

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 728 966**

51 Int. Cl.:

C07D 239/47 (2006.01)

C07D 409/06 (2006.01)

A01N 43/54 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **05.08.2010 PCT/US2010/044576**

87 Fecha y número de publicación internacional: **10.02.2011 WO11017538**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.08.2010 E 10807171 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **20.03.2019 EP 2519512**

54 Título: **Derivados de N1-acil-5-fluoropirimidinona**

30 Prioridad:

07.08.2009 US 232223 P

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

29.10.2019

73 Titular/es:

**ADAMA MAKHTESHIM LTD. (100.0%)
Golan Street, Airport City
7019900 Israel, IL**

72 Inventor/es:

**BOEBEL, TIMOTHY;
BRYAN, KRISTY;
LORSBACH, BETH;
MARTIN, TIMOTHY;
OWEN, W.;
POBANZ, MARK;
THORNBURGH, SCOTT;
WEBSTER, JEFFERY y
YAO, CHENGLIN**

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 728 966 T3

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

DESCRIPCIÓN

Derivados de N1-acil-5-fluoropirimidinona

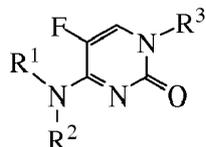
Referencia cruzada a solicitudes relacionadas

Antecedentes y sumario de la invención

- 5 Los fungicidas son compuestos, de origen natural o sintético, que actúan protegiendo y/o curando plantas contra el daño causado por hongos agrícolamente relevantes. Generalmente, ningún fungicida único es útil en todas las situaciones. Por consiguiente, hay investigación en curso para producir fungicidas que puedan tener mejor rendimiento, sean más fáciles de usar y cuesten menos. La patente de EE.UU. N° 3.368.938 se refiere al uso de 5-fluorocitosina en el control de hongos.
- 10 La invención se define por las reivindicaciones adjuntas. La descripción que sigue está sometida a esta limitación. Todos los aspectos y realizaciones que se marcan como que pertenecen a la invención, pero no están cubiertos por las reivindicaciones, son simplemente aspectos de la presente divulgación y no forman parte de la invención.

- 15 La presente divulgación se refiere a compuestos de N1-acil-5-fluoropirimidinona y su uso como fungicidas en plantas. Los compuestos de la presente divulgación pueden ofrecer protección contra ascomicetos, basidiomicetos, deuteromicetos y oomicetos.

Una realización de la presente divulgación puede incluir compuestos de la fórmula II:



Fórmula II

en la que

R¹ es:

- 20 H;
- alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con 1-3 R⁴;
- alqueno C₁-C₆ opcionalmente sustituido con 1-3 R⁴;
- alquino C₃-C₆ opcionalmente sustituido con 1-3 R⁴;
- 25 fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema de anillos saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema de anillos condensados 5-6, o con un sistema de anillos condensados 6-6, que contiene cada uno 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;
- (CHR⁶)_mOR⁷;
- C(=O)R⁸;
- 30 -C(=S)R⁸;
- C(=O)OR⁸;
- C(=S)OR⁸;
- (CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;
- C(=O)N(R⁹)R¹⁰; o
- 35 -C(=S)N(R⁹)R¹⁰;
- C(=S)R⁸;
- C(=O)OR⁸;
- C(=S)OR⁸;

-S(O)₂R⁸;
 -(CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;
 -C(=O)N(R⁹)R¹⁰; o
 -C(=S)N(R⁹)R¹⁰;

5 en las que m es un número entero 1-3;

R² es:

H; o
 alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con R⁴;

alternativamente R¹ y R² se pueden tomar conjuntamente para formar =CR¹¹N(R¹²)R¹³;

10 R³:

-C(=O)R⁸; o
 -C(=S)R⁸;

15 R⁴ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, amino, halotio, alquil C₁-C₃-amino, alcoxi C₂-C₆-carbonilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, alquil C₂-C₆-aminocarbonilo, hidroxilo o trialquil C₃-C₆-sililo;

R⁵ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, halotio, amino, alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₂-C₆-amino, alcoxi C₂-C₆-carbonilo o alquil C₂-C₆-carbonilo, nitro, hidroxilo o ciano;

20 R⁶ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

25 R⁷ es H, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema de anillos saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema de anillos condensados 5-6, o con un sistema de anillos condensados 6-6, que contiene cada uno 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

30 R⁸ es H, etilo, propilo, butilo, isopropilo, isobutilo, butilo terciario, pentilo, hexilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema de anillos saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema de anillos condensados 5-6, o con un sistema de anillos condensados 6-6, que contiene cada uno 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

35 R⁹ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema de anillos saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema de anillos condensados 5-6, o con un sistema de anillos condensados 6-6, que contiene cada uno 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

R¹⁰ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, bencilo, en el que el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

40 alternativamente R⁹ y R¹⁰ se pueden tomar conjuntamente para formar un anillo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos, en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

R¹¹ es H o alquilo C₁-C₄;

R¹² es H, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

45 alternativamente R¹¹ y R¹² se pueden tomar conjuntamente para formar un anillo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

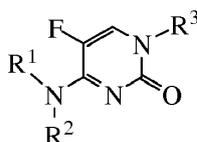
R¹³ es H, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵; y

alternativamente R¹² y R¹³ se pueden tomar conjuntamente para formar un anillo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵.

- 5 Otra realización de la presente divulgación puede incluir una composición fungicida para el control o la prevención del ataque fúngico, que comprende los compuestos de la fórmula I descritos a continuación y un material de vehículo fitológicamente aceptable.

- 10 Otra realización más de la presente divulgación puede incluir un método para el control o la prevención del ataque fúngico sobre una planta, incluyendo el método las etapas de aplicar una cantidad fungicidamente eficaz de uno o más de los compuestos de la fórmula I descritos a continuación a al menos uno del hongo, la planta, un área adyacente a la planta y la semilla adaptada para producir la planta.

En los compuestos de la fórmula I:



Fórmula I

R¹ es:

- 15 H;
 alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con 1-3 R⁴;
 alquenoilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con 1-3 R⁴;
 alquiniilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con 1-3 R⁴;
- 20 fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema de anillos saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema de anillos condensados 5-6, o con un sistema de anillos condensados 6-6, que contiene cada uno 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;
- CHR⁶)_mOR⁷;
- C(=O)R⁸;
- 25 -C(=S)R⁸;
- C(=O)OR⁸;
- C(=S)OR⁸;
- (CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;
- C(=O)N(R⁹)R¹⁰; o
- 30 -C(=S)N(R⁹)R¹⁰;
- C(=S)R⁸;
- C(=O)OR⁸;
- C(=S)OR⁸;
- S(O)₂R⁸;
- 35 -(CHR⁶)_mN(R⁹)R¹⁰;
- C(=O)N(R⁹)R¹⁰; o
- C(=S)N(R⁹)R¹⁰;

en las que m es un número entero 1-3;

R² es:

H; o

alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con R⁴;

alternativamente R¹ y R² se pueden tomar conjuntamente para formar =CR¹¹N(R¹²)R¹³;

5 R³ es:

- C(=O)R⁸; o

- C(=S)R⁸;

10 R⁴ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄, haloalquiltio C₁-C₄, amino, halotio, alquil C₁-C₃-amino, alcoxi C₂-C₆-carbonilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, alquil C₂-C₆-aminocarbonilo, hidroxilo o alquil C₃-C₆-silo;

R⁵ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, halotio, amino, alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₂-C₆-amino, alcoxi C₂-C₆-carbonilo o alquil C₂-C₆-carbonilo, nitro, hidroxilo o ciano;

15 R⁶ es H, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

20 R⁷ es H, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema de anillos saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema de anillos condensados 5-6, o con un sistema de anillos condensados 6-6, que contiene cada uno 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

25 R⁸ es H, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema de anillos saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema de anillos condensados 5-6, o con un sistema de anillos condensados 6-6, que contiene cada uno 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

30 R⁹ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema de anillos saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema de anillos condensados 5-6, o con un sistema de anillos condensados 6-6, que contiene cada uno 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

R¹⁰ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, bencilo, en el que el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

35 alternativamente R⁹ y R¹⁰ se pueden tomar conjuntamente para formar un anillo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

R¹¹ es H o alquilo C₁-C₄;

R¹² es H, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

40 alternativamente R¹¹ y R¹² se pueden tomar conjuntamente para formar un anillo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

R¹³ es H, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵; y

alternativamente R¹² y R¹³ se pueden tomar conjuntamente para formar un anillo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵.

45 El término "alquilo" se refiere a una cadena de carbonos ramificada, sin ramificar o cíclica, que incluye metilo, etilo, propilo, butilo, isopropilo, isobutilo, butilo terciario, pentilo, hexilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo y similares.

El término "alqueno" se refiere a una cadena de carbonos ramificada, sin ramificar o cíclica que contiene uno o más dobles enlaces que incluyen etenilo, propenilo, butenilo, isopropenilo, isobutenilo, ciclohexenilo y similares.

El término "alquinilo" se refiere a una cadena de carbonos ramificada o sin ramificar que contiene uno o más triples enlaces que incluyen propinilo, butinilo y similares.

Como se usa en toda esta memoria descriptiva, el término 'R' se refiere al grupo que consiste en alquilo C₂₋₈, alquenilo C₃₋₈ o alquinilo C₃₋₈, a menos que se establezca de otro modo.

5 El término "alcoxi" se refiere a un sustituyente -OR.

El término "alcoxicarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-OR.

El término "alquilcarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-R.

El término "alquilsulfonilo" se refiere a un sustituyente -SO₂-R.

10 El término "haloalquilsulfonilo" se refiere a un sustituyente -SO₂-R donde R está completamente o parcialmente sustituido con Cl, F, I, o Br o cualquier combinación de los mismos.

El término "alquiltio" se refiere a un sustituyente -S-R.

El término "halotio" se refiere a un azufre sustituido con tres o cinco sustituyentes F.

El término "haloalquiltio" se refiere a un alquiltio, que está sustituido con Cl, F, I, o Br o cualquier combinación de los mismos.

15 El término "alquilaminocarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-N(H)-R.

El término "dialquilaminocarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-NR₂.

El término "alquilocicloalquilamino" se refiere a un sustituyente cicloalquilamino que está sustituido con un grupo alquilo.

El término "trialquilsililo" se refiere un -SiR₃.

20 El término "ciano" se refiere a un sustituyente -C≡N.

El término "hidroxilo" se refiere a un sustituyente -OH.

El término "amino" se refiere a un sustituyente -NH₂.

El término "alquilamino" se refiere a un sustituyente -N(H)-R.

El término "dialquilamino" se refiere a un sustituyente -NR₂.

25 El término "alcoxialcoxi" se refiere a -O(CH₂)_nO(CH₂)_mCH₃ donde n es 1-3 y m es 0-2.

El término "alcoxialquilo" se refiere a una sustitución de alcoxi en un alquilo.

El término "haloalcoxialquilo" se refiere a una sustitución de alcoxi en un alquilo que está completamente o parcialmente sustituido con Cl, F, I, o Br o cualquier combinación de los mismos.

El término "hidroxialquilo" se refiere a un alquilo que está sustituido con un grupo hidroxilo.

30 El término "haloalcoxi" se refiere a un sustituyente -OR-X, en el que X es Cl, F, Br o I, o cualquier combinación de los mismos.

El término "haloalquilo" se refiere a un alquilo, que está sustituido con Cl, F, I o Br, o cualquier combinación de los mismos.

35 El término "haloalquenilo" se refiere a un alquenilo, que está sustituido con Cl, F, I o Br, o cualquier combinación de los mismos.

El término "haloalquinilo" se refiere a un alquinilo que está sustituido con Cl, F, I o Br, o cualquier combinación de los mismos.

El término "halógeno" o "halo" se refiere a uno o más átomos de halógeno, definidos como F, Cl, Br, y I.

El término "hidroxicarbonilo" se refiere a un sustituyente -C(O)-OH.

40 El término "nitro" se refiere a un sustituyente -NO₂.

En toda la divulgación, referencia a los compuestos de la fórmula I o II, respectivamente, se lee como que también incluye isómeros ópticos y sales de la fórmula I o II, respectivamente, y sus hidratos. Específicamente, cuando la fórmula I o II, respectivamente, contiene un grupo alquilo de cadena ramificada, se entiende que dichos compuestos incluyen isómeros ópticos y sus racematos. Las sales a modo de ejemplo incluyen: clorhidrato, bromhidrato, yodhidrato, y similares. Además, los compuestos de la fórmula I o II, respectivamente, pueden incluir formas tautómeras.

Ciertos compuestos desvelados en este documento pueden existir como uno o más isómeros. Se apreciará por los expertos en la técnica que un isómero puede ser más activo que los otros. Las estructuras desveladas en la presente divulgación se dibujan en solo una forma geométrica para claridad, pero pretenden representar todas las formas geométricas y tautómeras de la molécula.

También se entiende por los expertos en la técnica que es permisible sustitución adicional, a menos que se indique lo contrario, en tanto que se cumplan las reglas de enlace químico y energía de deformación y el producto todavía presente actividad fungicida.

Otra realización de la presente divulgación es un uso de un compuesto de la fórmula I para la protección de una planta contra el ataque por un organismo fitopatógeno o el tratamiento de una planta infestada por un organismo fitopatógeno, que comprende la aplicación de un compuesto de la fórmula I, o una composición que comprende el compuesto, a la tierra, una planta, una parte de una planta, follaje y/o semillas.

Además, otra realización de la presente divulgación es una composición útil para proteger una planta contra el ataque por un organismo fitopatógeno y/o el tratamiento de una planta infestada por un organismo fitopatógeno que comprende un compuesto de la fórmula I y un material de vehículo fitológicamente aceptable.

Las características y ventajas adicionales de la presente invención serán evidentes para los expertos en la técnica tras la consideración de la siguiente descripción detallada de las realizaciones ilustrativas que ejemplifican el mejor modo de llevar a cabo la invención como se percibe actualmente.

Descripción detallada de la presente divulgación

Los compuestos de la presente divulgación se pueden aplicar por cualquiera de una variedad de técnicas conocidas, ya sea como los compuestos o como las formulaciones que comprenden los compuestos. Por ejemplo, los compuestos se pueden aplicar a las raíces, semillas o follaje de plantas para el control de diversos hongos, sin dañar el valor comercial de las plantas. Los materiales se pueden aplicar en forma de cualquiera de los tipos de formulación generalmente usados, por ejemplo, como disoluciones, polvos, polvos humectables, concentrados fluidos o concentrados emulsionables.

Preferentemente, los compuestos de la presente divulgación se aplican en forma de una formulación, que comprende uno o más de los compuestos de la fórmula I con un vehículo fitológicamente aceptable. Las formulaciones concentradas se pueden dispersar en agua, u otros líquidos, para aplicación, o las formulaciones pueden ser de tipo polvo o granuladas, que entonces se pueden aplicar sin tratamiento adicional. Las formulaciones se pueden preparar según procedimientos que son convencionales en la técnica química agrícola.

La presente divulgación contempla todos los vehículos por los que uno o más de los compuestos se pueden formular para la administración y uso como un fungicida. Normalmente, las formulaciones se aplican como suspensiones o emulsiones acuosas. Dichas suspensiones o emulsiones se pueden producir a partir de formulaciones solubles en agua, suspensibles en agua o emulsionables que son sólidas, normalmente conocidas como polvos humectables; o líquidos, normalmente conocidos como concentrados emulsionables, suspensiones acuosas o concentrados en suspensión. Como será fácilmente apreciado, se puede usar cualquier material al que se puedan añadir estos compuestos, siempre que dé la utilidad deseada sin interferencia significativa con la actividad de estos compuestos como agentes antifúngicos.

Los polvos humectables, que se pueden compactar para formar gránulos dispersables en agua, comprenden una mezcla íntima de uno o más de los compuestos de la fórmula I, un vehículo inerte y tensioactivos. La concentración del compuesto en el polvo humectable puede ser desde aproximadamente 10 por ciento hasta aproximadamente 90 por ciento en peso basado en el peso total del polvo humectable, más preferentemente aproximadamente 25 por ciento en peso hasta aproximadamente 75 por ciento en peso. En la preparación de formulaciones en polvo humectables, los compuestos se pueden combinar con cualquier sólido finamente dividido, tal como pirofillita, talco, caliza, yeso, tierra de Fuller, bentonita, atapulgita, almidón, caseína, gluten, arcillas de montmorillonita, tierras de diatomeas, silicatos purificados o similares. En dichas operaciones, el vehículo finamente dividido y los tensioactivos normalmente se mezclan con el (los) compuesto(s) y se muelen.

Los concentrados emulsionables de los compuestos de la fórmula I pueden comprender una concentración conveniente, tal como desde aproximadamente 10 por ciento en peso hasta aproximadamente 50 por ciento en peso del compuesto, en un líquido adecuado, basado en el peso total del concentrado. Los compuestos se pueden disolver en un vehículo inerte, que es ya sea un disolvente miscible en agua o una mezcla de disolventes orgánicos inmiscibles en agua, y emulsionantes. Los concentrados se pueden diluir con agua y aceite para formar mezclas

para pulverización en forma de emulsiones de aceite en agua. Los disolventes orgánicos útiles incluyen aromáticos, especialmente las porciones naftalénicas y olefinicas de alto punto de ebullición del petróleo, tales como nafta aromática pesada. También se pueden usar otros disolventes orgánicos, por ejemplo, disolventes terpénicos, que incluyen derivados de colofonia, cetonas alifáticas, tales como ciclohexanona, y alcoholes complejos, tales como 2-etoxietanol.

Los emulsionantes que se pueden emplear ventajosamente en el presente documento se pueden determinar fácilmente por los expertos en la técnica e incluyen diversos emulsionantes no iónicos, aniónicos, catiónicos y anfóteros emulsionantes, o una mezcla de dos o más emulsionantes. Los ejemplos de emulsionantes no iónicos útiles en la preparación de los concentrados emulsionables incluyen los polialquilenglicol éteres y productos de condensación de alquil- y arilfenoles, alcoholes alifáticos, aminas alifáticas o ácidos grasos con óxido de etileno, óxidos de propileno tales como los alquilfenoles etoxilados y ésteres carboxílicos solubilizados con el polioli o polioxialquileno. Los emulsionantes catiónicos incluyen compuestos de amonio cuaternario y sales de amina grasa. Los emulsionantes aniónicos incluyen las sales solubles en aceite (por ejemplo, calcio) de ácidos alquilarilsulfónicos, sales solubles en aceite o poliglicol éteres sulfatados y sales apropiadas de poliglicol éteres fosfatados.

Los líquidos orgánicos representativos que se pueden emplear en la preparación de los concentrados emulsionables de los compuestos de la presente invención son líquidos aromáticos tales como xileno, fracciones de propilbenceno; o fracciones de naftaleno mixtas, aceites minerales, líquidos orgánicos aromáticos sustituidos tales como ftalato de dioctilo; queroseno; dialquilamidas de diversos ácidos grasos, particularmente las dimetilamidas de glicoles grasos y derivados de glicol tales como el n-butyl éter, etil éter o metil éter de dietilenglicol, y el metil éter de trietilenglicol y similares. También se pueden emplear mezclas de dos o más líquidos orgánicos en la preparación del concentrado emulsionable. Los líquidos orgánicos incluyen xileno y fracciones de propilbenceno, siendo el xileno el más preferido en algunos casos. Los agentes dispersantes tensioactivos normalmente se emplean en formulaciones líquidas y en una cantidad de desde 0,1 hasta 20 por ciento en peso, basado en el peso combinado del agente dispersante con uno o más de los compuestos. Las formulaciones también pueden contener otros aditivos compatibles, por ejemplo, reguladores del crecimiento de las plantas y otros compuestos biológicamente activos usados en la agricultura.

Las suspensiones acuosas comprenden suspensiones de uno o más compuestos insolubles en agua de la fórmula I, dispersos en un vehículo acuoso a una concentración en el intervalo desde aproximadamente 5 hasta aproximadamente 50 por ciento en peso, basado en el peso total de la suspensión acuosa. Las suspensiones se preparan moliendo finamente uno o más de los compuestos, y mezclando vigorosamente el material molido en un vehículo que comprende agua y tensioactivos elegidos de los mismos tipos tratados anteriormente. También se pueden añadir otros componentes, tales como sales inorgánicas y gomas sintéticas o naturales, para aumentar la densidad y viscosidad del vehículo acuoso. Frecuentemente lo más eficaz es moler y mezclar al mismo tiempo preparando la mezcla acuosa y homogeneizándola en un instrumento tal como un molino de arena, molino de bolas, u homogeneizador de tipo pistón.

Las emulsiones acuosas comprenden emulsiones de uno o más principios pesticidamente activos insolubles en agua emulsionados en un vehículo acuoso a una concentración normalmente en el intervalo desde aproximadamente 5 hasta aproximadamente 50 por ciento en peso, basado en el peso total de la emulsión acuosa. Si el principio pesticidamente activo es un sólido, se debe disolver en un disolvente inmiscible en agua adecuado antes de la preparación de la emulsión acuosa. Las emulsiones se preparan emulsionando el principio pesticidamente activo líquido o su disolución inmiscible en agua en un medio acuoso normalmente con inclusión de tensioactivos que ayudan en la formación y estabilización de la emulsión como se ha descrito anteriormente. Esto se realiza frecuentemente con la ayuda de mezcla vigorosa, proporcionada por mezcladoras de alto cizallamiento u homogeneizadores.

Los compuestos de la fórmula I también se puede aplicar como formulaciones en gránulos, que son particularmente útiles para aplicaciones a la tierra. Las formulaciones en gránulos generalmente contienen desde aproximadamente 0,5 hasta aproximadamente 10 por ciento en peso, basado en el peso total de la formulación en gránulos del (de los) compuesto(s), dispersas en un vehículo inerte que consiste completamente o en gran parte de material inerte gruesamente dividido tal como atapulgita, bentonita, diatomita, arcilla o un sustancia barata similar. Dichas formulaciones se preparan normalmente disolviendo los compuestos en un disolvente adecuado y aplicándolo a un vehículo en gránulos que se ha preformado al tamaño de partículas apropiado, en el intervalo de desde aproximadamente 0,5 hasta aproximadamente 3 mm. Un disolvente adecuado es un disolvente en el que el compuesto es sustancialmente o completamente soluble. Dichas formulaciones también se pueden preparar preparando una masa o pasta del vehículo y el compuesto y disolvente, y machacándola y secándola para obtener la partícula en gránulos deseada.

Se pueden preparar polvos que contienen los compuestos de la fórmula I mezclando íntimamente uno o más de los compuestos en forma de polvo con un vehículo agrícola pulverulento adecuado, tal como, por ejemplo, arcilla de caolín, roca volcánica molida, y similares. Los polvos pueden contener adecuadamente desde aproximadamente 1 hasta aproximadamente 10 por ciento en peso de los compuestos, basado en el peso total del polvo.

Las formulaciones pueden contener adicionalmente tensioactivos adyuvantes para potenciar la deposición, humectación y penetración de los compuestos sobre el cultivo y organismo dianas. Estos tensioactivos adyuvantes

se pueden emplear opcionalmente como componente de formulación o como una mezcla en tanque. La cantidad de tensioactivo adyuvante normalmente variará desde 0,01 hasta 1,0 por ciento en volumen, basado en un volumen de agua de pulverización, preferentemente 0,05 a 0,5 por ciento en volumen. Los tensioactivos adyuvantes adecuados incluyen, pero no se limitan a, nonilfenoles etoxilados, alcoholes sintéticos o naturales etoxilados, sales de los ésteres o ácidos sulfosuccínicos, organosiliconas etoxiladas, aminas grasas etoxiladas y mezclas de tensioactivos con aceites minerales o vegetales. Las formulaciones también pueden incluir emulsiones de aceite en agua tales como las desveladas en la solicitud de patente de EE.UU. Nº de serie 11/495.228.

Las formulaciones pueden incluir opcionalmente combinaciones que contienen otros compuestos pesticidas. Dichos compuestos pesticidas adicionales pueden ser fungicidas, insecticidas, herbicidas, nematocidas, miticidas, artropocidas, bactericidas o sus combinaciones, que son compatibles con los compuestos de la presente invención en el medio seleccionado para aplicación, y no antagonistas para la actividad de los presentes compuestos. Por consiguiente, en dichas realizaciones, el otro compuesto pesticida se emplea como un veneno suplementario para el mismo uso pesticida o para uno diferente. Los compuestos de la fórmula I y el compuesto pesticida en la combinación pueden estar generalmente presentes en una relación de peso de desde 1:100 hasta 100:1.

Los compuestos de la presente divulgación también se pueden combinar con otros fungicidas para formar mezclas fungicidas y sus mezclas sinérgicas. Los compuestos fungicidas de la presente divulgación se aplican frecuentemente conjuntamente con uno o varios de otros fungicidas para controlar una amplia variedad de enfermedades no deseables. Cuando se usa conjuntamente con otro(s) fungicida(s), los compuestos presentemente reivindicados se pueden formular con los otro(s) fungicida(s), mezclados en tanque con el (los) otro(s) fungicida(s) o aplicados secuencialmente con el (los) otro(s) fungicida(s). Dichos otros fungicidas pueden incluir 2-(tiocianatometil)-benzotiazol, 2-fenilfenol, sulfato de 8-hidroxiquinolina, ametotradin, amisulbrom, antimicina, *Ampelomyces quisqualis*, azaconazol, azoxistrobina, *Bacillus subtilis*, cepa QST713 de *Bacillus subtilis*, benalaxilo, benomilo, bentiavalicarb-isopropilo, sal de sulfonato de bencilaminobenceno (BABS), bicarbonatos, bifenilo, bismertiazol, bitertanol, bixafeno, blastidina-S, bórax, mezcla de Burdeos, boscalid, bromuconazol, bupirimato, polisulfuro de calcio, captafol, captán, carbendazim, carboxin, carpropamid, carvona, clazafenona, cloroneb, clorotalonilo, clozolinato, *Coniothyrium minitans*, hidróxido de cobre, octanoato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, sulfato de cobre (tribásico), óxido cuproso, ciazofamid, ciflufenamida, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, dazomet, debacarb, etilenbis-(ditiocarbamato) de diamonio, diclofluanida, diclorofeno, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, ion de difenzoquat, diflumerim, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinobutón, dinocap, difenilamina, ditionón, dodemorf, acetato de dodemorf, dodina, base libre de dodina, edifenfos, enestrobina, epoxiconazol, etaboxam, etoxiquin, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenoxanilo, fenciclonilo, fenpropidin, fenpropimorf, fenpirazamina, fentina, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumorf, fluopicolida, fluopiram, fluoroimida, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutianilo, flutolanilo, flutriafol, fluxapiraxad, folpet, formaldehído, fosetilo, fosetilo-aluminio, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, acetatos de guazatina, GY-81, hexaclorobenceno, hexaconazol, himexazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol, iminocadina, triacetato de iminocadina, tris(albesilato) de iminocadina, yodocarb, ipconazol, ipfenpirazolona, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoprotiolo, isopirazam, isotianilo, laminarin, kasugamicina, clorhidrato de kasugamicina hidratado, kresoxim-metilo, mancozeb, mandipropamid, maneb, mepanipirim, mepromorf, cloruro mercuríco, óxido mercuríco, cloruro mercurioso, metalaxilo, mfenoxam, meptilo-dinocap, metalaxilo-M, metam, metam-amonio, metam-potasio, metam-sodio, metconazol, metasulfocarb, yoduro de metilo, isotiocianato de metilo, metiram, metominostrobina, metrafenona, mildiomicina, miclobutanilo, nabam, nitrotal-isopropilo, nuarimol, octilinona, ofurace, ácido oleico (ácidos grasos), orisastrobina, oxadixilo, oxina-cobre, fumarato de oxpoconazol, oxicarboxina, pefurazoato, penconazol, pencicurón, penflufeno, pentaclorofenol, laurato de pentaclorofenilo, pentiopirad, acetato de fenilmercurio, ácido fosfónico, ftaluro, picoxistrobina, polioxina B, polioxinas, polioxorim, bicarbonato potásico, hidroxiquinolona sulfato de potasio, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, clorhidrato de propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, protioconazol, piraclostrobina, pirametostrobina, piraioxistrobina, pirazofos, piribencarb, piributicarb, pirifenox, pirimetanilo, pirofenona, piroquilón, quinoclamina, quinoxifeno, quintozeno, extracto de *Reynoutria sachalinensis*, sedaxano, siltiofam, simeconazol, 2-fenilfenóxido de sodio, bicarbonato sódico, pentaclorofenóxido de sodio, espiroxamina, azufre, SYP-Z071, SYP-Z048, aceites de brea, tebuconazol, tebufloquina, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifulzamida, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tolclorfenol, tolilfluanid, triadimefon, triadimenol, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobina, triflumizol, triflorina, triticonazol, validamicina, valifenalato, valifenal, vinclozolina, zineb, ziram, zoxamida, *Candida oleophila*, *Fusarium oxysporum*, *Gliocladium* spp., *Phlebiopsis gigantea*, *Streptomyces griseoviridis*, *Trichoderma* spp., (RS)-N-(3,5-diclorofenil)-2-(metoximetil)-succinimida, 1,2-dicloropropano, hidrato de 1,3-dicloro-1,1,3,3-tetrafluoroacetona, 1-cloro-2,4-dinitronaftaleno, 1-cloro-2-nitropropano, 2-(2-heptadecil-2-imidazolin-1-il)etanol, 1,1,4,4-tetraóxido de 2,3-dihidro-5-fenil-1,4-ditiina, acetato de 2-metoxietilmercurio, cloruro de 2-metoxietilmercurio, silicato de 2-metoxietilmercurio, 3-(4-clorofenil)-5-metilrrodanina, tiocianato de 4-(2-nitroprop-1-enil)fenilo, ampropilfos, anilazina, azitiram, polisulfuro de bario, Bayer 32394, benodanilo, benquinox, bentalarón, benzamacrilo; benzamacrilo-isobutilo, benzamorf, binapacril, sulfato de bis(metilmercurio), óxido de bis(tributilestaño), butiobato, cromato-sulfato de cadmio calcio cobre cinc, carbamorf, CECA, clobentiazona, cloraniformetano, clorfenazol, clorquinox, climbazol, ciclafuramida, cependazol, ciprofuram, decafentina, diclona, diclozolina, diclobutrazol, dimetirimol, dinoceton, dinosulfón, dinoterbón, dipiritiona, ditalimfos, dodicina, drazoxolón, EBP, ESBP, etaconazol, etem, etirim, fenaminosulf, fenapanilo, fenitropan, 5-fluorocitosina y sus profungicidas, fluotrimazol, furcarbanilo, furconazol, furconazol-cis, furmeciclox,

furofanato, gliodina, griseofulvina, halacrinato, Hercules 3944, hexiltiofos, ICIA0858, isopanfos, isovalediona, mebenilo, mecarbinzid, metazoxolon, metfuroxam, diciandiamida de metilmercurio, metsulfovax, milneb, anhídrido mucoclórico, miclozolina, *N*-3,5-diclorofenil-succinimida, *N*-3-nitrofenilitaconimida, natamicina, *N*-etilmercurio-4-toluenosulfonanilida, bis(dimetilditiocarbamato) de níquel, OCH, dimetilditiocarbamato de fenilmercurio, nitrato de fenilmercurio, fosdifeno, picolinamida UK-2A y sus derivados, protiocarb; clorhidrato de protiocarb, piracarbolid, piridinitrilo, piroxiclor, piroxifur, quinacetol; sulfato de quinacetol, quinazamid, quinconazol, rabenzazol, salicilanilida, SSF-109, sultropen, tecoram, tiadifluor, ticiofen, tioclorfenfim, tiofanato, tioquinox, tioximid, triamifos, triarimol, triazbutilo, triclamida, urbacid y zarilamida, y cualquier combinación de los mismos.

Además, los compuestos de la presente invención se pueden combinar con otros pesticidas, que incluyen insecticidas, nematocidas, miticidas, artropodocidas, bactericidas o sus combinaciones que son compatibles con los compuestos de la presente invención en el medio seleccionado para aplicación, y no antagonistas para la actividad de los presentes compuestos para formar mezclas pesticidas y sus mezclas sinérgicas. Los compuestos fungicidas de la presente divulgación se pueden aplicar conjuntamente con uno o varios de otros pesticidas para controlar una mayor variedad de plagas no deseables. Cuando se usan conjuntamente con otros pesticidas, los compuestos presentemente reivindicados se pueden formular con el (los) otro(s) pesticida(s), mezclados en tanque con el (los) otro(s) pesticida(s) o aplicar secuencialmente con el (los) otro(s) pesticida(s). Los insecticidas típicos incluyen, pero no se limitan a: *insecticidas antibióticos* tales como alosamidina y turingiensina; *insecticidas de lactonas macrocíclicas* tales como espinosad y espinetoram; *insecticidas de avermectina* tales como abamectina, doramectina, emamectina, eprinomectina, ivermectina y selamectina; *insecticidas de milbemicina* tales como lepmectina, milbemectina, milbemicina oxima y moxidectina; *insecticidas arsenicales* tales como arsenato de calcio, acetoarsenito de cobre, arsenato de cobre, arsenato de plomo, arsenito de potasio y arsenito de sodio; *insecticidas botánicos* tales como anabasina, azadiractina, *d*-limoneno, nicotina, piretrinas, cinerinas, cinerina I, cinerina II, jasmolina I, jasmolina II, piretrina I, piretrina II, quassia, rotenona, riania y sabadilla; *insecticidas de carbamato* tales como bendiocarb y carbarilo; *insecticidas de metilcarbamato de benzofuranilo* tales como benfuracarb, carbofurano, carbosulfano, decarbofurano y furatiocarb; *insecticidas de dimetilcarbamato* dimitan, dimetilan, hiquincarb y pirimicarb; *insecticidas de carbamato de oxima* tales como alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, butocarboxim, butoxicarboxim, metomilo, nitrilacarb, oxamilo, tazimcarb, tiocarboxima, tiodicarb y tiofanox; *insecticidas de metilcarbamato de fenilo* tales como almentexicarb, aminocarb, bufencarb, butacarb, carbanolato, cloetocarb, dicresilo, dioxacarb, EMPC, etiofencarb, fenetacarb, fenobucarb, isoprocacarb, metiocarb, metolcarb, mexacarbato, promacilo, promecarb, propoxur, trimetacarb, XMC y xililcarb; *insecticidas desecantes* tales como ácido bórico, tierra de diatomeas y gel de sílice; *insecticidas de diamida* tales como clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida; *insecticidas de dinitrofenol* tales como dinax, dinoprop, dinosam y DNOC; *insecticidas de flúor* tales como hexafluorosilicato de bario, criolita, fluoruro de sodio, hexafluorosilicato de sodio y sulfuramido; *insecticidas de formamidina* tales como amitraz, clordimeform, formetanato y formparanato; *insecticidas fumigantes* tales como acrilonitrilo, disulfuro de carbono, tetracloruro de carbono, cloroformo, cloropicrina, para-diclorobenceno, 1,2-dicloropropano, formiato de etilo, dibromuro de etileno, dicloruro de etileno, óxido de etileno, cianuro de hidrógeno, yodometano, bromuro de metilo, metilcloroform, cloruro de metileno, naftaleno, fosfina, fluoruro de sulfurilo y tetracloroetano; *insecticidas inorgánicos* tales como bórax, polisulfuro de calcio, oleato de cobre, cloruro mercurioso, tiocianato de potasio y tiocianato de sodio; *inhibidores de la síntesis de quitina* tales como bistriflurón, buprofezina, clorfluazurón, ciromazina, diflubenzurón, fluclicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, penflurón, teflubenzurón y triflumurón; *miméticos de la hormona juvenil* tales como epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, kinopreno, metopreno, piriproxifeno y tripreno; *hormonas juveniles* tales como hormona juvenil I, hormona juvenil II y hormona juvenil III; *agonistas de hormonas de la muda* tales como cromafenoazida, halofenoazida, metoxifenoazida y tebufenoazida; *hormonas de la muda* tales como α -ecdisona y ecdisterona; *inhibidores de la muda* tales como diofenolan; *precocenos* tales como precoceno I, precoceno II y precoceno III; *reguladores del crecimiento de insectos no clasificados* tales como diciclanilo; *insecticidas análogos a nereistoxinas* tales como bensultap, cartap, tiociclam y tiosultap; *insecticidas nicotinoides* tales como flonicamid; *insecticidas de nitroguanidina* tales como clotianidina, dinotefurano, imidacloprid y tiametoxam; *insecticidas de nitrometileno* tales como nitenpiram y nitiazina; *insecticidas de piridilmetil-amina* tales como acetamiprid, imidacloprid, nitenpiram y tiacloprid; *insecticidas de organocloro* tales como bromo-DDT, canfecloro, DDT, pp'-DDT, etil-DDD, HCH, gamma-HCH, lindano, metoxiclor, pentaclorofenol y TDE; *insecticidas de ciclodieno* tales como aldrina, bromocicleno, clorbicicleno, clordano, clordecona, dieldrin, dilor, endosulfano, alfa-endosulfano, endrina, HEOD, heptacloro, HHDN, isobenzano, isodrina, kelevan y mirex; *insecticidas de organofosfato* tales como bromfenvinfos, clorfenvinfos, crotoxifos, diclorvos, dicrotofos, dimetilvinfos, fospirato, heptenofos, metocrotofos, mevinfos, monocrotofos, naled, naftaleno, fosfamidón, propafos, TEPP y tetraclorvinfos; *insecticidas de organotiofosfato* tales como dioxabenzofos, fosmetilán y fentoato; *insecticidas de organotiofosfato alifático* tales como acetión, amitón, cadusafos, cloretoxifos, clormefos, demefión, demefión-O, demefión-S, demetón, demetón-O, demetón-S, demetón-metilo, demetón-O-metilo, demetón-S-metilo, demetón-S-metilsulfon, disulfotón, etión, etoprofos, IPSP, isotioato, malatión, metacrifos, oxidometón-metilo, oxidoprofos, oxidisulfotón, forato, sulfotep, terbufos y tiometón; *insecticidas de organotiofosfatos de amidas alifáticas* tales como amiditió, ciantoato, dimetoato, etoato-metilo, formotió, mecarbam, ometoato, protoato, sofamida y vamidotió; *insecticidas de organotiofosfato de oxima* tales como clorfoxim, foxim y foxim-metilo; *insecticidas de organotiofosfatos heterocíclicos* tales como azametifos, coumafos, coumitoato, dioxatió, endotió, menazón, morfotió, fosalona, piraclafos, pirdafentió y quinotió; *insecticidas de organotiofosfatos de benzotiazina* tales como diticofos y ticofos; *insecticidas de organotiofosfatos de benzotriazina* tales como azinfos-etilo y azinfos-metilo; *insecticidas de organotiofosfatos de isoindol* tales como dialifos y fosmet; *insecticidas de organotiofosfatos de*

5 *isoxazol* tales como isoxatión y zolapropos; *insecticidas de organotiofosfato de pirazolopirimidina* tales como clorprazofos y pirazofos; *insecticidas de organotiofosfato de piridina* tales como clorpirifos y clorpirifos-metilo; *insecticidas de organotiofosfato de pirimidina* tales como butatíofos, diazinón, etrimfos, lirimfos, pirimifos-etilo, pirimifos-metilo, primidofos, pirimitato y tebupirimfos; *insecticidas de organotiofosfato de quinoxalina* tales como quinalfos y quinalfos-metilo; *insecticidas de organotiofosfatos de tiadiazol* tales como atidatió, litidatió, metidatió y protidatió; *insecticidas de organotiofosfato de triazol* tales como isazofos y triazofos; *insecticidas de organotiofosfato de fenilo* tales como azotoato, bromofos, bromofos-etilo, carbofenotión, clortíofos, cianofos, citioato, dicaptón, diclofentió, etafofos, famfur, fenclorfos, fenitrotión, fensulfotión, fentió, fentió-etilo, heterofos, yodfenfos, mesulfenfos, paratió, paratió-metilo, fenkaptón, fosniclor, profenofos, protíofos, sulprofos, temefos, triclormetafos-3 y trifenofos; *insecticidas de fosfonato* tales como butonato y triclorfón; *insecticidas de fosfonotioato* tales como mecarfón; *insecticidas de etilfosfonotioato de fenilo* tales como fonofos y tricloronato; *insecticidas de fenilfosfonotioato de fenilo* tales como cianofenfos, EPN y leptofos; *insecticidas de fosforamidoato* tales como crufomato, fenamifos, fostietán, mefosolán, fosfolán y pirimetafos; *insecticidas de fosforamidato* tales como acefato, isocarbofos, isofenfos, isofenfos-metilo, metamidofos y propetanfos; *insecticidas de fosforodiamida* tales como dimefox, mazidox, mipafox y schradan; *insecticidas de oxadiazina* tales como indoxacarb; *insecticidas de oxadiazolina* tales como metoxadiazona; *insecticidas de ftalimida* tales como dialifos, fosmet y tetrametrina; *insecticidas de pirazol* tales como tebufenpirad, tofenenpirad; *insecticidas de fenilpirazol* tales como acetoprol, etiprol, fipronilo, pirafluprol, piriprol y vaniliprol; *insecticidas de ésteres piretroides* tales como acrinatrina, aletrina, bioaletrina, bartrina, bifentrina, bioetanometrina, ciclotrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, dimeflutrina, dimetrina, empenetrina, fenflutrina, fenpiritrina, fenpropatrina, fenvalerato, esfenvalerato, flucitrinato, flualinato, tau-fluvalinato, furetrina, imiprotrina, meperflutrina, metoflutrina, permetrina, biopermetrina, transpermetrina, fenotrina, praletrina, proflutrina, piresmetrina, resmetrina, bioresmetrina, cismetrina, teflutrina, teraletrina, tetrametrina, tetrametilflutrina, tralometrina y transflutrina; *insecticidas de éteres piretroides* tales como etofenprox, flufenprox, halfenprox, protrifenbuto y silafluofeno; *insecticidas de pirimidinamina* tales como flufenerim y pirimidifeno; *insecticidas de pirrol* tales como clorfenapir; *insecticidas de ácido tetrámico* tales como espirotetramato; *insecticidas de ácido tetrónico* tales como espiromesifeno; *insecticidas de tiourea* tales como diafentiurón; *insecticidas de urea* tales como flucofurón y sulcofurón; e *insecticidas sin clasificar* tales como closantel, naftenato de cobre, crotamitón, EXD, fenazaflor, fenoxacrim, hidrametilnón, isoprotoilano, malonoben, metaflumizona, nifluridida, plifenato, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazón, rafoxanida, sulfoxaflor, triaratenó y triazamato, y cualquiera de sus combinaciones.

Además, los compuestos de la presente invención se pueden combinar con herbicidas que son compatibles con los compuestos de la presente invención en el medio seleccionado para aplicación, y no antagonistas para la actividad de los presentes compuestos para formar mezclas pesticidas y sus mezclas sinérgicas. Los compuestos fungicidas de la presente divulgación se pueden aplicar conjuntamente con uno o más herbicidas para controlar una amplia variedad de plantas no deseables. Cuando se usan conjuntamente con herbicidas, los compuestos presentemente reivindicados se pueden formular con el (los) herbicida(s), mezclados en tanque con el (los) herbicida(s) o aplicados secuencialmente con el (los) herbicida(s). Los herbicidas típicos incluyen, pero no se limitan a: *herbicidas de amida* tales como alidoclor, beflubutamid, benzadox, bencipram, bromobutida, cafenstrol, CDEA, ciprazol, dimetenamid, dimetenamid-P, difenamid, epronaz, etnipromid, fentrazamida, flupoxam, fomesafeno, halosafeno, isocarbamid, isoxabeno, napropamida, naptalam, petoxamid, propizamida, quinonamid y tebutam; *herbicidas de anilida* tales como cloranocrilo, cisanilida, clomeprop, cipromid, diflufenican, etobenzanid, fenasulam, flufenacet, flufenican, mefenacet, mefluidida, metamifop, monalida, naproanilida, pentanoclor, picolinafeno y propanilo; *herbicidas de arilalanina* tales como benzoilprop, flamprop y flamprop-M; *herbicidas de cloroacetanilida* tales como acetoclor, alaclor, butaclor, butenaclor, delaclor, dietatilo, dimetaclor, metazaclor, metolaclor, S-metolaclor, pretilaclor, propaclor, propisoclor, prinaclor, terbuclor, tenilclor y xilaclor; *herbicidas de sulfonanilida* tales como benzofluor, perfluidona, pirimisulfán y profluazol; *herbicidas de sulfonamida* tales como asulam, carbasulam, fenasulam y orizalina; *herbicidas de tioamida* tales como clortiamid; *herbicidas antibióticos* tales como bilanafos; *herbicidas de ácido benzoico* tales como cloramben, dicamba, 2,3,6-TBA y tricamba; *herbicidas de ácido pirimidiniloxibenzoico* tales como bispiribac y piriminobac; *herbicidas de ácido pirimidiniltiobenzoico* tales como piritiobac; *herbicidas de ácido ftálico* tales como clortal; *herbicidas de ácido picolínico* tales como aminopirialid, clopiralid y picloram; *herbicidas de ácido quinolinacarboxílico* tales como quinclorac y quinmerac; *herbicidas arsenicales* tales como ácido cacodílico, CMA, DSMA, hexaflurato, MAA, MAMA, MSMA, arsenito de potasio y arsenito de sodio; *herbicidas de benzoilciclohexanodiona* tales como mesotriona, sulcotriona, tefuriltriona y tembotriona; *herbicidas de alquilsulfonato de benzofuranilo* tales como benfuresato y etofumesato; *herbicidas de benzotiazol* tales como benzazolina; *herbicidas de carbamato* tales como asulam, carboxazol clorprocarb, diclormato, fenasulam, karbutilato y terbutcarb; *herbicidas de carbanilato* tales como barban, BCPC, carbasulam, carbetamida, CEPC, clorbufam, clorprofam, CPPC, desmedifam, fenisofam, fenmedifam, fenmedifam-etilo, profam y swep; *herbicidas de ciclohexeno-oxima* tales como aloxidim, butoxidim, cletodim, cloproxidim, cicloxidim, profoxidim, setoxidim, tepraloxidim y tralcoxidim; *herbicidas de ciclopropilisoxazol* tales como isoxaclortol e isoxaflutol; *herbicidas de dicarboximida* tales como cinidon-etilo, flumezin, flumiclorac, flumioxazina y flumipropina; *herbicidas de dinitroanilina* tales como benfluralina, butralina, dinitramina, etalfuralina, flucloralina, isopropalina, metalpropalina, nitalina, orizalina, pendimetalina, prodiamina, profluralina y trifluralina; *herbicidas de dinitrofenol* tales como dinofenato, dinoprop, dinosam, dinoseb, dinoterb, DNOC, etinofeno y medinoterb; *herbicidas de difenil éter* tales como etoxifeno; *herbicidas de nitrofenil éter* tales como acifluorfenó, aclonifeno, bifenox, clometoxifeno, clornitrofenó, etnipromid, fluorodifeno, fluoroglicofeno,

5 fluoronitrofenol, fomesafenol, furiloxifenol, halosafenol, lactofenol, nitrofenol, nitrofluorfenol y oxifluorfenol; *herbicidas de ditiocarbamato* tales como dazomet y metam; *herbicidas alifáticos halogenados* tales como alorac, cloropón, dalapón, flupropanato, hexafluoroacetona, yodometano, bromuro de metilo, ácido monocloroacético, SMA y TCA; *herbicidas de imidazolinona* tales como imazametabenz, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquin e imazetapir; *herbicidas inorgánicas* tales como sulfamato de amonio, bórax, clorato de calcio, sulfato de cobre, sulfato ferroso, azida de potasio, cianato de potasio, azida de sodio, clorato de sodio y ácido sulfúrico; *herbicidas de nitrilo* tales como bromobonilo, bromoxinilo, cloroxinilo, diclobenilo, yodobonilo, ioxinilo y piraclonilo; *herbicidas de organofósforo* tales como amiprofos-metilo, anilofos, bensulida, bilanafos, butamifos, 2,4-DEP, DMPA, EBEP, fosamina, glufosinato, glufosinato-P, glifosato y piperofos; *herbicidas de fenoxi* tales como bromofenoxim, clomeprop, 2,4-DEB, 2,4-DEP, difenopenteno, disul, erbón, etnipromid, fenteracol y trifopsima; *herbicidas de oxadiazolina* tales como metazol, oxadiargilo, oxadiazon; *herbicidas de oxazol* tales como fenoxasulfona; *herbicidas fenoxiacéticos* tales como 4-CPA, 2,4-D, 3,4-DA, MCPA, MCPA-tioetilo y 2,4,5-T; *herbicidas fenoxibutíricos* tales como 4-CPB, 2,4-DB, 3,4-DB, MCPB y 2,4,5-TB; *herbicidas fenoxipropiónicos* tales como cloprop, 4-CPP, diclorprop, diclorprop-P, 3,4-DP, fenoprop, mecoprop y mecoprop-P; *herbicidas ariloxifenoxipropiónicos* tales como clorazifop, clodinafop, clofop, cihalofop, diclofop, fenoxaprop, fenoxaprop-P, fentiafop, fluzifop, fluzifop-P, haloxifop, haloxifop-P, isoxapirifop, metamifop, propaquizafop, quizalofop, quizalofop-P y trifop; *herbicidas de fenilendiamina* tales como dinitramina y prodiamina; *herbicidas de pirazol* tales como piroxasulfona; *herbicidas de benzolpirazol* tales como benzofenap, pirasulfotol, pirazolinato, pirazoxifenol y topamezona; *herbicidas de fenilpirazol* tales como fluzolato, nipiraclofenol, pioxadeno y piraflufenol; *herbicidas de piridazina* tales como credazina, piridafol y piridato; *herbicidas de piridazinona* tales como brompirazón, cloridazón, dimidazón, flufenpir, metflurazón, norflurazón, oxapirazón y pidanón; *herbicidas de piridina* tales como aminopiridil, clidinatol, clopiralid, ditiopir, fluroxipir, haloxidina, picloram, picolinafeno, piriclor, tiazopir y triclopir; *herbicidas de pirimidindiamina* tales como iprimidam y tioclorim; *herbicidas de amonio cuaternario* tales como ciperquat, dietamquat, difenzoquat, diquat, morfamquat y paraquat; *herbicidas de tiocarbamato* tales como butilato, cicloato, di-alato, EPTC, esprocarb, etiolato, isopolinato, metiobencarb, molinato, orbencarb, pebulato, prosulfocarb, piributicarb, sulfalato, tiobencarb, tiocarbazilo, tri-alato y vernolato; *herbicidas de tiocarbonato* tales como dimexano, EXD y proxano; *herbicidas de tiourea* tales como metiurón; *herbicidas de triazina* tales como dipropetrina, indaziflam, triaziflam y trihidroxitriazina; *herbicidas de clorotriazina* tales como atrazina, clorazina, cianazina, ciprazina, eglinazina, ipazina, mesoprazina, procirozina, proglinazina, propazina, sebutilazina, simazina, terbutilazina y trietazina; *herbicidas de metoxitriazina* tales como atratón, metometón, prometón, sebumetón, simetón y terbumetón; *herbicidas de metiltiotriazina* tales como ametrina, aziprotrina, cianatrina, desmetrina, dimetametrina, metoprotrina, prometrina, simetrina y terbutrina; *herbicidas de triazinona* tales como ametriona, amibuzina, hexazinona, isometiozina, metamitrón y metribuzina; *herbicidas de triazol* tales como amitrol, cafenstrol, epronaz y flupoxam; *herbicidas de triazolona* tales como amicarbazona, bencarbazona, carfentrazona, flucarbazona, ipfencarbazona, propoxicarbazona, sulfentrazona y tiencarbazona-metilo; *herbicidas de triazolopirimidina* tales como cloransulam, diclosulam, florasulam, flumetsulam, metosulam, penoxsulam y piroxsulam; *herbicidas de uracilo* tales como benzfendizona, bromacilo, butafenacilo, flupropacilo, isocilo, lenacilo, saflufenacilo y terbacilo; *herbicidas de urea* tales como benztiaturón, cumilurón, ciclurón, dicloralurea, diflufenzopir, isonorurón, isourón, metabenztiaturón, monisourón y norurón; *herbicidas de fenilurea* tales como anisurón, buturón, clorbromurón, cloreturón, clorotolurón, cloroxurón, daimurón, difenoxurón, dimefurón, diurón, fenurón, fluometurón, fluotiurón, isoproturón, linurón, metiurón, metildimurón, metobenzurón, metobromurón, metoxurón, monolinurón, monurón, neburón, paraflurón, fenobenzurón, sidurón, tetraflurón y tidiazuron; *herbicidas de pirimidinilsulfonilurea* tales como amidosulfurón, azimsulfurón, bensulfurón, clorimurón, ciclosulfamurón, etoxisulfurón, flazasulfurón, flucetosulfurón, flupirsulfurón, foramsulfurón, halosulfurón, imazosulfurón, mesosulfurón, metazosulfurón, nicosulfurón, ortosulfamurón, oxasulfurón, primisulfurón, propirisulfurón, pirazosulfurón, rimsulfurón, sulfometurón, sulfosulfurón y trifloxisulfurón; *herbicidas de triazinilsulfonilurea* tales como clorsulfurón, cinosulfurón, etametsulfurón, yodosulfurón, metsulfurón, prosulfurón, tifensulfurón, triasulfurón, tribenurón, triflusulfurón y tritosulfurón; *herbicidas de tiadiazolilurea* tales como butiurón, etidimurón, tebutiurón, tiazafurón y tidiazurón; y *herbicidas sin clasificar* tales como acroleína, alcohol alílico, aminociclopiraclor, azafenidina, bentazona, benzobiciclón, biciclopirona, butidazol, cianamida de calcio, cambendiclor, clorfenac, clorfenprop, clorflurazol, clorflurenol, cinmetilina, clomazona, CPMF, cresol, cianamida de calcio, ortodichlorobenceno, dimepiperato, endotal, fluoromidina, fluridona, flurocloridona, flurtamona, flutiacet, indanofán, isotiocianato de metilo, OCH, oxaziclomefona, pentaclorofenol, pentoxazona, acetato de fenilmercurio, prosulfalina, piribenzoxim, pirifalida, quinoclamina, rodetanilo, sulglicapina, tidiazimin, tridifano, trimeturón, tripropindán y tritac.

Otra realización de la presente divulgación es un método para el control o la prevención del ataque fúngico en plantas. Este método comprende aplicar a la tierra, planta, raíces, follaje, semilla o sitio del hongo, o a un sitio en el que la infestación se va a prevenir (por ejemplo, aplicando a plantas de cereal), una cantidad fungicidamente eficaz de uno o más de los compuestos de la fórmula I. Los compuestos son adecuados para el tratamiento de diversas plantas a niveles fungicidas, mientras que presentan baja fitotoxicidad. Los compuestos pueden ser útiles tanto en un modo protector y/o erradicador.

Se ha encontrado que los compuestos tienen efecto fungicida significativo, particularmente para uso agrícola. Muchos de los compuestos son particularmente eficaces para su uso con cultivos agrícolas y plantas hortícolas. Los beneficios adicionales pueden incluir, pero no se limitan a, mejorar la salud de una planta; mejorar el rendimiento de una planta (por ejemplo, aumento de biomasa y/o aumento del contenido de componentes valiosos); mejorar el vigor de una planta (por ejemplo, mejora del crecimiento de la planta y/u hojas más verdes); mejorar la calidad de una

planta (por ejemplo, mejora del contenido o composición de ciertos componentes); y mejora de la tolerancia a estrés abiótico y/o biótico de la planta.

Se entenderá por los expertos en la técnica que la eficacia del compuesto para los hongos anteriores establece la utilidad general de los compuestos como fungicidas.

- 5 Los compuestos tienen amplios intervalos de actividad contra patógenos fúngicos. Los patógenos a modo de ejemplo pueden incluir, pero no se limitan a, mancha foliar del trigo (*Septoria tritici*, también conocido como *Mycosphaerella graminicola*), sarna del manzano (*Venturia inaequalis*) y manchas foliares por *Cercospora* de remolachas azucareras (*Cercospora beticola*), manchas foliares de cacahuete (*Cercospora arachidicola* y *Cercosporidium personatum*) y otros cultivos, y sigatoka negra de bananas (*Mycosphaerella fijiensis*). La cantidad exacta del material activo que se va a aplicar es dependiente no solo del material activo específico que se aplica, sino también de la acción particular deseada, las especies fúngicas que se van a controlar y el estadio de su crecimiento, así como la parte de la planta u otro producto que se va a poner en contacto con el compuesto. Así, todos los compuestos, y formulaciones que los contienen, pueden no ser igualmente de eficaces a concentraciones similares o contra las mismas especies fúngicas.
- 10
- 15 Los compuestos son eficaces en uso con plantas en una cantidad inhibidora de la enfermedad y fitológicamente aceptable. El término "cantidad inhibidora de la enfermedad y fitológicamente aceptable" se refiere a una cantidad de un compuesto que destruye o inhibe la enfermedad de la planta para la que se desea control, pero no es significativamente tóxica para la planta. Esta cantidad generalmente será desde aproximadamente 0,1 hasta aproximadamente 1000 ppm (partes por millón), prefiriéndose 1 a 500 ppm. La cantidad exacta de un compuesto requerido varía con la enfermedad fúngica que se va a controlar, el tipo de formulación empleado, el método de aplicación, la especie de planta particular, condiciones climáticas, y similares. Una dosis adecuada normalmente está en el intervalo desde aproximadamente 0,10 hasta aproximadamente 4 libras/acre (aproximadamente 0,01 a 0,45 gramos por metro cuadrado, g/m²).
- 20

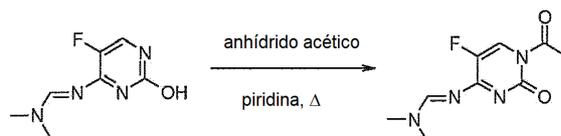
25 Cualquier intervalo o valor deseado dado en el presente documento puede ser ampliado o alterado sin perder los efectos buscados, como es evidente para el experto para entendimiento de las enseñanzas en el presente documento.

Los compuestos de la fórmula I o II, respectivamente, se pueden preparar usando procedimientos químicos bien conocidos. Los productos intermedios no específicamente mencionados en la presente divulgación están o bien comercialmente disponibles, se pueden preparar por vías desveladas en la bibliografía química, o bien se pueden sintetizar fácilmente a partir de materiales de partida comerciales que utilizan los procedimientos convencionales.

30

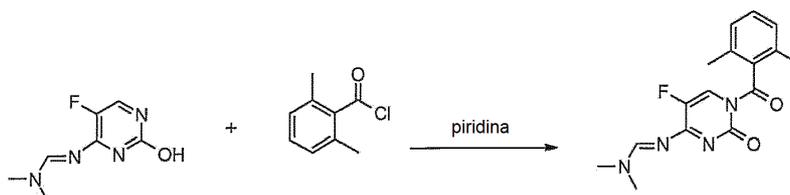
Los siguientes ejemplos se presentan para ilustrar los diversos aspectos de los compuestos de la presente divulgación y no se deben interpretar como limitaciones a las reivindicaciones.

Ejemplo 1: Preparación de *N*-(1-acetil-5-fluoro-2-oxo-1,2-dihidropirimidin-4-il)-*N,N*-dimetilformamidina (1)



- 35 Se suspendió *N*-(5-fluoro-2-hidroxi-pirimidin-4-il)-*N,N*-dimetilformamidina (70 miligramos (mg), 38 milimoles (mmoles)) en piridina (1 mililitro (ml)) y se añadió anhídrido acético (3 gota, exceso). Se agitó el vial de reacción y se calentó brevemente con una pistola de calor hasta que resultó una disolución transparente. Tras enfriarse, la disolución de reacción siguió estando clara, y el análisis de cromatografía de líquidos de ultra-rendimiento (UPLC) indicó 100 % de conversión en un material con el peso molecular (MW) del producto deseado. La evaporación dio un residuo sólido que se agitó con una pequeña cantidad de dietil éter (Et₂O) y heptano y se filtró dando el compuesto del título como un sólido blanco (57 mg, 65 %): p.f. 125-130 °C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 8,88 (s, 1H), 8,19 (d, 1H), 3,29 (s a, 6H), 2,81 (s, 3H); ESIMS *m/z* 227 ([M+H]⁺).
- 40

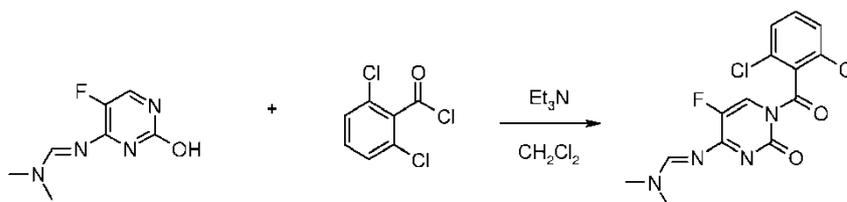
Ejemplo 2: Preparación de *N*-[1-(2,6-dimetilbenzoyl)-5-fluoro-2-oxo-1,2-dihidro-pirimidin-4-il]-*N,N*-dimetilformamidina (2)



45

A un vial con tapa roscada de 8 ml se añadieron piridina (2 ml), *N*-(5-fluoro-2-hidroxi-pirimidin-4-il)-*N,N*-dimetilformamida (100 mg, 0,54 mmoles) y cloruro de 2,6-dimetilbenzoilo (102 mg, 0,60 mmoles). La mezcla se calentó hasta 40 °C durante 2 h, se evaporó a sequedad y se repartió entre acetato de etilo (EtOAc) y agua (H₂O). La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio (MgSO₄), se filtró, se evaporó, y el residuo se purificó por cromatografía de fase inversa dando el compuesto del título como un sólido blanco (63 mg, 37 %): p.f. 120-150 °C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 8,81 (s, 1H), 8,22 (d, *J* = 6,04 Hz, 1H), 7,23-7,17 (m, 1H), 7,07-7,01 (m, 2H), 3,27 (s, 3H), 3,24 (s, 3H), 2,24 (s, 6H); ESIMS *m/z* 317 ([M+H]⁺).

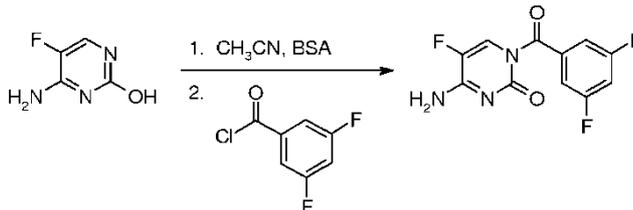
Ejemplo 3: Preparación de *N*-[1-(2,6-diclorobenzoil)-5-fluoro-2-oxo-1,2-dihidro-pirimidin-4-il]-*N,N*-dimetilformamida (3)



A un vial con tapa roscada de 8 ml se añadieron diclorometano (CH₂Cl₂; 4 ml), *N*-(5-fluoro-2-hidroxi-pirimidin-4-il)-*N,N*-dimetilformamida (100 mg, 0,54 mmoles) y trietilamina (Et₃N; 120 mg, 1,2 mmoles). A esta mezcla se añadió cloruro de 2,6-diclorobenzoilo (113 mg, 0,54 mmoles), y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 24 h. Después de evaporación a sequedad, el residuo se recogió en *N,N*-dimetilformamida (DMF; 2 ml), se filtró y se dispuso directamente sobre una columna de cromatografía de fase inversa. Después de la elución, el compuesto del título se aisló como un sólido amarillo pálido (75 mg, 39 %): p.f. 185-187 °C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 8,80 (s, 1H), 8,20 (d, *J* = 5,6 Hz, 1H), 7,31-7,20 (m, 3H), 3,23 (s, 3H), 3,21 (s, 3H); ESIMS *m/z* 357 ([M+H]⁺).

Los Compuestos 4-12 en la Tabla I se prepararon según el Ejemplo 3.

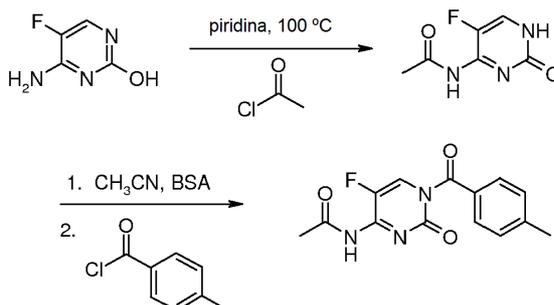
Ejemplo 4: Preparación de 4-amino-1-(3,5-difluorobenzoil)-5-fluoro-1*H*-pirimidin-2-ona (13)



A un vial con tapa roscada de 8 ml que contenía 4-amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol* (100 mg, 0,775 mmoles) y acetonitrilo (CH₃CN; 3 ml) se añadió bis-*N,O*-trimetilsililacetamida (BSA; 378 microlitros (μl), 1,55 mmoles). La mezcla se calentó hasta 70 °C durante 1 h dando como resultado una disolución transparente. Después del enfriamiento hasta temperatura ambiente, se añadió cloruro de 3,5-difluorobenzoilo (182 μl, 1,55 mmoles), y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 12 h. Se formó un precipitado blanco y se recogió por filtración a vacío. El sólido se lavó con Et₂O (1 x 10 ml) y se secó al aire durante la noche dando el producto final como un sólido blanco (126 mg, 60 %): p.f. 227-231 °C; ¹H RMN (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,54 (s a, 1H), 8,27 (s a, 1H), 8,14 (d, *J* = 6,8 Hz, 1H), 7,80-7,35 (m, 3H); ESIMS *m/z* 270 (M+H), 268 (M-H). *El 4-amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol se puede comprar comercialmente.

Los Compuestos 14-20 en la Tabla I se prepararon según el Ejemplo 4.

Ejemplo 5: Preparación de *N*-(5-fluoro-1-(4-metilbenzoil)-2-oxo-1,2-dihidropirimidin-4-il)acetamida (21)

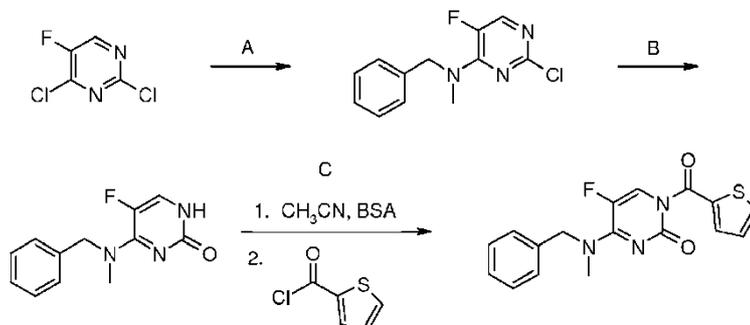


A) A un matraz redondo a temperatura ambiente se añadió 4-amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol* (5,0 g, 38,7 mmoles) y piridina seca (25 ml), seguido por cloruro de acetilo (3,35 ml, 42,6 mmoles). La mezcla se calentó hasta 100 °C durante 90 min, provocando que el sólido se disolviera. La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente (durante lo cual puede precipitar un sólido en la disolución). El sólido se filtró y se lavó sucesivamente con pequeñas cantidades de alcohol etílico (EtOH), agua con hielo y metil *t*-butil éter (MTBE, 50 ml) dando un material sólido blanco. El sólido en bruto se recrystalizó en EtOH y se secó a temperatura ambiente en una estufa de vacío durante 2 h dando un sólido blanco (4,3 g, 65 %). *El 4-amino-5-fluoro-pirimidin-2-ol se puede comprar comercialmente.

B) A un matraz redondo que contenía *N*-(5-fluoro-2-oxo-1,2-dihidropirimidin-4-il)acetamida (350 mg, 2,04 mmoles) en CH₂Cl₂ (20 ml) se añadió cloruro de 4-metilbenzoilo (316 mg, 2,2 mmoles) y Et₃N (454 mg, 4,5 mmoles) a 0 °C. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 3 h. La mezcla de reacción se diluyó con CH₂Cl₂ (30 ml), se lavó con disolución acuosa saturada de cloruro sódico (NaCl ac sat) (1 x 15 ml), se secó sobre Na₂SO₄ y se concentró a vacío. El sólido en bruto se purificó por cromatografía de fase inversa dando *N*-(5-fluoro-1-(4-metilbenzoil)-2-oxo-1,2-dihidropirimidin-4-il)acetamida como un sólido blanco (16 mg, 3 %): p.f. 146,9-148,2 °C; ¹H RMN (acetona- *d*₆) δ 9,75 (s, 1H), 8,64 (d, *J* = 2,5 Hz, 1H), 8,06 (d, *J* = 8,2 Hz, 2H), 7,44 (d, *J* = 8,1 Hz, 2H), 2,47 (s, 3H), 2,32 (s, 3H).

Los Compuestos 22-24 en la Tabla I se prepararon según el Ejemplo 5.

Ejemplo 6: Preparación de 4-(bencil(metil)amino)-5-fluoro-1-(tiofene-2-carbonil)pirimidin-2(1H)-ona (25)



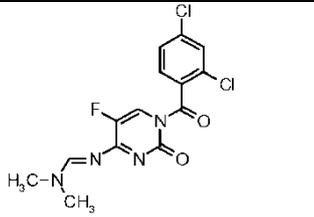
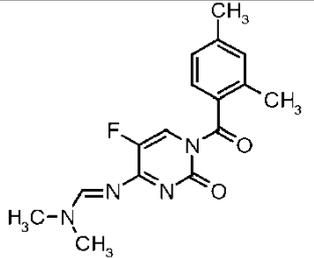
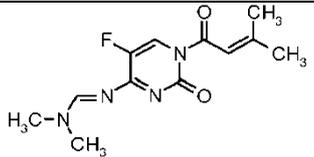
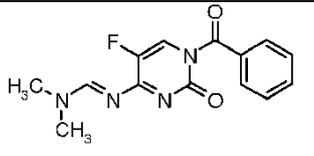
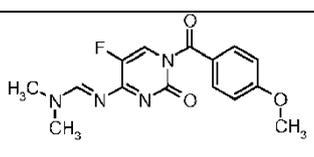
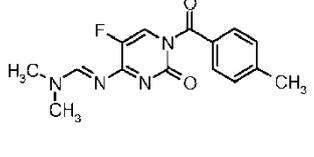
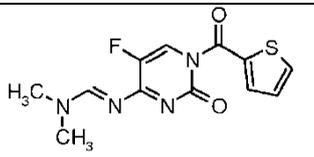
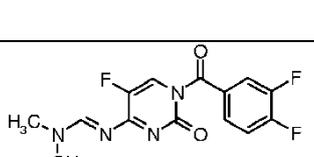
A) A una suspensión de 2,4-dicloro-5-fluoropirimidina (0,30 g, 1,80 mmoles) en dioxano (3,6 ml) se añadieron *N*-etil-*N*-isopropilpropan-2-amina (0,23 g, 1,80 mmoles) y *N*-metil-1-fenilmetanamina (0,24 g, 1,98 mmoles), y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 16 h. La reacción se diluyó con EtOAc (15 ml), y la disolución resultante se lavó con H₂O (2 x 5 ml). La fase orgánica se secó sobre Na₂SO₄, se filtró y se concentró dando un aceite amarillo claro que se purificó por cromatografía de fase normal (40 g de SiO₂; gradiente, EtOAc/Hexanos) dando un aceite incoloro que solidificó tras enfriarse. El sólido se secó bajo alto vacío a 23 °C durante 16 h dando *N*-bencil-2-cloro-5-fluoro-*N*-metilpirimidin-4-amina (0,34 g, 76 %) como un sólido blanco: p.f. 47-49 °C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 8,18 (d, *J* = 6,4, 1H), 7,43-7,23 (m, 5H), 4,82 (s, 2H), 3,17 (d, *J* = 3,3, 3H); EIMS *m/z* 251 (M)⁺.

B) A una suspensión de *N*-bencil-2-cloro-5-fluoro-*N*-metilpirimidin-4-amina (7,5 g, 27,1 mmoles) en dioxano/H₂O (1:1, 186 ml de volumen total) se añadió hidróxido potásico (KOH; 1,7 g, 27,1 mmoles). La mezcla se calentó hasta 100 °C y se agitó durante 72 h. La mezcla de reacción se diluyó con H₂O (50 ml) y el pH se ajustó a 7 con HCl 2 N. El precipitado blanco resultante se recogió por filtración a vacío, pero la mayoría del producto permaneció en la fase acuosa. Se combinaron el sólido y el filtrado y el disolvente se retiró por destilación azeotrópica con CH₃CN a vacío. El residuo se disolvió/suspendió en CH₂Cl₂ (25 ml), se adsorbió sobre Celite (3,0 g) y se purificó por cromatografía ultrarrápida (24 g de SiO₂; gradiente, MeOH/CH₂Cl₂) dando 4-(bencil(metil)amino)-5-fluoropirimidin-2-ol (4,4 g, 45 %) como un sólido blanco: p.f. 122,8-123,6 °C; ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 12,72 (s, 1H), 7,42-7,14 (m, 6H), 4,88 (s, 2H), 3,20 (d, *J* = 3,2, 3H); ESIMS *m/z* 235 (M+2)⁺, 232 (M-H)⁻.

C) A un matraz redondo cargado con 4-(bencil(metil)amino)-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona (250 mg, 1,06 mmoles) en CH₂Cl₂ (11 ml) y cloruro de 2-tiofenocarbonilo (172 mg, 1,1 mmoles, 1,1 eq) se añadió Et₃N (237 mg, 2,35 mmoles) a 0 °C bajo N₂. La mezcla de reacción se calentó hasta temperatura ambiente después de completarse la adición y se agitó a durante 12 h. La mezcla de reacción se diluyó con CH₂Cl₂ (25 ml), se lavó con disolución ac sat de NaCl (10 ml), se secó sobre Na₂SO₄ y se evaporó a sequedad a vacío a temperatura ambiente. El producto en bruto se purificó por cromatografía de fase inversa dando el producto como un sólido blanco (23 mg, 6 %): p.f. 101,3-102,4 °C; ¹H RMN (metanol-*d*₄) δ 8,10 (d, *J* = 6,3 Hz, 1H), 8,00 (d, *J* = 3,8 Hz, 1H), 7,91 (d, *J* = 4,9 Hz, 1H), 7,38-7,20 (m, 6H), 4,88 (s, 2H), 3,22 (d, *J* = 3,2 Hz, 3H); ESIMS *m/z* 344 ([M+H]⁺).

Los Compuestos 26 y 27 en la Tabla I se prepararon según el Ejemplo 6.

TABLA I: Compuestos y datos de caracterización relacionados

Comp	Estructura	EM	P.f. (°C)	Aspecto	RMN ¹ H ² (δ, disolvente)
4		ESIMS ⁺ 357		aceite incoloro claro	(CDCl ₃) 8,85 (s, 1H), 8,04 (d, <i>J</i> = 5,06 Hz, 1H), 7,43-7,30 (m, 3H), 3,26 (s, 3H), 3,25 (s, 3H)
5		ESIMS ⁺ 317		sólido pegajoso blanco	(CDCl ₃) 8,80 (s, 1H), 7,90 (d, <i>J</i> = 5,9 Hz, 1H), 7,29 (d, <i>J</i> = 7,9 Hz, 1H), 7,04 (s, 1H), 6,97 (d, <i>J</i> = 7,9 Hz, 1H), 3,21 (s, 3H), 3,19 (s, 3H), 2,42 (s, 3H), 2,31 (s, 3H)
6		ESIMS 289 (M+Na)	128-130		(CDCl ₃) 8,85 (s, 1H), 8,03 (d, <i>J</i> = 6,3 Hz, 1H), 6,85 (s a, 1H), 3,24 (s, 3H), 3,23 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 2,02 (s, 3H)
7		ESIMS <i>m/z</i> 289 ([M+H] ⁺)	137,3-139,2	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8,68 (s, 1H), 8,44 (d, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 8,11 (dd, <i>J</i> = 8,3, 1,2 Hz, 2H), 7,83-7,75 (m, 1H), 7,63 (t, <i>J</i> = 7,8 Hz, 2H), 3,20 (s, 3H), 3,11 (s, 3H)
8		ESIMS <i>m/z</i> 319 ([M+H] ⁺)	126,2-128,3	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8,67 (s, 1H), 8,42 (d, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 8,09-8,03 (m, 2H), 7,19-7,09 (m, 2H), 3,88 (s, 3H), 3,20 (s, 3H), 3,11 (s, 3H)
9		ESIMS <i>m/z</i> 303 ([M+H] ⁺)	128,8-130,5	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8,67 (s, 1H), 8,43 (d, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> = 8,2 Hz, 2H), 7,43 (d, <i>J</i> = 8,3 Hz, 2H), 3,19 (s, 3H), 3,11 (s, 3H), 2,43 (s, 3H)
10		ESIMS <i>m/z</i> 295 ([M+H] ⁺)	154,8-156,5	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8,68 (s, 1H), 8,43 (d, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 8,14 (dd, <i>J</i> = 4,9, 1,2 Hz, 1H), 8,03 (dd, <i>J</i> = 3,8, 1,3 Hz, 1H), 7,33 (dd, <i>J</i> = 4,9, 3,8 Hz, 1H), 3,21 (s, 3H), 3,11 (s, 3H)
11		ESIMS <i>m/z</i> 325 ([M+H] ⁺)	130-132	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8,67 (s, 1H), 8,45 (d, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 8,18-8,09 (m, 1H), 8,05-7,96 (m, 1H), 7,77-7,65 (m, 1H), 3,20 (s, 3H), 3,11 (s, 3H)

Comp	Estructura	EM	P.f. (°C)	Aspecto	RMN ¹ H ² (δ, disolvente)
12		ESIMS <i>m/z</i> 323 ([M+H] ⁺)	95,3-97,7	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8,71 (s, 1H), 8,48 (d, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 8,10 (dd, <i>J</i> = 4,4, 2,6 Hz, 2H), 7,94-7,86 (m, 1H), 7,68 (dd, <i>J</i> = 26,4, 18,3 Hz, 1H), 3,23 (s, 3H), 3,14 (s, 3H)
14		ESIMS <i>m/z</i> 234 ([M+H] ⁺), 232 ([M-H] ⁻)	213,2-215,3	sólido blanco	(metanol- <i>d</i> ₄) 8,04-7,97 (m, 2H), 7,90 (d, <i>J</i> = 5,6 Hz, 1H), 7,64-7,52 (m, 1H), 7,51 - 7,40 (m, 2H)
15		ESIMS <i>m/z</i> 262 ([M-H] ⁻)	257,9-259,6	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8,28 (s, 1H), 8,08 (d, <i>J</i> = 6,6 Hz, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,74 (d, <i>J</i> = 8,8 Hz, 2H), 7,03 (d, <i>J</i> = 8,8 Hz, 2H), 3,85 (s, 3H)
16		ESIMS <i>m/z</i> 252 ([M+H] ⁺), 250 ([M-H] ⁻)	228,3-229,7	sólido blanco	(metanol- <i>d</i> ₄) 7,90 (d, <i>J</i> = 5,0 Hz, 1H), 7,80 (m, <i>J</i> = 6,8 Hz, 1H), 7,67 (d, <i>J</i> = 5,7 Hz, 1H), 7,60-7,49 (m, 1H), 7,34-7,04 (m, 3H)
17		ESIMS <i>m/z</i> 248 ([M+H] ⁺), 246 ([M-H] ⁻)	257-259,5	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8,34 (s, 1H), 8,19-8,01 (m, 2H), 7,64 (d, <i>J</i> = 8,0 Hz, 2H), 7,30 (d, <i>J</i> = 7,8 Hz, 2H), 2,38 (s, 3H)
18		ESIMS <i>m/z</i> 294 ([M+H] ⁺), 292 ([M-H] ⁻)	170-172	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8,35 (s, 1H), 8,16 (s, 1H), 8,11 (d, <i>J</i> = 6,6 Hz, 1H), 7,39 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 1H), 7,32 (s, 1H), 7,05 (d, <i>J</i> = 8,5 Hz, 1H), 3,86 (s, 3H), 3,80 (s, 3H)
19		ESIMS <i>m/z</i> 240 ([M+H] ⁺), 238 ([M-H] ⁻)	223,1-225,2	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8,39 (dd, <i>J</i> = 2,9, 1,3 Hz, 1H), 8,33 (s, 1H), 8,08 (d, <i>J</i> = 6,7 Hz, 2H), 7,60 (dd, <i>J</i> = 5,1, 3,0 Hz, 1H), 7,42-7,35 (m, 1H)
20		ESIMS <i>m/z</i> 270 ([M+H] ⁺), 268 ([M-H] ⁻)	150-152	sólido blanco	(DMSO- <i>d</i> ₆) 8,48 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,12 (d, <i>J</i> = 6,8 Hz, 1H), 7,87 (ddd, <i>J</i> = 10,9,7,7, 2,1 Hz, 1H), 7,66-7,51 (m, 2H)
22		ESIMS <i>m/z</i> 276 ([M+H] ⁺), 274 ([M-H] ⁻)	122,8-123,6	sólido blanco	(CDCl ₃) 8,43 (d, <i>J</i> = 1,9 Hz, 1H), 8,20 (dd, <i>J</i> = 8,4, 1,3 Hz, 2H), 7,79 (s, 1H), 7,67 (dd, <i>J</i> = 10,5,4,4 Hz, 1H), 7,53 (dd, <i>J</i> = 9,8, 5,8 Hz, 2H), 2,57 (s, 3H)
23		ESIMS <i>m/z</i> 310 ([M+H] ⁺)	129,5-131	sólido blanquecino	(acetona- <i>d</i> ₆) 9,78 (s, 1H), 8,65 (d, <i>J</i> = 2,5 Hz, 1H), 8,20-8,07 (m, 1H), 7,89-7,79 (m, 1H), 7,70-7,64 (m, 1H), 7,58-7,44 (m, 1H), 2,32 (s, 3H)

Comp	Estructura	EM	P.f. (°C)	Aspecto	RMN ¹ H ² (δ, disolvente)
24		ESIMS <i>m/z</i> 282 ([M+H] ⁺)		goma amarilla	(acetona- <i>d</i> ₆) 9,78 (s, 1H), 8,64 (d, <i>J</i> = 2,5 Hz, 1H), 8,09-8,02 (m, 2H), 7,37- 7,30 (m, 1H), 2,32 (s, 3H)
26		ESIMS <i>m/z</i> 374 ([M+H] ⁺)		líquido marrón	(acetona- <i>d</i> ₆) 8,16 (d, <i>J</i> = 6,1 Hz, 1H), 8,08-8,01 (m, 2H), 7,58 (dt, <i>J</i> = 9,9, 7,9 Hz, 1H), 7,40-7,32 (m, 5H), 4,91 (s, 2H), 3,24 (d, <i>J</i> = 3,4 Hz, 3H)
27		ESIMS <i>m/z</i> 368 ([M+H] ⁺)		líquido	(acetona- <i>d</i> ₆) 8,14 (d, <i>J</i> = 6,2 Hz, 1H), 8,12-8,08 (m, 2H), 7,38-7,34 (m, 5H), 7,13-7,09 (m, 2H), 4,91 (s, 2H), 3,94 (s, 3H), 2,83 (s, 3H)

Ejemplo 5: Evaluación de la actividad fungicida: Mancha foliar del trigo (*Mycosphaerella graminicola*; anamorfo: *Septoria tritici*; código de Bayer SEPTTR)

- 5 Se cultivaron plantas de trigo (variedad Yuma) a partir de semilla en un invernadero en 50 % de tierra mineral / 50 % de mezcla Metro sin tierra hasta que emergió completamente la primera hoja, con 7-10 plantas de semillero por maceta. Estas plantas se inocularon con una suspensión acuosa de esporas de *Septoria tritici* ya fuera antes de o después de los tratamientos fungicidas. Después de la inoculación, las plantas se mantuvieron en 100 % de humedad relativa (un día en cámara de rocío oscura, seguido por dos o tres días en una cámara de rocío iluminada) para permitir que las esporas germinaran e infestaran la hoja. Las plantas se transfirieron entonces a un invernadero para el desarrollo de enfermedad.

La siguiente tabla presenta la actividad de compuestos típicos de la presente divulgación cuando se evaluaron en estos experimentos. La eficacia de los compuestos de prueba en controlar la enfermedad se determinó evaluando la gravedad de la enfermedad en las plantas tratadas, luego convirtiendo la gravedad en porcentaje de control basado en el nivel de enfermedad en plantas inoculadas no tratadas.

- 15 En cada caso de la Tabla II, la escala de clasificación es del siguiente modo:

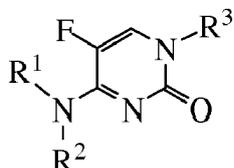
% de control de enfermedad	Clasificación
76-100	A
51-75	B
26-50	C
0-25	D
No probado	E

TABLA II: Actividad protectora de un día (1DP) y curativa de tres días (3DC) de compuestos en SEPTTR a 100 ppm

Comp	SEPTTR 100 PPM 1DP	SEPTTR 100 PPM 3DC
1	A	A
2	A	A
3	B	A
4	A	A
5	A	A
6	A	A
7	A	A
8	A	A
9	A	A
10	A	A
11	A	A
12	E	E
13	A	A
14	A	A
15	A	A
16	A	A
17	A	A
18	A	A
19	A	A
20	A	A
21	E	E
22	E	E
23	E	E
24	E	E
25	E	E
26	E	E
27	E	E

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula II:



Fórmula II

en la que R¹ es:

- 5 H;
alquilo C₁-C₆;
bencilo; o
-C(=O)R⁸;

R² es:

- 10 H; o
alquilo C₁-C₆;

alternativamente R¹ y R² se pueden tomar conjuntamente para formar =CR¹¹N(R¹²)R¹³;

R³ es:

- 15 -C(=O)R⁸; o
-C(=S)R⁸;

R⁵ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, halotio, amino, alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₂-C₆-amino, alcoxi C₂-C₆-carbonilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, nitro, hidroxilo o ciano;

20 R⁸ es H, etilo, propilo, butilo, isopropilo, isobutilo, butilo terciario, pentilo, hexilo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, alqueno C₂-C₆, alquino C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema de anillos saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema de anillos condensados 5-6, o con un sistema de anillos condensados 6-6, que contiene cada uno 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

25 R¹¹ es H o alquilo C₁-C₄;

R¹² es H, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

alternativamente R¹¹ y R¹² se pueden tomar conjuntamente para formar un anillo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

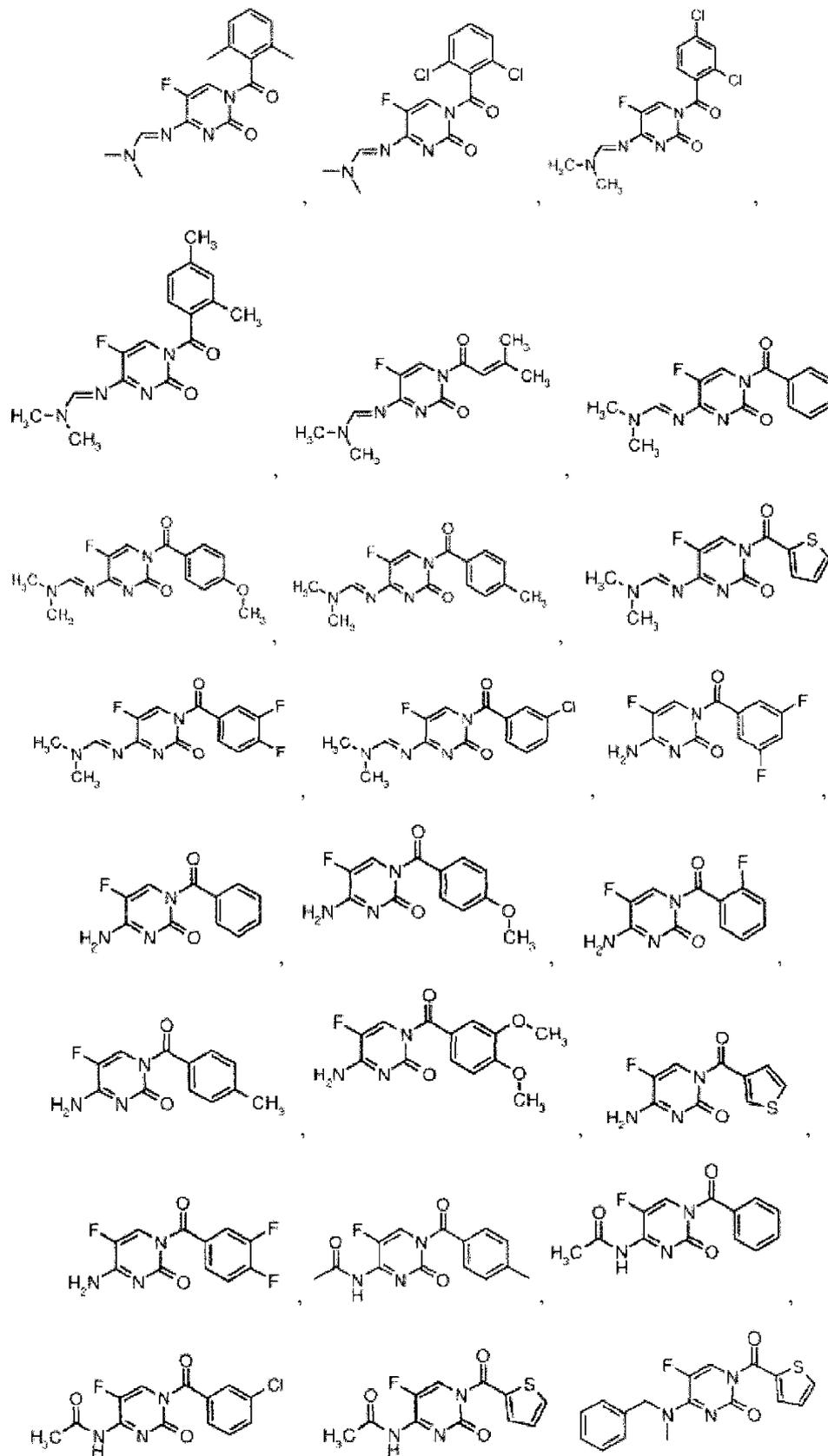
30 R¹³ es H, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵; y

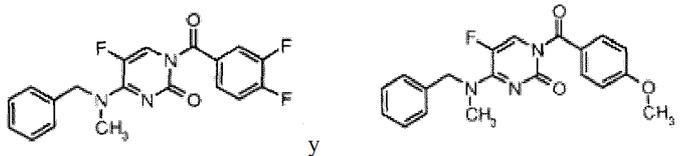
alternativamente R¹² y R¹³ se pueden tomar conjuntamente para formar un anillo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵,
o

35 un isómero óptico, una sal o su hidrato,

en el que el alquilo es una cadena de carbonos ramificada, sin ramificar o cíclica.

2. El compuesto de la reivindicación 1, en el que el compuesto se selecciona de un grupo que consiste en:

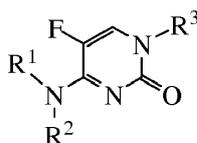




o un isómero óptico, una sal o su hidrato.

3. El compuesto de la reivindicación 1 o 2 en forma de una sal, en el que la sal es un clorhidrato, bromhidrato o yodhidrato.

5 4. Una composición para el control o la prevención de un ataque por un patógeno fúngico en una planta que comprende un compuesto de la fórmula I:



Fórmula I

en la que R¹ es:

H;

10 alquilo C₁-C₆;

bencilo; o

-C(=O)R⁸;

R² es:

H; o

15 C₁-C₆ alquilo;

alternativamente R¹ y R² se pueden tomar conjuntamente para formar =CR¹¹N(R¹²)R¹³;

R³ es:

-C(=O)R⁸; o

-C(=S)R⁸;

20 R⁵ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, halotio, amino, alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₂-C₆-amino, alcoxi C₂-C₆-carbonilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, nitro, hidroxilo o ciano;

25 R⁸ es H, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema de anillos saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema de anillos condensados 5-6, o con un sistema de anillos condensados 6-6, que contiene cada uno 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

R¹¹ es H o alquilo C₁-C₄;

30 R¹² es H, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

alternativamente R¹¹ y R¹² se pueden tomar conjuntamente para formar un anillo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

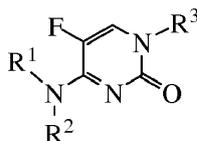
R¹³ es H, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵; y

35 alternativamente R¹² y R¹³ se pueden tomar conjuntamente para formar un anillo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

o

un isómero óptico, una sal o su hidrato y un material de vehículo fitológicamente aceptable,
 en el que el alquilo es una cadena de carbonos ramificada, sin ramificar o cíclica.

5. La composición de la reivindicación 4, en la que el compuesto de la fórmula I está en forma de una sal, en la que la sal es un clorhidrato, bromhidrato o yodhidrato.
- 5 6. La composición de la reivindicación 4 o 5, en la que el patógeno fúngico es sarna del manzano (*Venturia inaequalis*), mancha foliar del trigo (*Septoria tritici*), manchas foliares de remolachas azucareras (*Cercospora beticola*), manchas foliares de cacahuete (*Cercospora arachidicola* y *Cercosporidium personatum*), o sigatoka negra de bananas (*Mycosphaerella fijiensis*).
7. La composición de la reivindicación 6, en la que el patógeno fúngico es mancha foliar del trigo (*Septoria tritici*).
- 10 8. La composición de una cualquiera de las reivindicaciones 4-7, en la que la composición comprende además un tensioactivo adyuvante.
9. La composición de la reivindicación 8, en la que el adyuvante tensioactivo se selecciona de nonilfenoles etoxilados, alcoholes sintéticos o naturales etoxilados, sales de los ésteres o ácidos sulfosuccínicos, organosiliconas etoxiladas, aminas grasas etoxiladas y mezclas de tensioactivos con aceites minerales o vegetales.
- 15 10. La composición de una cualquiera de las reivindicaciones 4-9, en la que la composición se formula como una disolución, polvo, gránulo, polvo humectable, concentrado fluido, concentrado emulsionable, concentrado en suspensión, suspensión acuosa o emulsión.
11. Un método para el control o la prevención del ataque fúngico en una planta, incluyendo el método las etapas de:
 aplicar una cantidad fungicidamente eficaz de al menos un compuesto de la fórmula I:



Fórmula I

20 en la que R¹ es:

- H;
- alquilo C₁-C₆;
- bencilo; o
- C(=O)R⁸;

25 R² es:

- H; o
- alquilo C₁-C₆;
- alternativamente R¹ y R² se pueden tomar conjuntamente para formar =CR¹¹N(R¹²)R¹³;

30 R³ es:

- C(=O)R⁸; o
- C(=S)R⁸;

35 R⁵ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, halotio, amino, alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₂-C₆-amino, alcoxi C₂-C₆-carbonilo, alquil C₂-C₆-carbonilo, nitro, hidroxilo o ciano;

40 R⁸ es H, alquilo C₁-C₆, alquenido C₂-C₆, alquenido C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, o con un sistema de anillos saturado o insaturado de 5 o 6 miembros, o con un sistema de anillos condensados 5-6, o con un sistema de anillos condensados 6-6, que contiene cada uno 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵, bifenilo o naftilo opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

R¹¹ es H o alquilo C₁-C₄;

R¹² es H, ciano, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

5 alternativamente R¹¹ y R¹² se pueden tomar conjuntamente para formar un anillo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

R¹³ es H, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₆, alquil C₂-C₆-carbonilo, fenilo o bencilo, en el que cada uno del fenilo o el bencilo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵;

y

10 alternativamente R¹² y R¹³ se pueden tomar conjuntamente para formar un anillo saturado o insaturado de 5 o 6 miembros que contiene 1-3 heteroátomos en el que cada anillo puede estar opcionalmente sustituido con 1-3 R⁵,
o

un isómero óptico, una sal o su hidrato, a al menos uno de la planta, un área adyacente a la planta, tierra adaptada para soportar el crecimiento de la planta, una raíz de la planta, follaje de la planta y una semilla adaptada para producir la planta,

15 en el que el alquilo es una cadena de carbonos ramificada, sin ramificar o cíclica.

12. El método de la reivindicación 11, en el que el compuesto de la fórmula I está en forma de una sal, en el que la sal es un clorhidrato, bromhidrato o yodhidrato.

13. El método de la reivindicación 11 o 12, en el que la concentración del compuesto de la fórmula I aplicado es desde 0,1 hasta 1000 ppm.

20 14. El método de una cualquiera de las reivindicaciones 11-13, en el que la concentración del compuesto de la fórmula I aplicado es desde 1 hasta 500 ppm.

15. El método de una cualquiera de las reivindicaciones 11-14, en el que el compuesto de la fórmula I se aplica en un intervalo de 0,01 a 0,45 g/m² del compuesto.