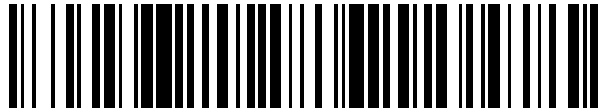


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 621 386**

51 Int. Cl.:

C07D 401/06 (2006.01)

C07D 401/08 (2006.01)

A01N 43/50 (2006.01)

A01N 43/653 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **28.01.2014 PCT/EP2014/051621**

87 Fecha y número de publicación internacional: **07.08.2014 WO14118170**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **28.01.2014 E 14701752 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **25.01.2017 EP 2951167**

54 Título: **Microbicidas novedosos**

30 Prioridad:

04.02.2013 EP 13153924

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

03.07.2017

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**JEANMART, STEPHANE ANDRÉ MARIE y
BONVALOT, DAMIEN**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 621 386 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

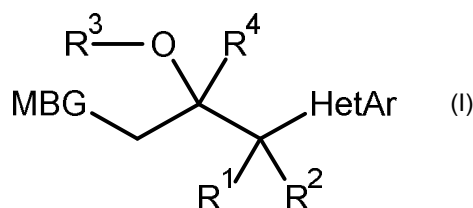
Microbicidas novedosos

5 La presente invención se refiere a compuestos novedosos que contienen cicloalquil-heteroarilo y cicloheteroalquil-heteroarilo activos como microbicidas, en particular activos como fungicidas, a su uso en composiciones y métodos para el control y/o la prevención de una infección microbiana, particularmente, una infección fúngica, en plantas y a procesos para la preparación de estos compuestos.

La incidencia de infecciones microbianas graves, particularmente infecciones fúngicas, ya sean sistémicas o tópicas, sigue aumentando en las plantas.

10 Los fungicidas son compuestos, de origen natural o sintético, que actúan protegiendo a las plantas contra los daños provocados por los hongos. Los métodos agrícolas actuales se basan en gran medida en el uso de fungicidas. De hecho, algunos cultivos no se pueden desarrollar de forma satisfactoria sin el uso de fungicidas. El uso de fungicidas permite que el agricultor aumente el rendimiento del cultivo y, como consecuencia, aumente el valor del cultivo. Se han desarrollado numerosos agentes fungicidas. Sin embargo, el tratamiento de infestaciones fúngicas sigue siendo un gran problema. Además, la resistencia fúngica se ha convertido en un problema serio, ya que hace que estos agentes sean ineficaces para algunas aplicaciones agrícolas. En este sentido, es necesario desarrollar nuevos compuestos fungicidas.

La presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I)



20 en donde

MBG es tetrazolilo opcionalmente sustituido, triazolilo opcionalmente sustituido, oxazolilo opcionalmente sustituido, tiazolilo opcionalmente sustituido, o imidazolilo opcionalmente sustituido;

25 HetAr es un piridilo unido a carbono en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, haloalquilo_{C₁-C₄}, haloalcoxi_{C₁-C₄}, cicloalquilo_{C₃-C₈} o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo_{C₁-C₄}, haloalquilo_{C₁-C₄}, alcoxi_{C₁-C₄}, haloalcoxi_{C₁-C₄} o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo_{C₁-C₄}, haloalquilo_{C₁-C₄}, alcoxi_{C₁-C₄}, haloalcoxi_{C₁-C₄};

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 8 miembros opcionalmente sustituido que opcionalmente contiene un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno; y/o

R³ es hidrógeno, alquilo, -Si(R⁵)₃, -P(O)(OH)₂, -CH₂-O-P(O)(OH)₂, -C(O)-alquilo, -C(O)-O-alquilo, -C(O)-N-alquilo,

30 R⁴ es arilo, heteroarilo, alquilo o cicloalquilo cada uno opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes;

R⁵ es independientemente alquilo o arilo

R⁶ es independientemente ciano, haloalquilo, hidroxilo, alcoxi, halógeno o haloalcoxi;

35 En las definiciones de los sustituyentes de los compuestos de la fórmula (I), cada resto alquilo solo o como parte de un grupo más grande (tal como alcoxi) es una cadena recta o ramificada y es, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-butilo, *n*-pentilo, *n*-hexilo, isopropilo, *n*-butilo, *sec*-butilo, isobutilo, *terc*-butilo o neopentilo. Los grupos alquilo son adecuadamente grupos alquilo_{C₁-C₆}, pero son preferiblemente grupos alquilo_{C₁-C₄} o alquilo_{C₁-C₃}, y, más preferiblemente, grupos alquilo_{C₁-C₂},

y sales, estereoisómeros, diastereoisómeros, enantiómeros, tautómeros, atropisómeros y N-óxidos agrónomicamente aceptables de dichos compuestos.

40 La invención abarca la totalidad de las sales, estereoisómeros, diastereoisómeros, enantiómeros, tautómeros, N-óxidos agrónomicamente aceptables de dichos compuestos. Los compuestos de fórmula (I) pueden existir en diferentes formas isoméricas ópticas o geométricas o en diferentes formas tautoméricas. Puede haber uno o más centros quirales presentes, en cuyo caso los compuestos de fórmula (I) pueden estar presentes como enantiómeros puros, mezclas de enantiómeros, diastereómeros puros o mezclas de diastereómeros. Puede haber dobles enlaces

- 5 presentes en la molécula tales como enlaces C=C o C=N, en cuyo caso los compuestos de fórmula (I) pueden existir como isómeros únicos o mezclas de isómeros. Puede haber centros de tautomerización presentes. Esta invención cubre todos estos isómeros y tautómeros y sus mezclas en todas las proporciones, así como formas isotópicas, tales como compuestos deuterados. Además, se puede producir atropoisomerismo como resultado de una rotación restringida en torno a un enlace simple.
- 10 Las sales adecuadas de los compuestos de fórmula (I) incluyen sales de adición de ácido tales como las obtenidas con un ácido inorgánico tal como el ácido clorhídrico, bromhídrico, sulfúrico, nítrico o fosfórico, o un ácido carboxílico orgánico tal como el ácido oxálico, tartárico, láctico, butírico, toluico, hexanoico o ftálico, o un ácido sulfónico tal como el ácido metanosulfónico, bencenosulfónico o toluenosulfónico. Otros ejemplos de ácidos carboxílicos orgánicos incluyen los haloácidos, tales como el ácido trifluoroacético.
- 15 Los N-óxidos son formas oxidadas de aminas terciarias o formas oxidadas de compuestos heteroaromáticos que contienen nitrógeno. Se describen en muchos libros, por ejemplo, en "Heterocyclic N-oxides" de Angelo Albini y Silvio Pietra, CRC Press, Boca Ratón, Florida, 1991.
- 20 En las definiciones de sustituyentes de los compuestos de fórmula (I), cada resto alquilo, ya sea solo o como parte de un grupo más grande (tal como alcoxi), es de cadena recta o ramificada y es, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-butilo, *n*-pentilo, *n*-hexilo, isopropilo, *n*-butilo, *sec*-butilo, isobutilo, *terc*-butilo o neopentilo. Los grupos alquilo de forma adecuada son grupos alquiloC₁-C₆, pero son preferiblemente alquiloC₁-C₄ o grupos alquiloC₁-C₃, y, más preferiblemente, grupos alquiloC₁-C₂.
- 25 Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en el anillo heteroaromático o anillo de 3 a 8 miembros, que opcionalmente contiene un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno incluyen uno o más de halógeno, nitro, ciano, cicloalquiloC₃-C₇ (opcionalmente sustituido por alquiloC₁-C₆ o halógeno), cicloalquenoC₅-C₇ (opcionalmente sustituido por alquiloC₁-C₄ o halógeno), hidroxilo, alcoxiC₁-C₁₀, alcoxiC₁-C₁₀alcoxi(C₁-C₁₀), trialquil(C₁-C₄)sililalcoxi(C₁-C₆), alcoxiC₁-C₆-carbonilalcoxi(C₁-C₁₀), haloalcoxiC₁-C₁₀, arilalcoxi(C₁-C₄) (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquiloC₃-C₇ (en donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido por alquiloC₁-C₆ o halógeno), alquenoC₃-C₁₀oxi, alquenoC₃-C₁₀oxi, mercapto, alquilC₁-C₁₀tio, haloalquilC₁-C₁₀tio, arilalquil(C₁-C₄)tio (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquilC₃-C₇tio (en donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido por alquiloC₁-C₆ o halógeno), trialquil(C₁-C₄)sililalquil(C₁-C₆)tio, ariltio (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), alquilC₁-C₆sulfonilo, haloalquilC₁-C₆sulfonilo, alquilC₁-C₆sulfonilo, haloalquilC₁-C₆sulfonilo, arilsulfonilo (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), trialquil(C₁-C₄)sililo, arildialquil(C₁-C₄)sililo, alquil(C₁-C₄)diarilsililo, triarilsililo, arilalquil(C₁-C₄)tioalquilo(C₁-C₄), ariloxialquilo(C₁-C₄), formilo, alquilC₁-C₁₀carbonilo, HO₂C, alcoxiC₁-C₁₀carbonilo, aminocarbonilo, alquilC₁-C₆aminocarbonilo, di(alquilC₁-C₆)aminocarbonilo, *N*-(alquilC₁-C₃)-*N*-(alcoxiC₁-C₃)aminocarbonilo, alquilC₁-C₆carboniloxi, arilcarboniloxi (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), dialquil(C₁-C₆)aminocarboniloxi, alquilC₁-C₆iminooxi, alquenoC₃-C₆oxiimino, ariloxiimino, arilo (opcionalmente sustituido), heteroarilo (opcionalmente sustituido), heterociclilo (opcionalmente sustituido por alquiloC₁-C₆ o halógeno), ariloxi (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), heteroariloxi, (en donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido), heterocicliloxi (en donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido por alquiloC₁-C₆ o halógeno), amino, alquilC₁-C₆amino, dialquil(C₁-C₆)amino, alquilC₁-C₆carbonilamino, *N*-alquil(C₁-C₆)carbonil-*N*-alquil(C₁-C₆)amino, alquenoC₂-C₆carbonilo, alquenoC₂-C₆carbonilo, alquenoC₃-C₆oxicarbonilo, alquenoC₃-C₆oxicarbonilo, ariloxicarbonilo (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido) y arilcarbonilo (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido).
- 30 Los sustituyentes preferidos de los grupos alquilo sustituidos se seleccionan de los siguientes sustituyentes -OH, CN, F, Cl, alcoxiC₁₋₄, alquilC₁₋₄amino. Los grupos alquilo son ramificados o lineales. Los grupos alquilo más preferidos son metilo, etilo, propilo, iso-propilo, butilo, iso-butilo (2-metilpropil), pentilo, 1-metilpentilo, 1-etilpentilo, iso-pentilo (3-metilbutil), hexilo, heptilo, octilo o nonilo.
- 35 Preferiblemente, los grupos alquilo en el compuesto de fórmula (I) y/o los grupos alcoxi en el compuesto de fórmula (I) no tienen más de dos sustituyentes adicionales, más preferiblemente los grupos alquilo en el compuesto de fórmula (I) y/o los grupos alcoxi en el compuesto de fórmula (I) no tienen más de un sustituyente adicional, de forma más preferida los grupos alquilo en el compuesto de fórmula (I) y/o los grupos alcoxi en el compuesto de fórmula (I) no son sustituidos adicionalmente.
- 40 Preferiblemente, cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en el anillo heteroaromático o anillo de 3 a 8 miembros, que opcionalmente contiene un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno incluyen uno o más de halógeno, nitro, ciano, alcoxiC₁-C₁₀, haloalcoxiC₁-C₁₀, cicloalquiloC₃-C₇ (opcionalmente sustituido por alquiloC₁-C₆ o halógeno), cicloalquenoC₅-C₇ (opcionalmente sustituido por alquiloC₁-C₄ o halógeno), hidroxilo, alcoxiC₁-C₁₀, alcoxiC₁-C₁₀alcoxi(C₁-C₁₀), trialquil(C₁-C₄)sililalcoxi(C₁-C₆), alcoxiC₁-C₆-carbonilalcoxi(C₁-C₁₀), haloalcoxiC₁-C₁₀, arilalcoxi(C₁-C₄) (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquiloC₃-C₇, alquilC₁-C₆sulfonilo, haloalquilC₁-C₆sulfonilo, arilsulfonilo, formilo, alquilC₁-C₁₀carbonilo, HO₂C, alcoxiC₁-C₁₀carbonilo, aminocarbonilo, alquilC₁-C₆aminocarbonilo, di(alquilC₁-C₆)aminocarbonilo, *N*-(alquilC₁-C₃)-*N*-(alcoxiC₁-C₃)aminocarbonilo, alquilC₁-C₆carboniloxi, arilcarboniloxi (en donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), dialquil(C₁-C₆)aminocarboniloxi, alquilC₁-C₆iminooxi, alquenoC₃-C₆oxiimino, ariloxiimino, arilo (opcionalmente sustituido), heteroarilo (opcionalmente sustituido), heterociclilo (opcionalmente sustituido por alquiloC₁-C₆ o halógeno), ariloxi (en donde el grupo arilo está
- 55
- 60

opcionalmente sustituido), heteroarilo, (en donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido), heterociclilo (en donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido por alquiloC₁-C₆ o halógeno).

“Arilo” o “resto anular aromático” se refiere a un sustituyente aromático que puede ser un anillo simple o anillos múltiples que están fusionados, de esta forma los grupos arilo derivados de arenos por eliminación de un átomo de hidrógeno de un átomo de carbono anular, y arenos son hidrocarburos aromáticos monocíclicos y policíclicos. El término "Arilo" puede significar arilo sustituido o insustituido a menos que se indique lo contrario y de esta forma los restos arilo pueden ser insustituídos o estar sustituidos por uno o más sustituyentes iguales o diferentes. Preferiblemente, arilo se refiere a un sustituyente aromático que puede ser un anillo simple o múltiples anillos que están fusionados, más preferiblemente a un sustituyente aromático que puede ser un anillo simple o se forma por dos anillos que están fusionados.

Heteroarilo significa un sistema anular heteroaromático que contiene al menos un heteroátomo y que consiste en un anillo simple o dos o más anillos fusionados, preferiblemente, anillos simples que contienen hasta cuatro heteroátomos y sistemas bicíclicos que contienen hasta cinco heteroátomos que preferiblemente serán seleccionados de nitrógeno, oxígeno y azufre. Ejemplos de dichos grupos incluyen furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,3,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo y indolizínilo, preferiblemente tiazolilo, imidazolilo, pirrazolilo, piridilo y pirimidinilo.

Más preferiblemente cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en el anillo heteroaromático o anillo de 3 a 8 miembros, que opcionalmente contiene un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno incluyen uno o más de halógeno, nitro, ciano, alcoxiC₁-C₆, haloalcoxiC₁-C₆, cicloalquiloC₃-C₆, hidroxilo, cicloalquiloC₃-C₇, mercapto, alquiloC₁-C₁₀tio.

MBG también son grupos heteroaromáticos y pueden, por lo tanto, sustituirse de la misma forma que anillos heteroaromáticos como se describe en esta descripción. Preferiblemente MBG es tetrazolilo opcionalmente sustituido, triazolilo opcionalmente sustituido, oxazolilo opcionalmente sustituido, tiazolilo opcionalmente sustituido, o imidazolilo opcionalmente sustituido; más preferiblemente MBG es un tetrazolilo, un triazolilo, un oxazolilo, un tiazolilo o un imidazolilo; aun más preferiblemente MBG es un triazolilo o un imidazolilo preferiblemente 1,2,4-triazol-1-ilo o 2-imidazol-1-ilo; más preferiblemente MBG es un triazolilo especialmente 1,2,4-triazol-1-ilo.

Halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo. Preferiblemente halógeno es flúor o cloro.

Grupos haloalquilo son grupos alquilo que están sustituidos por uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes. Por lo tanto esta definición de haloalquilo también puede incluir grupos alquilo perhalogenados. Ejemplos de grupos haloalquilo incluyen, a modo no taxativo, CF₃, CF₂Cl, CF₂H, CCl₂H, FCH₂, ClCH₂, BrCH₂, CH₃CHF, (CH₃)₂CF, CF₃CH₂ o CHF₂CH₂.

En el contexto de la presente memoria descriptiva el término arilo se refiere a sistemas de anillos que pueden ser monocíclicos, bicíclicos o tricíclicos. Los ejemplos de estos anillos incluyen fenilo, naftilo, antraceno, indenilo o fenantrenilo. Un grupo arilo preferido es fenilo. Preferiblemente arilo se refiere a fenilo sustituido o insustituido.

Cicloalquilo incluye preferiblemente ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. Cicloalquilalquilo es preferiblemente ciclopropilmetilo.

Valores preferidos de MBG, HetAr, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ y R⁶ son, en cualquier combinación, como se describe a continuación.

Preferiblemente, la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I)

en donde

MBG es un tetrazolilo, un triazolilo, un oxazolilo, un tiazolilo o un imidazolilo;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 6 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes y que opcionalmente contiene un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno;

R³ es hidrógeno, alquilo;

R⁴ es arilo, heteroarilo, cada uno opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente ciano, haloalquiloC₁-C₆, hidroxilo, alcoxiC₁-C₆, halógeno o haloalcoxiC₁-C₆.

Más preferiblemente, la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I)

en donde

MBG es un triazolilo o un imidazolilo;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes y que opcionalmente contiene un oxígeno;

5 R³ es hidrógeno, alquiloC₁-C₄;

R⁴ es arilo, heteroarilo, cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente ciano, haloalquiloC₁-C₆, halógeno o haloalcoxiC₁-C₆.

En una realización más preferida la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un tetrazolilo, un triazolilo, un oxazolilo, un tiazolilo o un imidazolilo;

10 R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 6 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes y que opcionalmente contiene un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno;

R³ es hidrógeno, alquilo;

R⁴ es arilo, heteroarilo, cada uno opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente ciano, haloalquiloC₁-C₆, hidroxilo, alcoxiC₁-C₆, halógeno o haloalcoxiC₁-C₆.

15 En una realización más preferida la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un tetrazolilo, un triazolilo, un oxazolilo, un tiazolilo o un imidazolilo;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 6 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes y que opcionalmente contiene un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno;

R³ es hidrógeno, alquilo;

20 R⁴ es arilo, heteroarilo, cada uno opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente ciano, haloalquiloC₁-C₆, hidroxilo, alcoxiC₁-C₆, halógeno o haloalcoxiC₁-C₆.

En una realización más preferida la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un triazolilo o un imidazolilo;

25 R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes y que opcionalmente contiene un oxígeno;

R³ es hidrógeno, alquiloC₁-C₄;

R⁴ es arilo, heteroarilo, cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente ciano, haloalquiloC₁-C₆, halógeno o haloalcoxiC₁-C₆.

Aun más preferiblemente la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

30 MBG es un triazolilo o un imidazolilo;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes y que opcionalmente contiene un oxígeno;

R³ es hidrógeno, alquiloC₁-C₄;

R⁴ es arilo, heteroarilo, cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

35 R⁶ es independientemente ciano, haloalquiloC₁-C₆, halógeno o haloalcoxiC₁-C₆.

Aún más preferiblemente la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes y que opcionalmente contiene un oxígeno;

R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, heteroarilo, cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

En la realización más preferida la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un triazolilo o imidazolilo;

- 5 R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes y que opcionalmente contiene un oxígeno;

R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

- 10 Una realización preferida adicionalmente de la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un triazolilo o imidazolilo;

- 15 HetAr es un piridilo unido a carbono en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄; y más preferiblemente HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

- 20 R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes;

R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

- 25 Una realización aún más preferida de la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un triazolilo o imidazolilo;

HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

- 30 R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes;

R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

- 35 Una realización aún más preferida de la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un triazolilo o imidazolilo;

- 40 HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido preferiblemente ciclopropilo o ciclobutanilo;

R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

Una realización aún más preferida de la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un triazolilo o imidazolilo;

- 5 HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido preferiblemente ciclopropilo o ciclobutanilo;

- 10 R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

Una realización adicionalmente preferida de la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

- 15 MBG es un triazolilo;

HetAr es un piridilo unido a carbono en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄; y más preferiblemente HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

- 20

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes;

R³ es hidrógeno o metilo;

- 25 R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

Una realización aún más preferida de la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un triazolilo;

- 30 HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes;

- 35 R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

Una realización aún más preferida de la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

- 40 MBG es un triazolilo;

HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

- 45 R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido preferiblemente ciclopropilo o ciclobutanilo;

R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

5 Una realización aún más preferida de la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un triazolilo;

HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

10 R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido preferiblemente ciclopropilo o ciclobutanilo;

R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

15 Una realización adicionalmente preferida de la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un imidazolilo;

20 HetAr es un piridilo unido a carbono en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄; y más preferiblemente HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

25 R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes;

R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

30 Una realización aún más preferida de la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un imidazolilo;

HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

35 R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes;

R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

40 Una realización aún más preferida de la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un imidazolilo;

45 HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido preferiblemente ciclopropilo o ciclobutilo;

R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

5 R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

Una realización aún más preferida de la presente invención, por lo tanto, se refiere a compuestos de fórmula (I) en donde

MBG es un imidazolilo;

10 HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido preferiblemente ciclopropilo o ciclobutilo;

R³ es hidrógeno o metilo;

15 R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

En una realización, los compuestos de la presente invención se seleccionan de

1-(4-clorofenil)-1-[1-(2-piridil)ciclopropil]-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol,

1-[1-(5-bromo-3-cloro-2-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol,

20 1-[1-(5-bromo-2-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-imidazol-1-il-etanol,

1-[1-(5-bromo-2-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol,

1-[1-(5-bromo-3-cloro-2-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-imidazol-1-il-etanol,

1-[1-[5-bromo-6-(4-fluorofenil)-2-piridil]ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol,

1-[1-(5-ciclopropil-2-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol,

25 4-[6-[1-[1-(4-fluorofenil)-1-hidroxi-2-(1,2,4-triazol-1-il)etil]ciclopropil]-3-piridil]benzocarbonitrilo,

1-[1-(6-cloro-3-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol,

1-(4-fluorofenil)-1-[1-(2-piridil)ciclopropil]-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol,

1-(4-clorofenil)-1-[1-(5-cloro-2-piridil)ciclopropil]-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol,

6-[1-[1-(4-fluorofenil)-1-hidroxi-2-(1,2,4-triazol-1-il)etil]ciclopropil]piridina-3-carbonitrilo,

30 1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)-1-[1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]ciclopropil]etanol,

1-[1-(5-cloro-2-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol,

1-(4-clorofenil)-1-[1-(2-piridil)ciclopentil]-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol,

1-(4-clorofenil)-1-[1-(5-cloro-2-piridil)ciclobutil]-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol,

1-[1-(5-bromo-2-piridil)ciclobutil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol,

35 1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)-1-[1-[5-[3-(trifluorometoxi)fenil]-2-piridil]ciclobutil]etanol y

1-[1-[5-(4-cloro-2-fluoro-fenil)-2-piridil]ciclobutil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-(4-clorofenil)-1-[1-(2-piridil)ciclopropil]-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

40 En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-[1-(5-bromo-3-cloro-2-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-[1-(5-bromo-2-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-imidazol-1-il-etanol.

En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-[1-(5-bromo-2-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

- 5 En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-[1-(5-bromo-3-cloro-2-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-imidazol-1-il-etanol.

En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-[1-(5-bromo-6-(4-fluorofenil)-2-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

- 10 En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-[1-(5-ciclopropil-2-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 4-[6-[1-[1-(4-fluorofenil)- en una realización los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-hidroxi-2-(1,2,4-triazol- en una realización los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-il)etil]ciclopropil]-3-piridil]benzonitrilo.

- 15 En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-[1-(6-cloro-3-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-(4-fluorofenil)-1-[1-(2-piridil)ciclopropil]-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-(4-clorofenil)-1-[1-(5-cloro-2-piridil)ciclopropil]-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

- 20 En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 6-[1-[1-(4-fluorofenil)-1-hidroxi-2-(1,2,4-triazol-1-il)etil]ciclopropil]piridina-3-carbonitrilo.

En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-(4-fluorofenil)-2- en una realización los compuestos de la presente invención se relacionan con (1,2,4-triazol-1-il)-1-[1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]ciclopropil]etanol.

- 25 En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-[1-(5-cloro-2-piridil)ciclopropil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-(4-clorofenil)-1-[1-(2-piridil)ciclobutil]-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

- 30 En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-(4-clorofenil)-1-[1-(5-cloro-2-piridil)ciclobutil]-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-[1-(5-bromo-2-piridil)ciclobutil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

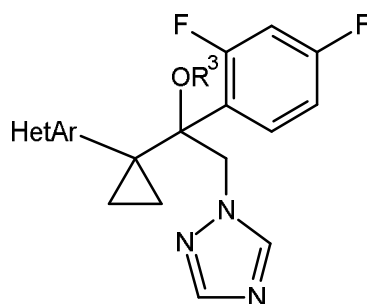
En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)-1-[1-[5-[3-(trifluorometoxi)fenil]-2-piridil]ciclobutil]etanol.

- 35 En una realización, los compuestos de la presente invención se relacionan con 1-[1-[5-(4-cloro-2-fluoro-fenil)-2-piridil]ciclobutil]-1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

Realizaciones preferidas adicionales de la presente invención son las realizaciones E1 a E11, que se definen como compuestos de fórmula I que son representados por una fórmula seleccionada del grupo que consiste en las fórmulas T-1 a T-11 tal como se describe a continuación, en donde en las fórmulas T-1 a T-11 los significados de los sustituyentes HetAR y R³ tienen los significados preferidos que se mencionaron anteriormente.

- 40

Por ejemplo, la realización E1 es representada por los compuestos de la fórmula T-1



(T-1)

y los sustituyentes HetAR y R³ tienen los significados tal como se definieron anteriormente.

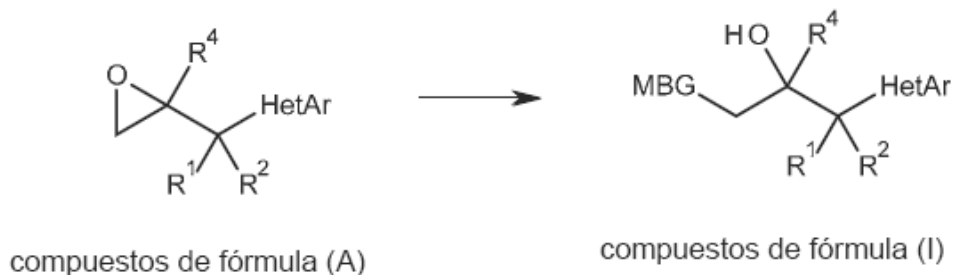
Las realizaciones E2 a E11 se definen en consecuencia y los sustituyentes HetAR y R³ tienen los significados tal como se definieron anteriormente.

- 5 Los expertos en la técnica apreciarán que los compuestos de fórmula (I) pueden contener un resto heteroaromático que contenga uno o más sustituyentes capaces de transformarse en sustituyentes alternativos en condiciones conocidas, y que estos compuestos pueden servir en sí mismos como intermediarios en la preparación de compuestos adicionales de fórmula (I).
- 10 Por ejemplo, los compuestos de fórmula (I) en donde HetAr es heteroarilo opcionalmente sustituido por un halógeno, preferiblemente, bromuro o yodo, pueden someterse a una reacción de acoplamiento cruzado con un par de acoplamiento adecuado en las condiciones descritas en la bibliografía para Suzuki-Miyaura, Sonogashira y reacciones de acoplamiento cruzado para proporcionar compuestos adicionales de fórmula (I) (ver, por ejemplo, O'Brien, C. J. y Organ, M. G. *Angew. Chem. Int. Ed.* (2007), 46, 2768-2813; Suzuki, A. *Journal of Organometallic Chemistry* (2002), 653, 83; Miyaura N. y Suzuki, A. *Chem. Rev.* (1995), 95, 2457-2483).
- 15 Los compuestos de fórmula (I) pueden prepararse de acuerdo con la descripción del proceso en el esquema 1 a continuación:



Esquema 1

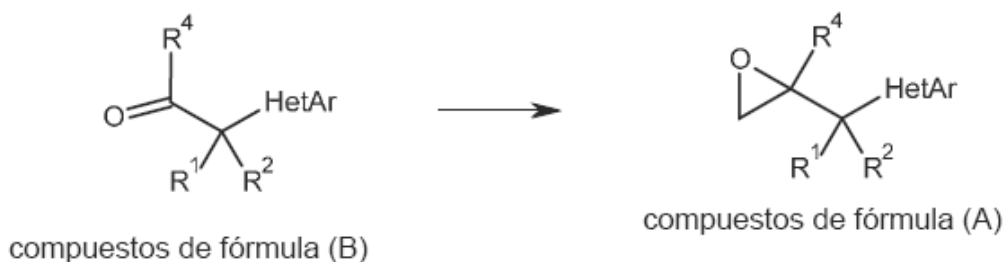
- 20 Por lo tanto, los compuestos de fórmula (I) pueden prepararse tratando los compuestos de fórmula (I) en donde R³ es hidrógeno con un agente alquilante o un agente de silylante en presencia de una base inorgánica seleccionada adecuada tal como hidruro de sodio o *tert*-butóxido de potasio y similares; en un disolvente orgánico adecuado tal como acetonitrilo o tetrahidrofurano a una temperatura entre -30°C y 200°C. Para ver un ejemplo relacionado, ver el documento JP60172904.
- 25 Los compuestos de fórmula (I) en donde R³ es hidrógeno pueden prepararse de acuerdo con la descripción del proceso en el esquema 2 a continuación:



Esquema 2

5 Por lo tanto, los compuestos de fórmula (I) en donde R^3 es hidrógeno pueden prepararse tratando los compuestos de fórmula (A) con un triazol, un imidazol o tetrazol en presencia de una base inorgánica seleccionada tal como carbonato de potasio y similares; en un disolvente orgánico adecuado como acetonitrilo o dimetilformamida a una temperatura entre -30°C y 200°C . Para ver ejemplos de transformación similar, ver Capriati, V. *et al. Org. Lett.* 2002, 4(14), 2445; Ogata, M. *et al. J. Med. Chem.* 1987, 30, 1054.

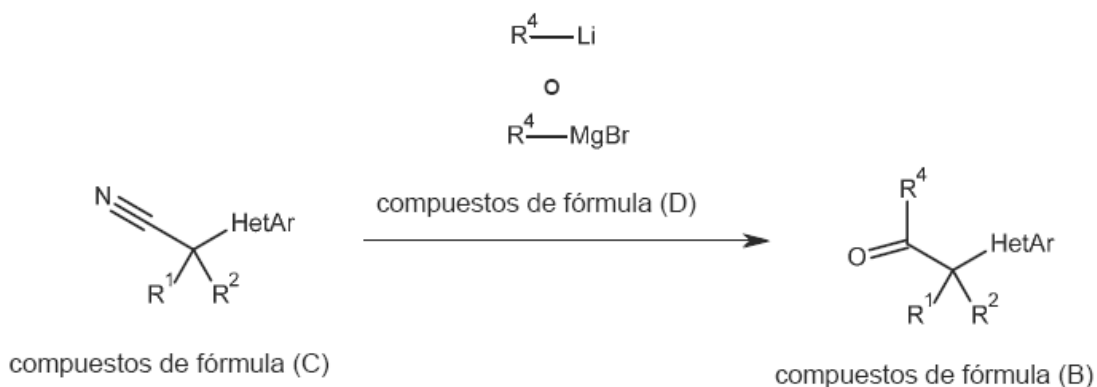
10 Los compuestos de fórmula (A) pueden prepararse por adición de un alquil sulfonio o sal de sulfoxonio, tal como yoduro de trimetilsulfonio, yodo de trimetilsulfoxonio en compuestos de fórmula (B) en presencia de una base tal como hidruro de sodio en un disolvente adecuado tal como dimetil sulfóxido a una temperatura entre 0°C y 50°C tal como se describe en el esquema 3. Para ver un ejemplo de un método análogo ver Corey E. J. y Chaykovsky M. *J. Am. Chem. Soc.* 1965, 87, 1353; Corey E. J. *et al. Tetrahedron Lett.* 1967, 2325.



15

Esquema 3

Los compuestos de fórmula (B) pueden prepararse por la adición de los compuestos de fórmula (D) a compuestos de fórmula (C) en un disolvente adecuado tal como tetrahidrofurano a una temperatura entre 0°C y 50°C tal como se describe en el esquema 4.



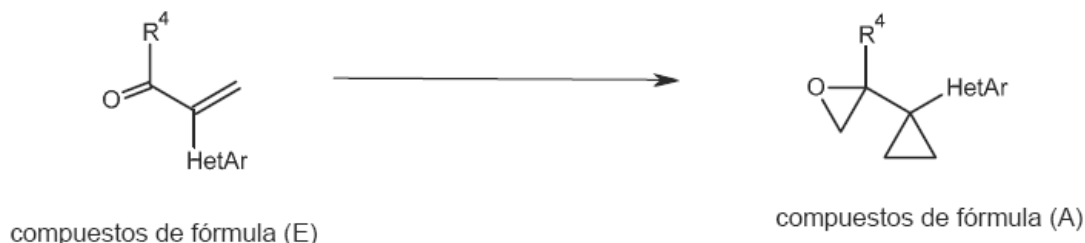
20

Esquema 4

Los compuestos de fórmula (D) son conocidos o pueden realizarse a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos.

Los compuestos de fórmula (C) son conocidos o pueden realizarse a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos. Por ejemplo, ver Pauls, H. W. *et al.* WO2013053051; Klapars, A. *et al.* J. Org. Chem. 2005, 70(24), 10186; Thompson, A. D. y Haestis, M. P. J. Org. Chem. 2013, 78(2), 762.

5



en donde R¹ y R² forman con el carbono al que están unidos un ciclopropano

Esquema 5

10 Alternativamente, los compuestos de fórmula (A) en donde R¹ y R² forman con el carbono al que están unidos un ciclopropano, pueden prepararse haciendo reaccionar los compuestos de fórmula (E) mediante la adición de un alquil sulfonio o sal de sulfoxonio, tal como yoduro de trimetilsulfonio, yodo de trimetilsulfoxonio en compuestos de fórmula (B) en presencia de una base tal como hidruro de sodio en un disolvente adecuado tal como dimetil sulfóxido a una temperatura entre 0°C y 50°C tal como se describe en el esquema 5. Para ver un ejemplo de un procedimiento análogo ver By Wagner, G. *et al Zeitschrift fuer Naturforschung, B: Chemical Sciences* 2001, 56(1), 25-38.

15 Los compuestos de fórmula (E) son conocidos o pueden prepararse a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos. Por ejemplo, ver Renga, J. M. *et al. Org. Proc. Res. Dev.* 2003, 7, 267.

Se ha encontrado ahora que los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención tienen, a efectos prácticos, un espectro muy ventajoso de actividades para proteger a las plantas útiles contra enfermedades que son provocadas por microorganismos fitopatógenos, tales como hongos, bacterias o virus.

20 La invención, por lo tanto, se refiere también a un método de control o prevención de la infestación de plantas útiles por parte de microorganismos fitopatógenos, en donde un compuesto de fórmula (I) se aplica como ingrediente activo a las plantas, a partes de la misma o al locus de la misma. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención se distinguen por la excelente actividad con tasas bajas de aplicación, por ser muy bien tolerados por las plantas y por ser seguros para el medio ambiente. Tienen propiedades curativas, preventivas y sistémicas muy útiles y son utilizados para proteger numerosas plantas útiles. Los compuestos de fórmula (I) pueden utilizarse para inhibir o destruir las enfermedades que aparecen en plantas o partes de plantas (fruto, flores, hojas, tallos, tubérculos, raíces) de diferentes cultivos de plantas útiles, mientras que al mismo tiempo protegen también aquellas partes de las plantas que crecen más tarde, por ejemplo, de microorganismos fitopatógenos.

30 También es posible utilizar compuestos de fórmula (I) como agentes de preparación para el tratamiento de material de propagación de planta, en particular semillas (frutos, tubérculos, granos) y esquejes de plantas (por ejemplo arroz), para la protección contra infecciones fúngicas así como contra hongos fitopatógenos que existen en el suelo.

Más aun, los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención pueden utilizarse para controlar hongos en áreas relacionadas, por ejemplo, en la protección de materiales técnicos, incluida madera y productos técnicos relacionados con madera, en almacenamiento de alimentos o en gestión de higiene.

35 Los compuestos de fórmula (I) son, por ejemplo, efectivos contra los hongos fitopatógenos de las siguientes clases: Fungi imperfecti (por ejemplo, Botrytis, Pyricularia, Helminthosporium, Fusarium, Septoria, Cercospora y Alternaria) y Basidiomycetes (por ejemplo, Rhizoctonia, Hemileia, Puccinia). Adicionalmente, son también efectivos contra las clases de Ascomycetes (por ejemplo, Venturia y Erysiphe, Podosphaera, Monilinia, Uncinula) y las clases de Oomycetes (por ejemplo, Phytophthora, Pythium, Plasmopara). Asimismo, los compuestos nuevos de fórmula (I) son efectivos contra bacterias fitopatógenas y virus (por ejemplo, contra Xanthomonas spp, Pseudomonas spp, Erwinia amylovora así como contra el virus del mosaico del tabaco). Los compuestos de fórmula (I) también son efectivos contra la roya de la soja asiática (Phakopsora pachyrhizi).

40

Dentro del alcance de la invención, las plantas útiles que deben ser protegidas típicamente comprenden las siguientes especies de plantas: cereal (trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz, sorgo y especies relacionadas); remolacha (remolacha azucarera y remolacha de forraje); frutas de pipa, drupas y bayas (manzanas, peras, ciruelas, duraznos, almendras, bayas, fresas, frambuesas y moras); plantas leguminosas (chauchas, lentejas, arvejas, plantas de soja); plantas para elaborar aceite (colza, mostaza, amapolas, aceitunas, girasoles, coco, plantas para elaborar aceite de ricino, granos de cacao, maníes); plantas de pepino (calabazas, pepino, melones); plantas de fibra (algodón, lino, cáñamo, yute); frutos cítricos (naranjas, limones, pomelos, mandarinas); verduras (espinaca, lechuga, espárrago, repollos, zanahorias, cebollas, tomates, papas, pimientos); lauráceas (palta, Cinamomum, alcanfor) o plantas tales como tabaco, nueces, café, berenjenas, caña de azúcar, té, pimiento, vid, lúpulos, bananas y plantas de caucho natural, así como ornamentales.

Se entenderá que la expresión "plantas útiles" también incluye las plantas útiles que se han vuelto tolerantes a herbicidas, tales como bromoxinil, o a clases de herbicidas (tales como, por ejemplo, inhibidores de HPPD, inhibidores de ALS, por ejemplo, primisulfurón, prosulfurón y trifloxisulfurón, inhibidores de EPSPS (5-enolpirovilshikimato-3-fosfato-sintasa), inhibidores de GS (glutamina-sintetasa) o inhibidores de PPO (protoporfirinógeno-oxidasa)) como resultado de métodos convencionales de cultivo selectivo o de ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que se ha vuelto tolerante a imidazolinonas, por ejemplo, imazamox, mediante métodos convencionales de cultivo selectivo (mutagénesis) es la colza de verano Clearfield® (canola). Ejemplos de cultivos que se han vuelto tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas mediante métodos de ingeniería genética incluyen variedades de maíz resistentes a glifosato y glufosinato disponibles en el mercado con las marcas RoundupReady®, Herculex I® y Libertilink®.

Debe entenderse que la expresión "plantas útiles" también incluye plantas útiles que se han transformado mediante el uso de técnicas de ADN recombinante de forma tal que son capaces de sintetizar una o más toxinas que actúan selectivamente tales como, por ejemplo, las conocidas por proceder de bacterias que producen toxinas, especialmente las del género Bacillus.

Algunos ejemplos de estas plantas son: YieldGard® (variedad del maíz que expresa una toxina CryIA(b); YieldGard Rootworm® (variedad del maíz que expresa una toxina CryIIIB(b1)); YieldGard Plus® (variedad del maíz que expresa una toxina CryIA(b) y una toxina CryIIIB(b1)); Starlink® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry9(c)); Herculex I® (variedad del maíz que expresa una toxina CryIF(a2) y la enzima fosfinotricina N-acetiltransferasa (PAT) para lograr la tolerancia al herbicida glufosinato de amonio); NuCOTN 33B® (variedad el algodón que expresa una toxina CryIA(c)); Bollgard I® (variedad del algodón que expresa una toxina CryIA(c)); Bollgard II® (variedad del algodón que expresa una toxina CryIA(c) y una toxina CryIIA(b)); VipCot® (variedad del algodón que expresa una toxina VIP); NewLeaf® (variedad de la papa que expresa una toxina CryIIIA); NatureGard®, Agrisure® GT Advantage (rasgo GA21 tolerante al glifosato), Agrisure® CB Advantage (rasgo Bt11 del gusano barrenador del maíz (CB)), Agrisure® RW (rasgo del gusano de la raíz del maíz) y Protecta®.

Se entenderá que el término "cultivo" también incluye las plantas de cultivo que se han transformado de tal modo mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que son capaces de sintetizar una o más toxinas que actúan selectivamente, según se conocen, por ejemplo, a partir de bacterias que producen toxinas, especialmente las del género Bacillus.

Las toxinas que pueden expresarse mediante dichas plantas transgénicas incluyen, por ejemplo, proteínas insecticidas de Bacillus cereus o Bacillus popilliae; o proteínas insecticidas de Bacillus thuringiensis, tales como δ -endotoxinas, por ejemplo, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 o Cry9C o proteínas insecticidas vegetativas (Vip), por ejemplo, Vip1, Vip2, Vip3 o Vip3A; o proteínas insecticidas de nemátodos colonizadores de bacterias, por ejemplo Photorhabdus spp. o Xenorhabdus spp., tales como Photorhabdus luminescens, Xenorhabdus nematophilus; toxinas producidas por animales, tales como toxinas de escorpión, toxinas de arácnidos, toxinas de avispa y otras neurotoxinas específicas de insectos; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de Streptomyces, lectinas vegetales, tales como lectinas de arvejas, lectinas de cebada o lectinas de campanilla de invierno; aglutininas; inhibidores de proteinasa, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de proteasa de serina, patatina, cistatina, inhibidores de papaína; proteínas de inactivación de ribosomas (PIR), tales como ricina, maíz-PIR, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas de metabolismo esteroide, tales como 3-hidroxisteroidoxidasa, ecdiesteroido-UDP-glicosil-transferasa, oxidasas de colesterol, inhibidores de ecdisona, HMG-COA-reductasa, bloqueadores del canal de iones, tales como bloqueadores de canales de sodio o de calcio, esterasa de la hormona juvenil, receptores de hormonas diuréticas, sintasa de estilbeno, sintasa de bibencilo, quitinasas y glucanasas.

En el contexto de la presente invención deben comprenderse como δ -endotoxinas, por ejemplo, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 o Cry9C, o proteínas insecticidas vegetativas (Vip), por ejemplo Vip1, Vip2, Vip3 o Vip3A, expresamente también toxinas híbridas, toxinas truncadas y toxinas modificadas. Las toxinas híbridas se producen por recombinación mediante una combinación nueva de diferentes dominios de las proteínas (ver, por ejemplo, el documento WO 02/15701). Las toxinas truncadas, por ejemplo, una toxina Cry1Ab truncada,

son conocidas. En el caso de las toxinas modificadas, se reemplaza uno o más aminoácidos de la toxina de origen natural. En estas sustituciones de aminoácidos, preferentemente se insertan en la toxina secuencias de reconocimiento de proteasas artificiales, como, por ejemplo, en el caso de Cry3A055, se inserta una secuencia de reconocimiento de la catepsina G en una toxina Cry3A (ver el documento WO 03/018810).

- 5 Se describen ejemplos de estas toxinas o plantas transgénicas capaces de sintetizar estas toxinas en, por ejemplo, los documentos EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878 y WO 03/052073.

Los procesos para preparar estas plantas transgénicas son generalmente conocidos por el experto en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas previamente. Los ácidos desoxirribonucleicos de tipo CryI y su preparación se describen, por ejemplo, en los documentos WO 95/34656, EP-A-0 367 474, EP-A-0 401 979 y
10 WO 90/13651.

La toxina contenida en las plantas transgénicas les confiere tolerancia contra insectos dañinos. Estos insectos pueden pertenecer a cualquier grupo taxonómico de insectos, pero de forma habitual pertenecen especialmente al grupo de los escarabajos (Coleoptera), insectos con dos alas (Diptera) y mariposas (Lepidoptera).

Las plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican una resistencia insecticida y expresan una o más toxinas son conocidas y algunas de ellas se encuentran comercialmente disponibles. Algunos ejemplos de estas plantas son: YieldGard® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry1Ab); YieldGard Rootworm® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry3Bb1); YieldGard Plus® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry1Ab y una toxina Cry3Bb1); Starlink® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry9C); Herculex I® (variedad del maíz que expresa una toxina Cry1Fa2 y la enzima fosfinotricina N-acetiltransferasa (PAT) para lograr la tolerancia al herbicida glufosinato de amonio); NuCOTN 33B® (variedad el algodón que expresa una toxina Cry1Ac); Bollgard I® (variedad del algodón que expresa una toxina Cry1Ac); Bollgard II® (variedad del algodón que expresa una toxina Cry1Ac y una toxina Cry2Ab); VipCot® (variedad del algodón que expresa una toxina Vip3A y una toxina Cry1Ab); NewLeaf® (variedad de la papa que expresa una toxina Cry3A); NatureGard®, Agrisure® GT Advantage (rasgo GA21 tolerante al glifosato), Agrisure® CB Advantage (rasgo Bt11 del gusano barrenador del maíz (CB)) y Protecta®.

Otros ejemplos de estos cultivos transgénicos son:

1. **Maíz Bt11** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. *Zea mays* modificado genéticamente que se ha hecho resistente al ataque del gusano barrenador europeo (*Ostrinia nubilalis* y *Sesamia nonagrioides*) por la expresión transgénica de una toxina Cry1Ab truncada. El maíz Bt11 también expresa transgénicamente la enzima PAT para obtener tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

2. **Maíz Bt176** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. *Zea mays* modificado genéticamente que se ha hecho resistente al ataque del gusano barrenador europeo (*Ostrinia nubilalis* y *Sesamia nonagrioides*) por la expresión transgénica de una toxina Cry1Ab. El maíz Bt176 también expresa transgénicamente la enzima PAT para obtener tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

3. **Maíz MIR604** de Syngenta Seeds SAS, Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St. Sauveur, Francia, número de registro C/FR/96/05/10. Maíz que se ha hecho resistente a los insectos por la expresión transgénica de una toxina Cry3A modificada. Esta toxina es Cry3A055 modificada mediante la inserción de una secuencia de reconocimiento de la proteasa catepsina G. La preparación de estas plantas de maíz transgénicas se describe en el documento WO 03/018810.

4. **Maíz MON 863** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/DE/02/9. MON 863 expresa una toxina Cry3Bb1 y tiene resistencia a ciertos insectos coleópteros.

5. **Algodón IPC 531** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/ES/96/02.

6. **Maíz 1507** de Pioneer Overseas Corporation, Avenue Tedesco, 7 B-1160 Bruselas, Bélgica, número de registro C/NL/00/10. Maíz modificado genéticamente para la expresión de la proteína Cry1F para lograr resistencia a ciertos insectos lepidópteros y de la proteína PAT para lograr tolerancia al herbicida glufosinato de amonio.

7. **Maíz NK603 × MON 810** de Monsanto Europe S.A. 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Bruselas, Bélgica, número de registro C/GB/02/M3/03. Consiste en variedades de maíz híbridas convencionalmente desarrolladas mediante el cruce de las variedades genéticamente modificadas NK603 y MON 810. El maíz NK603 × MON 810 expresa transgénicamente la proteína CP4 EPSPS, obtenida de la cepa CP4 de *Agrobacterium* spp., que transmite tolerancia al herbicida Roundup® (contiene glifosato), y también una toxina Cry1Ab obtenida de *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki* que produce tolerancia a ciertos lepidópteros, incluido el gusano barrenador europeo.

El término "locus" de una planta útil, según se emplea en la presente, pretende abarcar el lugar en el que se cultivan las plantas útiles, donde se siembran los materiales de propagación de planta de las plantas útiles o donde se colocarán los materiales de propagación de planta de las plantas útiles en la tierra. Un ejemplo de este locus es un campo en el que crecen plantas de cultivo.

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

Los compuestos de fórmula (I) se pueden emplear en una forma no modificada o, preferentemente, junto con portadores y adyuvantes empleados convencionalmente en la técnica de la formulación.

- 15 Por lo tanto, la invención también se refiere a composiciones para controlar y proteger contra microorganismos fitopatógenos, que comprenden un compuesto de fórmula (I) y un portador inerte, y a un método para controlar y prevenir la infestación de plantas útiles por parte de microorganismos fitopatógenos, en donde una composición, que comprende un compuesto de fórmula (I) como ingrediente activo y un portador inerte, se aplica a las plantas, a partes de las mismas o al locus de las mismas.

- 20 A tales efectos, pueden formularse convenientemente compuestos de fórmula (I) y portadores inertes de maneras conocidas con concentrados emulsionables, pastas que se pueden recubrir, soluciones directamente pulverizables o solubles, emulsiones diluidas, polvos humectables, polvos solubles, polvos, granulados y también encapsulaciones, por ejemplo, en sustancias poliméricas. Al igual que con el tipo de composiciones, los métodos de aplicación, tales como pulverizado, atomizado, empolvado, difusión, recubrimiento o vertido, se eligen de acuerdo con los objetivos pretendidos y las circunstancias que prevalecen. Las composiciones también pueden contener adyuvantes adicionales tales como estabilizantes, antiespumantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes o adherentes, así como fertilizantes, donantes de micronutrientes u otras formulaciones para obtener efectos especiales.

- 25 Los portadores y adyuvantes (auxiliares) adecuados pueden ser sólidos o líquidos y son sustancias útiles en la tecnología de la formulación, por ejemplo, sustancias minerales naturales o regeneradas, disolventes, dispersantes, agentes humectantes, adherentes, espesantes, aglutinantes o fertilizantes. Dichos portadores se describen por ejemplo en el documento WO 97/33890.

- 30 Los compuestos de fórmula (I) o las composiciones, que comprenden un compuesto de fórmula (I) como ingrediente activo y un portador inerte, pueden aplicarse al locus de la planta o a la planta a tratar, simultáneamente o sucesivamente con compuestos adicionales. Estos compuestos adicionales pueden ser, por ejemplo, fertilizantes o donantes de micronutrientes u otras preparaciones que influyen en el crecimiento de las plantas. También pueden ser herbicidas selectivos, así como insecticidas, fungicidas, bactericidas, nematocidas, molusquicidas o mezclas de varias de estas preparaciones, si se desea junto con portadores, tensioactivos o adyuvantes promotores de la aplicación adicionales comúnmente utilizados en la técnica de las formulaciones.

- 35 Un método preferido para la aplicación de un compuesto de fórmula (I), o una composición, que comprende un compuesto de fórmula (I) como ingrediente activo y un portador inerte, es la aplicación foliar. La frecuencia de aplicación y la tasa de aplicación dependerán del riesgo de infestación por el patógeno correspondiente. Sin embargo, los compuestos de fórmula (I) también pueden penetrar en la planta por las raíces a través del suelo (acción sistémica) empapando el locus de la planta con una formulación líquida o aplicando los compuestos en forma sólida al suelo, por ejemplo en forma granular (aplicación en suelo). En cultivos de arroz en agua, dichos granulados pueden aplicarse al campo de arroz inundado. Los compuestos de fórmula (I) también pueden aplicarse a semillas (recubrimiento), impregnando las semillas o tubérculos con una formulación líquida del fungicida o recubriéndolos con una formulación sólida.

- 40 Una formulación, por ejemplo una composición conteniendo el compuesto de fórmula I, y, si se desea, un sólido o adyuvante líquido o monómeros para encapsular el compuesto de fórmula I, pueden prepararse de forma conocida, típicamente mezclando bien y/o moliendo el compuesto con diluyentes, por ejemplo disolventes, portadores sólidos y, opcionalmente, compuestos tensioactivos.

- 45 La actividad de las composiciones de acuerdo con la invención puede ampliarse considerablemente y adaptarse a las circunstancias prevalentes mediante la adición de otros ingredientes activos desde el punto de vista insecticida, acaricida y/o fungicida. Las mezclas de compuestos de fórmula (I) con otros ingredientes activos desde el punto de vista insecticida, acaricida, y/o fungicida también puede tener ventajas adicionales sorprendentes que también pueden describirse, en un sentido más amplio, como actividad sinérgica. Por ejemplo, mejor tolerancia por parte de las plantas, fitotoxicidad reducida, insectos que pueden controlarse en sus distintas etapas de desarrollo o mejor comportamiento durante su producción, por ejemplo durante la molienda o mezclado, durante su almacenamiento o durante su uso.

Adiciones adecuadas a ingredientes activos aquí son, por ejemplo, representantes de las siguientes clases de ingredientes activos: compuestos de organosfósforo, derivados de nitrofenol, tioureas, hormonas juveniles, formamidinas, derivados de benzofenona, ureas, derivados de pirrol, carbamatos, piretroides, hidrocarburos clorados, acilureas, derivados de piridilmetilenoamino, macrólidos, neonicotinoides y preparaciones de *Bacillus thuringiensis*.

Se prefieren las siguientes mezclas de los compuestos de fórmula I con ingredientes activos (la abreviatura "TX" significa "un compuesto de acuerdo con la fórmula (I) o un compuesto específico seleccionado de la Tabla 1 a 22 o un compuesto específico seleccionado de la Tabla T1 de la presente invención"):

un adyuvante seleccionado del grupo de sustancias constituido por aceites de petróleo (nombre alternativo) (628) + TX,

un acaricida que se selecciona del grupo de sustancias que consiste en 1,1-bis(4-clorofenil)-2-etoxietanol (nombre IUPAC) (910) + TX, bencenosulfonato de 2,4-diclorofenilo (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (1059) + TX, 2-fluoro-*N*-metil-*N*-1-naftilacetamida (nombre IUPAC) (1295) + TX, 4-clorofenil fenil sulfona (nombre IUPAC) (981) + TX, abamectina (1) + TX, acequinocilo (3) + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxcarb (863) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, amiditió (870) + TX, amidoflumet [CCN] + TX, amidotioato (872) + TX, amitón (875) + TX, hidrógeno oxalato de amitón (875) + TX, amitraz (24) + TX, aramita (881) + TX, óxido arsenoso (882) + TX, AVI 382 (código de compuesto) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, azinfós-etilo (44) + TX, azinfós-metilo (45) + TX, azobenceno (nombre IUPAC) (888) + TX, azociclotina (46) + TX, azotoato (889) + TX, benomilo (62) + TX, benoxafós (nombre alternativo) [CCN] + TX, benzoximato (71) + TX, benzoato de bencilo (nombre IUPAC) [CCN] + TX, bifenazato (74) + TX, bifentrina (76) + TX, binapacril (907) + TX, brofenvalerato (nombre alternativo) + TX, bromociclén (918) + TX, bromofós (920) + TX, bromofós-etilo (921) + TX, bromopropilato (94) + TX, buprofezina (99) + TX, butocarboxim (103) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabén (nombre alternativo) + TX, polisulfuro de calcio (nombre IUPAC) (111) + TX, camfeclor (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarilo (115) + TX, carbofurán (118) + TX, carbofenotión (947) + TX, CGA 50'439 (código de desarrollo) (125) + TX, quinometionat (126) + TX, clorbensida (959) + TX, clordimeform (964) + TX, hidrocloreuro de clordimeform (964) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenetol (968) + TX, clorfensón (970) + TX, clorfensulfuro (971) + TX, clorfenvinfos (131) + TX, clorobencilato (975) + TX, cloromebuform (977) + TX, clorometiurón (978) + TX, cloropropilato (983) + TX, clorpirifós (145) + TX, clorpirifós-metilo (146) + TX, clortiofós (994) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, clofentezina (158) + TX, closantel (nombre alternativo) [CCN] + TX, coumafós (174) + TX, crotamitón (nombre alternativo) [CCN] + TX, crotoxifós (1010) + TX, cufraneb (1013) + TX, ciantoato (1020) + TX, ciflumetofén (No Reg. CAS.: 400882-07-7) + TX, cihalotrina (196) + TX, cihexatina (199) + TX, cipermetrina (201) + TX, DCPM (1032) + TX, DDT (219) + TX, demefión (1037) + TX, demefión-O (1037) + TX, demefión-S (1037) + TX, demetón (1038) + TX, demetón-metilo (224) + TX, demetón-O (1038) + TX, demetón-O-metilo (224) + TX, demetón-S (1038) + TX, demetón-S-metilo (224) + TX, demetón-S-metilsulfón (1039) + TX, diafentiurón (226) + TX, dialifós (1042) + TX, diazinón (227) + TX, diclofluand (230) + TX, diclorvos (236) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dicofol (242) + TX, dicrotofós (243) + TX, dienoclor (1071) + TX, dimefox (1081) + TX, dimetoato (262) + TX, dinactina (nombre alternativo) (653) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinobutón (269) + TX, dinocap (270) + TX, dinocap-4 [CCN] + TX, dinocap-6 [CCN] + TX, dinocetón (1090) + TX, dinopentón (1092) + TX, dinosulfón (1097) + TX, dinoterbón (1098) + TX, dioxatió (1102) + TX, difenil sulfona (nombre IUPAC) (1103) + TX, disulfiram (nombre alternativo) [CCN] + TX, disulfotón (278) + TX, DNOC (282) + TX, dofenapina (1113) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, endosulfán (294) + TX, endotió (1121) + TX, EPN (297) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, etió (309) + TX, etoato-metilo (1134) + TX, etoxazol (320) + TX, etrimfós (1142) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenazaquina (328) + TX, fenbutatina óxido (330) + TX, fenotiocarb (337) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fenpiroximato (345) + TX, fensón (1157) + TX, fentripanilo (1161) + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronilo (354) + TX, fluacripirim (360) + TX, fluzaurón (1166) + TX, flubencimina (1167) + TX, flucicloxurón (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetilo (1169) + TX, flufenoxurón (370) + TX, flumetrina (372) + TX, fluorbensida (1174) + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, formetanato (405) + TX, formetanato hidrocloreuro (405) + TX, formotió (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, gamma-HCH (430) + TX, gliodina (1205) + TX, halfenprox (424) + TX, heptenofós (432) + TX, ciclopropanocarboxilato de hexadecilo (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (1216) + TX, hexitiazox (441) + TX, yodometano (nombre IUPAC) (542) + TX, isocarbofós (nombre alternativo) (473) + TX, *O*-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo (nombre IUPAC) (473) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolina II (696) + TX, jodfenfós (1248) + TX, lindano (430) + TX, lufenurón (490) + TX, malatió (492) + TX, malonobén (1254) + TX, mecarbam (502) + TX, mefosfolán (1261) + TX, mesulfén (nombre alternativo) [CCN] + TX, metacrifós (1266) + TX, metamidofós (527) + TX, metidatió (529) + TX, metiocarb (530) + TX, metomilo (531) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, metolcarb (550) + TX, mevinfós (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, milbemicina oxima (nombre alternativo) [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, monocrotofós (561) + TX, morfotió (1300) + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, naled (567) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, NC-512 (código de compuesto) + TX, nifluridida (1309) + TX, nicomicinas (nombre alternativo) [CCN] + TX, nitrilacarb (1313) + TX, nitrilacarb 1:1 complejo de cloruro de zinc (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) + TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxideprofós (1324) + TX, oxidisulfotón (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, paratió (615) + TX, permetrina (626) + TX, aceites de petróleo (nombre alternativo) (628) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) +

TX, fosadona (637) + TX, fosfolán (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosfamidón (639) + TX, foxim (642) + TX, pirimifós-metilo (652) + TX, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + TX, polinactinas (nombre alternativo) (653) + TX, proclonol (1350) + TX, profenofós (662) + TX, promacilo (1354) + TX, propargita (671) + TX, propetamfós (673) + TX, propoxur (678) + TX, protidación (1360) + TX, protoato (1362) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridabén (699) + TX, piridafentión (701) + TX, pirimidifén (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, quinalfós (711) + TX, quintiofós (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, RA-17 (código de desarrollo) (1383) + TX, rotenona (722) + TX, scradán (1389) + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, sofamida (1402) + TX, espiroclorfen (738) + TX, espiromesifén (739) + TX, SSI-121 (código de desarrollo) (1404) + TX, sulfiram (nombre alternativo) [CCN] + TX, sulfiramid (750) + TX, sulfotep (753) + TX, azufre (754) + TX, SZI-121 (código de desarrollo) (757) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tebufenpirad (763) + TX, TEPP (1417) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, tetraclorvinfós (777) + TX, tetradifón (786) + TX, tetranactina (nombre alternativo) (653) + TX, tetrasul (1425) + TX, tifenox (nombre alternativo) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometón (801) + TX, tioquinox (1436) + TX, turingiensina (nombre alternativo) [CCN] + TX, triamifós (800) + TX, triaratenó (1443) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón (nombre alternativo) + TX, triclorfón (824) + TX, trifenofós (1455) + TX, trinactina (nombre alternativo) (653) + TX, vamidotión (847) + TX, vaniliprol [CCN] y YI-5302 (código de compuesto) + TX,

un algicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por betoxazina [CCN] + TX, dioctanoato de cobre (nombre IUPAC) (170) + TX, sulfato de cobre (172) + TX, cibutrina [CCN] + TX, diclona (1052) + TX, diclorofeno (232) + TX, endotal (295) + TX, fentina (347) + TX, cal hidratada [CCN] + TX, nabam (566) + TX, quinoclamina (714) + TX, quinonamida (1379) + TX, simazina (730) + TX, acetato de trifenilestaño (nombre IUPAC) (347) e hidróxido de trifenilestaño (nombre IUPAC) (347) + TX,

un antihelmíntico seleccionado del grupo de sustancias constituido por abamectina (1) + TX, crufomato (1011) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, piperazina [CCN] + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, espinosad (737) y tiofanato (1435) + TX,

un avicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por cloralosa (127) + TX, endrina (1122) + TX, fentión (346) + TX, piridin-4-amina (nombre IUPAC) (23) y estricnina (745) + TX,

un bactericida que se selecciona del grupo de sustancias que consiste en 1-hidroxi-1*H*-piridina-2-tiona (nombre IUPAC) (1222) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)benzenosulfonamida (nombre IUPAC) (748) + TX, sulfato de 8-hidroxiquinolina (446) + TX, bronopol (97) + TX, dioctanoato de cobre (nombre IUPAC) (170) + TX, hidróxido de cobre (nombre IUPAC) (169) + TX, cresol [CCN] + TX, diclorofén (232) + TX, dipiritiona (1105) + TX, dodicina (1112) + TX, fenaminosulf (1144) + TX, formaldehído (404) + TX, hidrargafén (nombre alternativo) [CCN] + TX, kasugamicina (483) + TX, hidrato de clorhidrato de kasugamicina (483) + TX, bis(dimetiliditiocarbamato) de níquel (nombre IUPAC) (1308) + TX, nitrapirina (580) + TX, octilina (590) + TX, ácido oxolínico (606) + TX, oxitetraciclina (611) + TX, sulfato de hidroxiquinolina de potasio (446) + TX, probenazol (658) + TX, estreptomina (744) + TX, estreptomina sesquisulfato (744) + TX, tecloftalam (766) + TX, y tiomersal (nombre alternativo) [CCN] + TX,

un agente biológico que se selecciona del grupo de sustancias que consiste en *Adoxophyes orana* GV (nombre alternativo) (12) + TX, *Agrobacterium radiobacter* (nombre alternativo) (13) + TX, *Amblyseius* spp. (nombre alternativo) (19) + TX, *Anagrapha falcifer* NPV (nombre alternativo) (28) + TX, *Anagrus atomus* (nombre alternativo) (29) + TX, *Afelinus abdominalis* (nombre alternativo) (33) + TX, *Aphidius colemani* (nombre alternativo) (34) + TX, *Aphidoletes aphidimiza* (nombre alternativo) (35) + TX, *Autographa californica* NPV (nombre alternativo) (38) + TX, *Bacillus firmus* (nombre alternativo) (48) + TX, *Bacillus sphaericus* Neide (nombre científico) (49) + TX, *Bacillus thuringiensis* Berliner (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* (nombre científico) (51) + TX, *Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis* (nombre científico) (51) + TX, *Beauveria bassiana* (nombre alternativo) (53) + TX, *Beauveria brongniartii* (nombre alternativo) (54) + TX, *Chrysoperla carnea* (nombre alternativo) (151) + TX, *Cryptolaemus montrouzieri* (nombre alternativo) (178) + TX, *Cidia pomonella* GV (nombre alternativo) (191) + TX, *Dacnusa sibirica* (nombre alternativo) (212) + TX, *Diglyphus isaea* (nombre alternativo) (254) + TX, *Encarsia formosa* (nombre científico) (293) + TX, *Eretmocerus eremicus* (nombre alternativo) (300) + TX, *Helicoverpa zea* NPV (nombre alternativo) (431) + TX, *Heterorhabditis bacteriophora* y *H. megidis* (nombre alternativo) (433) + TX, *Hippodamia convergens* (nombre alternativo) (442) + TX, *Leptomastix dactilopii* (nombre alternativo) (488) + TX, *Macrolophus caliginosus* (nombre alternativo) (491) + TX, *Mamestra brassicae* NPV (nombre alternativo) (494) + TX, *Metaphycus helvolus* (nombre alternativo) (522) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *acidum* (nombre científico) (523) + TX, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* (nombre científico) (523) + TX, *Neodiprion sertifer* NPV y *N. lecontei* NPV (nombre alternativo) (575) + TX, *Orius* spp. (nombre alternativo) (596) + TX, *Paecilomyces fumosoroseus* (nombre alternativo) (613) + TX, *Phytoseiulus persimilis* (nombre alternativo) (644) + TX, *Spodoptera exigua* virus de la poliedrosis nuclear de cápside múltiple (nombre científico) (741) + TX, *Steinernema bibionis* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema carpocapsae* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema feltiae* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema glaseri* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema riobrave* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema riobrave* (nombre alternativo) (742) + TX, *Steinernema scapterisci* (nombre alternativo) (742) + TX,

Steinernema spp. (nombre alternativo) (742) + TX, *Trichogramma* spp. (nombre alternativo) (826) + TX, *Tyflodromus occidentalis* (nombre alternativo) (844) y *Verticillium lecanii* (nombre alternativo) (848) + TX,

un esterilizante de la tierra seleccionado del grupo de sustancias constituido por yodometano (nombre IUPAC) (542) y bromuro de metilo (537) + TX,

- 5 un esterilizante químico seleccionado del grupo de sustancias constituido por afolato [CCN] + TX, bisazir (nombre alternativo) [CCN] + TX, busulfán (nombre alternativo) [CCN] + TX, diflubenzurón (250) + TX, dimatif (nombre alternativo) [CCN] + TX, hemel [CCN] + TX, hempa [CCN] + TX, metepa [CCN] + TX, metiotepa [CCN] + TX, afolato metílico [CCN] + TX, morzid [CCN] + TX, penflurón (nombre alternativo) [CCN] + TX, tepa [CCN] + TX, tiohempa (nombre alternativo) [CCN] + TX, tiotepa (nombre alternativo) [CCN] + TX, tretamina (nombre alternativo) [CCN] y uredepa (nombre alternativo) [CCN] + TX,

- una feromona de insecto que se selecciona del grupo de sustancias que consiste en acetato de (*E*)-dec-5-en-1-ilo con (*E*)-dec-5-en-1-ol (nombre IUPAC) (222) + TX, acetato de (*E*)-tridec-4-en-1-ilo (nombre IUPAC) (829) + TX, (*E*)-6-metilhept-2-en-4-ol (nombre IUPAC) (541) + TX, acetato de (*E,Z*)-tetradeca-4,10-dien-1-ilo (nombre IUPAC) (779) + TX, acetato de (*Z*)-dodec-7-en-1-ilo (nombre IUPAC) (285) + TX, (*Z*)-hexadec-11-enal (nombre IUPAC) (436) + TX, acetato de (*Z*)-hexadec-11-en-1-ilo (nombre IUPAC) (437) + TX, acetato de (*Z*)-hexadec-13-en-11-in-1-ilo (nombre IUPAC) (438) + TX, (*Z*)-icos-13-en-10-ona (nombre IUPAC) (448) + TX, (*Z*)-tetradec-7-en-1-al (nombre IUPAC) (782) + TX, (*Z*)-tetradec-9-en-1-ol (nombre IUPAC) (783) + TX, acetato de (*Z*)-tetradec-9-en-1-ilo (nombre IUPAC) (784) + TX, acetato de (*7E,9Z*)-dodeca-7,9-dien-1-ilo (nombre IUPAC) (283) + TX, acetato de (*9Z,11E*)-tetradeca-9,11-dien-1-ilo (nombre IUPAC) (780) + TX, acetato de (*9Z,12E*)-tetradeca-9,12-dien-1-ilo (nombre IUPAC) (781) + TX, 14-metiloctadec-1-eno (nombre IUPAC) (545) + TX, 4-metilnonan-5-ol con 4-metilnonan-5-ona (nombre IUPAC) (544) + TX, alfa-multistriatina (nombre alternativo) [CCN] + TX, brevicomina (nombre alternativo) [CCN] + TX, codlelure (nombre alternativo) [CCN] + TX, codlemona (nombre alternativo) (167) + TX, cuelure (nombre alternativo) (179) + TX, disparlure (277) + TX, acetato de dodec-8-en-1-ilo (nombre IUPAC) (286) + TX, acetato de dodec-9-en-1-ilo (nombre IUPAC) (287) + TX, dodeca-8 + TX, acetato de 10-dien-1-ilo (nombre IUPAC) (284) + TX, dominicalure (nombre alternativo) [CCN] + TX, etil 4-metiloctanoato (nombre IUPAC) (317) + TX, eugenol (nombre alternativo) [CCN] + TX, frontalina (nombre alternativo) [CCN] + TX, gosiplure (nombre alternativo) (420) + TX, grandlure (421) + TX, grandlure I (nombre alternativo) (421) + TX, grandlure II (nombre alternativo) (421) + TX, grandlure III (nombre alternativo) (421) + TX, grandlure IV (nombre alternativo) (421) + TX, hexalure [CCN] + TX, ipsdienol (nombre alternativo) [CCN] + TX, ipsenol (nombre alternativo) [CCN] + TX, japonilure (nombre alternativo) (481) + TX, lineatin (nombre alternativo) [CCN] + TX, litlure (nombre alternativo) [CCN] + TX, looplure (nombre alternativo) [CCN] + TX, medlure [CCN] + TX, ácido megatomoico (nombre alternativo) [CCN] + TX, eugenol de metilo (nombre alternativo) (540) + TX, muscalure (563) + TX, acetato de octadeca-2,13-dien-1-ilo (nombre IUPAC) (588) + TX, acetato de octadeca-3,13-dien-1-ilo (nombre IUPAC) (589) + TX, orfuralure (nombre alternativo) [CCN] + TX, orictalure (nombre alternativo) (317) + TX, ostramona (nombre alternativo) [CCN] + TX, siglure [CCN] + TX, sordidin (nombre alternativo) (736) + TX, sulcatol (nombre alternativo) [CCN] + TX, acetato de tetradec-11-en-1-ilo (nombre IUPAC) (785) + TX, trimedlure (839) + TX, trimedlure A (nombre alternativo) (839) + TX, trimedlure B₁ (nombre alternativo) (839) + TX, trimedlure B₂ (nombre alternativo) (839) + TX, trimedlure C (nombre alternativo) (839) y trunc-call (nombre alternativo) [CCN] + TX,

- 40 un repelente de insectos seleccionado del grupo de sustancias constituido por 2-(octiltio)etanol (nombre IUPAC) (591) + TX, butopironoxil (933) + TX, butoxi(polipropilenglicol) (936) + TX, adipato de dibutilo (nombre IUPAC) (1046) + TX, ftalato de dibutilo (1047) + TX, succinato de dibutilo (nombre IUPAC) (1048) + TX, dietiltoluamida [CCN] + TX, carbato de dimetilo [CCN] + TX, ftalato de dimetilo [CCN] + TX, etilhexanodiol (1137) + TX, hexamida [CCN] + TX, metoquina butílica (1276) + TX, metilneodecanamida [CCN] + TX, oxamato [CCN] y picaridina [CCN] + TX,

- 45 un insecticida que se selecciona del grupo de sustancias que consiste en 1-dicloro-1-nitroetano (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (1058) + TX, 1,1-dicloro-2,2-bis(4-etilfenil)etano (nombre IUPAC) (1056), + TX, 1,2-dicloropropano (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropano (nombre IUPAC) (1063) + TX, 1-bromo-2-cloroetano (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (916) + TX, 2,2,2-tricloro-1-(3,4-diclorofenil)etil acetato (nombre IUPAC) (1451) + TX, fosfato de 2,2-diclorovinil 2-etilsulfinitil metilo (nombre IUPAC) (1066) + TX, dimetilcarbamato de 2-(1,3-ditiolan-2-il)fenilo (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (1109) + TX, tiocianato de 2-(2-butoxi)etil (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (935) + TX, metilcarbamato de 2-(4,5-dimetil-1,3-dioxolan-2-il)fenilo (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (1084) + TX, 2-(4-cloro-3,5-xililoxi)etanol (nombre IUPAC) (986) + TX, 2- fosfato de clorovinil dietilo (nombre IUPAC) (984) + TX, 2-imidazolidona (nombre IUPAC) (1225) + TX, 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre IUPAC) (1246) + TX, metilcarbamato de 2-metil(prop-2-inil)aminofenilo (nombre IUPAC) (1284) + TX, laurato de 2-tiocianatoetilo (nombre IUPAC) (1433) + TX, 3-bromo-1-cloroprop-1-eno (nombre IUPAC) (917) + TX, dimetilcarbamato de 3-metil-1-fenilpirazol-5-ilo (nombre IUPAC) (1283) + TX, metilcarbamato de 4-metil(prop-2-inil)amino-3,5-xililo (nombre IUPAC) (1285) + TX, dimetilcarbamato de 5,5-dimetil-3-oxociclohex-1-enilo (nombre IUPAC) (1085) + TX, abamectina (1) + TX, acefato (2) + TX, acetamidrid (4) + TX, acetión (nombre alternativo) [CCN] + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, acrilonitrilo (nombre IUPAC) (861) + TX, alanicarb (15) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, aldrina (864) + TX, aletrina (17) + TX, alosamidina (nombre alternativo) [CCN] + TX, alixicarb (866) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, alfa-eccidisona (nombre alternativo) [CCN] + TX, fosfuro de aluminio (640) + TX, amiditió (870) + TX, amidotioato (872) + TX, aminocarb (873) + TX, amitón (875) + TX, hidrógeno oxalato de amitón (875) + TX, amitraz (24) + TX, anabasina

(877) + TX, atidación (883) + TX, AVI 382 (código de compuesto) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, azadiractina (nombre alternativo) (41) + TX, azametifós (42) + TX, azinfos-etilo (44) + TX, azinfos-metilo (45) + TX, azotoato (889) + TX, delta endotoxinas de *Bacillus thuringiensis* (nombre alternativo) (52) + TX, hexafluorosilicato de bario (nombre alternativo) [CCN] + TX, polisulfuro de bario (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (892) + TX, bartrina [CCN] + TX, Bayer 22/190 (código de desarrollo) (893) + TX, Bayer 22408 (código de desarrollo) (894) + TX, bendiocarb (58) + TX, benfuracarb (60) + TX, bensultap (66) + TX, beta-ciflutrina (194) + TX, beta-cipermetrina (203) + TX, bifentrina (76) + TX, bioaletrina (78) + TX, S-ciclopentenil isómero de bioaletrina (nombre alternativo) (79) + TX, bioetanometrina [CCN] + TX, biopermetrina (908) + TX, bioresmetrina (80) + TX, bis(2-cloroetil) éter (nombre IUPAC) (909) + TX, bistriflurón (83) + TX, borax (86) + TX, brofenvalerato (nombre alternativo) + TX, bromfenvinfos (914) + TX, bromociclén (918) + TX, bromo-DDT (nombre alternativo) [CCN] + TX, bromofós (920) + TX, bromofós-etilo (921) + TX, bufencarb (924) + TX, buprofezina (99) + TX, butacarb (926) + TX, butatofós (927) + TX, butocarboxim (103) + TX, butonato (932) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabén (nombre alternativo) + TX, cadusafós (109) + TX, arsenato de calcio [CCN] + TX, cianuro de calcio (444) + TX, polisulfuro de calcio (nombre IUPAC) (111) + TX, camfeclor (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarilo (115) + TX, carbofurán (118) + TX, disulfuro de carbono (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (945) + TX, tetracloruro de carbono (nombre IUPAC) (946) + TX, carbofenotión (947) + TX, carbosulfán (119) + TX, cartap (123) + TX, hidrocloreuro de cartap (123) + TX, cevadina (nombre alternativo) (725) + TX, clorbiciclén (960) + TX, clordano (128) + TX, clordecona (963) + TX, clordimeform (964) + TX, hidrocloreuro de clordimeform (964) + TX, cloretoxifós (129) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenvinfos (131) + TX, clorfluazurón (132) + TX, clormefós (136) + TX, cloroformo [CCN] + TX, cloropicrina (141) + TX, clorfoxim (989) + TX, clorprazofós (990) + TX, clorpirifós (145) + TX, clorpirifós-metilo (146) + TX, clortiofós (994) + TX, cromafenozida (150) + TX, cinerina I (696) + TX, cinerina II (696) + TX, cinerinas (696) + TX, cis-resmetrina (nombre alternativo) + TX, cismetrina (80) + TX, cloctirina (nombre alternativo) + TX, cloetocarb (999) + TX, closantel (nombre alternativo) [CCN] + TX, clotianidina (165) + TX, acetoarsenita de cobre [CCN] + TX, arsenato de cobre [CCN] + TX, oleato de cobre [CCN] + TX, coumafós (174) + TX, coumitoato (1006) + TX, crotamitón (nombre alternativo) [CCN] + TX, crotoxifós (1010) + TX, cruformato (1011) + TX, criolita (nombre alternativo) (177) + TX, CS 708 (código de desarrollo) (1012) + TX, cianofenfos (1019) + TX, cianofós (184) + TX, ciantoato (1020) + TX, cicletrina [CCN] + TX, cicloprotrina (188) + TX, ciflutrina (193) + TX, cihalotrina (196) + TX, cipermetrina (201) + TX, cifenotrina (206) + TX, ciromazina (209) + TX, citioato (nombre alternativo) [CCN] + TX, d-limoneno (nombre alternativo) [CCN] + TX, d-tetrametrina (nombre alternativo) (788) + TX, DAEP (1031) + TX, dazomet (216) + TX, DDT (219) + TX, decarbofurán (1034) + TX, deltametrina (223) + TX, demefión (1037) + TX, demefión-O (1037) + TX, demefión-S (1037) + TX, demetón (1038) + TX, demetón-metilo (224) + TX, demetón-O (1038) + TX, demetón-O-metilo (224) + TX, demetón-S (1038) + TX, demetón-S-metilo (224) + TX, demetón-S-metilsulfón (1039) + TX, diafentiurón (226) + TX, dialifós (1042) + TX, diamidafós (1044) + TX, diazinón (227) + TX, dicaptón (1050) + TX, diclofentión (1051) + TX, diclorvós (236) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dicresilo (nombre alternativo) [CCN] + TX, dicrotofós (243) + TX, diciclanilo (244) + TX, dieldrina (1070) + TX, 5-metilpirazol-3-il fosfato de dietilo (nombre IUPAC) (1076) + TX, diflubenzurón (250) + TX, dilor (nombre alternativo) [CCN] + TX, dimelflutrina [CCN] + TX, dimefox (1081) + TX, dimetán (1085) + TX, dimetoato (262) + TX, dimetrina (1083) + TX, dimetilvinfos (265) + TX, dimetilán (1086) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinoprop (1093) + TX, dinosam (1094) + TX, dinoseb (1095) + TX, dinotefurán (271) + TX, diofenolán (1099) + TX, dioxabenzofós (1100) + TX, dioxacarb (1101) + TX, dioxatión (1102) + TX, disulfotón (278) + TX, diticrofós (1108) + TX, DNOC (282) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, DSP (1115) + TX, ecdisterona (nombre alternativo) [CCN] + TX, EI 1642 (código de desarrollo) (1118) + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, EMPC (1120) + TX, empentrina (292) + TX, endosulfán (294) + TX, endotión (1121) + TX, endrina (1122) + TX, EPBP (1123) + TX, EPN (297) + TX, epofenonano (1124) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, esfenvalerato (302) + TX, etafós (nombre alternativo) [CCN] + TX, etiofencarb (308) + TX, etión (309) + TX, etiprol (310) + TX, etoato-metilo (1134) + TX, etoprofós (312) + TX, formato de etilo (nombre IUPAC) [CCN] + TX, etil-DDD (nombre alternativo) (1056) + TX, dibromuro de etileno (316) + TX, dicloruro de etileno (nombre químico) (1136) + TX, óxido de etileno [CCN] + TX, etofenprox (319) + TX, etrimfós (1142) + TX, EXD (1143) + TX, famfur (323) + TX, fenamifós (326) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenclorfós (1148) + TX, fenetacarb (1149) + TX, fenflutrina (1150) + TX, fenitrotión (335) + TX, fenobucarb (336) + TX, fenoxacrim (1153) + TX, fenoxicarb (340) + TX, fenpiritrina (1155) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fensulfotión (1158) + TX, fentión (346) + TX, fentión-etilo [CCN] + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronilo (354) + TX, flonicamid (358) + TX, flubendiamida (CAS. Reg. No.: 272451-65-7) + TX, flucofurón (1168) + TX, fluciclofurón (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetil (1169) + TX, flufenerim [CCN] + TX, flufenoxurón (370) + TX, flufenprox (1171) + TX, flumetrina (372) + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, fonofós (1191) + TX, formetanato (405) + TX, clorhidrato de formetanato (405) + TX, formotión (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, fosmetilán (1194) + TX, fospirato (1195) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietán (1196) + TX, furiocarb (412) + TX, furetrina (1200) + TX, gamma-cihalotrina (197) + TX, gamma-HCH (430) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, halfenprox (424) + TX, halofenozida (425) + TX, HCH (430) + TX, HEOD (1070) + TX, heptacloro (1211) + TX, heptenofós (432) + TX, heterofós [CCN] + TX, hexaflumurón (439) + TX, HHDN (864) + TX, hidrametilnón (443) + TX, cianuro de hidrógeno (444) + TX, hidropreno (445) + TX, hiquincarb (1223) + TX, imidacloprid (458) + TX, imiprotrina (460) + TX, indoxacarb (465) + TX, yodometano (nombre IUPAC) (542) + TX, IPSP (1229) + TX, isazofós (1231) + TX, isobenzán (1232) + TX, isocarbofós (nombre alternativo) (473) + TX, isodrin (1235) + TX, isofenfos (1236) + TX, isolano (1237) + TX, isoprocarb (472) + TX, O-(metoxi-aminotiofosforil)salicilato de isopropilo (nombre IUPAC) (473) + TX, isoprotilano (474) + TX, isotioato (1244) + TX, isoxatión (480) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, jasmolín I (696) + TX, jasmolín II (696) + TX, jodfenfos (1248) + TX, hormona juvenil I

(nombre alternativo) [CCN] + TX, hormona juvenil II (nombre alternativo) [CCN] + TX, hormona juvenil III (nombre alternativo) [CCN] + TX, keleván (1249) + TX, quinopreno (484) + TX, lambda-cihalotrina (198) + TX, arsenato de plomo [CCN] + TX, lepimectina (CCN) + TX, leptofós (1250) + TX, lindano (430) + TX, lirimfós (1251) + TX, lufenurón (490) + TX, litidación (1253) + TX, metilcarbamato de *m*-cumenilo (nombre IUPAC) (1014) + TX, fosfuro de magnesio (nombre IUPAC) (640) + TX, malatión (492) + TX, malonobén (1254) + TX, mazidox (1255) + TX, mecarbam (502) + TX, mecarfón (1258) + TX, menazón (1260) + TX, mefosfolán (1261) + TX, cloruro de mercurio (513) + TX, mesulfenfós (1263) + TX, metaflumizona (CCN) + TX, metam (519) + TX, metam-potasio (nombre alternativo) (519) + TX, metam-sodio (519) + TX, metacrifós (1266) + TX, metamidofós (527) + TX, fluoruro de metanosulfonilo (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (1268) + TX, metidación (529) + TX, metiocarb (530) + TX, metocrotofós (1273) + TX, metomilo (531) + TX, metopreno (532) + TX, metoquin-butilo (1276) + TX, metotrina (nombre alternativo) (533) + TX, metoxicloro (534) + TX, metoxifenzida (535) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, isotiocianato de metilo (543) + TX, metilcloroforno (nombre alternativo) [CCN] + TX, cloruro de metileno [CCN] + TX, metoflutrina [CCN] + TX, metolcarb (550) + TX, metoxadiazona (1288) + TX, mevinfós (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, milbemicina oxima (nombre alternativo) [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, mirex (1294) + TX, monocrotofós (561) + TX, morfotión (1300) + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, naftalofós (nombre alternativo) [CCN] + TX, naled (567) + TX, naftaleno (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (1303) + TX, NC-170 (código de desarrollo) (1306) + TX, NC-184 (código del compuesto) + TX, nicotina (578) + TX, nicotina sulfato (578) + TX, nifluridida (1309) + TX, nitenpiram (579) + TX, nitiazina (1311) + TX, nitrilcarb (1313) + TX, complejo de nitrilcarb y cloruro de zinc 1:1 (1313) + TX, NNI-0101 (código del compuesto) + TX, NNI-0250 (código del compuesto) + TX, nornicotina (nombre tradicional) (1319) + TX, novalurón (585) + TX, noviflumurón (586) + TX, etilfosfonotioato de *O*-5-dicloro-4-yodofenilo *O*-etilo (nombre IUPAC) (1057) + TX, fosforotioato de *O*,*O*-dietil *O*-4-metil-2-oxo-2*H*-cromen-7-ilo (nombre IUPAC) (1074) + TX, fos de forotioato *O*,*O*-dietil *O*-6-metil-2-propilpirimidin-4-ilo (nombre IUPAC) (1075) + TX, ditiopirofosfato de *O*,*O*,*O*'-tetrapropilo (nombre IUPAC) (1424) + TX, ácido oleico (nombre IUPAC) (593) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxidemetón-metilo (609) + TX, oxideprofós (1324) + TX, oxidisulfotón (1325) + TX, pp-DDT (219) + TX, para-diclorobenceno [CCN] + TX, paratión (615) + TX, paratión-metilo (616) + TX, penflurón (nombre alternativo) [CCN] + TX, pentaclorofenol (623) + TX, pentaclorofenilo laurato (nombre IUPAC) (623) + TX, permetrina (626) + TX, aceites de petróleo (nombre alternativo) (628) + TX, PH 60-38 (código de desarrollo) (1328) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fenotrina (630) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosalona (637) + TX, fosfolán (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosnicloro (1339) + TX, fosfamidón (639) + TX, fosfina (nombre IUPAC) (640) + TX, foxim (642) + TX, foxim-metilo (1340) + TX, pirimetafós (1344) + TX, pirimicarb (651) + TX, pirimifós-etilo (1345) + TX, pirimifós-metilo (652) + TX, isómeros de policlorodociclopentadieno (nombre IUPAC) (1346) + TX, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + TX, arsenita de potasio [CCN] + TX, tiocianato de potasio [CCN] + TX, praletrina (655) + TX, precoceno I (nombre alternativo) [CCN] + TX, precoceno II (nombre alternativo) [CCN] + TX, precoceno III (nombre alternativo) [CCN] + TX, primidofós (1349) + TX, profenofós (662) + TX, proflutrina [CCN] + TX, promacilo (1354) + TX, promecarb (1355) + TX, propafós (1356) + TX, propetamfós (673) + TX, propoxur (678) + TX, protidación (1360) + TX, protiofós (686) + TX, proato (1362) + TX, protrifenbute [CCN] + TX, pimetrozina (688) + TX, piraclofós (689) + TX, pirazofós (693) + TX, piresmetrina (1367) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridabén (699) + TX, piridalilo (700) + TX, piridafentión (701) + TX, pirimidifén (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, piriproxifén (708) + TX, quasía (nombre alternativo) [CCN] + TX, quinalfós (711) + TX, quinalfós-metilo (1376) + TX, quinotión (1380) + TX, quintiofós (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, rafxanida (nombre alternativo) [CCN] + TX, resmetrina (719) + TX, rotenona (722) + TX, RU 15525 (código de desarrollo) (723) + TX, RU 25475 (código de desarrollo) (1386) + TX, riania (nombre alternativo) (1387) + TX, rianodina (nombre tradicional) (1387) + TX, sabadilla (nombre alternativo) (725) + TX, scradán (1389) + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, SI-0009 (código del compuesto) + TX, SI-0205 (código del compuesto) + TX, SI-0404 (código del compuesto) + TX, SI-0405 (código del compuesto) + TX, silafluofén (728) + TX, SN 72129 (código de desarrollo) (1397) + TX, arsenita de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoruro de sodio (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (1399) + TX, hexafluorosilicato de sodio (1400) + TX, pentaclorofenóxido de sodio (623) + TX, selenato de sodio (nombre IUPAC) (1401) + TX, tiocianato de sodio [CCN] + TX, sofamida (1402) + TX, spinosad (737) + TX, espiromesifén (739) + TX, espirotetmat (CCN) + TX, sulcofurón (746) + TX, sulcofurón-sodio (746) + TX, sulfuramid (750) + TX, sulfotep (753) + TX, fluoruro de sulfurilo (756) + TX, sulprofós (1408) + TX, aceites de alquitrán (nombre alternativo) (758) + TX, tau-fluvalinato (398) + TX, tazimcarb (1412) + TX, TDE (1414) + TX, tebufenozida (762) + TX, tebufenpirad (763) + TX, tebupirimfós (764) + TX, teflubenzurón (768) + TX, teflutrina (769) + TX, temefós (770) + TX, TEPP (1417) + TX, teraletrina (1418) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, terbufós (773) + TX, tetracloroetano [CCN] + TX, tetraclorvinfós (777) + TX, tetrametrina (787) + TX, theta-cipermetrina (204) + TX, tiacloprid (791) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tiametoxam (792) + TX, ticrofós (1428) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiociclam (798) + TX, hidrógeno oxalato de ticiclam (798) + TX, tiodicarb (799) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometón (801) + TX, tionazina (1434) + TX, tiosultap (803) + TX, tiosultap-sodio (803) + TX, turingiensina (nombre alternativo) [CCN] + TX, tolfenpirad (809) + TX, tralometrín (812) + TX, transflutrina (813) + TX, transpermetrina (1440) + TX, triamifós (1441) + TX, triazamato (818) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón (nombre alternativo) + TX, triclorfón (824) + TX, triclorometafós-3 (nombre alternativo) [CCN] + TX, tricloronato (1452) + TX, trifenofós (1455) + TX, triflumurón (835) + TX, trimetacarb (840) + TX, tripreno (1459) + TX, vamidotión (847) + TX, vaniliprol [CCN] + TX, veratridina (nombre alternativo) (725) + TX, veratrína (nombre alternativo) (725) + TX, XMC (853) + TX, xillcarb (854) + TX, YI-5302 (código del compuesto) + TX, zeta-cipermetrina (205) + TX, zetametrina (nombre alternativo) + TX, fosfuro de zinc (640) + TX, zolaprofós (1469) + TX, ZXI 8901 (código de desarrollo) (858) + TX, ciantraniliprol [736994-63-19] + TX, clorantraniliprol [500008-45-7] + TX, cienopirafén [560121-52-0] + TX,

ciflumetofeno [400882-07-7] + TX, pirifluquinazona [337458-27-2] + TX, spinetoram [187166-40-1 + 187166-15-0] + TX, espirotetramat [203313-25-1] + TX, sulfoxaflor [946578-00-3] + TX, flupirrol [704886-18-0] + TX, meperflutrina [915288-13-0] + TX, tetrametilflutrina [84937-88-2] + TX,

5 un moluscicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por el óxido de bis(tributilestaño) (nombre IUPAC) (913) + TX, bromoacetamida [CCN] + TX, arseniato de calcio [CCN] + TX, cloetocarb (999) + TX, acetoarsenito de cobre [CCN] + TX, sulfato de cobre (172) + TX, fentina (347) + TX, fosfato férrico (nombre IUPAC) (352) + TX, metaldehído (518) + TX, metiocarb (530) + TX, niclosamida (576) + TX, niclosamida-olamina (576) + TX, pentaclorofenol (623) + TX, pentaclorofenóxido de sodio (623) + TX, tazimcarb (1412) + TX, tiodicarb (799) + TX, óxido de tributilestaño (913) + TX, trifenmorf (1454) + TX, trimetacarb (840) + TX, acetato de trifenilestaño (nombre IUPAC) (347) e hidróxido de trifenilestaño (nombre IUPAC) (347) + TX, piriprol [394730-71-3] + TX,

un nematocida que se selecciona del grupo de sustancias que consiste en AKD-3088 (código del compuesto) + TX, 1,2-dibromo-3-cloropropano (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (1045) + TX, 1,2-dicloropropano (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno (nombre IUPAC) (1063) + TX, 1,3-dicloropropeno (233) + TX, 1,1-dióxido de 3,4-diclorotetrahidrotiofeno (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (1065) + TX, 3-(4-clorofenil)-5-metilrodanina (nombre IUPAC) (980) + TX, ácido 5-metil-6-tioxo-1,3,5-tiadiazinan-3-ilacético (nombre IUPAC) (1286) + TX, 6-isopentenilaminopurina (nombre alternativo) (210) + TX, abamectina (1) + TX, acetoprol [CCN] + TX, alanicarb (15) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, AZ 60541 (código del compuesto) + TX, benclotiaz [CCN] + TX, benomilo (62) + TX, butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, cadusafós (109) + TX, carbofurano (118) + TX, disulfuro de carbono (945) + TX, carbosulfán (119) + TX, cloropicrín (141) + TX, clorpirifós (145) + TX, cloetocarb (999) + TX, citoquininas (nombre alternativo) (210) + TX, dazomet (216) + TX, DBCP (1045) + TX, DCIP (218) + TX, diamidafós (1044) + TX, diclofentión (1051) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dimetoato (262) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, emamectina (291) + TX, benzoato de emamectina (291) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, etoprofós (312) + TX, dibromuro de etileno (316) + TX, fenamifós (326) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fensulfotión (1158) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietán (1196) + TX, furfural (nombre alternativo) [CCN] + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, heterofós [CCN] + TX, yodometano (nombre IUPAC) (542) + TX, isamidofós (1230) + TX, isazofós (1231) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, quinetina (nombre alternativo) (210) + TX, mecarfón (1258) + TX, metam (519) + TX, metam-potasio (nombre alternativo) (519) + TX, metam-sodio (519) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, isotiocianato de metilo (543) + TX, milbemicina oxima (nombre alternativo) [CCN] + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, *Mirothecio verrucaria* composición (nombre alternativo) (565) + TX, NC-184 (código del compuesto) + TX, oxamilo (602) + TX, forato (636) + TX, fosfamidón (639) + TX, fosfocarb [CCN] + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, spinosad (737) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, terbufós (773) + TX, tetraclorotiofeno (nombre IUPAC/Chemical Abstracts) (1422) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tionazina (1434) + TX, triazofós (820) + TX, triazurón (nombre alternativo) + TX, xilenoles [CCN] + TX, YI-5302 (código del compuesto) y zeatina (nombre alternativo) (210) + TX, fluensulfona [318290-98-1] + TX,

un inhibidor de la nitrificación seleccionado del grupo de sustancias constituido por etilxantato potásico [CCN] y nitrapirina (580) + TX,

40 un activador de plantas que se selecciona del grupo de sustancias que consiste en acibenzolar (6) + TX, acibenzolar-S-metilo (6) + TX, probenazol (658) y extracto de *Reynoutria sachalinensis* (nombre alternativo) (720) + TX,

un rodenticida seleccionado del grupo de sustancias constituido por 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre de la IUPAC) (1246) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)bencenosulfonamida (nombre de la IUPAC) (748) + TX, alfa-clorohidrina [CCN] + TX, fosfuro de aluminio (640) + TX, antu (880) + TX, óxido arsenioso (882) + TX, carbonato de bario (891) + TX, bistiosemi (912) + TX, brodifacum (89) + TX, bromadiolona (91) + TX, brometalina (92) + TX, cianuro de calcio (444) + TX, cloralosa (127) + TX, clorofacinona (140) + TX, colecalciferol (nombre alternativo) (850) + TX, coumaclor (1004) + TX, coumafuril (1005) + TX, coumatetralil (175) + TX, crimidina (1009) + TX, difenacoum (246) + TX, difetialona (249) + TX, difacinona (273) + TX, ergocalciferol (301) + TX, flocoumafeno (357) + TX, fluoroacetamida (379) + TX, flupropadina (1183) + TX, clorhidrato de flupropadina (1183) + TX, gamma-HCH (430) + TX, HCH (430) + TX, cianuro de hidrógeno (444) + TX, yodometano (nombre de la IUPAC) (542) + TX, lindano (430) + TX, fosfuro de magnesio (nombre de la IUPAC) (640) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, norbormida (1318) + TX, fosacetim (1336) + TX, fosfina (nombre de la IUPAC) (640) + TX, fosforo [CCN] + TX, pindona (1341) + TX, arsenito de potasio [CCN] + TX, pirinurón (1371) + TX, escilirosida (1390) + TX, arsenito de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoroacetato de sodio (735) + TX, estricnina (745) + TX, sulfato de talio [CCN] + TX, warfarina (851) y fosfuro de zinc (640) + TX,

60 un sinergista seleccionado del grupo de sustancias constituido por piperonilato de 2-(2-butoxi)etilo (nombre IUPAC) (934) + TX, 5-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-hexilciclohex-2-enona (nombre IUPAC) (903) + TX, farnesol con nerolidol (nombre alternativo) (324) + TX, MB-599 (código de desarrollo) (498) + TX, MGK 264 (código de desarrollo) (296) + TX, butóxido de piperonilo (649) + TX, piprotal (1343) + TX, isómero de propilo (1358) + TX, S421 (código de desarrollo) (724) + TX, sesamex (1393) + TX, sesasmolina (1394) y sulfóxido (1406) + TX,

- un repelente de animales seleccionado del grupo de sustancias constituido por antraquinona (32) + TX, cloralosa (127) + TX, naftenato de cobre [CCN] + TX, oxiclورو de cobre (171) + TX, diazinón (227) + TX, dicitlopentadieno (nombre químico) (1069) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, metiocarb (530) + TX, piridin-4-amina (nombre IUPAC) (23) + TX, tiram (804) + TX, trimetacarb (840) + TX, naftenato de zinc [CCN] y ziram (856) + TX,
- 5 un virucida seleccionado del grupo de sustancias constituido por imanina (nombre alternativo) [CCN] y ribavirina (nombre alternativo) [CCN] + TX,
- un protector de heridas seleccionado del grupo de sustancias constituido por óxido mercúrico (512) + TX, octilina (590) y tiofanato de metilo (802) + TX,
- 10 y compuestos biológicamente activos que se seleccionan del grupo que consiste en azaconazol (60207-31-0) + TX, bitertanol [70585-36-3] + TX, bromuconazol [116255-48-2] + TX, ciproconazol [94361-06-5] + TX, difenoconazol [119446-68-3] + TX, diniconazol [83657-24-3] + TX, epoxiconazol [106325-08-0] + TX, fenbuconazol [114369-43-6] + TX, fluquinconazol [136426-54-5] + TX, flusilazol [85509-19-9] + TX, flutriafol [76674-21-0] + TX, hexaconazol [79983-71-4] + TX, imazalil [35554-44-0] + TX, imibenconazol [86598-92-7] + TX, ipconazol [125225-28-7] + TX,
- 15 metconazol [125116-23-6] + TX, miclobutanil [88671-89-0] + TX, pefurazoato [101903-30-4] + TX, penconazol [66246-88-6] + TX, prothioconazol [178928-70-6] + TX, pirifenox [88283-41-4] + TX, procloraz [67747-09-5] + TX, propiconazol [60207-90-1] + TX, simeconazol [149508-90-7] + TX, tebuconazol [107534-96-3] + TX, tetraconazol [112281-77-3] + TX, triadimefón [43121-43-3] + TX, triadimenol [55219-65-3] + TX, triflumizol [99387-89-0] + TX, triticonazol [131983-72-7] + TX, ancimidol [12771-68-5] + TX, fenarimol [60168-88-9] + TX, nuarimol [63284-71-9] + TX,
- 20 bupirimato [41483-43-6] + TX, dimetirimol [5221-53-4] + TX, etirimol [23947-60-6] + TX, dodemorf [1593-77-7] + TX, fenpropidina [67306-00-7] + TX, fenpropimorf [67564-91-4] + TX, espiroxamina [118134-30-8] + TX, tridemorf [81412-43-3] + TX, ciprodinilo [121552-61-2] + TX, mepanipirim [110235-47-7] + TX, pirimetanil [53112-28-0] + TX, fencpiclonil [74738-17-3] + TX, fludioxonilo [131341-86-1] + TX, benalaxilo [71626-11-4] + TX, furalaxilo [57646-30-7] + TX, metalaxilo [57837-19-1] + TX, metalaxil-R [70630-17-0] + TX, ofurace [58810-48-3] + TX, oxadixilo [77732-09-3] + TX, benomil [17804-35-2] + TX, carbendazim [10605-21-7] + TX, debacarb [62732-91-6] + TX, fuberidazol [3878-19-1] + TX, tiabendazol [148-79-8] + TX, clozolinato [84332-86-5] + TX, diclozolina [24201-58-9] + TX, iprodiona [36734-19-7] + TX, miclozolina [54864-61-8] + TX, procimidona [32809-16-8] + TX, vinclozolina [50471-44-8] + TX, boscalid [188425-85-6] + TX, carboxina [5234-68-4] + TX, fenfuram [24691-80-3] + TX, flutolanil [66332-96-5] + TX, metpronilo [55814-41-0] + TX, oxicarboxina [5259-88-1] + TX, pentiopirad [183675-82-3] + TX, tifluzamida [130000-40-7] + TX, guazatina [108173-90-6] + TX, dodina [2439-10-3] [112-65-2] (base libre) + TX, iminocadina [13516-27-3] + TX, azoxistrobina [131860-33-8] + TX, dimoxistrobina [149961-52-4] + TX, enestroburina {Proc. BCPC, Int. Congr., Glasgow, 2003, 1, 93} + TX, fluoxastrobina [361377-29-9] + TX, kresoxim-metilo [143390-89-0] + TX, metominostrobin [133408-50-1] + TX, trifloxistrobina [141517-21-7] + TX, orisastrobina [248593-16-0] + TX, picoxistrobina [117428-22-5] + TX, piraclostrobina [175013-18-0] + TX, ferbam [14484-64-1] + TX, mancozeb [8018-01-7] + TX, maneb [12427-38-2] + TX, metiram [9006-42-2] + TX, propineb [12071-83-9] + TX, tiram [137-26-8] + TX, zinab [12122-67-7] + TX, ziram [137-30-4] + TX, captafol [2425-06-1] + TX, captano [133-06-2] + TX, diclofluanid [1085-98-9] + TX, fluoroimid [41205-21-4] + TX, folpet [133-07-3] + TX, tolifluanid [731-27-1] + TX, mezcla bordeaux [8011-63-0] + TX, hidróxido de cobre [20427-59-2] + TX, cloruro de cobre [1332-40-7] + TX, sulfato de cobre [7758-98-7] + TX, óxido de cobre [1317-39-1] + TX, mancoque [53988-93-5] + TX, oxina-cobre [10380-28-6] + TX, dinocap [131-72-6] + TX, nitrotal-isopropil [10552-74-6] + TX, edifenfós [17109-49-8] + TX, iprobenfós [26087-47-8] + TX, isoprotiolano [50512-35-1] + TX, fosdifeno [36519-00-3] + TX, pirazofós [13457-18-6] + TX, tolclofós-metilo [57018-04-9] + TX, acibenzolar-S-metilo [135158-54-2] + TX, anilazina [101-05-3] + TX, bentiavalcarb [413615-35-7] + TX, blasticidina-S [2079-00-7] + TX, quinometonat [2439-01-2] + TX, cloroneb [2675-77-6] + TX, clorotalonil [1897-45-6] + TX, ciflufenamid [180409-60-3] + TX, cimoxanilo [57966-95-7] + TX, diclona [117-80-6] + TX, diclocimet [139920-32-4] + TX, diclomezina [62865-36-5] + TX, dicloran [99-30-9] + TX, dietofencarb [87130-20-9] + TX, dimetomorf [110488-70-5] + TX, SYP-LI90 (Flumorf) [211867-47-9] + TX, ditionona [3347-22-6] + TX, etaboxam [162650-77-3] + TX, etridiazol [2593-15-9] + TX, famoxadona [131807-57-3] + TX, fenamidona [161326-34-7] + TX, fenoxanilo [115852-48-7] + TX, fentin [668-34-8] + TX, ferimzona [89269-64-7] + TX, fluazinam [79622-59-6] + TX, fluopicolida [239110-15-7] + TX, flusulfamida [106917-52-6] + TX, fenhexamid [126833-17-8] + TX, fosetil-aluminio [39148-24-8] + TX, himexazol [10004-44-1] + TX, iprovalicarb [140923-17-7] + TX, IKF-916 (Ciazofamid) [120116-88-3] + TX, kasugamicina [6980-18-3] + TX, methasulfocarb [66952-49-6] + TX, metrafenona [220899-03-6] + TX, pencicuron [66063-05-6] + TX, ftalida [27355-22-2] + TX, polioxinas [11113-80-7] + TX, probenazol [27605-76-1] + TX, propamocarb [25606-41-1] + TX, proquinazid [189278-12-4] + TX, piroquilona [57369-32-1] + TX, quinoxifeno [124495-18-7] + TX, quintozeno [82-68-8] + TX, sulfuro [7704-34-9] + TX, tiadinilo [223580-51-6] + TX, triazoxida [72459-58-6] + TX, triciclazol [41814-78-2] + TX, triforina [26644-46-2] + TX, validamicina [37248-47-8] + TX, zoxamida (RH7281) [156052-68-5] + TX, mandipropamid [374726-62-2] + TX, isopirazam [881685-58-1] + TX, sedaxano [874967-67-6] + TX, N-ciclopentil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[[2-(1-metiletil)fenil]metil]-1H-pirazol-4-carboxamida (Número de registro CAS: 1255733-83-5) + TX, (9-diclorometileno-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida de 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (que se describe en el documento WO 2007/048556) + TX, 3-(difluorometil)-N-metoxi-1-metil-N-[1-metil-2-(2,4,6-triclorofenil)etil]-1H-pirazol-4-carboxamida + TX, [2-(2,4-diclorofenil)-2-metoxi-1-metil-etil]-amida de 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (que se describe en el documento WO 2008/148570) + TX, 1-[4-[4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona + TX, 1-[4-[4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-

dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona [1003318-67-9], ambas descritas en los documentos WO 2010/123791, WO 2008/013925, WO 2008/013622 y WO 2011/051243 page 20) +TX, (S)-[3-(4-Cloro-2-fluoro-fenil)-5-(2,4-difluoro-fenil)-isoxazol-4-il]-piridin-3-il-metanol + TX, 3-(4-Cloro-2-fluoro-fenil)-5-(2,4-difluoro-fenil)-isoxazol-4-il]-piridin-3-il-metanol + TX, (3',4'-dicloro-5-fluoro-1,1'-bifenil-2-il)-amida de ácido (3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (bixafeno) + TX, (N-{2-[3-Cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluorometil)benzamida (fluopiram) + TX, N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (Penflufen) + TX, 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona (CAS Reg. CAS No.: 1003318-67-9, oxatiapiprolin) + TX y (3',4',5'-trifluorobifenil-2-il)-amida de ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (que se describe en el documento WO 2006/087343) + TX, flupiradifurona (número de registro CAS 951659-40-8) + TX, afidopiropeno (número de registro CAS 915972-17-7) + TX, pasteuria penetrans y TX, pasteuria spp. + TX, bacillus firmus +TX, bacillus cereus + TX, bacillus subtilis + TX, pasteuria penetrans +TX.

Las referencias que se indican entre paréntesis luego de cada ingrediente activo, por ejemplo [3878-19-1], se refieren al número de Registro de Chemical Abstracts. Los componentes de las mezclas anteriormente descritos son conocidos. Cuando se incluyen los ingredientes activos en el manual de plaguicidas [The Pesticide Manual - A World Compendium; Decimotercera edición; Editor: C. D. S. Tomlin; Ministerio Británico de Protección de los Cultivos], se describen en este con el número de entrada que se indica entre paréntesis anteriormente en la presente para el compuesto particular, por ejemplo, el compuesto "abamectina" se describe con el número de entrada (1). Cuando precedentemente en la presente se agrega "[CCN]" al compuesto particular, el compuesto en cuestión se incluye en el compendio de nombres comunes de plaguicidas al cual se puede acceder a través de Internet [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright© 1995-2004]; así pues, por ejemplo, el compuesto "acetoprol" se describe en la dirección de Internet <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>.

Se hace referencia a la mayoría de los ingredientes activos descritos anteriormente mediante el denominado "nombre común", utilizándose el "nombre común ISO" u otro "nombre común" relevante en casos individuales. Si la designación no es un "nombre común", la naturaleza de la designación que se utilizará se proporciona entre paréntesis curvos para el compuesto particular, en cuyo caso, se utilizará el nombre de la IUPAC o nombre de IUPAC/Chemical Abstracts, un "nombre químico", un "nombre tradicional", un "nombre de compuesto" o un "código de desarrollo" o, si no se utiliza ninguna de estas designaciones ni un "nombre común", se empleará un "nombre alternativo". "No. de Registro CAS" significa "número de registro de Chemical Abstracts".

La mezcla de ingrediente activo de un compuesto de acuerdo con la fórmula (I) o un compuesto específico seleccionado de la Tabla 1 a 22 o un compuesto específico seleccionado de la Tabla T1 de la presente invención y un ingrediente activo tal como se describió anteriormente preferiblemente en la relación de mezcla de 100:1 a 1:6000, especialmente de 50:1 a 1:50, más especialmente en una relación de 20:1 a 1:20, aun más especialmente de 10:1 a 1:10, muy especialmente de 5:1 a 1:5, dándose preferencia especial a una relación de 2:1 a 1:2, y una relación de 4:1 a 2:1, siendo preferible del mismo modo, por encima de todo, una relación de 1:1, o 5:1, o 5:2, o 5:3, o 5:4, o 4:1, o 4:2, o 4:3, o 3:1, o 3:2, o 2:1, o 1:5, o 2:5, o 3:5, o 4:5, o 1:4, o 2:4, o 3:4, o 1:3, o 2:3, o 1:600, o 1:300, o 1:150, o 1:35, o 2:35, o 4:35, o 1:75, o 2:75, o 4:75, o 1:6000, o 1:3000, o 1:1500, o 1:350, o 2:350, o 4:350, o 1:750, o 2:750 o 4:750. Se sobreentenderá que estas relaciones de mezcla incluyen, por un lado, relaciones en peso y además, por otro lado, relaciones molares.

Las mezclas, tal como se describió anteriormente, pueden utilizarse en un método para controlar plagas que comprende aplicar una composición que comprende una mezcla tal como se describió anteriormente a las plagas o su entorno con excepción de un método para el tratamiento del cuerpo humano o animal mediante cirugía o terapia y métodos de diagnóstico llevados a cabo en el cuerpo humano o animal.

Las mezclas que comprenden un compuesto de acuerdo con la fórmula (I) o un compuesto específico seleccionado de la Tabla 1 a 22 o un compuesto específico seleccionado de la Tabla T1 de la presente invención y uno o más ingredientes activos como se describió anteriormente pueden aplicarse, por ejemplo, en una forma simple "pre-mezclada", en una mezcla en aerosol combinada compuesta por formulaciones separadas de los componentes del ingrediente activo simples, tal como una "mezcla en tanque", y en un uso combinado de los ingredientes activos simples cuando se aplican de forma secuencial, es decir, uno detrás del otro con un intervalo razonablemente corto, tal como algunas horas o días. El orden de aplicación de un compuesto de acuerdo con la fórmula (I) o un compuesto específico seleccionado de la Tabla 1 a 22 o un compuesto específico seleccionado de la Tabla T1 de la presente invención y los ingredientes activos tal como se describieron anteriormente no es esencial para el manejo de la presente invención.

Las composiciones también pueden comprender otros auxiliares sólidos o líquidos, tales como estabilizadores, por ejemplo, aceites vegetales epoxidados o no epoxidados (por ejemplo aceite de coco, aceite de colza o aceite de soja epoxidado), antiespumantes, por ejemplo, aceite de silicona, conservantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes y/o adherentes, fertilizantes u otros ingredientes activos para lograr efectos específicos, por ejemplo, bactericidas, fungicidas, nematocidas, activadores de plantas, molusquicidas o herbicidas.

Las composiciones se preparan de una manera conocida, en ausencia de auxiliares, por ejemplo, moliendo, tamizando y/o comprimiendo un compuesto sólido de la presente invención y en presencia de al menos un auxiliar,

por ejemplo, mezclando y/o moliendo bien el compuesto de la presente invención con el o los auxiliares. Estos procesos para la preparación de las composiciones y el uso de los compuestos para la preparación de estas composiciones constituyen también un objeto de la invención.

5 Los métodos de aplicación para las composiciones, es decir, los métodos para el control de plagas del tipo mencionado anteriormente, tales como pulverización, atomización, esparcimiento, cepillado, preparación, esparcimiento o volcado - que deben seleccionarse para adecuarse a los objetivos pretendidos de las circunstancias prevalentes - y el uso de las composiciones para controlar las plagas del tipo mencionado anteriormente son otros objetos de la invención. Tasas de concentración típicas se encuentran entre 0.1 y 1000 ppm, preferiblemente entre 0.1 y 500 ppm, de ingrediente activo. La tasa de aplicación por hectárea es generalmente de 1 a 2000 g del
10 ingrediente activo por hectárea, en particular 10 a 1000 g/ha, preferiblemente 10 a 600 g/ha.

Un método preferido de aplicación en el campo de la protección de cultivos es la aplicación al follaje de las plantas (aplicación foliar), siendo posible seleccionar la frecuencia y la tasa de aplicación según el peligro de infestación con la plaga en cuestión.

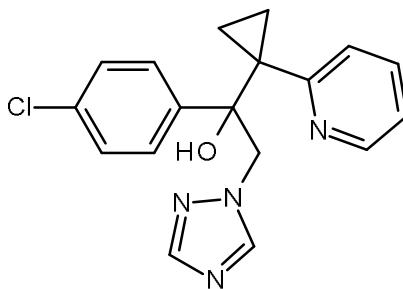
15 Alternativamente, el ingrediente activo puede llegar a las plantas por medio de un sistema de raíz (acción sistémica), empapando el locus de las plantas con una composición líquida o incorporando el ingrediente activo en forma sólida en el locus de las plantas, por ejemplo, en el suelo, por ejemplo, en forma de gránulos (aplicación al suelo). En el caso de cultivos de arroz, dichos gránulos pueden medirse y colocarse en los campos inundados.

20 Las composiciones de acuerdo con la invención son también adecuadas para la protección del material de propagación de plantas, por ejemplo, semillas tales como frutos, tubérculos o granos, o plantas de invernadero, contra plagas del tipo mencionado anteriormente. El material de propagación vegetal puede tratarse con las composiciones antes de plantarse, por ejemplo, pueden tratarse las semillas antes de sembrar. Alternativamente, las composiciones también pueden aplicarse a pepitas de semillas (recubrimiento), remojando las pepitas en una composición líquida o aplicando una capa de una composición sólida. Es también posible aplicar las composiciones cuando el material de propagación se planta en el sitio de aplicación, por ejemplo, en el surco de la semilla durante
25 la siembra. Estos métodos de tratamiento para el material de propagación vegetal y el material de propagación vegetal de esta forma tratado son objetos adicionales de la invención

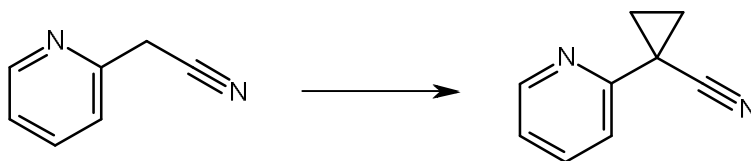
Los siguientes ejemplos no taxativos ilustran la invención anteriormente descrita en mayor detalle sin limitarla.

30 Los compuestos de la invención pueden distinguirse de los compuestos conocidos en virtud de una mayor eficacia a tasas de aplicación bajas, lo que puede ser verificado por el experto en la técnica usando los procedimientos experimentales descritos en los Ejemplos, usando tasas de aplicación más bajas si es necesario, por ejemplo 50 ppm, 12.5 ppm, 6 ppm, 3 ppm, 1.5 ppm o 0.8 ppm.

Ejemplo 1: Síntesis de 1-(4-clorofenil)-1-[1-(2-piridil)ciclopropil]-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.



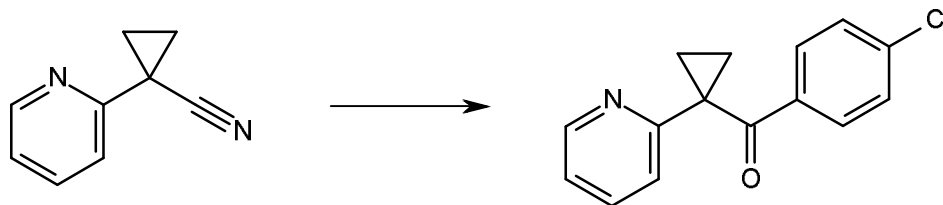
Paso 1: Síntesis de 1-(2-piridil)ciclopropanocarbonitrilo



35 Una solución acuosa de hidróxido de sodio (40 mL, 7.5 M) se agregó a una solución de 2-(2-piridil)acetonitrilo (3.00 g, 25.4 mmol), 1,2-dibromometano (4.77 g, 25.4 mmol) y tetrabutilcloruro de amonio (7.08 g, 25.4 mmol) en acetonitrilo (40 mL) a temperatura ambiente. La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante cuatro horas y luego se extrajo con acetato de etilo (2 x 50 mL). Los extractos combinados se lavaron con salmuera (1 x 40
40 mL), se secaron sobre sulfato de magnesio y se filtraron. Los disolventes se eliminaron a presión reducida y el

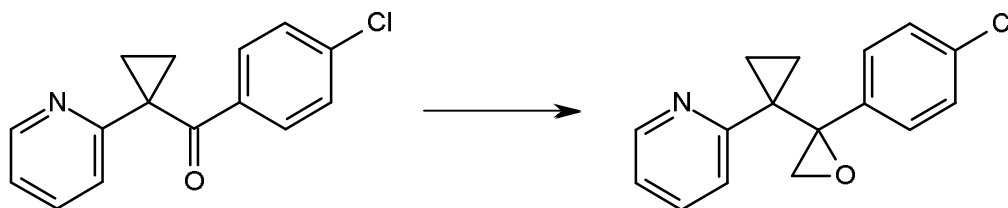
residuo se purificó mediante cromatografía instantánea para proporcionar 1,7 g de 1-(2-piridil)ciclopropanocarbonitrilo como un sólido blanco.

Paso 2: Síntesis de (4-clorofenil)-[1-(2-piridil)ciclopropil]metanona



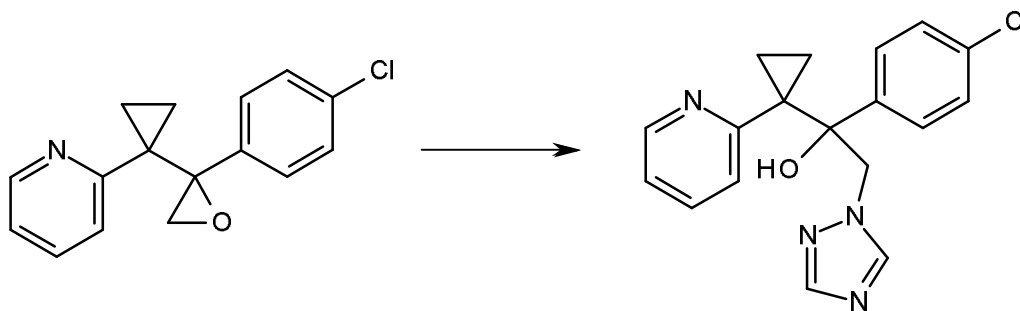
- 5 A una solución de 1-(2-piridil)ciclopropanocarbonitrilo (500 mg, 3.47 mmol) en tetrahidrofurano (10 mL) se agregó lentamente bromo-(4-clorofenil)magnesio (3.8 ml, 1M en THF, 3.8 mmol) a 0 °C. La mezcla de reacción se agitó durante una hora a 0 °C y luego se dejó entibiar hasta alcanzar temperatura ambiente y se agitó durante toda la noche. La mezcla de reacción se aplacó con ácido clorhídrico 0.5 M (20 mL) y luego se extrajo con acetato de etilo (2 x 40 mL). Las capas combinadas se lavaron con salmuera (1 x 40 mL), se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y luego se concentraron a presión reducida. El producto bruto se purificó mediante cromatografía instantánea para proporcionar 0.89 g de (4-clorofenil)-[1-(2-piridil)ciclopropil]metanona.

Paso 3: Síntesis de 2-[1-[2-(4-clorofenil)oxiran-2-il]ciclopropil]piridina



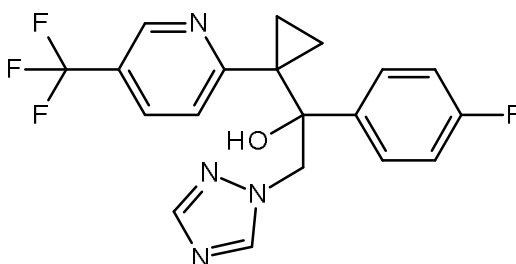
- 15 Se colocó hidruro de sodio (60% dispersión en aceite mineral, 70 mg, 1.75 mmol) bajo nitrógeno y luego se agregó dimetil sulfóxido (5 mL). Se agregó yoduro de trimetilsulfonio (360 mg, 1.75 mmol) como un sólido después de 15 minutos y luego, después de 30 minutos más, (4-clorofenil)-[1-(2-piridil)ciclopropil]metanona (410 mg, 1.59 mmol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 24 horas y luego se diluyó con acetato de etilo (30 mL). La mezcla de reacción se lavó con agua (15 mL) y salmuera (15 mL). La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró a presión reducida para proporcionar el producto bruto. El producto bruto se purificó mediante cromatografía instantánea para proporcionar el producto deseado con un material desconocido. Esto se utilizó como tal en el siguiente paso.

Paso 4: Síntesis de 1-(4-clorofenil)-1-[1-(2-piridil)ciclopropil]-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

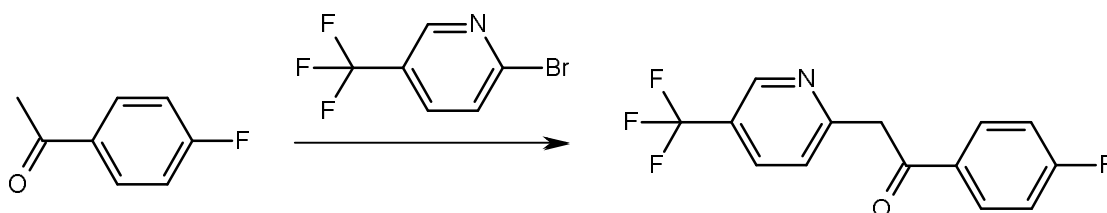


- 25 Se mezclaron carbonato de potasio (195 mg, 1.93 mmol), 1,2,4-triazol (134 mg, 1.93 mmol) y 2-[1-[2-(4-clorofenil)oxiran-2-il]ciclopropil]piridina (350 mg, 1.29 mmol) en dimetilformamida (10 mL) y se agitaron durante toda la noche a 60 °C. Se agregaron 20 mL de agua y 20 mL de acetato de etilo y la capa orgánica se separó. La fase orgánica se lavó con salmuera (10 mL), se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se evaporó a presión reducida para proporcionar el producto bruto. El producto bruto se purificó mediante cromatografía instantánea para proporcionar 1-(4-clorofenil)-1-[1-(2-piridil)ciclopropil]-2-(1,2,4-triazol-1-il)etanol.

- 30 Ejemplo 2: Preparación de 1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)-1-[1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]ciclopropil]etanol

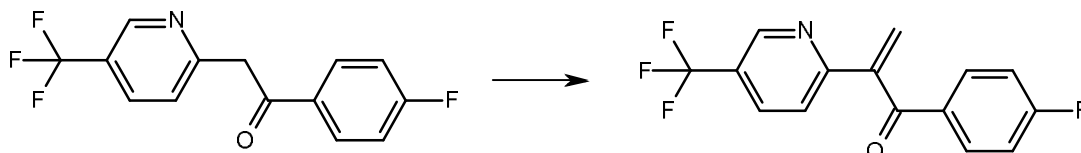


Paso 1: Síntesis de 1-(4-fluorofenil)-2-[5-(trifluorometil)-2-piridil]etanona



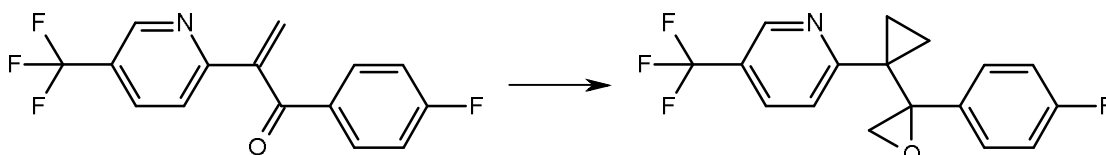
5 Se dispersó hidruro de sodio (60% dispersión en aceite mineral, 796 mg, 19.9 mmol) en tetrahidrofurano (15 ml) y se calentó hasta alcanzar 55 °C con agitación mecánica. Una solución de 1-(4-fluorofenil)etanona (1.83 g, 13.3 mmol) y 2-bromo-5-(trifluorometil)piridina (3.00 g, 13.3 mmol) en tetrahidrofurano (15 ml) se agregó durante un período de 10 minutos. Después de 10 horas más a reflujo, la mezcla se enfrió hasta alcanzar 0 °C y el exceso de hidruro de sodio se aplacó mediante adición de una solución de metanol en éter dietílico durante una hora. La mezcla se dividió entre éter (25 ml) y salmuera (25 ml). La capa orgánica se lavó con salmuera (25 ml). Las capas acuosas combinadas se lavaron con éter dietílico (25 ml). Las capas de éter dietílico combinadas se secaron sobre sulfato de sodio, se filtraron y se evaporaron a presión reducida hasta obtener un sólido oscuro que luego se purificó mediante cromatografía instantánea para proporcionar 1.93 g de 1-(4-fluorofenil)-2-[5-(trifluorometil)-2-piridil]etanona.

Paso 2: Síntesis de 1-(4-fluorofenil)-2-[5-(trifluorometil)-2-piridil]prop-2-en-1-ona



15 Se agregó lentamente anhídrido acético (2.87 g, 27.3 mmol) a una suspensión en agitación de 1-(4-fluorofenil)-2-[5-(trifluorometil)-2-piridil]etanona (1.93 g 6.81 mmol) en N,N,N',N'-tetrametilmetanodiamina (4.65 ml, 34.1 mmol) a 0°C provocando la disolución inmediata. La cromatografía de capa fina mostró la conversión completa después de 5 minutos y la mezcla se dividió entre metil *terc*-butil éter (25 ml) y agua (25 ml) mediante la adición de estos disolventes y separación de las capas. La capa orgánica se lavó con salmuera (20 ml), se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se evaporó a presión reducida para obtener el material bruto que se purificó mediante cromatografía instantánea para proporcionar 1.4 g de 1-(4-fluorofenil)-2-[5-(trifluorometil)-2-piridil]prop-2-en-1-ona

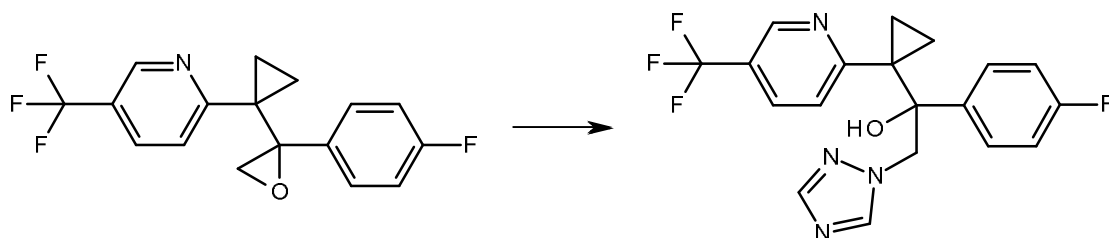
Paso 3: Síntesis de 2-[1-[2-(4-fluorofenil)oxiran-2-il]ciclopropil]-5-(trifluorometil)piridina:



25 Se colocó hidruro de sodio (60% dispersión en aceite mineral, 400 mg, 10 mmol) bajo nitrógeno y luego se agregó DMSO (20 ml). Se agregó yoduro de trimetilsulfonio (2.20 g, 10 mmol) como un sólido después de 15 minutos y luego de 30 minutos más se agregó 1-(4-fluorofenil)-2-[5-(trifluorometil)-2-piridil]prop-2-en-1-ona (1.4 g, 4.7 mmol). La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 24 horas, luego se diluyó con acetato de etilo (50 ml) y se lavó con agua (20 ml) y salmuera (20 ml). La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y se concentró para proporcionar el compuesto bruto. El producto se purificó mediante cromatografía instantánea para proporcionar 2-[1-[2-(4-fluorofenil)oxiran-2-il]ciclopropil]-5-(trifluorometil)piridina que aún no era puro; sin embargo se utilizó como

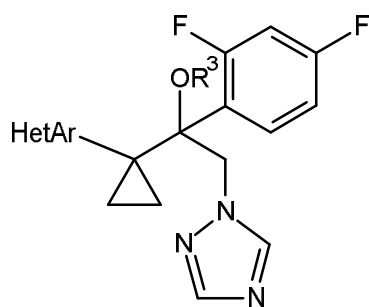
tal en el siguiente paso.

Paso 4: Síntesis de 1-(4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)-1-[1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]ciclopropil]etanol



- 5 Se mezclaron 1H-1,2,4-triazol (256 mg, 3.71 mmol), carbonato de potasio (375 mg, 3.71 mmol), dimetilformamida (5 ml) y 2-[1-[2-(4-fluorofenil)oxiran-2-il]ciclopropil]-5-(trifluorometil)piridina (800 mg, 2.47 mmol) y se dejaron reaccionar 2 horas a 100 grados. Luego se agregaron 20 mL de agua y 20 mL de acetato de etilo y la capa orgánica se separó. La fase orgánica se lavó con salmuera (25 ml), se secó sobre sulfato de magnesio, se filtró y el filtrado se concentró al vacío para proporcionar el producto bruto. El aceite naranja luego se absorbió sobre sílice y se purificó mediante cromatografía instantánea utilizando un gradiente de ciclohexano 100% a acetato de etilo puro para proporcionar 1-
- 10 (4-fluorofenil)-2-(1,2,4-triazol-1-il)-1-[1-[5-(trifluorometil)-2-piridil]ciclopropil]etanol.

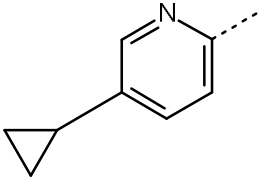
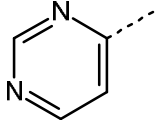
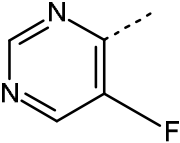
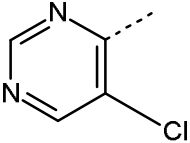
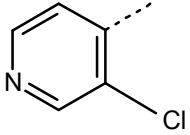
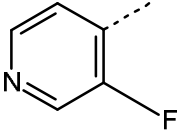
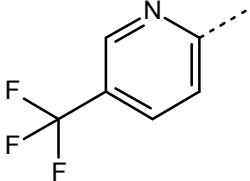
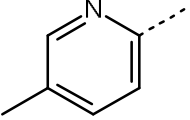
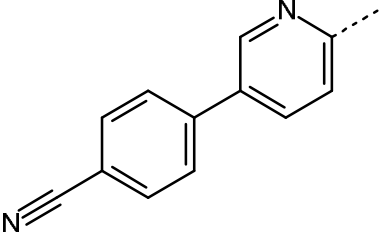
Tabla 1: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de fórmula (T-1) en donde R³ es hidrógeno y

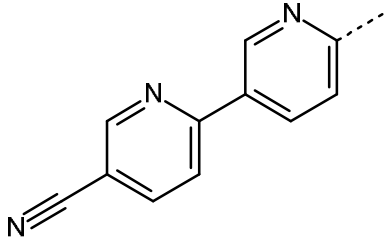
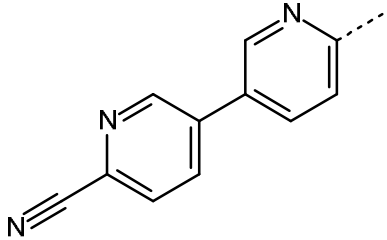
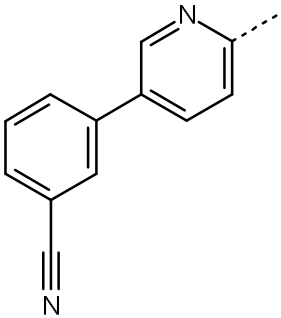
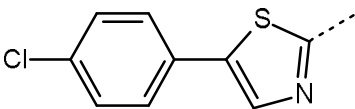
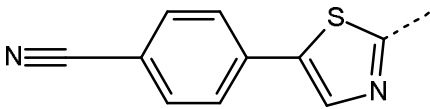
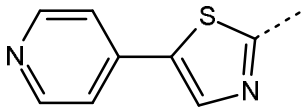
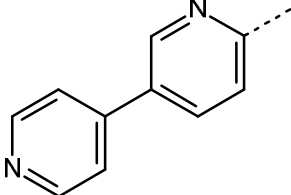


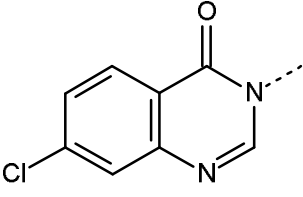
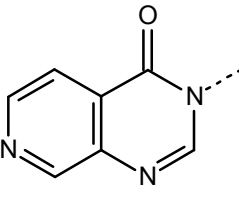
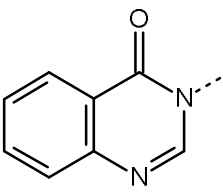
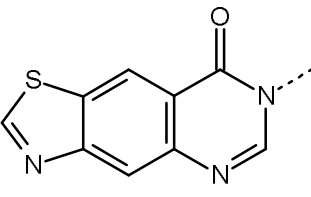
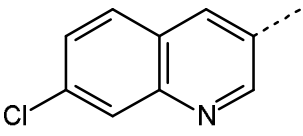
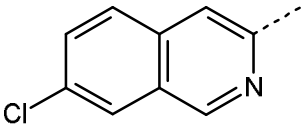
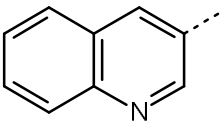
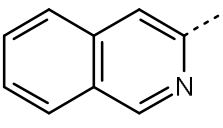
(T-1)

en donde HetAr es tal como se define a continuación en la tabla (la línea punteada muestra dónde HetAr se une a la molécula)

No.	HetAr
1.001	
1.002	
1.003	

No.	HetAr
1.004	 <chem>C1CC1c2ccncc2</chem>
1.005	 (no acorde con la invención)
1.006	 (no acorde con la invención)
1.007	 (no acorde con la invención)
1.008	 <chem>Clc1ccncc1</chem>
1.009	 <chem>Fc1ccncc1</chem>
1.010	 <chem>FC(F)(F)c1ccncc1</chem>
1.011	 <chem>Cc1ccncc1</chem>
1.012	 <chem>N#Cc1ccc(cc1)c2ccncc2</chem>

No.	HetAr
1.013	
1.014	
1.015	
.016	 <p data-bbox="427 1323 730 1352">(no acorde con la invención)</p>
1.017	 <p data-bbox="427 1498 730 1527">(no acorde con la invención)</p>
1.018	 <p data-bbox="427 1673 730 1702">(no acorde con la invención)</p>
1.019	

No.	HetAr
1.020	 <p>(no acorde con la invención)</p>
1.021	 <p>(no acorde con la invención)</p>
1.022	 <p>(no acorde con la invención)</p>
1.023	 <p>(no acorde con la invención)</p>
1.024	 <p>(no acorde con la invención)</p>
1.025	 <p>(no acorde con la invención)</p>
1.026	 <p>(no acorde con la invención)</p>
1.027	 <p>(no acorde con la invención)</p>

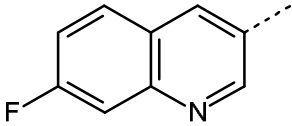
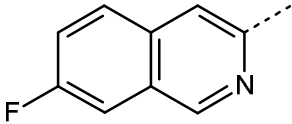
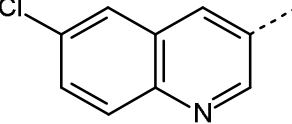
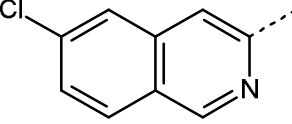
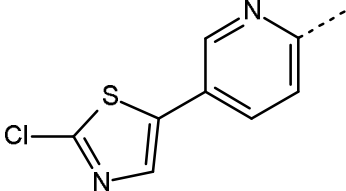
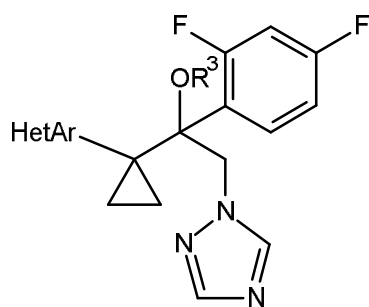
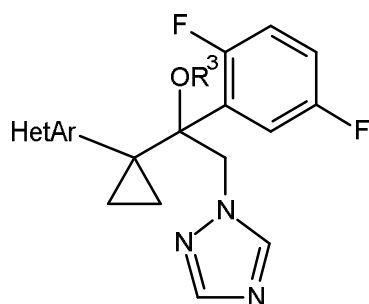
No.	HetAr
1.028	 (no acorde con la invención)
1.029	 (no acorde con la invención)
1.030	 (no acorde con la invención)
1.031	 (no acorde con la invención)
1.032	

Tabla 2: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de la fórmula (T-1), en donde R^3 es metilo y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.



(T-1)

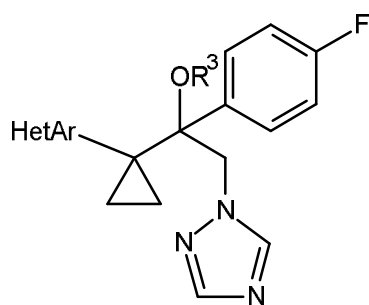
- 5 Tabla 3: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de fórmula (T-2), en donde R^3 es hidrógeno y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.



(T-2)

Tabla 4: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de la fórmula (T-2), en donde R³ es metilo y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.

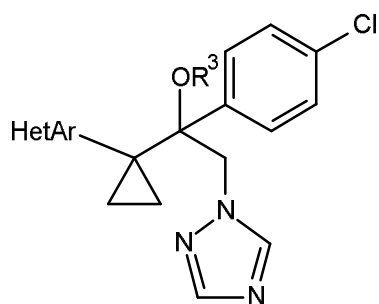
5 Tabla 5: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de fórmula (T-3), en donde R³ es hidrógeno y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.



(T-3)

Tabla 6: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de la fórmula (T-3), en donde R³ es metilo y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.

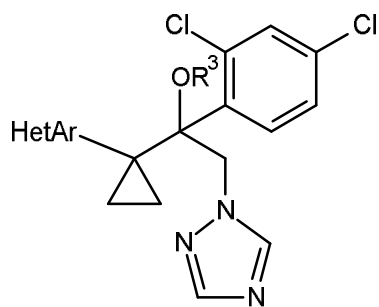
10 Tabla 7: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de fórmula (T-4), en donde R³ es hidrógeno y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.



(T-4)

Tabla 8: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de la fórmula (T-4), en donde R³ es metilo y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.

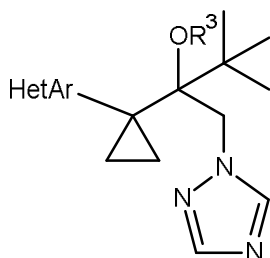
15 Tabla 9: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de fórmula (T-5), en donde R³ es hidrógeno y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.



(T-5)

Tabla 10: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de la fórmula (T-5), en donde R^3 es metilo y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.

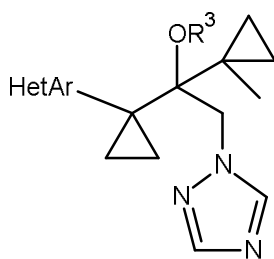
5 Tabla 11: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de fórmula (T-6), en donde R^3 es hidrógeno y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.



(T-6)

Tabla 12: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de la fórmula (T-6), en donde R^3 es metilo y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.

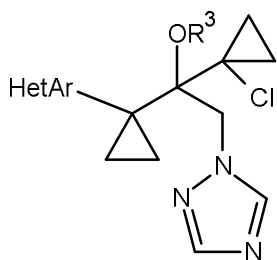
10 Tabla 13: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de fórmula (T-7), en donde R^3 es hidrógeno y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.



(T-7)

Tabla 14: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de la fórmula (T-7), en donde R^3 es metilo y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.

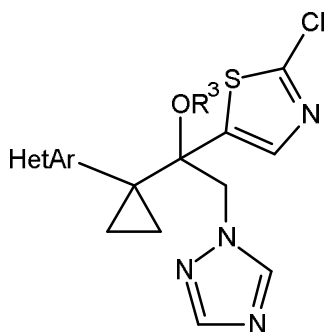
15 Tabla 15: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de fórmula (T-8), en donde R^3 es hidrógeno y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.



(T-8)

Tabla 16: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de la fórmula (T-8), en donde R³ es metilo y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.

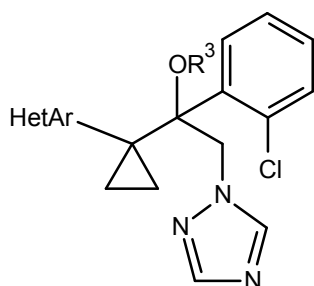
5 Tabla 17: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de fórmula (T-9), en donde R³ es hidrógeno y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.



(T-9)

Tabla 18: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de la fórmula (T-9), en donde R³ es metilo y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.

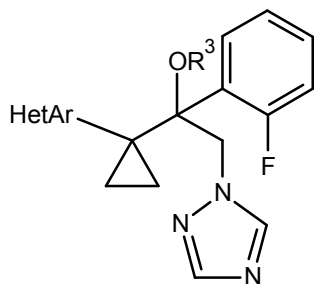
10 Tabla 19: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de fórmula (T-10), en donde R³ es hidrógeno y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.



(T-10)

Tabla 20: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de la fórmula (T-10), en donde R³ es metilo y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.

15 Tabla 21: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de fórmula (T-11), en donde R³ es hidrógeno y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.



(T-11)

Tabla 22: Esta tabla describe 32 compuestos específicos de la fórmula (T-11), en donde R³ es metilo y HetAr es tal como se define en la Tabla 1.

5 La Tabla T1 muestra datos seleccionados de la LCMS y tiempos de retención/ión molecular como compuestos ejemplares similares a los descritos en las Tablas 1 a 22.

El método analítico utilizado se describe en la presente a continuación:

Espectrómetro de masas ACQUITY SQD de Waters (espectrómetro de masas de cuadrupolo único)

Método de ionización: Electropulverización

Polaridad: iones positivos

10 Capilaridad (kV) 3.00, Cono (V) 20.00, Extractor (V) 3.00, Temperatura de la fuente (°C) 150, Temperatura de desolvatación (°C) 400, Flujo de gas del cono (L/Hr) 60, Flujo de gas de desolvatación (L/Hr) 700

Rango de masa: 100 a 800 Da

Intervalo de longitud de onda de DAD (nm): 210 a 400

Método Waters ACQUITY UPLC con las siguientes condiciones de gradiente de HPLC

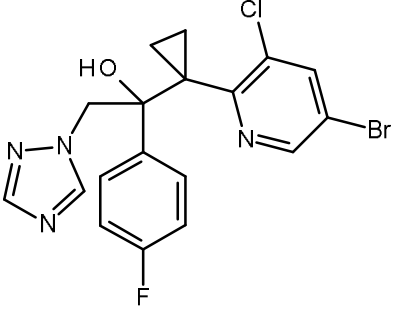
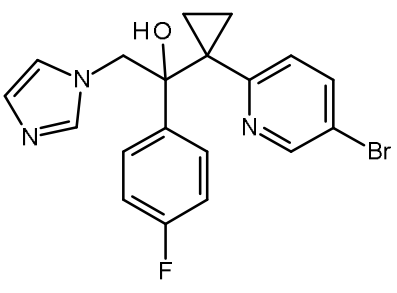
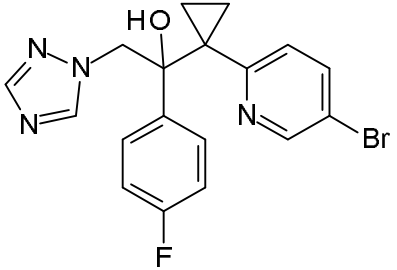
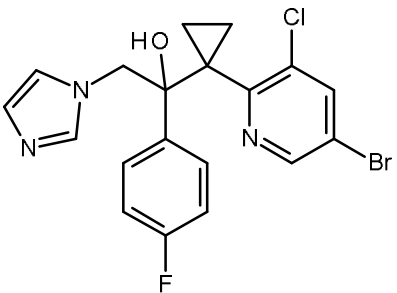
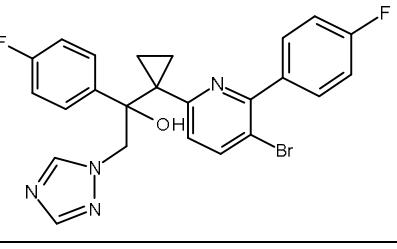
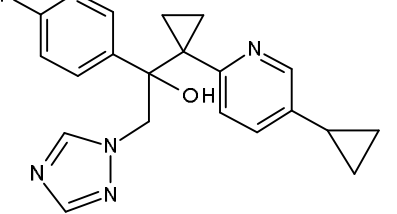
15 (Disolvente A: Agua/Metanol 9:1, 0.1% ácido fórmico y Disolvente B: Acetonitrilo, 0.1% ácido fórmico)

Tiempo (minutos)	A (%)	B (%)	Tasa de flujo (ml/min)
0	80	20	1.5
0.1	75	25	1.5
0.2	70	30	0.75
1.20	0	100	0.75
1.40	0	100	0.75
1.45	80	20	0.75

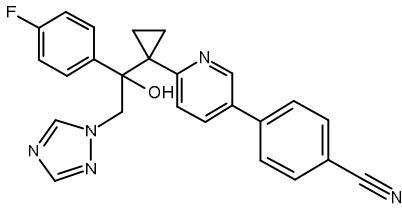
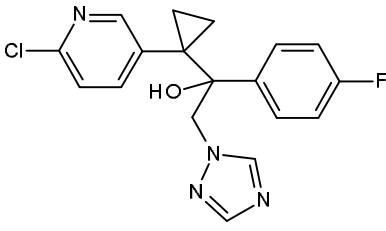
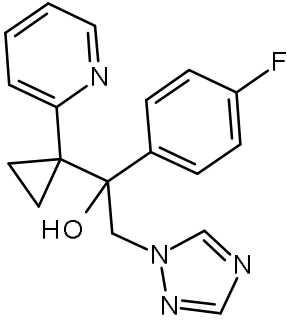
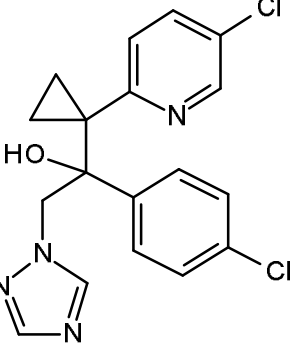
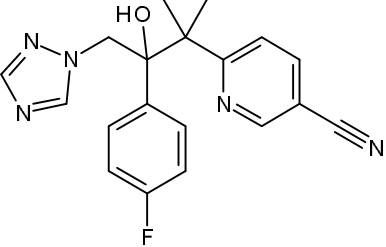
Tipo de columna: Waters ACQUITY UPLC HSS T3; Longitud de la columna: 30 mm; Diámetro interno de la columna: 2.1 mm; Tamaño de partícula: 1.8 micrones; Temperatura: 60°C.

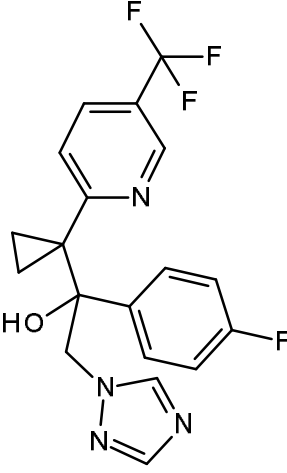
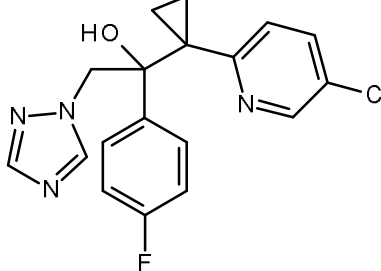
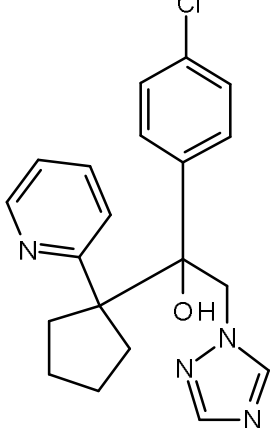
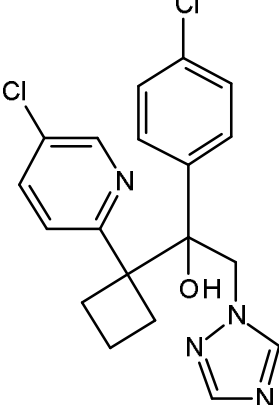
Tabla T1: Datos de puntos de fusión y/o tiempos de retención para compuestos:

Entrada	ESTRUCTURA	TR (min)	[M+H] ⁺ (medido)
1		0.71	341

2		1.07	439
3		0.74	404
4		0.97	405
5		0.82	438
6		1.11	497
7		0.75	365

ES 2 621 386 T3

8		0.96	426
9		0.89	359
10		0.62	325
11		1.00	375
12		0.84	350

13		0.98	393
14		0.94	359
15		0.93	369
16		1.08	389

17		1.04	417
18		1.17	499
19		1.17	467

Ejemplos de formulación para los compuestos de fórmula (I):

Ejemplo F-1.1 a F-1.2: Concentrados emulsionables

Componentes	F-2.1	F-2.2
Un compuesto seleccionado de las Tablas 2 a 22 y la Tabla T1	25%	50%
dodecibencenosulfonato de calcio	5%	6%
polietilenglicoléter de aceite de ricino (unidades de etilenoxi de 36 moles)	5%	-
tributilfenolpolietilenglicoléter (unidades de etilenoxi de 30 moles)	-	
ciclohexanona	-	20%
mezcla de xileno	65%	20%

5

Pueden prepararse emulsiones de cualquier concentración deseada diluyendo dichos concentrados con agua.

Ejemplo F-2: Concentrado emulsionable

Componentes	F-2
Un compuesto seleccionado de las Tablas 2 a 22 y la Tabla T1	10%
octilfenolpolietilenglicoléter (unidades de etilenoxi de 4 a 5 moles)	3%
Dodecibencenosulfonato de calcio	3%
poliglicoléter de aceite de ricino (unidades de etilenoxi de 36 moles)	4%
ciclohexanona	30%
mezcla de xileno	50%

Pueden prepararse emulsiones de cualquier concentración deseada diluyendo dichos concentrados con agua.

Ejemplos F-3.1 a F-3.4: Soluciones

Componentes	F-3.1	F-3.2	F-3.3	F-3.4
Un compuesto seleccionado de las Tablas 2 a 22 y la Tabla T1	80%	10%	5%	95%
Propilenglicol monometil éter	20%	-	-	-
polietilenglicol (masa molecular relativa: 400 unidades de masa atómica)	-	70%	-	-
N-metilpirrolid-2-ona	-	20%	-	-
aceite de coco epoxidado	-	-	1%	5%
bencina (rango de ebullición: 160-190°)	-	-	94%	-
Las soluciones son adecuadas para su uso en forma de microgotas.				

5 Ejemplos F-4.1 a F-4.4: Granulados

Componentes	F-4.1	F-4.2	F-4.3	F-4.4
Un compuesto seleccionado de las Tablas 2 a 22 y la Tabla T1	5%	10%	8%	21%
Caolína	94%	-	79%	54%
ácido silícico altamente disperso	1%	-	13%	7%
Atapulgita	-	90%	-	18%

El compuesto novedoso se disuelve en diclorometano, la solución se pulveriza en el portador y el disolvente se quita luego por destilación al vacío.

Ejemplos F-5.1 y F-5.2: Polvos

Componentes	F-5.1	F-5.2
Un compuesto seleccionado de las Tablas 2 a 22 y la Tabla T1	2%	5%
ácido silícico altamente disperso	1%	5%
Talco	97%	-
Caolína	-	90%

10

Los polvos listos para su uso se obtienen mezclando bien todos los componentes.

Ejemplos F-6.1 a F-6.3: Polvos humectables

Componentes	F-6.1	F-6.2	F-6.3
Un compuesto seleccionado de las Tablas 2 a 22 y la Tabla T1	25%	50%	75%
sulfonato de lignina de sodio	5%	5%	-
laurilsulfato de sodio	3%	-	5%
diisobutilnaftaleno sulfonato de sodio	6%	10%	-
octilfenolpolietilenglicol éter (unidades de etileno de 7 a 8 moles)	2%	-	-
ácido silícico altamente disperso	5%	10%	10%
Caolína	62%	27%	-

15

Todos los componentes se mezclan y la mezcla se muele completamente en un molino adecuado para proporcionar polvos humectables que puedan diluirse con agua hasta obtener suspensiones de cualquier concentración deseada.

Ejemplo F7: Concentrado fluido para tratamiento de semillas

Componentes	F-7
Un compuesto seleccionado de las Tablas 2 a 22 y la Tabla T1	40 %
propilenglicol	5 %
copolímero de butanol PO/EO	2 %
triestirenofenol con 10-20 moles EO	2 %
1,2-bencisotiazolin-3-ona (en forma de una solución en agua al 20%)	0.5 %
Sal de calcio de pigmento monoazo	5 %
Aceite de silicona (en forma de una emulsión en agua al 75%)	0.2 %

Agua	45.3 %
------	--------

El ingrediente activo finamente molido se mezcla a fondo con los adyuvantes, proporcionando un concentrado de suspensión a partir del cual pueden obtenerse suspensiones de cualquier dilución deseada por dilución con agua. Utilizando dichas diluciones, las plantas vivas, al igual que el material de propagación de planta, pueden tratarse y protegerse contra la infestación por microorganismos por pulverizado, vertido o inmersión.

Ejemplos biológicos:

Estos ejemplos ilustran las propiedades fungicidas de los compuestos descritos en la tabla T1.

Ejemplo biológico 1: actividad fungicida contra *Blumeria graminis* f. sp. *tritici* (*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*) / trigo / preventivo de disco de hoja (mildíu polvoriento en el trigo)

10 Segmentos de hoja del trigo cv. Kanzler se colocaron sobre agar en una placa de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizaron con el compuesto de prueba formulado diluido en agua. Los discos de hoja se inocularon agitando las placas infectadas con mildíu polvoriento sobre las placas de prueba 1 día después de la aplicación. Los
15 discos de hojas inoculados se incubaron a 20°C y 60% de hr en un régimen de luz de 24 h de oscuridad y luego con 12 h de luz / 12 h de oscuridad en una cámara climatizada y la actividad de un compuesto se evaluó como el control porcentual de la enfermedad en comparación con un testigo sin tratar cuando aparece un nivel de daño por la enfermedad apropiado en segmentos de hojas de verificación sin tratar (6 – 8 días después de la aplicación).

Los compuestos (de la tabla T1) 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18 y 19 a 200 ppm proporcionan al menos 80% de control de la enfermedad en esta prueba cuando se comparan con los discos de hoja testigo sin tratar en las mismas condiciones, que muestran un gran desarrollo de la enfermedad.

Ejemplo biológico 2: actividad fungicida contra *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* / trigo / preventivo de disco de hoja (roya marrón)

25 Segmentos de hoja del trigo cv. Kanzler se colocaron sobre agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizaron con el compuesto de prueba formulado diluido en agua. Los discos de hojas se inocularon con una suspensión de esporas del hongo 1 día después de la aplicación. Los segmentos de hojas inoculados se incubaron a 19°C y 75% de hr en un régimen de luz de 12 h luz / 12 h oscuridad en un gabinete climatizado y la actividad de un compuesto se evaluó como el control porcentual de la enfermedad en comparación con un testigo sin tratar cuando aparece un nivel de daño por la enfermedad apropiado en segmentos de hojas de verificación sin tratar (7 – 9 días después de la aplicación).

30 Los compuestos (de la tabla T1) 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16 y 17 a 200 ppm proporcionan al menos 80% de control de la enfermedad en esta prueba cuando se comparan con los discos de hoja testigo sin tratar en las mismas condiciones, que muestran un gran desarrollo de la enfermedad.

Ejemplo biológico 3: actividad fungicida contra *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* / trigo / curativo de disco de hoja (roya marrón)

35 Segmentos de hoja de trigo se colocan sobre agar en placas de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos). Los discos de hoja se inoculan luego con una suspensión de esporas del hongo. Un día después de la inoculación, se aplica la solución de prueba. Después de la incubación apropiada, se evalúa la actividad de un compuesto 8 dpi (días después de la inoculación) como actividad fungicida curativa. Rango de dosis: 200-22 ppm.

40 Los compuestos (de la tabla T1) 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16 y 17 a 200 ppm proporcionan al menos 80% de control de la enfermedad en esta prueba cuando se comparan con los discos de hoja testigo sin tratar en las mismas condiciones, que muestran un gran desarrollo de la enfermedad.

Ejemplo biológico 4: actividad fungicida contra *Pyrenophora teres* / cebada / preventivo de disco de hoja (manchas reticulares)

45 Segmentos de hoja de cebada cv. Hasso se colocaron sobre agar en una placa de múltiples pocillos (formato de 24 pocillos) y se pulverizaron con el compuesto de prueba formulado diluido en agua. Los segmentos de hojas se inocularon con una suspensión de esporas del hongo 2 días después de la aplicación. Los segmentos de hojas inoculados se incubaron a 20°C y 65% de hr en un régimen de luz de 12 h luz / 12 h oscuridad en un gabinete climatizado y la actividad de un compuesto se evaluó como el control de la enfermedad en comparación con un testigo sin tratar cuando aparece un nivel de daño por la enfermedad apropiado en segmentos de hojas de verificación sin tratar (5 – 7 días después de la aplicación).

50 Los compuestos (de la tabla T1) 3, 4, 7, 10, 11, 13 y 14 a 200 ppm proporcionan un control de al menos 80% de la enfermedad en esta prueba al compararse con discos de hojas testigo sin tratar en las mismas condiciones que muestran un gran desarrollo de la enfermedad.

Ejemplo biológico 5: actividad fungicida contra *Botryotinia fuckeliana* (*Botrytis cinerea*) / cultivo líquido (moho gris)

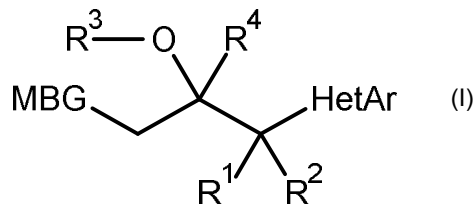
- 5 Se mezclaron conidias de hongos procedentes de un depósito criogénico directamente en un caldo de nutrientes (caldo de Vogels). Después de colocar una solución (DMSO) del compuesto de prueba en una placa de microtitulación (formato de 96 pocillos), se añadió el caldo nutritivo que contiene las esporas fúngicas. Las placas de prueba se incubaron a 24°C y la inhibición del crecimiento se determinó fotométricamente 3-4 días después de la aplicación.
- Los compuestos (de la tabla T1) 1, 4, 11 y 17 a 200 ppm proporcionan un control de al menos 80% de la enfermedad en esta prueba al compararse con discos de hojas testigo sin tratar en las mismas condiciones que muestran un gran desarrollo de la enfermedad.
- 10 Ejemplo biológico 6: actividad fungicida contra *Mycosphaerella arachidis* (*Cercospora arachidicola*) / cultivo líquido (mancha de la hoja temprana)
- 15 Se mezclaron conidias de hongos procedentes de un depósito criogénico directamente en un caldo de nutrientes (caldo de dextrosa de papa PDB). Después de colocar una solución (DMSO) del compuesto de prueba en una placa de microtitulación (formato de 96 pocillos), se añadió el caldo nutritivo que contiene las esporas fúngicas. Las placas de prueba se incubaron a 24°C y la inhibición del crecimiento se determinó fotométricamente 4-5 días después de la aplicación.
- Los compuestos (de la tabla T1) 1, 2, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 13, 14, 15, 16, 17, 18 y 19 a 200 ppm proporcionan un control de al menos 80% de la enfermedad en esta prueba al compararse con discos de hojas testigo sin tratar en las mismas condiciones que muestran un gran desarrollo de la enfermedad.
- 20 Ejemplo biológico 7: actividad fungicida contra *Mycosphaerella graminicola* (*Septoria tritici*) / cultivo líquido (manchas de Septoria)
- 25 Se mezclaron conidias de hongos procedentes de un depósito criogénico directamente en un caldo de nutrientes (caldo de dextrosa de papa PDB). Después de colocar una solución (DMSO) del compuesto de prueba en una placa de microtitulación (formato de 96 pocillos), se añadió el caldo nutritivo que contiene las esporas fúngicas. Las placas de prueba se incubaron a 24°C y la inhibición del crecimiento se determinó fotométricamente 4-5 días después de la aplicación.
- Los compuestos (de la tabla T1) 1, 2, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18 y 19 a 200 ppm proporcionan un control de al menos 80% de la enfermedad en esta prueba al compararse con discos de hojas testigo sin tratar en las mismas condiciones que muestran un gran desarrollo de la enfermedad.
- 30 Ejemplo biológico 8: actividad fungicida contra *Gaeumannomyces graminis* / cultivo líquido (podrición radical de cereales)
- 35 Se mezclaron fragmentos de micelios del hongo procedentes de un depósito criogénico directamente en un caldo de nutrientes (caldo de dextrosa de papa PDB). Después de colocar una solución (DMSO) del compuesto de prueba en una placa de microtitulación (formato de 96 pocillos), se añade el caldo nutritivo que contiene las esporas fúngicas. Las placas de prueba se incubaron a 24°C y la inhibición del crecimiento se determinó fotométricamente 4-5 días después de la aplicación.
- Los compuestos (de la tabla T1) 1, 2, 8, 11 y 17 a 200 ppm proporcionan un control de al menos 80% de la enfermedad en esta prueba al compararse con discos de hojas testigo sin tratar en las mismas condiciones que muestran un gran desarrollo de la enfermedad.
- 40 Ejemplo biológico 9: actividad fungicida contra *Thanatephorus cucumeris* (*Rhizoctonia solani*) / cultivo líquido (mal de pie, podredumbre)
- 45 Se mezclaron fragmentos de micelios de un cultivo líquido recientemente desarrollado directamente en el caldo nutriente (PDB, caldo papa-dextrosa). Después de colocar una solución (DMSO) de los compuestos del ensayo en una placa de microtitulación (formato de 96 pocillos), se añadió el caldo de nutrientes que contenía el material fúngico. Las placas de prueba se incubaron a 24°C y la inhibición del crecimiento se determinó fotométricamente 3-4 días después de la aplicación.
- Los compuestos (de la tabla T1) 1, 2, 4, 7, 8, 10, 11, 13, 14 y 17 a 200 ppm proporcionan un control de al menos 80% de la enfermedad en esta prueba al compararse con discos de hojas testigo sin tratar en las mismas condiciones que muestran un gran desarrollo de la enfermedad.
- 50 Ejemplo biológico 10: actividad fungicida contra *Sclerotinia sclerotiorum* / cultivo líquido (moho blanco, etc.):
- Se mezclaron fragmentos de micelios del hongo procedentes de un depósito criogénico directamente en un caldo de nutrientes (caldo de dextrosa de papa PDB). Después de colocar una solución (DMSO) de los compuestos del ensayo en una placa de microtitulación (formato de 96 pocillos), se añadió el caldo de nutrientes que contenía las esporas fúngicas. Las placas de prueba se incubaron a 24°C y la inhibición del crecimiento se determinó fotométricamente 72 hrs a 620 nm.

ES 2 621 386 T3

Los compuestos (de la tabla T1) 2, 8 y 11 a 200 ppm proporcionan un control de al menos 80% de la enfermedad en esta prueba al compararse con discos de hojas testigo sin tratar en las mismas condiciones que muestran un gran desarrollo de la enfermedad.

REIVINDICACIONES

1. Compuestos de fórmula (I)



en donde

5 MBG es tetrazolilo opcionalmente sustituido, triazolilo opcionalmente sustituido, oxazolilo opcionalmente sustituido, tiazolilo opcionalmente sustituido, o imidazolilo opcionalmente sustituido;

HetAr es un piridilo unido a carbono en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, haloalquilo_{C₁-C₄}, haloalcoxi_{C₁-C₄}, cicloalquilo_{C₃-C₈} o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo_{C₁-C₄}, haloalquilo_{C₁-C₄}, alcoxi_{C₁-C₄}, haloalcoxi_{C₁-C₄};

10 R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 8 miembros opcionalmente sustituido, que opcionalmente contiene un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno;

R³ es hidrógeno, alquilo, -Si(R⁵)₃, -P(O)(OH)₂, -CH₂-O-P(O)(OH)₂, -C(O)-alquilo, -C(O)-O-alquilo, -C(O)-N-alquilo;

R⁴ es arilo, heteroarilo, alquilo o cicloalquilo cada uno opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes;

R⁵ es independientemente alquilo o arilo;

15 R⁶ es independientemente ciano, haloalquilo, hidroxilo, alcoxi, halógeno o haloalcoxi;

en las definiciones de los sustituyentes de los compuestos de la fórmula (I), cada resto alquilo solo o como parte de un grupo más grande (tal como alcoxi) es una cadena recta o ramificada y es, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, *n*-pentilo, *n*-hexilo, isopropilo, *n*-butilo, *sec*-butilo, isobutilo, *terc*-butilo o neopentilo; y sales, estereoisómeros, diastereoisómeros, enantiómeros, tautómeros, atropisómeros y N-óxidos agrónomicamente aceptables de dichos compuestos.

20

2. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 que se caracterizan por que

MBG es un triazolilo, un tetrazolilo, un triazolilo, un oxazolilo, un tiazolilo o un imidazolilo;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 6 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes y que opcionalmente contiene un átomo de oxígeno, azufre o nitrógeno;

25 R³ es hidrógeno, alquilo;

R⁴ es arilo, heteroarilo, cada uno opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente ciano, haloalquilo_{C₁-C₆}, hidroxilo, alcoxi_{C₁-C₆}, halógeno o haloalcoxi_{C₁-C₆}.

3. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 que se caracterizan por que

MBG es un triazolilo o un imidazolilo;

30 R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 6 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes y que opcionalmente contiene un oxígeno

R³ es hidrógeno, alquilo_{C₁-C₄};

R⁴ es arilo, heteroarilo, cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente ciano, haloalquilo_{C₁-C₆}, halógeno o haloalcoxi_{C₁-C₆}.

35 4. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 que se caracterizan por que

MBG es un triazolilo;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 6 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes y que opcionalmente contiene un oxígeno

R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, heteroarilo, cada uno opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

5 R⁶ es independientemente, haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

5. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 que se caracterizan por que

MBG es un triazolilo;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 6 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes y que opcionalmente contiene un oxígeno;

10 R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

6. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 que se caracterizan por que

MBG es un triazolilo o imidazolilo;

15 HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido por 0, 1, 2 o 3 R⁶ independientes;

20 R³ es hidrógeno o metilo

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

7. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 que se caracterizan por que

MBG es triazolilo o imidazolilo;

25 HetAr es pirid-2-ilo donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquiloC₁-C₄, haloalquiloC₁-C₄, alcoxiC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido, preferiblemente ciclopropilo o ciclobutanilo;

30 R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

8. Compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 que se caracterizan por que

MGB es un triazolilo o imidazolilo;

35 HetAr es pirid-2-ilo en donde los sustituyentes se seleccionan del grupo que consiste en halógeno, ciano, haloalquiloC₁-C₄, cicloalquiloC₃-C₈ o fenilo opcionalmente sustituido, además, por halógeno, haloalquiloC₁-C₄, haloalcoxiC₁-C₄;

R¹ y R² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico de 3 a 4 miembros opcionalmente sustituido, preferiblemente ciclopropilo o ciclobutanilo;

40 R³ es hidrógeno o metilo;

R⁴ es arilo, opcionalmente sustituido por 1, 2 R⁶ independientes;

R⁶ es independientemente haloalquiloC₁-C₄, flúor, cloro, haloalcoxiC₁-C₄.

- 5 9. Un método para controlar o prevenir la infestación de plantas útiles por parte de microorganismos fitopatógenos, en donde un compuesto de fórmula (I) tal como se define en la reivindicación 1 o una composición que comprende, un compuesto de fórmula (I) tal como se define en la reivindicación 1 como ingrediente activo, se aplica a las plantas, a partes de las mismas o al locus de las mismas.
10. Una composición para controlar y proteger contra microorganismos fitopatógenos que comprende un compuesto de fórmula (I) tal como se define en la reivindicación 1 y al menos un auxiliar.
- 10 11. Un método para controlar enfermedades fitopatógenas en plantas útiles o material de propagación de planta de las mismas que comprende aplicar a dicho material de propagación de planta una cantidad fungicidamente efectiva de una composición protectora de material de propagación de planta que comprende un compuesto de fórmula (I) tal como se define en la reivindicación 1, junto con un portador adecuado para dicho fin.
12. Una composición que comprende una cantidad fungicidamente efectiva de un compuesto de fórmula (I) tal como se define en la reivindicación 1, que opcionalmente comprende al menos un ingrediente activo adicional.