s a, 2H), 6,42 (s, 1H), 7,52-7,65 (m, 3H), 8,05 (s, 1H), 8,16 (dd, 1H)
I-6	RMN ¹ H (CD ₃ CN, 400 MHz): δ_{ppm} : 1,64-1,74 (m, 1H), 1,80-1,91 (m, 1H), 2,10-2,23 (m, 2H), 2,23 (s, 3H), 2,80-2,89 (m, 1H), 3,25-3,38 (m, 2H), 3,89-3,95 (m, 1H), 4,45-4,51 (m, 1H), 5,04 (d, 1H), 5,11 (d, 1H), 6,39 (s, 1H), 7,53 (dd, 1H), 7,63 (d, 1H), 8,06 (s, 1H), 8,14 (d, 1H)
I-7	RMN ¹ H (CD ₃ CN, 400 MHz): δ_{ppm} : 1,71-2,05 (m, 2H), 2,11-2,21 (m, 2H), 2,24 (s, 3H), 2,90 (s a, 1H), 3,24-3,40 (m, 2H), 3,90 (s, 3H), 3,98 (s a, 1H), 4,45 (s a, 1H), 5,05 (s a, 2H), 6,37 (s, 1H), 7,05-7,95 (m, 2H), 7,99 (s, 1H), 8,13-8,18 (m, 2H)
I-8	RMN ¹ H (CD ₃ CN, 400 MHz): δ_{ppm} : 1,25 (s, 9H), 1,62-1,90 (m, 2H), 2,10-2,19 (m, 2H), 2,24 (s, 3H), 2,89 (s a, 1H), 3,20-3,37 (m, 2H), 3,95 (s a, 1H), 4,44 (s a, 1H), 5,04 (s a, 2H), 6,36 (s, 1H), 7,89 (s, 1H)
I-9	RMN ¹ H (CD ₃ CN, 400 MHz): δ_{ppm} : 1,70-1,95 (m, 2H), 2,13-2,22 (m, 2H), 2,24 (s, 3H), 2,91 (s a, 1H), 3,23-3,40 (m, 2H), 3,95 (s a, 1H), 4,44 (s a, 1H), 5,05 (s a, 2H), 6,37 (s, 1H), 7-26 (dd, 1H), 7,90 (dd, 1H), 8,01 (s, 1H), 8,06 (dd, 1H)
I-10	RMN ¹ H (CD ₃ CN, 400 MHz): δ_{ppm} : 1,68-1,95 (m, 2H), 2,10-2,20 (m, 2H), 2,24 (s, 3H), 2,92 (s a, 1H), 3,22-3,40 (m, 2H), 3,98 (s a, 1H), 4,46 (s a, 1H), 5,05 (s a, 2H), 6,37 (s, 1H), 6,69 (dd, 1H), 7,52 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,99 (s, 1H)

(continuación)

Ej.	Datos de RMN
I-11	RMN ¹ H (CD ₃ CN, 400 MHz): δ _{ppm} : 1,44 (t, 3H), 1,65-1,95 (m, 2H), 2,12-2,21 (m, 2H), 2,24 (s, 3H), 2,90 (s a, 1H), 3,25-3,38 (m, 2H), 3,95 (s a, 1H), 4,22 (c, 2H), 4,43 (1H), 5,04 (s a, 2H), 6,37 (s, 1H), 7,02-7,18 (m, 2H), 7,54-7,60 (m, 1H), 7,87 (dd, 1H), 7,89 (s, 1H)
I-12	RMN ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ _{ppm} : 1,56-1,68 (m, 1H), 1,78-1,91 (m, 1H), 2,10-2,21 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,84-2,92 (m, 1H), 3,20-3,50 (m, 2H), 3,95-4,05 (m, 1H), 4,36-4,92 (m, 1H), 5,23 (d, 1H), 5,34 (d, 1H), 6,50 (s, 1H), 7,26 (d, 1H), 7,28 (d, 1H), 7,58 (m, 1H), 7,81 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 8,626 (s, 1H)
I-13	RMN ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ _{ppm} : 1,56-1,68 (m, 1H), 1,80-1,91 (m, 1H), 2,10-2,22 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,83-2,92 (m, 1H), 3,25-3,35 (m, 1H), 3,40-3,48 (m, 1H), 3,96-4,03 (m, 1H), 4,35-4,42 (m, 1H), 4,57 (s, 2H), 5,24 (d, 1H), 5,33 (d, 1H), 6,50 (s, 1H), 7,23 (td, 1H), 7,33-7,42 (m, 2H), 7,62 (dd, 1H), 8,54 (s, 1H)
I-14	RMN ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ _{ppm} : 1,41 (s, 9H), 1,48-1,61 (m, 2H), 1,90-2,11 (4H), 2,62-2,67 (m, 2H), 2,87-2,95 (m, 2H), 3,15-3,20 (m, 1H), 3,94-4,00 (2H), 4,62-4,67 (m, 1H), 5,09-5,12 (m, 1H), 7,11-7,18 (m, 3H), 7,22-7,27 (m, 3H)
I-15	RMN ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ _{ppm} : 1,41 (s, 6H), 1,52-1,85 (m, 2H), 2,08-2,15 (m, 2H), 2,23 (s, 3H), 2,90 (s a, 1H), 3,20-3,40 (m, 2H), 3,41 (s, 2H), 3,99 (s a, 1H), 4,34 (s a, 1H), 5,22 (s a, 2H), 6,45 (s, 1H), 7,08-7,13 (m, 1H), 7,21-7,26 (m, 2H), 7,35-7,39 (m, 2H), 8,22 (s, 1H)
I-16	RMN ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ _{ppm} : 1,58-1,90 (m, 2H), 2,12-2,19 (m, 2H), 2,23 (s, 3H), 2,93 (s a, 1H), 3,31 (s a, 1H), 3,36-3,47 (m, 1H), 4,00 (s a, 1H), 4,32 (s a, 1H), 4,33 (s, 2H), 5,17-5,27 (m, 2H), 6,45 (s, 1H), 7,18-7,32 (m, 5H), 8,43 (s, 1H)
I-17	RMN ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ _{ppm} : 0,94-1,05 (m, 2H), 1,10-1,29 (m, 3H), 1,54-1,71 (m, 6H), 1,75-1,93 (m, 2H), 2,06-2,18 (m, 2H), 2,21 (s, 3H), 2,81-2,89 (m, 1H), 2,89 (d, 2H), 3,22-3,45 (m, 2H), 3,94-4,01 (m, 1H), 4,33-4,40 (m, 1H), 5,22 (d, 1H), 5,33 (d, 1H), 6,50 (s, 1H), 8,42 (s, 1H)
I-18	RMN ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ _{ppm} : 1,60-1,91 (m, 2H), 2,11-2,21 (m, 2H), 2,23 (s, 3H), 2,92 (s a, 1H), 3,31 (s a, 1H), 3,40-3,49 (m, 1H), 4,02 (s a, 1H), 4,34 (s a, 1H), 4,83 (s, 2H), 5,22 (s a, 2H), 6,45 (s, 1H), 7,43-7,52 (m, 3H), 7,79-7,82 (m, 2H), 7,88-7,94 (m, 1H), 7,97-8,01 (m, 1H), 8,46 (s, 1H)
I-19	RMN ¹ H (CD ₃ CN, 400 MHz): δ _{ppm} : 1,55-1,67 (m, 1H), 1,72-1,83 (m, 1H), 2,03-2,14 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,79-2,87 (m, 1H), 3,06 (t, 2H), 3,19-3,35 (m, 2H), 3,34 (t, 2H), 3,85-3,92 (m, 1H), 3,88 (s, 3H), 4,40-4,46 (m, 1H), 5,03 (d, 1H), 5,08 (d, 1H), 6,39 (s, 1H), 6,98 (s, 1H), 7,00 (t, 1H), 7,09 (d, 1H), 7,45-7,56 (m, 2H)
I-20	RMN ¹ H (CD ₃ CN, 400 MHz): δ _{ppm} : 1,44 (t, 3H), 1,58-1,70 (m, 1H), 1,75-1,86 (m, 1H), 2,06-2,18 (m, 2H), 2,25 (s, 3H), 2,82-2,90 (m, 1H), 3,09 (t, 2H), 3,20-3,32 (m, 2H), 3,42 (t, 2H), 3,88-3,95 (m, 1H), 4,16 (c, 2H), 4,42-4,47 (m, 1H), 5,04 (d, 1H), 5,11 (d, 1H), 6,42 (s, 1H), 6,95 (s, 1H), 7,01 (t, 1H), 7,09 (d, 1H), 7,47-7,53 (m, 1H), 5,59 (dd, 1H)
I-21	RMN ¹ H (CD ₃ CN, 400 MHz): δ _{ppm} : 1,55-1,66 (m, 1H), 1,71-1,82 (m, 1H), 2,02-2,15 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,78-2,86 (m, 1H), 3,08 (t, 2H), 3,18-3,33 (m, 2H), 3,32 (t, 2H), 3,85-3,92 (m, 1H), 4,39-4,46 (m, 1H), 5,02 (d, 1H), 5,09 (d, 1H), 6,39 (s, 1H), 6,96 (s, 1H), 7,35-7,52 (m, 4H)
I-22	RMN ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ _{ppm} : 1,51-1,63 (m, 1H), 1,75-1,88 (m, 1H), 2,05-2,16 (m, 2H), 2,80-2,88 (m, 1H), 3,20-3,42 (m, 2H), 3,92-4,01 (m, 1H), 4,30-4,46 (m, 1H), 5,35 (d, 1H), 5,44 (d, 1H), 6,88 (s, 1H), 7,04 (t, 1H), 7,15-7,20 (m, 1H), 7,18 (t, 1H), 7,24-7,32 (m, 2H), 7,49 (d, 1H), 7,60-7,70 (m, 1H), 8,17 (s, 1H)
I-23	RMN ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ _{ppm} : 1,62-1,69 (m, 2H), 2,05-2,09 (m, 2H), 2,11 (s, 3H), 2,23 (s, 3H), 2,95-3,01 (m, 2H), 3,29-3,35 (m, 1H), 4,13-4,17 (m, 2H), 6,86 (d, 1H), 6,99 (s, 1H), 7,04 (d, 1H), 7,17 (d, 1H), 7,27-7,32 (m, 2H), 7,49 (d, 1H), 7,63-7,68 (m, 1H), 8,03 (s, 1H), 8,18 (s, 1H)
I-24	RMN ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ _{ppm} : 0,95-1,02 (m, 2H), 1,10-1,26 (m, 3H), 1,54-1,69 (m, 6H), 1,77-1,91 (m, 2H), 2,06-2,15 (m, 2H), 2,82-2,87 (m, 1H), 2,89 (d, 2H), 3,25-3,30 (m, 1H), 3,35-3,41 (m, 1H), 3,94-3,99 (m, 1H), 4,33-4,37 (m, 1H), 5,36 (d, 1H), 5,45 (d, 1H), 6,91 (s, 1H), 7,04 (t, 1H), 7,18 (t, 1H), 8,44 (s, 1H)
I-25	RMN ¹ H (DMSO-d ₆ , 400 MHz): δ _{ppm} : 0,94-1,05 (m, 2H), 1,10-1,26 (m, 4H), 1,56-1,73 (m, 6H), 1,83-1,92 (m, 1H), 2,06-2,13 (m, 2H), 2,16 (s, 3H), 2,88 (d, 2H), 2,98-3,06 (m, 2H), 3,30-3,38 (m, 1H), 4,11-4,18 (m, 2H), 7,07 (dd, 1H), 7,19 (d, 1H), 7,33 (d, 1H), 8,12 (s, 1H), 8,04 (s, 1H)

ES 2 613 066 T3

Los datos de RMN ¹H de los ejemplos seleccionados se ofrecen en forma de una lista de picos de RMN ¹H. Para cada pico de señal se lista el valor δ en ppm y la intensidad de la señal entre paréntesis:

Ej.	Lista de datos de picos de RMN
I-26	[DMSO-D ₆] 8,1231 6,35;8,0482 7,38;7,9751 0,56;7,9599 2,84;7,9569 3,62;7,9443 1,14;7,9392 4,50;7,9357 3,58;7,8555 0,74;7,8509 1,42;7,8379 0,77;7,8343 0,72;7,6973 0,46;7,6939 0,91;7,6907 0,51;7,6806 0,67;7,6755 2,23;7,6706 0,80;7,6604 1,05;7,6571 1,85;7,6537 0,93;7,5924 3,06;7,5886 1,33;7,5760 2,41;7,5729 4,24;7,5589 1,05;7,5547 2,02;7,5528 1,33;7,5417 0,38;7,4696 0,59;7,4502 0,78;7,4321 0,37;7,0164 1,35;6,4681 0,77;6,4582 0,72;6,4485 3,44;5,6885 5,31;5,2322 0,85;5,2161 0,86;5,1375 1,62;4,9763 2,78;4,0644 0,46;4,0468 1,31;4,0289 1,42;4,0112 0,61;3,5676 0,65;3,4437 0,34;3,4342 0,61;3,4244 0,38;3,4159 0,68;3,4063 1,22;3,3965 0,76;3,3876 0,47;3,3782 0,74;3,3689 0,42;3,2752 0,36;3,2544 0,34;3,1201 134,75;3,0183 0,50;2,9006 0,33;2,6626 0,42;2,6579 0,59;2,6533 0,42;2,5272 0,49;2,5111 1,30;2,5064 1,84;2,4982 32,10;2,4935 66,61;2,4888 94,30;2,4841 66,08;2,4794 31,81;2,3203 0,38;2,3157 0,60;2,3109 0,44;2,2578 3,63;2,2563 3,71;2,2265 15,73;2,2250 16,00;2,1931 0,80;2,1744 0,92;2,1442 1,08;2,0406 0,95;1,9742 5,50;1,9015 0,40;1,6943 0,40;1,6725 0,38;1,6649 0,36;1,6591 0,40;1,6396 0,35;1,2449 0,45;1,1952 1,59;1,1774 3,19;1,1597 1,59;-0,0001 2,84
I-29	[DMSO-D ₆] 8,1441 11,91;7,7596 3,68;7,7418 3,77;7,7397 4,01;7,6802 0,35;7,6610 0,38;7,5576 1,03;7,5549 1,06;7,5382 3,23;7,5215 4,67;7,5188 4,35;7,5112 3,71;7,5060 6,34;7,4917 5,35;7,4861 3,10;7,4745 2,90;7,4721 3,56;7,4689 2,31;7,4665 2,27;7,4549 1,87;7,4492 1,33;7,4147 0,37;7,4013 0,34;7,3191 4,88;7,3060 2,61;7,2797 8,40;7,1972 0,86;7,1779 8,71;7,1727 6,14;7,1580 2,85;7,1386 4,51;7,0394 2,75;7,0219 6,38;6,8997 5,57;6,8860 3,13;5,4484 1,02;5,4057 4,32;5,3696 4,24;5,3445 0,38;5,3267 1,03;4,3555 1,27;4,3222 1,34;4,0571 1,33;4,0393 3,75;4,0215 3,79;4,0038 1,44;3,9800 1,26;3,9453 1,36;3,4781 0,43;3,4577 0,49;3,4356 0,72;3,4109 1,52;3,4017 1,30;3,3918 1,86;3,3825 2,70;3,3729 2,13;3,3631 2,09;3,3537 2,84;3,3057 573,68;3,2826 9,11;3,2429 1,20;2,8901 1,16;2,8789 0,91;2,8508 1,60;2,8206 0,91;2,7321 0,68;2,6740 0,89;2,6695 1,12;2,6648 0,82;2,5394 2,52;2,5091 62,88;2,5048 112,86;2,5004 143,95;2,4960 99,46;2,4917 47,75;2,3315 0,71;2,3271 0,91;2,3225 0,67;2,1468 1,23;2,1107 2,33;2,0697 1,63;1,9869 16,00;1,8609 0,43;1,8514 0,48;1,8237 1,11;1,8017 0,98;1,7928 0,89;1,7702 0,38;1,6262 0,43;1,6163 0,48;1,5961 1,00;1,5879 1,06;1,5650 0,98;1,5573 0,90;1,5367 0,40;1,2363 0,48;1,1928 4,35;1,1750 8,73;1,1572 4,22;0,9264 0,37;0,0080 0,67;-0,0002 11,85;-0,0084 0,46

ES 2 613 066 T3

(continuación)

Ej.	Lista de datos de picos de RMN
I-30	[DMSO-D ₆] 8,6206 4,81;8,4136 16,00;7,7324 0,47;7,7047 2,72;7,6850 3,18;7,5317 4,01;7,4853 2,48;7,4658 2,02;7,2201 2,26;7,2139 1,78;7,0810 4,92;7,0761 4,14;6,9500 0,37;6,9418 2,61;4,2512 0,33;4,2282 0,34;4,1744 2,50;4,1403 2,58;4,0571 0,57;4,0393 1,54;4,0215 1,61;4,0036 0,60;3,7222 1,42;3,7090 0,46;3,6975 0,44;3,5947 0,39;3,5678 1,69;3,4175 0,41;3,4044 0,54;3,3904 1,05;3,3810 1,53;3,3707 1,63;3,3619 2,31;3,3517 3,59;3,3135 2176,06;3,2900 33,84;3,2738 1,64;3,2531 0,61;3,0807 1,68;3,0522 3,15;3,0228 1,72;2,8922 9,42;2,8752 9,74;2,6790 0,68;2,6744 1,35;2,6699 1,88;2,6651 1,34;2,6608 0,69;2,5398 3,16;2,5231 5,65;2,5184 8,38;2,5097 103,40;2,5053 202,26;2,5008 272,55;2,4963 187,40;2,4918 88,41;2,3320 1,34;2,3275 1,94;2,3229 1,39;2,3182 0,64;2,1176 2,00;2,0914 2,31;2,0856 2,24;2,0691 6,17;2,0494 0,37;1,9869 6,91;1,9197 0,44;1,9097 0,65;1,9003 0,94;1,8916 0,94;1,8828 1,19;1,8743 1,04;1,8649 0,76;1,8555 0,77;1,8460 0,49;1,8393 0,33;1,7467 0,73;1,7363 0,91;1,7146 1,85;1,7063 2,08;1,6841 4,03;1,6751 4,16;1,6565 4,64;1,6501 3,99;1,6325 2,59;1,6263 2,30;1,5853 1,04;1,3985 0,45;1,2841 0,36;1,2718 0,58;1,2411 1,68;1,2180 1,77;1,2099 2,18;1,1928 2,46;1,1874 1,53;1,1751 5,58;1,1572 2,51;1,1491 1,32;1,1195 0,86;1,0386 0,94;1,0324 1,09;1,0041 2,29;0,9743 1,82;0,9499 0,64;0,9395 0,49;- 0,0001 5,55
I-3	[DMSO-D ₆] 8,1416 7,23;7,9858 2,56;7,9664 2,64;7,5640 1,19;7,5462 2,69;7,5281 1,81;7,4712 0,37;7,4521 2,56;7,4481 2,76;7,4331 2,10;7,4292 1,92;7,4220 0,39;7,3303 0,72;7,3051 1,95;7,2949 4,15;7,2793 2,46;7,2753 2,39;7,2557 6,06;7,2010 0,33;7,1713 4,28;7,1679 5,64;7,1572 1,93;7,1284 2,66;7,0388 1,80;7,0211 3,80;6,9590 0,32;6,9000 3,83;6,8854 1,90;5,4476 0,81;5,4045 2,98;5,3871 0,76;5,3690 2,96;5,3273 0,85;4,3570 1,12;4,3185 1,12;4,2594 0,41;4,2556 0,36;4,1721 0,48;4,1607 0,41;4,1086 0,44;4,0905 0,48;4,0727 0,51;4,0568 1,63;4,0392 4,13;4,0215 4,29;4,0034 1,80;3,9821 1,27;3,9679 1,10;3,9456 1,34;3,9094 0,67;3,8857 0,67;3,8808 0,78;3,8652 0,75;3,8537 0,73;3,7222 1,37;3,6832 1,62;3,6610 1,85;3,6523 1,86;3,6335 2,02;3,6298 1,99;3,5555 2,99;3,4880 4,86;3,3256 3385,14;3,2484 4,44;3,1974 2,05;3,1152 1,41;3,1033 1,39;3,0967 1,29;3,0836 1,22;3,0670 1,02;3,0343 1,05;3,0223 0,96;2,9873 0,87;2,9446 0,88;2,9150 0,86;2,9014 0,97;2,8821 1,42;2,8499 2,05;2,8220 1,49;2,7990 1,00;2,7843 1,05;2,7708 1,02;2,7565 1,08;2,7296 1,25;2,6955 2,61;2,6702 3,41;2,6661 2,97;2,5403 11,32;2,5057 258,17;2,5014 323,27;2,4973 233,05;2,4329 1,69;2,4245 1,31;2,4158 1,07;2,3762 0,73;2,3676 0,70;2,3320 2,03;2,3281 2,50;2,2801 0,54;2,2681 0,50;2,2450 0,46;2,2164 0,51;2,1967 0,60;2,1900 0,52;2,1779 0,78;2,1570 1,27;2,1516 1,30;2,1150 2,00;2,0844 1,70;2,0686 2,66;2,0489 0,68;2,0398 0,47;2,0179 0,55;1,9867 16,00;1,9595 0,42;1,9414 0,36;1,9203 0,46;1,9076 0,60;1,9035 0,58;1,8815 0,49;1,8643 0,62;1,8534 0,78;1,8276 1,06;1,8055 0,93;1,7744 0,56;1,7633 0,52;1,7524 0,36;1,7370 0,40;1,7172 0,32;1,6846 0,33;1,6321 0,58;1,6218 0,57;1,5907 1,01;1,5674 0,96;1,5634 0,92;1,4347 0,33;1,3982 1,38;1,2917 0,36;1,2355 0,75;1,2291 0,51;1,2133 0,47;1,1929 4,61;1,1751 8,54;1,1574 4,31;1,0366 0,33;-0,0002 5,53
I-34	[DMSO-D ₆] 8,1326 4,77;7,7556 1,35;7,7495 1,36;7,7338 1,36;7,7277 1,30;7,6227 1,19;7,6075 1,32;7,6013 1,54;7,5861 1,39;7,4392 0,85;7,4330 0,81;7,4179 1,53;7,4117 1,40;7,3966 0,72;7,3904 0,66;7,3518 2,08;7,3126 3,32;7,3064 1,15;7,1775 3,36;7,1732 2,50;7,1580 1,13;7,1384 1,91;7,0399 1,10;7,0219 2,47;6,9006 2,17;6,8860 1,21;5,4501 0,42;5,4064 1,72;5,3694 1,67;5,3271 0,42;4,3574 0,53;4,3232 0,53;4,0571 1,27;4,0392 3,71;4,0214 3,73;4,0036 1,33;3,9819 0,51;3,9477 0,55;3,4127 0,72;3,4027 0,68;3,3938 0,92;3,3840 1,30;3,3745 1,13;3,3083 410,62;3,2447 0,51;2,8802 0,36;2,8502 0,67;2,8210 0,37;2,6741 0,43;2,6694 0,57;2,6647 0,42;2,5396 1,36;2,5093 31,74;2,5049 57,40;2,5005 73,67;2,4961 51,08;2,4917 24,52;2,3320 0,35;2,3272 0,46;2,3227 0,32;2,1467 0,53;2,1121 0,92;2,0693 0,85;1,9868 16,00;1,8299 0,41;1,8237 0,46;1,7994 0,38;1,7922 0,36;1,5982 0,41;1,5894 0,42;1,5672 0,38;1,5578 0,36;1,1928 4,47;1,1750 8,78;1,1572 4,31;-0,0002 2,18

ES 2 613 066 T3

(continuación)

Ej.	Lista de datos de picos de RMN
I-35	[DMSO-D ₆] 8,1524 10,14;7,6638 2,28;7,6518 2,45;7,6417 2,83;7,6297 2,73;7,5019 2,25;7,4944 3,06;7,4809 2,39;7,4733 3,03;7,4636 2,19;7,4559 1,54;7,4427 2,99;7,4346 2,07;7,4209 1,82;7,4132 1,23;7,3880 4,78;7,3486 6,57;7,3068 2,09;7,2890 0,40;7,2189 0,39;7,1709 7,64;7,1580 2,65;7,1313 4,26;7,0462 0,74;7,0403 2,41;7,0220 5,38;6,9590 0,34;6,9009 4,78;6,8861 2,72;5,7461 16,00;5,4494 0,94;5,4074 3,67;5,3893 0,62;5,3699 3,71;5,3271 0,90;5,2962 0,85;4,3562 1,10;4,3249 1,13;4,2641 0,33;4,2522 0,39;4,2400 0,34;4,0572 0,84;4,0395 2,42;4,0217 2,47;4,0039 0,95;3,9826 1,07;3,9495 1,17;3,6968 0,35;3,6930 0,36;3,6843 0,55;3,6729 0,75;3,6637 0,58;3,6512 0,38;3,5681 0,54;3,4416 0,48;3,4149 1,26;3,4056 1,13;3,3956 1,61;3,3864 2,39;3,3769 1,98;3,3671 2,06;3,3138 679,74;3,2457 1,26;3,0376 0,32;2,8818 0,78;2,8506 1,55;2,8225 0,79;2,6748 0,58;2,6701 0,76;2,6656 0,56;2,5401 1,68;2,5098 43,12;2,5055 78,38;2,5011 100,99;2,4967 70,61;2,4924 34,59;2,3325 0,54;2,3278 0,69;2,3232 0,54;2,1470 1,05;2,1123 2,00;2,0694 1,35;1,9871 10,39;1,8628 0,39;1,8583 0,40;1,8521 0,45;1,8320 0,89;1,8239 0,98;1,8014 0,84;1,7715 0,36;1,7633 0,32;1,6205 0,46;1,5984 0,89;1,5901 0,95;1,5688 0,87;1,5608 0,83;1,5391 0,36;1,2359 0,41;1,1930 2,90;1,1753 5,73;1,1574 2,83;-0,0002 3,83
I-36	[DMSO-D ₆] 8,1773 7,83;7,6322 0,91;7,6164 1,11;7,6117 2,06;7,5960 2,17;7,5909 1,51;7,5752 1,34;7,4931 3,38;7,4729 2,41;7,4336 1,63;7,4113 2,75;7,3872 3,63;7,3470 4,08;7,3062 1,64;7,1729 3,65;7,1584 1,82;7,1246 4,22;7,0852 3,07;7,0397 1,80;7,0223 4,02;6,9007 3,62;6,8864 2,01;5,4484 0,70;5,4053 2,95;5,3701 2,86;5,3281 0,70;4,3546 0,89;4,3227 0,91;4,0572 1,28;4,0395 3,75;4,0217 3,79;4,0039 1,37;3,9818 0,86;3,9475 0,93;3,4377 0,56;3,4221 0,84;3,4139 1,17;3,4041 1,11;3,3951 1,53;3,3857 2,19;3,3762 1,98;3,3136 766,08;3,2443 1,08;2,8810 0,62;2,8506 1,18;2,8241 0,66;2,6747 0,64;2,6701 0,82;2,6654 0,62;2,5399 1,92;2,5097 49,29;2,5055 88,69;2,5011 113,23;2,4967 79,02;2,4926 38,38;2,3323 0,57;2,3278 0,74;2,3229 0,57;2,1466 0,85;2,1100 1,57;2,0693 1,39;1,9871 16,00;1,8543 0,33;1,8317 0,68;1,8244 0,76;1,8027 0,69;1,6207 0,34;1,6005 0,67;1,5914 0,71;1,5697 0,67;1,5619 0,63;1,4039 0,53;1,1930 4,42;1,1752 8,75;1,1574 4,28;-0,0002 2,58
I-37	[DMSO-D ₆] 8,1616 16,00;8,0401 8,89;8,0224 10,20;8,0188 8,00;7,9030 0,42;7,8856 0,55;7,8818 0,43;7,8365 5,64;7,7983 10,55;7,7190 11,16;7,7010 2,08;7,6979 1,48;7,6813 9,55;7,6672 2,70;7,6642 4,06;7,6611 2,34;7,6069 7,16;7,5875 10,45;7,5693 4,54;7,4781 0,36;7,4590 0,50;7,3184 3,26;7,1851 7,42;7,1645 3,65;7,0519 3,67;7,0285 8,29;6,9891 0,40;6,9572 0,46;6,9076 7,49;6,8926 4,22;6,6263 0,45;6,5951 0,37;5,4668 1,50;5,4242 5,66;5,3824 5,56;5,3398 1,53;5,3181 0,75;4,3941 1,69;4,3606 1,77;4,0571 1,03;4,0393 3,16;4,0215 3,78;4,0038 2,55;3,9740 1,79;3,5680 0,97;3,4493 0,98;3,4400 1,67;3,4303 1,35;3,4209 2,07;3,4113 3,29;3,4018 2,38;3,3922 2,10;3,3823 2,85;3,3729 2,70;3,3125 1921,95;3,1672 0,70;3,1034 0,49;3,0697 0,43;3,0466 0,38;3,0374 0,40;2,8905 1,40;2,8613 2,26;2,8325 1,34;2,6954 0,60;2,6790 0,84;2,6745 1,47;2,6699 1,90;2,6652 1,43;2,5399 4,06;2,5229 9,24;2,5095 110,27;2,5053 201,65;2,5008 260,70;2,4965 183,97;2,4922 90,87;2,3322 1,53;2,3276 1,98;2,3230 1,51;2,1793 1,79;2,1479 3,46;2,1144 1,92;2,0693 0,89;1,9869 13,51;1,9082 0,69;1,8916 0,66;1,8836 0,82;1,8623 1,46;1,8530 1,55;1,8305 1,46;1,8238 1,42;1,8005 0,68;1,6775 0,67;1,6666 0,80;1,6450 1,52;1,6365 1,61;1,6143 1,47;1,6060 1,34;1,5960 0,64;1,5853 0,63;1,5746 0,53;1,3983 1,42;1,2358 0,74;1,1929 3,79;1,1751 7,42;1,1573 3,71;0,8902 0,34;-0,0002 2,24
I-38	[DMSO-D ₆] 8,1561 7,74;7,8566 0,37;7,8334 5,18;7,8152 3,93;7,7767 5,16;7,7497 0,35;7,7080 5,45;7,6698 2,67;7,5071 0,70;7,5026 0,68;7,4865 5,18;7,4671 2,46;7,4480 0,82;7,3179 1,59;7,1846 3,56;7,1638 1,91;7,0513 1,77;7,0278 4,10;6,9068 3,59;6,8920 2,12;5,4675 0,71;5,4248 2,68;5,3818 2,65;5,3389 0,85;4,3976 0,82;4,3643 0,84;4,0571 1,06;4,0393 3,04;4,0215 3,33;4,0038 1,68;3,9757 0,84;3,5679 0,65;3,4497 0,44;3,4407 0,74;3,4310 0,63;3,4213 0,94;3,4119 1,51;3,4029 1,09;3,3922 0,91;3,3827 1,29;3,3734 1,16;3,3106 847,89;3,2606 1,74;2,8865 0,63;2,8590 1,06;2,8271 0,65;2,6744 0,68;2,6697 0,90;2,6652 0,67;2,6607 0,39;2,5765 0,35;2,5608 1,10;2,5398 1,95;2,5228 4,26;2,5095 50,87;2,5051 93,57;2,5007 121,23;2,4963 85,30;2,4920 42,05;2,4215 16,00;2,3809 0,65;2,3656 1,42;2,3319 0,79;2,3272 1,23;2,1795 0,84;2,1466 1,68;2,1134 0,93;2,0693 0,42;1,9869 12,96;1,8882 0,34;1,8796 0,38;1,8582 0,69;1,8502 0,73;1,8273 0,71;1,8240 0,69;1,7982 0,33;1,6711 0,33;1,6606 0,39;1,6385 0,68;1,6312 0,76;1,6095 0,70;1,5999 0,65;1,3984 0,70;1,2360 0,33;1,1929 3,60;1,1751 7,09;1,1573 3,53;-0,0002 0,86

ES 2 613 066 T3

(continuación)

Ej.	Lista de datos de picos de RMN
I-39	[DMSO-D ₆] 8,0529 2,63;7,4083 0,69;7,3873 1,39;7,3663 0,80;7,3046 0,54;7,1713 1,24;7,1572 0,83;7,1539 1,29;7,1145 1,75;7,0380 0,63;7,0216 1,35;6,9734 1,68;6,9340 1,07;6,8995 1,24;6,8857 0,67;6,7675 2,92;6,7464 2,73;5,7462 2,13;5,4023 0,98;5,3669 0,97;5,2961 0,37;3,7483 0,73;3,7297 0,96;3,7183 16,00;3,6726 0,38;3,3900 0,39;3,3710 0,55;3,3621 0,81;3,3520 0,80;3,3120 148,95;3,2739 0,52;3,2692 0,52;3,1774 0,33;2,8482 0,36;2,5397 0,32;2,5093 9,70;2,5051 17,38;2,5007 22,12;2,4964 15,46;2,0966 0,55;2,0691 0,42;1,9869 0,66;1,1751 0,38
I-40	[DMSO-D ₆] 8,1658 16,00;8,1537 1,38;8,1463 6,35;8,1411 3,10;8,1324 7,18;8,1242 7,06;8,1155 3,20;8,1103 6,18;7,8314 5,38;7,7934 10,54;7,7232 11,07;7,6852 5,42;7,4246 6,41;7,4198 2,50;7,4025 12,01;7,3853 2,51;7,3804 5,93;7,3287 0,58;7,3200 3,34;7,1867 7,49;7,1659 3,73;7,0534 3,64;7,0299 8,05;6,9096 7,63;6,8940 4,13;5,7478 8,22;5,4673 1,53;5,4248 5,92;5,3843 5,83;5,3421 1,61;4,3962 1,81;4,3639 1,89;4,0579 0,37;4,0400 1,00;4,0221 1,56;4,0047 1,88;3,9742 1,86;3,4467 0,76;3,4379 1,37;3,4280 1,08;3,4184 1,72;3,4091 2,88;3,3999 1,80;3,3901 1,27;3,3804 1,69;3,3714 1,12;3,3059 258,95;3,2617 1,92;2,8898 1,27;2,8608 2,24;2,8319 1,28;2,6751 0,45;2,6705 0,58;2,6661 0,43;2,5404 1,00;2,5099 34,49;2,5058 61,68;2,5014 78,48;2,4972 55,77;2,3326 0,48;2,3283 0,60;2,3235 0,46;2,1782 1,69;2,1462 3,51;2,1120 1,96;2,0707 0,36;1,9876 3,68;1,8915 0,62;1,8809 0,72;1,8599 1,47;1,8518 1,55;1,8298 1,47;1,8221 1,38;1,7999 0,62;1,7897 0,51;1,6799 0,62;1,6710 0,77;1,6497 1,51;1,6409 1,60;1,6192 1,46;1,6106 1,39;1,5891 0,59;1,5794 0,50;1,1934 1,02;1,1756 1,98;1,1578 1,00;-0,0002 2,56
I-41	[DMSO-D ₆] 8,1966 16,00;7,9032 4,15;7,8838 4,79;7,8736 0,65;7,8076 3,98;7,7992 2,84;7,7930 3,32;7,7893 2,92;7,7694 15,05;7,7407 13,03;7,7026 3,85;7,6729 1,85;7,6584 2,23;7,6527 3,53;7,6382 3,57;7,6332 2,61;7,6186 2,20;7,5794 0,35;7,5584 2,16;7,5536 1,96;7,5374 3,17;7,5320 2,93;7,5178 1,45;7,5159 1,46;7,5112 1,36;7,3183 3,17;7,2152 0,48;7,1850 7,11;7,1646 3,72;7,0517 3,54;7,0286 7,98;6,9075 7,40;6,8927 4,12;5,7472 7,53;5,4663 1,46;5,4241 5,62;5,3831 5,56;5,3407 1,65;5,3275 0,53;4,3943 1,71;4,3616 1,80;4,0575 0,36;4,0398 0,94;4,0219 1,45;4,0045 1,76;3,9740 1,76;3,4478 0,76;3,4389 1,51;3,4291 1,10;3,4199 1,75;3,4103 2,74;3,4010 1,80;3,3909 1,32;3,3815 1,84;3,3721 1,26;3,3093 504,59;3,2858 10,43;3,2613 2,21;3,1909 0,40;3,1817 0,36;2,8901 1,23;2,8603 2,16;2,8324 1,25;2,6750 0,52;2,6704 0,69;2,6659 0,54;2,5403 1,13;2,5099 40,78;2,5057 74,07;2,5013 95,31;2,4970 68,09;2,3327 0,58;2,3282 0,75;2,3233 0,58;2,1812 1,62;2,1474 3,34;2,1138 1,88;2,0702 0,38;1,9874 3,52;1,8930 0,64;1,8834 0,72;1,8625 1,42;1,8542 1,49;1,8315 1,41;1,8243 1,34;1,8023 0,63;1,7924 0,52;1,6773 0,63;1,6680 0,75;1,6468 1,48;1,6378 1,54;1,6161 1,44;1,6072 1,35;1,5864 0,60;1,5775 0,48;1,2348 0,40;1,1933 0,98;1,1755 1,92;1,1577 0,98;-0,0002 2,25
I-42	[DMSO-D ₆] 9,6022 0,51;8,1426 16,00;8,1000 0,44;7,6087 1,85;7,6058 2,17;7,5886 7,11;7,5868 6,55;7,5851 6,19;7,5820 4,73;7,5772 4,59;7,5655 4,35;7,5606 5,97;7,5567 3,74;7,5517 3,37;7,5462 1,73;7,5411 4,80;7,5359 7,56;7,5327 4,36;7,5119 5,22;7,5077 5,25;7,4955 3,89;7,4925 4,83;7,4883 2,58;7,4762 1,72;7,4724 1,65;7,4214 0,33;7,3567 6,58;7,3442 0,48;7,3174 11,38;7,3054 3,64;7,2919 0,47;7,2126 10,79;7,1726 12,70;7,1575 4,07;7,0464 0,85;7,0388 3,87;7,0214 8,53;6,9989 0,46;6,9656 0,43;6,8997 7,57;6,8856 4,42;6,2908 0,40;6,2754 0,37;5,7463 7,66;5,4482 1,44;5,4054 5,92;5,3888 1,38;5,3685 5,82;5,3261 1,46;5,2949 0,54;5,2788 0,55;4,3552 1,70;4,3220 1,80;4,0392 0,32;4,0215 0,39;3,9786 1,58;3,9462 1,77;3,6839 0,32;3,6720 0,36;3,5679 0,70;3,4728 0,35;3,4485 0,47;3,4115 1,95;3,4019 1,88;3,3925 2,79;3,3835 4,22;3,3733 3,67;3,3107 2339,33;3,2435 3,77;3,1939 1,38;3,1526 0,83;3,1441 0,81;3,0746 0,52;3,0209 0,43;2,9962 0,35;2,9745 0,36;2,9605 0,33;2,9565 0,34;2,9265 0,35;2,9100 0,35;2,8784 1,39;2,8524 2,31;2,8212 1,38;2,7681 0,33;2,6955 0,42;2,6742 1,96;2,6697 2,54;2,6651 1,88;2,6192 0,39;2,5396 4,00;2,5226 12,06;2,5093 145,42;2,5050 264,34;2,5006 339,77;2,4962 237,87;2,4920 117,25;2,3747 0,67;2,3716 0,59;2,3579 0,58;2,3497 0,55;2,3366 1,23;2,3318 2,03;2,3273 2,66;2,3228 2,02;2,3019 0,47;2,2849 0,41;2,2255 0,33;2,2202 0,34;2,2162 0,33;2,1927 0,34;2,1429 1,76;2,1103 3,38;2,0692 3,06;1,9869 1,67;1,9078 0,46;1,8600 0,75;1,8515 0,87;1,8217 1,66;1,7989 1,50;1,7925 1,40;1,7706 0,70;1,7493 0,32;1,6417 0,36;1,6269 0,71;1,6175 0,84;1,5959 1,49;1,5872 1,59;1,5658 1,48;1,5573 1,41;1,5359 0,68;1,3983 0,38;1,2361 1,25;1,1928 0,61;1,1749 1,07;1,1572 0,59;1,0271 0,58;0,8902 0,42;-0,0002 4,66

ES 2 613 066 T3

(continuación)

Ej.	Lista de datos de picos de RMN
I-43	[DMSO-D ₆] 8,1720 14,54;7,6305 6,14;7,6255 7,71;7,6087 16,00;7,6074 16,00;7,5745 8,52;7,5580 5,31;7,5511 3,66;7,5394 0,60;7,5347 2,63;7,3074 9,53;7,2679 9,62;7,1737 6,57;7,1590 3,22;7,0746 8,73;7,0404 3,64;7,0351 6,55;7,0230 7,51;6,9008 6,24;6,8871 3,63;5,7468 9,42;5,4475 1,13;5,4051 5,10;5,3719 5,08;5,3295 1,10;4,3546 1,43;4,3212 1,50;3,9811 1,35;3,9467 1,46;3,4212 0,76;3,4118 1,24;3,4020 1,00;3,3927 1,54;3,3834 2,49;3,3739 1,67;3,3640 1,31;3,3550 1,83;3,3451 1,62;3,3057 532,18;3,2430 1,10;2,8798 0,99;2,8505 1,73;2,8229 0,98;2,6743 0,57;2,6697 0,76;2,6652 0,57;2,5397 1,04;2,5228 3,13;2,5095 43,31;2,5051 80,87;2,5006 105,64;2,4962 72,60;2,4918 34,34;2,3319 0,51;2,3274 0,70;2,3228 0,49;2,1460 1,23;2,1109 2,57;2,0761 1,48;2,0697 2,08;1,9871 0,34;1,8677 0,43;1,8576 0,52;1,8371 1,09;1,8282 1,16;1,8061 1,08;1,7981 1,00;1,7764 0,44;1,7668 0,35;1,6318 0,42;1,6227 0,53;1,6019 1,10;1,5928 1,18;1,5713 1,11;1,5628 1,06;1,5420 0,45;1,5330 0,36;0,0080 0,91;-0,0002 21,13;-0,0084 0,80
I-44	[DMSO-D ₆] 8,0076 16,00;7,5620 7,74;7,5229 8,94;7,3109 3,30;7,1776 7,54;7,1606 3,72;7,0444 3,71;7,0246 8,50;7,0016 8,77;6,9624 7,56;6,9033 7,09;6,8887 4,24;5,7458 7,11;5,4559 1,43;5,4133 5,52;5,3717 5,46;5,3291 1,43;4,3700 1,59;4,3368 1,68;4,0395 0,48;4,0217 0,54;3,9873 1,51;3,9526 1,65;3,4072 0,82;3,3978 1,47;3,3885 1,21;3,3787 1,90;3,3692 3,11;3,3597 2,31;3,3494 2,32;3,3398 3,75;3,3125 811,08;3,2891 6,55;3,2722 3,23;3,2425 1,55;2,8735 1,16;2,8462 2,03;2,8160 1,18;2,7890 0,76;2,7808 1,11;2,7718 0,85;2,7617 1,77;2,7536 2,28;2,7453 1,29;2,7344 1,26;2,7266 1,30;2,6792 0,32;2,6744 0,58;2,6700 0,77;2,6654 0,59;2,5400 1,06;2,5231 2,82;2,5098 41,65;2,5054 78,84;2,5009 103,87;2,4965 72,41;2,4921 35,05;2,3323 0,58;2,3276 0,74;2,3230 0,55;2,1412 1,46;2,1087 3,04;2,0691 2,21;1,9869 2,02;1,8576 0,66;1,8486 0,85;1,8145 4,71;1,7863 4,49;1,7557 2,72;1,7487 3,00;1,7410 2,68;1,7240 3,48;1,7174 4,43;1,6634 1,69;1,6318 2,31;1,6232 1,88;1,6021 1,41;1,5927 1,46;1,5714 1,36;1,5628 1,29;1,5420 0,57;1,5316 0,47;1,3981 0,51;1,3911 0,60;1,3835 0,81;1,3603 1,87;1,3529 2,68;1,3209 4,92;1,3078 3,17;1,2903 6,56;1,2644 2,70;1,2579 2,99;1,2346 1,37;1,2280 1,35;1,2204 1,12;1,2119 0,95;1,1929 1,76;1,1898 1,76;1,1817 1,38;1,1753 1,84;1,1682 0,93;1,1576 1,58;1,1517 0,93;1,1384 0,38;1,1303 0,44;- 0,0002 1,84
I-45	[DMSO-D ₆] 8,1080 7,57;7,8502 0,34;7,5392 1,54;7,5353 1,71;7,5296 0,62;7,5187 2,18;7,5165 2,17;7,4670 0,76;7,4637 0,76;7,4483 1,94;7,4450 1,65;7,4296 1,63;7,4262 1,46;7,3967 2,30;7,3577 7,53;7,3514 2,76;7,3416 2,36;7,3319 1,81;7,3232 1,13;7,3115 6,23;7,2725 2,19;7,1752 3,35;7,1676 0,47;7,1588 1,71;7,0420 1,66;7,0304 0,42;7,0227 3,82;6,9019 3,16;6,8868 1,93;5,7458 2,90;5,4523 0,59;5,4097 2,46;5,3896 0,33;5,3711 2,44;5,3292 0,70;4,3626 0,70;4,3298 0,73;3,9844 0,65;3,9506 0,72;3,4132 0,57;3,4042 0,46;3,3943 0,75;3,3848 1,24;3,3755 0,91;3,3651 0,81;3,3563 1,21;3,3172 394,60;3,2752 1,65;3,2468 0,83;2,8817 0,52;2,8509 0,96;2,8238 0,52;2,6703 0,35;2,5759 0,78;2,5429 0,67;2,5404 0,53;2,5236 1,24;2,5102 19,67;2,5058 37,43;2,5013 49,46;2,4968 34,40;2,4924 16,69;2,4237 0,37;2,3502 16,00;2,3327 0,50;2,3280 0,51;2,3236 0,39;2,1503 0,67;2,1166 1,34;2,0824 0,76;2,0693 0,65;1,9871 0,62;1,8345 0,60;1,8276 0,64;1,8041 0,60;1,7975 0,55;1,6048 0,57;1,5958 0,61;1,5740 0,57;1,5651 0,55;1,1753 0,35;-0,0002 5,31
I-46	[DMSO-D ₆] 8,2538 0,55;8,2464 2,60;8,2378 2,12;8,2347 2,34;8,2281 1,60;8,2220 2,83;8,1638 3,93;8,1432 4,27;8,1115 16,00;8,0617 2,86;8,0565 2,00;8,0492 2,57;8,0456 2,60;8,0379 3,08;8,0297 0,58;7,8844 3,94;7,8817 4,05;7,8667 4,91;7,8639 4,50;7,7642 0,76;7,6727 4,14;7,6642 0,56;7,6547 4,45;7,6523 4,57;7,6423 0,70;7,6345 4,12;7,6246 6,02;7,6190 4,20;7,6137 4,57;7,6106 4,56;7,6058 4,05;7,6002 6,58;7,5888 1,05;7,5827 0,40;7,5410 1,71;7,5020 14,99;7,4927 14,47;7,4782 0,38;7,4538 1,63;7,3082 2,72;7,1749 6,26;7,1590 3,10;7,1437 0,43;7,0417 3,11;7,0325 0,86;7,0230 7,09;6,9977 0,40;6,9665 0,52;6,9025 6,29;6,8871 3,50;6,7280 0,46;6,6967 0,38;5,7462 12,28;5,4531 1,14;5,4104 4,61;5,3909 0,50;5,3709 4,52;5,3284 1,15;5,2700 0,36;5,2559 0,36;4,3684 1,31;4,3351 1,40;4,0578 0,48;4,0400 1,47;4,0222 1,52;4,0043 0,79;3,9874 1,31;3,9536 1,42;3,4289 0,57;3,4196 1,07;3,4100 0,87;3,4001 1,34;3,3910 2,26;3,3817 1,55;3,3715 1,30;3,3622 1,96;3,3196 789,08;3,2752 2,90;3,2467 1,47;3,0381 0,49;2,8795 1,00;2,8512 2,01;2,8221 0,98;2,6753 0,48;2,6709 0,62;2,6664 0,48;2,5409 0,77;2,5241 2,11;2,5107 33,80;2,5063 64,26;2,5019 84,75;2,4974 59,16;2,4930 28,67;2,3332 0,51;2,3285 0,65;2,3239 0,49;2,1541 1,23;2,1216 2,54;2,0873 1,44;2,0699 0,84;1,9875 6,45;1,8702 0,47;1,8618 0,54;1,8393 1,10;1,8316 1,17;1,8097 1,10;1,8017 1,02;1,7795 0,47;1,7697 0,41;1,6407 0,45;1,6312 0,58;1,6099 1,07;1,6009 1,16;1,5794 1,10;1,5706 1,03;1,5491 0,48;1,5397 0,39;1,2345 0,60;1,1933 1,90;1,1755 3,61;1,1577 1,79;0,0081 0,37;-0,0002 9,08;-0,0083 0,39

ES 2 613 066 T3

(continuación)

Ej.	Lista de datos de picos de RMN
I-47	[DMSO-D ₆] 8,0468 1,47;7,5409 0,62;7,5028 1,01;7,3802 0,96;7,3422 0,60;7,1786 0,70;7,1604 0,36;7,0454 0,35;7,0244 0,79;6,9036 0,67;6,8885 0,41;5,4185 0,50;5,3705 0,50;3,3180 74,17;2,5103 3,27;2,5059 6,15;2,5014 8,08;2,4970 5,64;2,4927 2,73;1,1568 16,00;1,0780 0,44
I-48	[DMSO-D ₆] 8,1047 5,08;7,8248 1,17;7,8028 2,14;7,7814 0,98;7,6546 0,54;7,6500 0,56;7,6164 2,14;7,6120 2,06;7,5928 1,97;7,5860 1,94;7,5547 0,48;7,5478 0,50;7,3152 0,97;7,1819 2,21;7,1620 1,12;7,0487 1,09;7,0259 2,52;6,9976 1,12;6,9916 1,33;6,9637 0,87;6,9571 2,99;6,9508 0,98;6,9354 1,52;6,9293 1,17;6,9059 2,12;6,8901 1,28;5,7462 1,77;5,4651 0,46;5,4226 1,58;5,3754 1,60;5,3330 0,45;4,3811 0,48;4,3467 0,50;4,0039 0,41;3,9974 0,47;3,9625 0,51;3,8751 16,00;3,8388 1,04;3,5688 0,58;3,4328 0,49;3,4228 0,42;3,4136 0,63;3,4043 0,94;3,3950 0,66;3,3853 0,56;3,3754 0,74;3,3659 0,69;3,3209 214,30;3,2901 0,87;3,2858 0,87;3,2541 0,41;2,8861 0,33;2,8554 0,58;2,8286 0,34;2,5413 0,33;2,5245 0,85;2,5112 10,46;2,5069 19,22;2,5024 24,80;2,4980 16,91;2,4936 7,87;2,1657 0,42;2,1299 0,85;2,0948 0,47;1,9877 0,79;1,8415 0,38;1,8332 0,39;1,8105 0,37;1,8037 0,34;1,6143 0,38;1,6061 0,40;1,5846 0,38;1,5756 0,35;1,1758 0,42;-0,0002 0,46
I-49	[DMSO-D ₆] 9,6003 0,61;8,0177 16,00;7,5816 8,06;7,5556 8,77;7,3632 0,40;7,3605 0,34;7,2989 0,38;7,2743 2,73;7,2673 0,33;7,2175 0,34;7,1857 6,39;7,1784 0,61;7,1287 3,26;7,0972 3,11;7,0605 0,61;7,0383 7,66;6,9762 0,37;6,9703 0,58;6,9520 8,89;6,9480 3,85;6,9259 7,98;6,9154 7,06;6,3327 0,60;6,3226 0,62;5,4579 2,40;5,4294 5,41;5,4039 0,99;5,3792 5,39;5,3644 0,41;5,3509 2,44;5,3087 0,77;5,2972 0,39;5,2893 0,33;4,3668 1,60;4,3487 1,64;4,3448 1,67;4,1728 0,35;4,1637 0,34;3,9801 1,48;3,9568 1,62;3,6698 0,48;3,6598 0,47;3,4003 0,60;3,3941 1,23;3,3879 0,77;3,3811 1,49;3,3749 2,61;3,3685 1,68;3,3618 1,37;3,3438 592,30;3,3202 11,51;3,3150 1,54;3,3028 2,20;3,3004 2,26;3,2884 4,89;3,2764 2,49;3,2740 2,60;3,2656 2,49;3,2624 2,60;3,2465 1,40;3,2426 1,12;2,8581 1,03;2,8539 1,46;2,8363 1,99;2,8332 2,06;2,8159 1,22;2,8119 1,02;2,6205 0,45;2,6176 0,98;2,6146 1,40;2,6116 1,01;2,5423 0,52;2,5239 2,52;2,5208 3,20;2,5177 3,15;2,5088 75,70;2,5058 163,26;2,5028 224,58;2,4998 163,62;2,4968 76,90;2,3929 0,53;2,3900 1,06;2,3870 1,47;2,3840 1,07;2,3811 0,53;2,1352 1,38;2,1152 1,65;2,0948 1,52;2,0768 2,25;1,9558 2,53;1,8583 0,73;1,8509 1,97;1,8417 2,34;1,8364 3,21;1,8317 2,66;1,8276 2,78;1,8206 3,17;1,8150 3,13;1,8054 1,50;1,7998 1,58;1,7937 1,41;1,7799 0,71;1,7732 0,63;1,7219 0,79;1,7097 2,70;1,6972 3,10;1,6888 2,85;1,6846 2,05;1,6766 2,32;1,6662 0,84;1,6638 0,94;1,6199 0,33;1,6008 2,09;1,5913 6,28;1,5845 8,13;1,5782 10,69;1,5734 5,83;1,5679 4,51;1,5590 2,66;1,5460 0,99;1,5386 0,78;1,4972 0,40;1,4097 1,92;1,3893 0,44;1,2336 0,96;1,1708 0,45;1,0236 0,38;0,0052 0,81;-0,0002 27,57;-0,0057 0,89
I-50	[DMSO-D ₆] 8,0244 14,36;7,9983 1,29;7,6093 6,63;7,5701 7,63;7,5310 0,62;7,4919 0,67;7,3112 3,18;7,1779 7,28;7,1611 3,67;7,0446 3,64;7,0354 0,96;7,0251 8,22;6,9964 0,61;6,9733 7,58;6,9341 6,68;6,9039 7,11;6,8892 4,39;5,7457 4,24;5,4559 1,35;5,4133 5,41;5,3722 5,38;5,3298 1,43;5,2957 0,59;4,3705 1,56;4,3368 1,70;4,0396 0,55;4,0218 0,62;3,9878 1,49;3,9532 1,65;3,6730 0,43;3,4016 1,37;3,3915 1,09;3,3821 1,76;3,3728 2,86;3,3631 2,32;3,3168 815,40;3,2783 3,69;3,2444 1,84;2,9482 0,33;2,9225 0,37;2,8758 1,20;2,8455 2,05;2,8176 1,15;2,6750 0,59;2,6704 0,77;2,6661 0,56;2,5493 1,43;2,5405 1,78;2,5102 39,56;2,5058 72,67;2,5013 94,78;2,4969 66,70;2,4926 32,43;2,3324 0,52;2,3280 0,73;2,3235 0,53;2,1415 1,50;2,1088 3,06;2,0693 2,13;1,9871 2,49;1,8476 0,74;1,8264 1,44;1,8184 1,52;1,7952 1,51;1,7875 1,53;1,7662 2,67;1,7362 3,74;1,7218 4,03;1,6837 4,30;1,6677 2,83;1,6409 1,91;1,6328 1,82;1,6242 1,83;1,6056 1,81;1,5722 1,42;1,5641 1,28;1,5417 0,57;1,4071 0,41;1,2632 3,22;1,2549 3,25;1,2314 1,99;1,2254 1,94;1,1932 1,69;1,1753 1,64;1,1576 0,83;1,0719 0,61;1,0447 1,44;1,0189 1,19;0,9883 0,45;0,7780 15,77;0,7621 16,00;0,7414 1,58;-0,0002 1,35
I-51	[DMSO-D ₆] 7,6117 0,46;7,5934 1,32;7,5740 1,93;7,5557 1,42;7,5381 0,48;7,3069 2,68;7,2107 1,34;7,2040 5,75;7,1829 11,79;7,1792 12,89;7,1776 12,89;7,1738 8,13;7,1617 5,80;7,0403 2,98;7,0230 6,62;6,9007 5,78;6,8871 3,34;5,4383 1,13;5,3952 4,33;5,3542 4,38;5,3115 1,20;5,2976 0,36;4,3064 1,34;4,2744 1,38;3,9328 1,27;3,8993 1,37;3,4838 1,18;3,4666 2,41;3,4496 2,62;3,4325 1,53;3,4159 0,53;3,3792 2,18;3,3621 1,74;3,3374 3,86;3,3116 292,13;3,2880 5,08;3,2679 1,61;3,2598 1,71;3,2488 1,23;3,2391 2,49;3,2309 3,43;3,2215 1,64;3,2024 1,86;3,1296 1,93;3,1120 1,79;3,0883 1,45;3,0706 1,29;2,8495 0,87;2,8420 0,93;2,8150 1,62;2,7851 0,91;2,5102 13,21;2,5059 24,79;2,5014 32,48;2,4970 22,75;2,4927 11,05;2,0699 0,41;2,0440 1,16;2,0066 1,78;1,9635 1,32;1,7392 0,47;1,7097 1,07;1,6864 1,00;1,6802 0,96;1,6566 0,40;1,6493 0,34;1,5146 0,48;1,5036 0,45;1,4845 1,10;1,4540 1,05;1,4237 0,42;1,2883 16,00;1,2712 15,74;-0,0002 3,98

ES 2 613 066 T3

(continuación)

Ej.	Lista de datos de picos de RMN
I-52	[DMSO-D ₆] 8,1450 16,00;7,9241 0,88;7,8342 0,33;7,8301 0,34;7,7728 2,13;7,7685 2,39;7,7542 4,11;7,7497 4,60;7,7345 2,55;7,7303 2,48;7,7035 1,30;7,6987 1,27;7,6901 1,60;7,6853 2,71;7,6823 2,22;7,6714 2,25;7,6674 2,23;7,6644 2,75;7,6595 1,60;7,6510 1,63;7,6463 1,35;7,6221 3,53;7,6190 3,50;7,5836 6,54;7,5806 6,29;7,4983 5,45;7,4922 5,33;7,4598 2,94;7,4539 2,87;7,4088 3,30;7,3968 3,95;7,3944 4,12;7,3875 3,63;7,3830 3,87;7,3780 6,81;7,3593 5,87;7,3104 3,30;7,2799 0,41;7,1772 7,65;7,1594 3,67;7,0440 3,77;7,0234 8,21;6,9281 0,61;6,9027 7,22;6,8875 4,01;5,7458 4,96;5,4582 1,60;5,4166 5,55;5,3715 5,47;5,3481 0,78;5,3291 1,57;4,3715 1,80;4,3388 1,84;4,1303 0,35;4,0392 0,39;4,0202 0,43;3,9930 1,81;3,9598 1,88;3,8840 0,33;3,8496 0,33;3,8245 0,39;3,7895 0,39;3,7752 0,35;3,7579 0,37;3,7289 0,37;3,7233 0,37;3,6965 0,42;3,6610 0,45;3,6217 0,54;3,5969 0,60;3,5520 0,72;3,4287 3,21;3,4096 4,17;3,3998 5,68;3,3903 5,36;3,3708 7,58;3,3190 2661,98;3,2498 2,21;3,2196 0,57;3,2014 0,46;3,1642 0,33;2,8811 1,22;2,8518 2,09;2,8243 1,26;2,6750 1,07;2,6704 1,30;2,6657 1,03;2,5943 0,50;2,5402 2,29;2,5101 76,99;2,5057 139,24;2,5013 178,61;2,4969 123,40;2,4926 59,64;2,4440 0,40;2,3322 0,85;2,3282 1,16;2,3235 0,84;2,1585 1,58;2,1250 3,07;2,0852 2,03;2,0692 1,31;1,9868 0,46;1,8602 0,71;1,8300 1,49;1,8091 1,34;1,8014 1,27;1,7781 0,60;1,7688 0,55;1,6302 0,69;1,6093 1,37;1,6001 1,42;1,5787 1,36;1,5704 1,30;1,5477 0,56;1,5370 0,50;1,2365 0,54;-0,0002 12,15
I-55	[DMSO-D ₆] 8,2161 0,55;8,0448 12,22;8,0245 0,94;8,0222 1,08;7,5743 1,29;7,5700 1,58;7,5519 2,58;7,5491 2,43;7,5351 1,79;7,5306 2,10;7,4889 2,95;7,4846 3,06;7,4699 3,52;7,4657 3,40;7,4413 0,38;7,4237 15,38;7,4226 16,00;7,4168 2,28;7,4129 1,63;7,4071 1,54;7,3832 0,47;7,3043 2,07;7,2886 0,59;7,2762 3,88;7,2556 3,38;7,2039 0,40;7,1915 0,41;7,1822 0,70;7,1709 4,73;7,1574 2,58;7,1299 2,24;7,1113 3,88;7,0945 2,00;7,0927 2,00;7,0766 0,42;7,0550 0,57;7,0464 0,76;7,0377 2,42;7,0213 5,38;6,9783 0,33;6,9548 0,49;6,9007 4,86;6,8854 3,08;6,8539 0,53;6,7244 0,41;5,7466 1,57;5,4440 0,74;5,4010 3,72;5,3720 3,77;5,3580 0,73;5,3465 0,34;5,3300 0,85;5,3056 0,36;5,2957 0,98;4,9216 9,22;4,9158 10,09;4,8789 0,73;4,8732 0,75;4,8116 0,32;4,8058 0,34;4,3462 1,07;4,3106 1,10;4,2628 0,35;4,2512 0,38;4,2396 0,39;4,0218 0,33;3,9780 1,07;3,9416 1,11;3,6973 0,44;3,6931 0,44;3,6841 0,58;3,6723 0,76;3,6630 0,54;3,6508 0,35;3,5793 0,49;3,5560 2,51;3,5501 5,43;3,5442 2,70;3,5373 0,69;3,4073 0,79;3,3931 1,05;3,3883 1,12;3,3794 1,79;3,3697 1,27;3,3585 1,26;3,3498 1,63;3,3074 734,77;3,2863 8,37;3,2551 2,26;3,1387 0,42;3,0369 0,63;2,9014 0,88;2,8763 1,52;2,8492 0,96;2,8150 0,33;2,6740 0,51;2,6692 0,61;2,6649 0,47;2,5744 0,55;2,5394 0,75;2,5090 34,19;2,5047 64,65;2,5002 85,50;2,4958 60,67;2,4915 30,30;2,3315 0,56;2,3269 0,72;2,3224 0,56;2,2033 0,50;2,1583 1,06;2,1246 1,99;2,0894 1,22;2,0693 0,92;2,0330 0,41;1,9867 0,54;1,8534 0,51;1,8246 0,97;1,8018 0,91;1,7728 0,47;1,6391 0,61;1,6185 1,06;1,6096 1,07;1,5879 1,10;1,5802 0,95;1,5579 0,63;1,4151 1,04;1,4082 6,37;1,3933 0,47;1,3889 0,41;1,3846 0,34;1,2654 0,63;1,2499 0,74;1,2358 1,21;1,1822 0,32;1,1747 0,38;1,1085 0,55;1,0909 1,03;1,0735 0,51;0,0079 0,32;-0,0002 5,93
I-57	[DMSO-D ₆] 8,1634 13,11;8,1472 0,76;7,5710 4,48;7,5319 5,69;7,5073 0,36;7,4373 0,57;7,4241 3,82;7,4040 5,44;7,4009 5,75;7,3808 3,84;7,3282 0,89;7,3111 3,27;7,3060 1,88;7,2835 0,77;7,1776 11,64;7,1653 3,74;7,1379 3,93;7,0447 3,27;7,0293 7,89;7,0152 0,64;6,9934 0,35;6,9096 7,23;6,8935 4,18;5,4580 1,46;5,4154 5,09;5,3913 0,87;5,3745 5,11;5,3554 0,72;5,3319 1,52;4,3627 1,46;4,3299 1,58;4,0564 1,19;4,0386 3,60;4,0208 3,65;4,0030 1,43;3,9843 1,37;3,9494 1,66;3,9175 0,40;3,8629 2,49;3,8203 0,37;3,8073 0,48;3,5491 0,33;3,3691 454,41;3,3559 688,63;3,2715 3,26;3,2420 1,92;3,1943 0,69;3,1851 0,69;3,1660 1,21;3,1448 0,46;2,8753 1,09;2,8446 1,91;2,8179 1,18;2,6822 0,40;2,6779 0,81;2,6733 1,07;2,6688 0,80;2,6643 0,39;2,5434 1,87;2,5264 3,05;2,5133 58,45;2,5088 117,23;2,5042 155,51;2,4996 111,90;2,4951 53,73;2,3401 0,37;2,3356 0,77;2,3309 1,04;2,3263 0,76;2,1489 1,33;2,1120 2,64;2,0867 1,53;2,0729 3,43;1,9891 16,00;1,8606 0,49;1,8514 0,59;1,8303 1,16;1,8217 1,27;1,7998 1,17;1,7909 1,10;1,7697 0,49;1,7602 0,45;1,6289 0,55;1,6179 0,63;1,5974 1,18;1,5885 1,27;1,5667 1,18;1,5584 1,13;1,5367 0,51;1,5266 0,44;1,3105 0,53;1,2439 1,83;1,2350 1,03;1,2166 2,36;1,1930 4,45;1,1752 8,86;1,1574 4,35;-0,0002 1,64

ES 2 613 066 T3

(continuación)

Ej.	Lista de datos de picos de RMN
I-59	[DMSO-D ₆] 8,4936 9,05;7,3144 1,47;7,1811 3,27;7,1608 1,62;7,0612 1,55;7,0551 1,88;7,0476 2,64;7,0404 6,28;7,0247 4,40;7,0209 3,64;7,0058 1,19;6,9989 0,84;6,9846 0,66;6,9041 3,26;6,8889 1,86;5,7472 1,75;5,4671 0,69;5,4239 2,46;5,3787 2,48;5,3356 0,70;4,5903 0,34;4,4152 10,64;4,3748 0,80;4,3413 0,86;4,0390 0,34;4,0212 0,44;4,0039 0,78;3,9676 0,78;3,7096 0,47;3,7057 0,36;3,6980 0,55;3,6960 0,58;3,6810 0,60;3,6715 0,37;3,6677 0,41;3,4979 0,45;3,4861 0,42;3,4746 0,85;3,4639 1,03;3,4561 0,61;3,4462 0,82;3,4364 1,23;3,4268 0,75;3,4179 0,57;3,4087 0,72;3,3982 0,47;3,3009 297,63;3,2772 7,56;2,9051 0,55;2,8768 0,95;2,8471 0,57;2,6732 0,49;2,6686 0,69;2,6639 0,51;2,5386 1,04;2,5084 39,69;2,5041 72,43;2,4997 93,44;2,4953 65,59;2,4910 32,05;2,3452 0,39;2,3310 0,53;2,3263 0,69;2,3219 0,51;2,2393 15,38;2,2068 0,36;2,1885 0,79;2,1850 0,78;2,1726 0,67;2,1483 1,40;2,1128 1,01;2,0768 16,00;1,9866 1,34;1,8627 0,63;1,8541 0,66;1,8330 0,61;1,8258 0,57;1,6385 0,63;1,6303 0,65;1,6093 0,60;1,5996 0,58;1,2368 0,78;1,1925 0,38;1,1747 0,68;1,1570 0,36;0,0079 0,62;-0,0002 11,73;-0,0085 0,51
I-60	[DMSO-D ₆] 8,3299 0,40;7,7755 6,73;7,6623 0,33;7,3056 1,04;7,2679 0,47;7,1722 2,36;7,1569 1,27;7,0388 1,16;7,0317 0,56;7,0211 2,58;6,8993 2,66;6,8854 1,32;5,7474 1,35;5,4566 0,56;5,4132 1,63;5,3601 1,71;5,3176 0,60;5,2956 0,47;5,2746 0,36;4,3544 0,44;4,3432 0,59;4,3127 0,63;3,9748 0,57;3,9354 0,78;3,9197 0,40;3,8887 1,04;3,8676 16,00;3,6860 0,35;3,6721 0,45;3,6627 0,36;3,4247 0,45;3,3792 1,14;3,3008 1113,92;3,2777 19,21;3,2076 0,63;3,1878 0,59;3,1744 0,49;3,1672 0,43;3,1486 0,39;2,8868 0,54;2,8592 0,74;2,8383 0,35;2,8211 0,50;2,6925 2,76;2,6736 4,08;2,6688 3,15;2,6642 2,17;2,6598 1,18;2,6255 0,37;2,6134 0,41;2,6090 0,44;2,5388 4,71;2,5085 159,43;2,5042 286,60;2,4997 366,70;2,4953 252,97;2,4909 121,25;2,4240 0,76;2,3732 0,38;2,3676 0,37;2,3563 0,40;2,3312 2,00;2,3265 2,52;2,3218 1,83;2,1289 0,65;2,1226 0,64;2,0845 4,97;2,0694 4,57;1,9864 0,54;1,7881 0,59;1,7521 0,51;1,5951 2,86;1,5634 2,25;1,3991 0,42;1,2368 0,73;1,1747 0,51;1,1577 0,50;1,1150 2,15;1,0951 1,38;1,0060 0,57;0,9835 0,98;0,9616 0,73;0,9555 0,77;0,8901 0,49;0,0080 2,80;-0,0002 51,71;-0,0084 2,10;-0,1497 0,32
I-61	[DMSO-D ₆] 7,7676 6,50;7,3003 0,96;7,1671 2,26;7,1545 1,10;7,0337 1,12;7,0185 2,56;6,9655 0,92;6,9483 1,70;6,9263 1,19;6,9067 2,05;6,8964 2,35;6,8827 1,36;6,8246 1,41;6,8057 0,97;5,4374 0,51;5,3940 1,76;5,3536 1,74;5,3104 0,49;4,3147 0,63;4,2815 0,61;4,0985 4,92;4,0568 0,38;4,0389 0,97;4,0211 1,02;4,0034 0,36;3,9443 0,64;3,9025 16,00;3,7095 0,35;3,6962 0,36;3,6808 0,38;3,4982 0,39;3,4752 0,58;3,4640 0,53;3,4527 0,53;3,4443 0,52;3,4166 0,67;3,4003 0,89;3,3047 1218,33;3,2814 18,99;3,2131 0,65;3,0832 0,49;2,8555 0,43;2,8231 0,72;2,7949 0,49;2,6736 1,46;2,6690 1,91;2,6643 1,44;2,6602 0,80;2,6131 0,39;2,5390 3,14;2,5087 109,72;2,5044 200,01;2,4999 258,25;2,4955 180,12;2,4912 86,91;2,3311 1,32;2,3265 1,73;2,3220 1,17;2,3174 0,62;2,2191 10,31;2,1997 10,49;2,0828 0,52;2,0691 1,44;2,0478 0,92;2,0120 0,61;1,9867 4,02;1,7607 0,47;1,7301 0,42;1,5373 0,48;1,5301 0,45;1,5074 0,45;1,3985 1,31;1,2364 0,52;1,1926 1,17;1,1748 2,17;1,1570 1,12;0,8903 0,37;0,0079 1,13;-0,0002 20,73;-0,0084 0,91
I-62	[DMSO-D ₆] 8,6244 16,00;8,4920 0,52;8,0955 4,59;8,0545 6,27;7,8260 6,63;7,7849 4,95;7,6205 0,66;7,6038 1,48;7,5993 1,46;7,5828 2,83;7,5663 1,51;7,5618 1,74;7,5454 0,79;7,3139 2,67;7,2904 4,80;7,2679 7,01;7,2461 3,91;7,1806 5,94;7,1610 2,97;7,0782 0,35;7,0473 3,04;7,0250 6,55;6,9047 5,84;6,8891 3,33;5,4687 1,21;5,4263 4,20;5,3779 4,28;5,3351 1,26;5,2959 0,43;4,3852 1,32;4,3523 1,40;4,0572 1,04;4,0394 3,11;4,0216 3,52;4,0039 2,14;3,9745 1,38;3,5682 0,36;3,4991 0,69;3,4899 1,12;3,4799 0,94;3,4707 1,40;3,4614 2,23;3,4520 1,49;3,4426 1,16;3,4330 1,50;3,4252 1,10;3,4115 0,90;3,3151 1941,32;3,1796 0,72;3,1408 0,67;2,9072 1,09;2,8782 1,77;2,8506 1,14;2,8302 0,33;2,6956 0,39;2,6795 0,76;2,6749 1,36;2,6702 1,76;2,6658 1,33;2,6612 0,76;2,5402 3,49;2,5233 8,22;2,5099 97,98;2,5056 183,21;2,5011 241,25;2,4967 173,04;2,4923 86,93;2,3804 0,38;2,3491 0,35;2,3323 1,45;2,3278 1,79;2,3233 1,42;2,1993 1,36;2,1620 2,48;2,1238 1,57;2,0851 0,33;2,0694 2,27;1,9871 13,50;1,9085 0,86;1,8950 0,53;1,8854 0,62;1,8636 1,17;1,8565 1,25;1,8330 1,17;1,8256 1,14;1,8047 0,55;1,7953 0,50;1,6675 0,61;1,6469 1,16;1,6376 1,25;1,6157 1,15;1,6072 1,11;1,5860 0,52;1,5764 0,47;1,3984 0,42;1,2355 0,71;1,1930 3,81;1,1753 7,51;1,1575 3,69;0,0079 0,46;-0,0002 9,48;-0,0085 0,45

(continuación)

Ej.	Lista de datos de picos de RMN
I-63	[DMSO-D ₆] 8,1046 3,68;7,3058 0,73;7,2811 0,75;7,2622 1,16;7,2431 1,07;7,1725 1,68;7,1582 0,89;7,1374 2,66;7,1301 1,34;7,1186 1,96;7,0904 3,04;7,0561 2,91;7,0392 0,87;7,0221 1,91;7,0166 1,02;6,9007 1,65;6,8863 0,91;5,4029 1,36;5,3696 1,32;4,3529 0,40;4,3211 0,42;4,0573 0,42;4,0395 1,20;4,0217 1,22;4,0038 0,46;3,9768 0,38;3,9445 0,42;3,3995 0,60;3,3902 0,62;3,3808 0,83;3,3713 1,19;3,3608 1,19;3,3132 179,92;3,2393 0,40;2,8479 0,49;2,5398 0,71;2,5096 16,90;2,5053 30,21;2,5009 38,39;2,4966 26,71;2,4923 12,94;2,1841 0,47;2,1360 16,00;2,1043 0,77;2,0695 0,51;1,9870 5,09;1,8196 0,33;1,5817 0,32;1,3982 0,54;1,1929 1,40;1,1752 2,76;1,1573 1,35;-0,0002 0,40
I-64	[DMSO-D ₆] 11,4444 4,39;11,1901 0,81;9,8995 0,61;9,0748 0,34;8,6602 0,56;7,9819 0,34;7,8239 1,45;7,7835 1,56;7,6641 0,87;7,6598 0,95;7,6444 1,02;7,6404 0,97;7,6203 2,89;7,6118 0,37;7,6004 2,97;7,5921 0,47;7,5795 0,71;7,5283 0,70;7,4820 0,52;7,4651 1,27;7,4613 1,12;7,4428 1,44;7,4257 0,56;7,4216 0,56;7,3257 0,38;7,3187 0,66;7,3051 0,81;7,2482 0,43;7,2196 1,03;7,2109 2,00;7,1990 1,13;7,1919 2,15;7,1884 2,39;7,1714 2,69;7,1462 0,37;7,0881 0,41;7,0802 1,14;7,0690 0,56;7,0608 2,03;7,0526 1,09;7,0426 1,41;7,0388 1,54;7,0349 2,49;7,0276 1,94;6,9091 2,84;6,8913 0,96;6,3120 1,53;6,2723 1,45;6,1958 0,37;6,1870 0,76;6,1688 0,61;5,7851 0,68;5,7646 0,79;5,7573 1,82;5,7375 0,50;5,4713 0,46;5,4445 0,43;5,4276 1,10;5,4027 1,31;5,3905 0,78;5,3807 1,73;5,3669 1,21;5,3376 0,51;5,3260 0,44;5,0197 0,55;5,0141 0,57;4,9042 2,67;4,8986 2,60;4,8296 0,71;4,8208 0,86;4,8045 2,17;4,7984 2,25;4,7687 0,39;4,7639 0,42;4,3678 0,52;4,3440 0,75;4,3274 0,56;4,0553 0,78;4,0374 2,23;4,0197 2,26;4,0018 0,77;3,9550 0,68;3,8317 0,39;3,8045 0,41;3,7879 0,78;3,7614 0,68;3,7015 0,68;3,6923 0,45;3,6806 0,63;3,6583 0,34;3,6384 0,38;3,6124 0,86;3,6067 2,11;3,6010 0,87;3,5675 0,69;3,5118 1,03;3,5061 2,16;3,5001 0,92;3,4144 0,39;3,4015 0,59;3,3913 0,99;3,3795 1,66;3,3470 1964,81;3,3250 5,70;3,2972 1,40;3,2599 1,04;3,2431 0,82;3,2282 0,61;3,2018 0,33;2,8662 0,42;2,8307 0,70;2,8039 0,50;2,6768 1,01;2,6718 1,53;2,6673 1,15;2,5421 0,78;2,5251 2,65;2,5206 3,84;2,5112 86,20;2,5071 166,76;2,5028 232,18;2,4986 160,26;2,4944 80,12;2,4562 0,37;2,3342 1,12;2,3295 1,39;2,3251 1,04;2,1407 0,58;2,1029 1,02;2,0746 16,00;2,0457 0,53;1,9892 10,59;1,8258 0,58;1,7937 0,54;1,7670 0,43;1,7581 0,43;1,5938 0,34;1,5805 0,39;1,5736 0,52;1,5644 0,52;1,5448 0,62;1,2346 0,73;1,1922 2,79;1,1744 5,96;1,1567 2,76;0,0079 0,59;-0,0002 20,96;- 0,0087 0,56
I-65	[CD ₃ CN] 8,0859 4,04;7,8317 3,92;7,8312 3,99;7,6910 0,33;7,6866 0,33;7,6476 1,02;7,6434 1,12;7,6283 1,07;7,6241 1,11;7,5577 0,89;7,5556 1,56;7,5534 0,79;7,5395 0,82;7,5368 0,92;7,5350 0,83;7,5323 0,74;7,5185 0,85;7,5139 0,73;7,1323 1,29;7,1122 1,16;7,0765 0,89;7,0741 0,85;7,0575 1,35;7,0557 1,19;7,0390 0,79;7,0366 0,71;7,0124 0,43;7,0047 0,33;6,9912 0,42;6,9858 0,49;6,9674 0,35;6,9022 1,35;6,3609 2,00;5,4215 10,07;5,0391 1,26;5,0021 0,57;3,9498 0,56;3,8868 16,00;3,8073 4,63;3,7942 1,21;3,3556 0,49;3,3456 0,35;3,3381 0,57;3,3281 0,99;3,3181 0,58;3,3108 0,41;3,3009 0,58;3,2899 0,44;2,2310 12,74;2,2294 10,23;2,1955 0,52;2,1638 0,59;2,0857 0,36;1,9912 41,03;1,9596 1,75;1,9524 1,81;1,9428 7,37;1,9367 4,93;1,9307 19,09;1,9246 33,26;1,9184 43,17;1,9123 29,21;1,9061 14,83;1,7469 0,34;1,2802 0,39;1,2203 0,34;1,2026 0,74;1,1847 0,39;0,9161 0,44;-0,0001 4,75

5 La intensidad de las señales intensas correlaciona con la altura de las señales en cm de un ejemplo impreso de un espectro de RMN y muestra las verdaderas proporciones de las intensidades de las señales. En el caso de señales anchas se pueden mostrar varios picos o el medio de la señal y su intensidad relativa comparada con la señal más intensa del espectro.

Las listas de los picos de RMN ¹H son similares a los espectros impresos de RMN ¹H clásicos y de esta manera comprenden normalmente todos los picos listados en una interpretación de RMN clásica.

Además, como los espectros impresos de RMN ¹H clásicos, pueden mostrar señales del disolvente, señales de estereoisómeros de los compuestos objetivo, que son asimismo objeto de la invención, y/o picos de las impurezas.

10 En la indicación de señales de compuestos en el intervalo de delta de disolventes y/o agua, en las listas de los inventores de picos de RMN ¹H se muestran los picos habituales del disolvente, por ejemplo los picos de DMSO en DMSO-d₆ y el pico de agua, que normalmente tiene una elevada intensidad en promedio.

15 Normalmente, en promedio, los picos de los estereoisómeros de los compuestos objetivo y/o los picos de las impurezas tienen una menor intensidad que los picos de los compuestos objetivo (por ejemplo con una pureza > 90 %).

Tales estereoisómeros y/o impurezas pueden ser típicos del respectivo procedimiento de preparación. De esta manera, sus picos pueden ayudar a identificar la reproducción del procedimiento de preparación de los inventores usando las "huellas de productos secundarios".

- 5 Si fuera oportuno, un experto que calcula los picos de los compuestos objetivo con procedimientos conocidos (MestreC, simulación ACD, pero también usando los valores esperados evaluados empíricamente) puede aislar los picos de los compuestos objetivo usando, si fuera oportuno, filtros adicionales de intensidad. Este aislamiento sería similar a la correspondiente selección de picos de la interpretación clásica de RMN ¹H.

Ejemplos de uso

Ejemplo A

10 Ensayo de *Phytophthora* (tomate) / protector

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

- 15 Para preparar una preparación adecuada del principio activo se mezcla 1 parte en peso del principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y el concentrado se diluye con agua hasta la concentración deseada.

- 20 Para ensayar la actividad protectora, se rocían plantas de tomate jóvenes con la preparación del principio activo en la dosis de aplicación indicada. 1 día después del tratamiento, las plantas se inoculan con una suspensión de esporas que *Phytophthora infestans* y a continuación se mantienen a una humedad relativa de un 100 % y 22 °C durante 24 h. A continuación, las plantas se colocan en una cabina climatizada con una humedad relativa atmosférica de aproximadamente un 96 % y una temperatura de aproximadamente 20 °C.

La evaluación se lleva a cabo 7 días después de la inoculación. 0 % significa una eficacia que corresponde con la del control, mientras una eficacia de un 100 % significa que no se observa ninguna infección.

- 25 En este ensayo, los siguientes compuestos de acuerdo con la invención I-2, I-3, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-11, I-13, I-14, I-15, I-17, I-18, I-19, I-20 y I-21 muestran, con una concentración de principio activo de 500 ppm, una eficacia de un 70 % o superior.

- 30 Además, en este ensayo los siguientes compuestos muestran, con una concentración del principio activo de 500 ppm, una eficacia de un 70 % o superior, en el que se pueden observar las eficacias presentadas entre paréntesis para los compuestos específicos: I-16 (80 %), I-22 (100 %), I-23 (70 %), I-24 (94 %), I-25 (100 %), I-29 (100 %), I-30 (95 %), I-33 (95 %), I-34 (95 %), I-35 (95 %), I-36 (100 %), I-37 (95 %), I-38 (95 %), I-39 (90 %), I-41 (95 %), I-42 (100 %), I-43 (90 %), I-44 (95 %), I-45 (95 %), I-46 (95 %), I-47 (94 %), I-48 (94 %), I-49 (90 %), I-50 (95 %), I-51 (98 %), I-52 (98 %), I-53 (90 %), I-54 (85 %), I-55 (98 %), I-57 (98 %), I-60 (95 %), I-61 (95 %), I-65 (93 %).

Ejemplo B

Ensayo de *Plasmopara* (vid) / protector

- | | | |
|---------------|------|---|
| Disolvente: | 24,5 | partes en peso de acetona |
| | 24,5 | partes en peso de dimetilacetamida |
| Emulsionante: | 1 | parte en peso de alquil-aril-poliglicoléter |

- 35 Para preparar una preparación adecuada del principio activo se mezcla 1 parte en peso del principio activo con las cantidades indicadas del disolvente y emulsionante y el concentrado se diluye con agua hasta la concentración deseada.

- 40 Para ensayar la actividad protectora, se rocían plantas jóvenes con la preparación del principio activo en la dosis de aplicación indicada. Después de secarse el recubrimiento de la pulverización, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas de *Plasmopara viticola* y a continuación se mantienen en una cabina de incubación a aproximadamente 20 °C y a una humedad atmosférica relativa de un 100 % durante 1 día. A continuación se colocan las plantas en un invernadero a aproximadamente 21 °C y a una humedad atmosférica de aproximadamente un 90 % durante 4 días. A continuación se humedecen las plantas y se colocan en una cabina de incubación durante 1 día.

- 45 La evaluación se lleva a cabo 6 días después de la inoculación. 0 % significa una eficacia que corresponde con la del control, mientras una eficacia de un 100 % significa que no se observa ninguna infección.

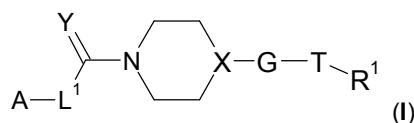
- 50 En este ensayo, los siguientes compuestos de acuerdo con la invención I-3, I-11, I-13, I-14, I-16, I-17, I-18, I-19, I-20, I-21 muestran, con una concentración del principio activo de 100 ppm, una eficacia de un 70 % o superior.

Además, en este ensayo los siguientes compuestos muestran, con una concentración del principio activo de 500

ppm, una eficacia de un 70 % o superior, en el que se pueden observar las eficacias presentadas entre paréntesis para los compuestos específicos: I-22 (100 %), I-24 (100 %), I-25 (96 %), I-29 (95 %), I-30 (85 %), I-33 (89 %), I-34 (84 %), I-35 (89 %), I-36 (96 %), I-42 (90 %), I-43 (100 %), I-44 (74 %), I-45 (100 %), I-46 (100 %), I-49 (79 %), I-50 (93 %), I-51 (100 %), I-52 (94 %), I-53 (76 %), I-55 (100 %), I-57 (91 %).

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de fórmula (I)



en la que los símbolos tienen los siguientes significados:

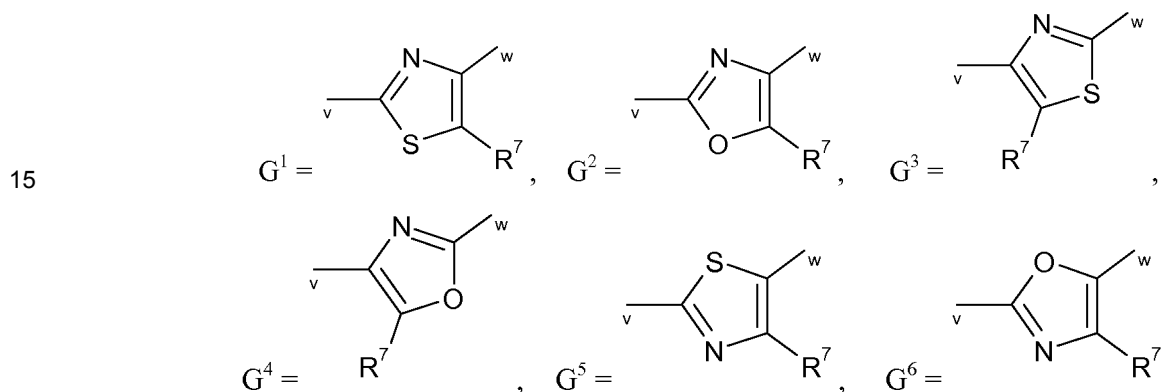
5 A representa fenilo que puede contener hasta tres sustituyentes,

en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R²,

o

10 A' representa heteroarilo de 5 o 6 miembros opcionalmente benzocondensado sin sustituir o sustituido, en el que los sustituyentes en el carbono se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R³ y los sustituyentes en el nitrógeno se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R⁴,
 L¹ representa NR⁵ o C(R⁶)₂,
 X representa CH o nitrógeno,
 Y representa azufre u oxígeno,

G representa:



en los que el enlace identificado por "v" está unido directamente a X y en los que el enlace identificado por "w" está unido directamente a T,

20 T representa *-C(=O)CH₂-#, *-C(=O)CH₂C(R⁸)₂-#, *-C(=O)CH=CH-#, *-C(=O)C≡C-#, *-C(=O)CH₂C(=O)-#, *-C≡CC(=O)-#, *-CH=CHC(=O)-#, *-CH₂CH₂C(=O)-#, *-C(=S)CH₂-#, *-C(=S)CH₂C(R⁸)₂-#, *-C(=S)CH=CH-#, *-C(=S)C≡C-#, *-C≡CC(=S)-#, *-CH=CHC(=S)-#, *-CH₂CH₂C(=S)-#, *-C(=NR⁹)CH₂-#, *-C(=NR⁹)CH₂C(R⁸)₂-# o *-CH₂CH₂C(=NR⁹)-#, *-C(=NR⁹)CH=CH-#, *-CH=CHC(=NR⁹)-#, *-CH=CHC(NOH)-#, *-CH=CHC(NO-alkil-C₁-C₄)CH₂-#,

25 en donde el enlace identificado por * está unido directamente a G y en donde el enlace identificado por # está unido directamente a R¹,

R¹ se selecciona entre el grupo que contiene R¹_a, R¹_b, R¹_c, R¹_d, R¹_e, R¹_f, R¹_g o R¹_h, en donde

R¹_a representa alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, alcohalquilo C₂-C₈ o cicloalcohalquilo C₅-C₉ o

R¹_b representa cicloalquilo C₃-C₁₀ sin sustituir o sustituido,

30 en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre -Q o R¹⁰ o

R¹_c representa cicloalqueno C₅-C₁₀ sin sustituir o sustituido,

en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹¹ o

R¹_d representa fenilo sin sustituir o sustituido,

en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre -L²Q o R¹² o

35 R¹_e representa naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, indan-1-ilo, indan-2-ilo, indan-3-ilo, indan-4-ilo o indan-5-ilo sin sustituir o sustituidos,

en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹³ o

40 R¹_f representa un radical heteroarilo de 5 o 6 miembros sin sustituir o sustituido, en donde los sustituyentes en el carbono se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre -L²Q o R¹⁴ y los sustituyentes en el nitrógeno se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre -L³Q o R¹⁵ o

R^1_g representa heteroarilo de 5 o 6 miembros benzocondensado sin sustituir o sustituido, en donde los sustituyentes en el carbono se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{16} y los sustituyentes en el nitrógeno se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{17} o

R^1_h representa heterociclilo C_5-C_{15} sin sustituir o sustituido, en donde los sustituyentes en el carbono se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{18} y los sustituyentes en el nitrógeno se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{19} ,

L^2 representa un enlace directo, $-O-$, $-C(R^{20})_2-$ o $-NR^{21}-$,

L^3 representa un enlace directo o $-C(R^{20})_2-$,

Q se selecciona entre el grupo que contiene Q', Q'' y Q''', en donde

Q' representa un fenilo que puede contener hasta dos sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{22} o

Q'' representa un radical heteroarilo de 5 o 6 miembros que puede contener hasta dos sustituyentes, en donde los sustituyentes en el carbono se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{23} y los sustituyentes en el nitrógeno se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R^{24} o

Q''' representa un cicloalquilo C_3-C_{10} saturado o parcialmente insaturado,

R^2 , R^{12} y R^{22} representan, independientemente los unos de los otros, halógeno, ciano, hidroxilo, SH, amino, nitro, fenilo, $C(=O)H$, $C(=O)OH$, $CONR^{25}R^{26}$, $NR^{25}R^{26}$, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , halocicloalquilo C_3-C_8 , alquil-cicloalquilo C_4-C_{10} , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , cicloalquilocicloalquilo C_6-C_{14} , halocicloalquilalquilo C_4-C_{10} , alquilocicloalquilalquilo C_5-C_{10} , cicloalquenilo C_3-C_8 , halocicloalquenilo C_3-C_8 , alcoxialquilo C_2-C_6 , cicloalcoxialquilo C_4-C_{10} , alcoxialcoxialquilo C_3-C_8 , alquilitoalquilo C_2-C_6 , alquilsulfinalquilo C_2-C_6 , alquilsulfonalquilo C_2-C_6 , alquilaminoalquilo C_2-C_6 , dialquilaminoalquilo C_3-C_8 , haloalquilaminoalquilo C_2-C_6 , cicloalquilaminoalquilo C_4-C_{10} , alquil-carbonilo C_2-C_6 , haloalquilcarbonilo C_2-C_6 , cicloalquilcarbonilo C_4-C_8 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , cicloalcoxi-carbonilo C_4-C_8 , cicloalquilalcoxycarbonilo C_5-C_{10} , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_8 , cicloalquilaminocarbonilo C_4-C_8 , haloalcoxialquilo C_2-C_6 , hidroxialquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , cicloalcoxi C_3-C_8 , halocicloalcoxi C_3-C_8 , cicloalquilalcoxi C_4-C_{10} , alqueniloxi C_3-C_6 , haloalqueniloxi C_3-C_6 , alquiniloxi C_3-C_6 , haloalquiniloxi C_3-C_6 , alcoxialcoxi C_2-C_6 , alquilcarboniloxi C_2-C_6 , haloalquilcarboniloxi C_2-C_6 , cicloalquilcarboniloxi C_4-C_8 , alquilcarbonilalcoxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , cicloalquiltio C_3-C_6 , alquilsulfino C_1-C_6 , haloalquilsulfino C_1-C_6 , alquilsulfonilo C_1-C_6 , haloalquilsulfonilo C_1-C_6 , cicloalquilsulfonilo C_3-C_8 , tri(alquil- C_1-C_4)sililo, alquilsulfonilamino C_1-C_6 o haloalquilsulfonilamino C_1-C_6 ,

R^3 , R^{14} , R^{16} , R^{18} y R^{23} representan, independientemente los unos de los otros, halógeno, ciano, hidroxilo, SH, amino, nitro, $NR^{25}R^{26}$, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquilocicloalquilo C_4-C_{10} , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , cicloalquilocicloalquilo C_6-C_{14} , alquilocicloalquilalquilo C_5-C_{10} , alcoxialquilo C_2-C_4 , alquilcarbonilo C_2-C_4 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 , alquilaminocarbonilo C_2-C_6 , dialquilaminocarbonilo C_3-C_8 , hidroxialquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alqueniloxi C_3-C_6 , alquiniloxi C_3-C_6 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquilcarboniloxi C_1-C_6 , alquilcarboniltio C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_4 , haloalquiltio C_1-C_4 , alquilsulfino C_1-C_4 , haloalquilsulfino C_1-C_4 , alquilsulfonilo C_1-C_4 , haloalquilsulfonilo C_1-C_4 , tri(alquil- C_1-C_4)sililo o fenilo,

R^4 , R^{15} , R^{17} , R^{19} y R^{24} representan, independientemente los unos de los otros, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_3-C_6 , haloalquinilo C_3-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alquilocicloalquilo C_4-C_{10} , cicloalquilalquilo C_4-C_{10} , fenilo, bencilo, alquilsulfonilo C_1-C_4 , $C(=O)H$, alquilcarboniloxi C_2-C_4 , alcoxycarbonilo C_2-C_5 o alquilcarbonilo C_2-C_5 ,

R^5 representa hidrógeno o alquilo C_1-C_4 ,

R^6 representa, independientemente los unos de los otros, hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , ciclopropilo, halógeno,

o los dos radicales R^6 junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo de ciclopropilo,

R^7 representa hidrógeno, alquilo C_1-C_3 , haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi C_1-C_4 , alcoxycarbonilo C_2-C_5 o halógeno,

R^8 representa, independientemente los unos de los otros, hidrógeno o alquilo C_1-C_4 ,

R^9 representa OH, nitro, ciano, alquilo C_1-C_4 , alquilamino C_1-C_4 , dialquilamino C_2-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 o ciclopropiloxi

R^{10} y R^{11} representan, independientemente los unos de los otros, ciano, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , tri(alquil- C_1-C_4)sililo, fenilo, hidroxilo, oxo, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_3-C_6 , alquiniloxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6 ,

R^{13} representa, independientemente los unos de los otros, ciano, nitro, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_1-C_6 , tri(alquil- C_1-C_4)sililo, bencilo, fenilo, hidroxilo, SH, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alqueniloxi C_3-C_6 , alquiniloxi C_3-C_6 , alquiltio C_1-C_6 o haloalquiltio C_1-C_6 ,

R^{20} representa, independientemente los unos de los otros, hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ,

R^{21} representa alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , alquilcarbonilo C_2-C_6 , haloalquilcarbonilo C_2-C_6 , alcoxycarbonilo C_2-C_6 o haloalcoxycarbonilo C_2-C_6 ,

R^{25} y R^{26} representan, independientemente los unos de los otros, hidrógeno, alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 , bencilo o fenilo,

y también las sales agroquímicamente activas de los mismos.

2. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, en la que los símbolos tienen los significados siguientes:

5 A representa fenilo que puede contener hasta dos sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre la lista de R² y R² representa:
 halógeno, ciano, hidroxilo, amino, nitro, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₅, alcocixarbonilo C₂-C₆, alquilcarboniloxi C₂-C₆ o C(=O)H,

10 A' representa un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo siguiente: furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, pirrol-1-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirazin-2-ilo, pirazin-3-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo o pirimidin-5-ilo que puede contener hasta dos sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan,
 15 independientemente los unos de los otros, entre R³ y R⁴ y

R³ representa un sustituyente en el carbono:

halógeno, ciano, hidroxilo, amino, nitro, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, alcoxialquilo C₂-C₄, alcocixarbonilo C₂-C₆, alquilcarboniloxi C₂-C₆, C(=O)H o fenilo

R⁴ representa un sustituyente en el carbono:

alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₃-C₆, haloalquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆ o haloalquinilo C₃-C₆

G representa G¹ o G²,

25 T representa *-C(=O)CH₂-#, *-C(=O)CH₂C(R₈)₂-#, *-C(=O)CH=CH-#, *-C(=O)C=C-#, *-C=CC(=O)-#, *-CH=CHC(=O)-#, *-CH₂CH₂C(=O)-#, *-C(=S)CH₂-#, *-C(=S)CH₂C(R₈)₂-#, *-CH₂CH₂C(=S)-#, *-C(=NR₉)CH₂-#, *-C(=NR₉)CH=CH-#, *-CH=CHC(=NR₉)-#, *-CH=CHC(NOH)-# o *-CH=CHC(NO-C₁-C₄-alquil)CH₂-#,

L¹ representa CH₂ o NR⁵,

X representa CH,

30 Y representa oxígeno,

R^{1a} representa alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆ o alquinilo C₂-C₆, alcoxialquilo C₂-C₆,

R^{1b} representa cicloalquilo C₃-C₁₀ sin sustituir o sustituido, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre -Q o R¹⁰ y R¹⁰ representa:

35 ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, tri(alquil-C₁-C₄)sililo, hidroxilo, oxo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₃-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆,

R^{1c} representa cicloalquenilo C₅-C₁₀ sin sustituir o sustituido, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹¹ y R¹¹ representa:

40 ciano, cloro, flúor, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, fenilo, oxo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alqueniloxi C₃-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆ o haloalquiltio C₁-C₆,

R^{1d} representa fenilo sin sustituir o sustituido, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre -L²Q o R¹² y R¹² representa:

45 halógeno, ciano, hidroxilo, SH, amino, nitro, C(=O)H, CONR²⁵R²⁶, NR²⁵R²⁶, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, alquilcicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilocicloalquilo C₆-C₁₄, halocicloalquilalquilo C₄-C₁₀, alquilcicloalquilalquilo C₅-C₁₀, cicloalquenilo C₃-C₈, halocicloalquenilo C₃-C₈, alcoxialquilo C₂-C₆, cicloalcoxialquilo C₄-C₁₀, alcoxialcoxialquilo C₃-C₈, alquiltioalquilo C₂-C₆, alquilsulfinalquilo C₂-C₆, alquilsulfonalquilo C₂-C₆, alquilaminoalquilo C₂-C₆, dialquilaminoalquilo C₃-C₈, haloalquilaminoalquilo C₂-C₆, cicloalquilaminoalquilo C₄-C₁₀, alquilcarbonilo C₂-C₆, haloalquilcarbonilo C₂-C₆, cicloalquilcarbonilo C₄-C₈, alcocixarbonilo C₂-C₆, cicloalcoxixarbonilo C₄-C₈, cicloalquilalcocixarbonilo C₅-C₁₀, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈, cicloalquilaminocarbonilo C₄-C₈, haloalcoxialquilo C₂-C₆, hidroxialquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₈, halocicloalcoxi C₃-C₈, cicloalquilalcoxi C₄-C₁₀, alqueniloxi C₃-C₆, haloalqueniloxi C₃-C₆, alquiniloxi C₃-C₆, haloalquiniloxi C₃-C₆, alcoxialcoxi C₂-C₆, alquilcarboniloxi C₂-C₆, haloalquilcarboniloxi C₂-C₆, cicloalquilcarboniloxi C₄-C₈, alquilcarbonilalcoxi C₃-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, cicloalquiltio C₃-C₆, alquilsulfino C₁-C₆, haloalquilsulfino C₁-C₆, alquilsulfonilo C₁-C₆, haloalquilsulfonilo C₁-C₆, cicloalquilsulfonilo C₃-C₈, tri(alquil-C₁-C₄)sililo, alquilsulfonilamino C₁-C₆, haloalquilsulfonilamino C₁-C₆,

50 R^{1e} representa naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decalin-1-ilo, decalin-1-ilo, 1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, indan-1-ilo, indan-2-ilo, indan-3-ilo, indan-4-ilo o indan-5-ilo sin sustituir o sustituidos, en donde los sustituyentes se seleccionan,

60

independientemente los unos de los otros, entre R¹³ y R¹³ representa:

ciano, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, bencilo, fenilo, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆ o alquiltio C₁-C₆,

R¹⁴ representa un radical heteroarilo de 5 o 6 miembros sin sustituir o sustituido, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre -L²Q o R¹⁴ y -L³Q o R¹⁵ y R¹⁴ representa un sustituyente en el carbono:

halógeno, ciano, hidroxilo, SH, amino, nitro, NR²⁵R²⁶, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquil-cicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilcicloalquilo C₆-C₁₄, alquilcicloalquilalquilo C₅-C₁₀, alcoxialquilo C₂-C₄, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈, hidroxialquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄, haloalquilsulfinilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, tri(alquil-C₁-C₄)sililo,

R¹⁵ representa un sustituyente en el nitrógeno:

alquilo C₁-C₆, alquenilo C₁-C₆, alquinilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₃-C₆, haloalquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, fenilo,

R¹⁶ representa un heteroarilo de 5 o 6 miembros benzocondensado sin sustituir o sustituido, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹⁶ y R¹⁷ y R¹⁶ representa un sustituyente en el carbono:

halógeno, ciano, hidroxilo, SH, amino, nitro, NR²⁵R²⁶, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilcicloalquilo C₆-C₁₄, alquilcicloalquilalquilo C₅-C₁₀, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈, hidroxialquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄, haloalquilsulfinilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, tri(alquil-C₁-C₄)sililo o fenilo,

R¹⁷ representa un sustituyente en el nitrógeno:

alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₃-C₆, haloalquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀ o fenilo,

R¹⁸ representa heterociclilo C₅-C₁₅ sin sustituir o sustituido, en donde los sustituyentes posibles se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹⁸ y R¹⁹ y

R¹⁸ representa un sustituyente en el carbono:

halógeno, ciano, hidroxilo, SH, amino, nitro, NR²⁵R²⁶, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilcicloalquilo C₆-C₁₄, alquilcicloalquilalquilo C₅-C₁₀, alcoxialquilo C₂-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₄, alcoxycarbonilo C₂-C₆, alquilaminocarbonilo C₂-C₆, dialquilaminocarbonilo C₃-C₈, hidroxialquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquilcarbonilo C₂-C₆, alquilcarboniltio C₂-C₆, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, alquilsulfinilo C₁-C₄, haloalquilsulfinilo C₁-C₄, alquilsulfonilo C₁-C₄, haloalquilsulfonilo C₁-C₄, tri(alquil-C₁-C₄)sililo o fenilo,

R¹⁹ representa un sustituyente en el nitrógeno:

alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, haloalquilo C₁₀-C₆, haloalquenilo C₃-C₆, haloalquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alquilcicloalquilo C₄-C₁₀, cicloalquilalquilo C₄-C₁₀ o fenilo,

L² representa un enlace directo o -O-,

L³ representa un enlace directo,

Q' representa fenilo que puede contener hasta dos sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R²² y R²² representa:

flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, SH, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄ o haloalquiltio C₁-C₄,

Q'' representa furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, pirrol-1-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, tetrazol-5-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-4-ilo, tetrazol-5-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo, pirazin-2-ilo, 1,3,5-triazin-2-ilo o 1,2,4-triazin-3-ilo que pueden contener hasta dos sustituyentes en cada caso, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R²³ y R²⁴ y R²³ representa un sustituyente en el carbono:

flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, hidroxilo, SH, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄ o haloalquiltio C₁-C₄,

R²⁴ representa un sustituyente en el nitrógeno:

alquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo,

R⁵ representa hidrógeno o metilo, etilo, propilo, *iso*-propilo, butilo, *iso*-butilo o *terc*-butilo,

R⁷ representa hidrógeno,

R⁸ representa, independientemente los unos de los otros, hidrógeno, metilo o etilo,

R²⁵ y R²⁶ representan, independientemente los unos de los otros, hidrógeno, metilo, etilo, propilo, *iso*-propilo, butilo, *iso*-butilo o *terc*-butilo,

y también las sales agroquímicamente activas de los mismos.

3. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con una o varias de las reivindicaciones 1 a 2, en los que los símbolos tienen los siguientes significados:

- 5 A representa fenilo que puede contener hasta dos sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R² y R² representa:
flúor, bromo, yodo, cloro, ciano, nitro, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, clorofluorometilo, diclorometilo, diclorofluorometilo, difluorometilo, triclorometilo, trifluorometilo, ciclopropilo, etoxi, 1-metiletoxi, propoxi, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, 1-metiletiltio, metiltio, etiltio, propiltio, difluorometiltio o trifluorometiltio,
- 10 A' representa un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo siguiente: furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, pirrol-1-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo o pirimidin-5-ilo que puede contener hasta dos sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R³ y R⁴ y
- 15 R³ representa un sustituyente en el carbono:
flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, clorofluorometilo, diclorometilo, diclorofluorometilo, difluorometilo, triclorometilo, trifluorometilo, ciclopropilo, etoxi, 1-metiletoxi, propoxi, metoxi, trifluorometoxi, difluorometoxi, 1-metiletiltio, metiltio, etiltio, propiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio o fenilo,
- 20 R⁴ representa un sustituyente en el nitrógeno:
metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, 2,2-trifluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2-difluoroetilo o 2-cloro-2-fluoroetilo,
- 25 G representa G¹,
T representa *-C(=O)CH2-#, *-C(=O)CH2C(R8)2-#, *-C(=O)CH=CH-#, *-C=CC(=O)-#, *-CH=CHC(=O)-#, *-CH2CH2C(=O)-#, *-C(=S)CH2-#, *-C(=S)CH2C(R8)2-#, *-CH2CH2C(=S)-#, *-C(=NR9)CH2-# *-C(=NR9)CH=CH-#, *-CH=CHC(-NOH)-# o *-CH=CHC(N-O-C1-C4-alquil)CH2-#,
- 30 L¹ representa CH₂,
X representa CH,
Y representa oxígeno,
R^{1a} representa 1,1-dimetiletilo, 3,3-dimetilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, pentilo, 1-etil-propilo, butilo, 2-metilpropilo, 1-metiletilo, etilo, propilo, 4-metilpentilo o hexilo,
R^{1b} representa ciclopentilo, ciclohexilo o cicloheptilo, cada uno de los cuales puede contener hasta dos sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹⁰ y R¹⁰ representa: ciano, cloro, flúor, bromo, yodo, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, 1,1-dimetiletilo, etenilo, fenilo, metoxi, etoxi, propiloxi, trifluorometoxi, etinilo, 2-propiniloxi, metiltio, etiltio o trifluorometiltio,
- 35 R^{1c} representa ciclopentenilo, ciclohexenilo o cicloheptenilo, cada uno de los cuales puede contener hasta dos sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹¹ y R¹¹ representa: metilo, etilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, etinilo, 2-propiniloxi, metiltio, etiltio o trifluorometiltio,
R^{1d} representa además fenilo que puede contener hasta tres sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre -L²Q' o R¹² y R¹² representa:
flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1,1-dimetiletilo, 1,2-dimetiletilo, etenilo, etinilo, trifluorometilo, difluorometilo, triclorometilo, diclorometilo, ciclopropilo, metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletoxilo, 1,1-dimetiletoxilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, propoxicarbonilo, 1-metiletoxicarbonilo, 1,1-dimetiletoxicarbonilo, 2-propeniloxi, 2-propiniloxi, metiltio, etiltio, metilsulfino o metilsulfonilo,
- 45 R^{1e} representa naftalen-1-ilo, naftalen-2-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-ilo, 1,2,3,4-tetrahidronaftalen-2-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-1-ilo, 5,6,7,8-tetrahidronaftalen-2-ilo, decalin-1-ilo, decalin-2-ilo, 1H-inden-1-ilo, 1H-inden-2-ilo, 1H-inden-3-ilo, 1H-inden-4-ilo, 1H-inden-5-ilo, 1H-inden-6-ilo, 1H-inden-7-ilo, indan-1-ilo, indan-2-ilo, indan-3-ilo, indan-4-ilo o indan-5-ilo que pueden contener hasta tres sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹³ y R¹³ representa:
metilo, metoxi, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo,
- 50 R^{1f} representa furan-2-ilo, furan-3-ilo, tiofen-2-ilo, tiofen-3-ilo, isoxazol-3-ilo, isoxazol-4-ilo, isoxazol-5-ilo, pirrol-1-ilo, pirrol-2-ilo, pirrol-3-ilo, oxazol-2-ilo, oxazol-4-ilo, oxazol-5-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, tiazol-5-ilo, isotiazol-3-ilo, isotiazol-4-ilo, isotiazol-5-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-4-ilo, imidazol-1-ilo, imidazol-2-ilo, imidazol-4-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-2-ilo, 1,2,3-triazol-4-ilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-4-ilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, piridazin-3-ilo, piridazin-4-ilo, pirimidin-2-ilo, pirimidin-4-ilo, pirimidin-5-ilo o pirazin-2-ilo, que pueden contener cada uno hasta dos sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹⁴ y R¹⁵ y
- 60 R¹⁴ representa un sustituyente en el carbono:
cloro, flúor, bromo, yodo, ciano, nitro, metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1,1-dimetiletilo, etenilo, etinilo, trifluorometilo, difluorometilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, metilcarbonilo, etilcarbonilo, metoxicarbonilo,

etoxicarbonilo, metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletoxi, 2-propiniloxi, trifluorometoxilo, metilcarboniloxi, metilcarboniltio, metiltio, etiltio, trifluorometiltio, metilsulfinilo, etilsulfinilo, trifluorometilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo o trifluorometilsulfonilo,

R¹⁵ representa un sustituyente en el nitrógeno:

5 metilo, etilo, propilo, ciclopropilo, ciclohexilo, fenilo o 2-propinilo,

R^{1g} representa indol-1-ilo, indol-2-ilo, indol-3-ilo, indol-4-ilo, indol-5-ilo, indol-6-ilo, indol-7-ilo, benzoimidazol-1-ilo, benzoimidazol-2-ilo, benzoimidazol-4-ilo, benzoimidazol-5-ilo, indazol-1-ilo, indazol-3-ilo, indazol-4-ilo, indazol-5-ilo, indazol-6-ilo, indazol-7-ilo, indazol-2-ilo, 1-benzofuran-2-ilo, 1-benzofuran-3-ilo, 1-benzofuran-4-ilo, 1-benzofuran-5-ilo, 1-benzofuran-6-ilo, 1-benzofuran-7-ilo, 1-benzotiofen-2-ilo, 1-benzotiofen-3-ilo, 1-benzotiofen-4-ilo, 1-benzotiofen-5-ilo, 1-benzotiofen-6-ilo, 1-benzotiofen-7-ilo, 1,3-benzotiazol-2-ilo, 1,3-benzotiazol-4-ilo, 1,3-benzotiazol-5-ilo, 1,3-benzotiazol-6-ilo, 1,3-benzotiazol-7-ilo, 1,3-benzoxazol-2-ilo, 1,3-benzoxazol-4-ilo, 1,3-benzoxazol-5-ilo, 1,3-benzoxazol-6-ilo, 1,3-benzoxazol-7-ilo, quinolin-2-ilo, quinolin-3-ilo, quinolin-4-ilo, quinolin-5-ilo, quinolin-6-ilo, quinolin-7-ilo, quinolin-8-ilo, isoquinolin-1-ilo, isoquinolin-3-ilo, isoquinolin-4-ilo, isoquinolin-5-ilo, isoquinolin-6-ilo, isoquinolin-7-ilo o isoquinolin-8-ilo, cada uno de los cuales puede contener hasta dos sustituyentes, en donde los sustituyentes se seleccionan, independientemente los unos de los otros, entre R¹⁶ y R¹⁷ y

R¹⁶ representa un sustituyente en el carbono:

flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, metoxi, 2-propiniloxi, 2-propeniloxi,

R¹⁷ representa un sustituyente en el nitrógeno:

20 metilo, etilo, propilo, ciclopropilo, ciclohexilo, fenilo o 2-propinilo,

L² representa un enlace directo,

Q' representa fenilo,

R⁵ representa hidrógeno,

R⁷ representa hidrógeno,

25 R⁸ representa hidrógeno, metilo,

y también las sales agroquímicamente activas de los mismos.

4. Procedimiento para el control de hongos fitopatógenos nocivos, **caracterizado porque** los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con una o varias de las reivindicaciones 1 a 3 se aplican a los hongos fitopatógenos nocivos y/o a su hábitat.

30 5. Agente para el control de hongos fitopatógenos nocivos, **caracterizado por** un contenido de al menos un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con una o varias de las reivindicaciones 1 a 3, además de diluyentes y/o sustancias tensioactivas.

6. Uso de derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina de fórmula (I) de acuerdo con una o varias de las reivindicaciones 1 a 3 para el control de hongos fitopatógenos nocivos.

35 7. Procedimiento de preparación de agentes para el control de hongos fitopatógenos nocivos, **caracterizado porque** los derivados de cetoheteroarilpiperidina y -piperazina de fórmula (I) de acuerdo con una o varias de las reivindicaciones 1 a 3 se mezclan con diluyentes y/o sustancias tensioactivas.

8. Uso de compuestos de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3 para el tratamiento de semillas.

40 9. Uso de compuestos de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3 para el tratamiento de plantas transgénicas.

10. Uso de compuestos de fórmula (I) de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3 para el tratamiento de semillas transgénicas.