

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 810 827**

51 Int. Cl.:

C07D 413/12 (2006.01)

C07D 271/06 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

A01N 43/836 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **08.04.2016 PCT/EP2016/057845**

87 Fecha y número de publicación internacional: **12.10.2017 WO17174158**

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **08.04.2016 E 16715322 (0)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **06.05.2020 EP 3439477**

54 Título: **Derivados de oxadiazol microbiocidas**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la
traducción de la patente:
09.03.2021

73 Titular/es:

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (100.0%)
Rosentalstrasse 67
4058 Basel, CH

72 Inventor/es:

BOU HAMDAN, FARHAN;
STIERLI, DANIEL;
JEANMART, STEPHANE ANDRÉ MARIE;
GODFREY, CHRISTOPHER RICHARD AYLES;
HOFFMAN, THOMAS JAMES;
BEAUDEGNIES, RENAUD y
POULIOT, MARTIN

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 810 827 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).

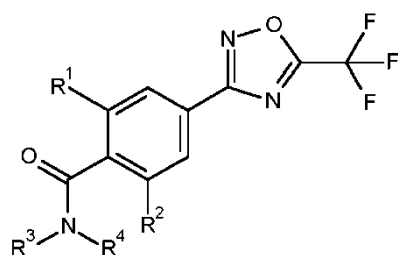
DESCRIPCIÓN

Derivados de oxadiazol microbiocidas

La presente invención se refiere a derivados de oxadiazol microbiocidas, p. ej., como ingredientes activos, que tienen actividad microbiocida, en particular actividad fungicida. La invención también se refiere a composiciones agroquímicas que comprenden al menos uno de los derivados de oxadiazol, a la preparación de estas composiciones y al uso de los derivados o las composiciones de oxadiazol en agricultura u horticultura para controlar o prevenir la infestación de plantas, cultivos alimenticios cosechados, semillas o materiales no vivos por microorganismos fitopatógenos, en particular, hongos.

Derivados de fenil oxadiazol son conocidos como agentes farmacéuticamente activos de, p. ej., el documento WO 2013/008162. Los documentos WO 2013/098146 y WO 2015/185485 describen el uso de oxadiazoles sustituidos para combatir hongos fitopatógenos.

De acuerdo con la invención, se proporciona un compuesto de fórmula (I):



(I)

en donde

R¹ es hidrógeno;

R² es halógeno, metilo o metoxi;

R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄; y

R⁴ representa R^{4A}, R^{4B}, R^{4C}, R^{4D} o R^{4E}; en donde

R^{4A} representa heterociclilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionado de R^{5A};

R^{5A} representa alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄carbonilo, fenilalquilo C₀₋₂;

R^{4B} representa cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5B};

R^{5B} representa ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, alquino C₂₋₄, alcoxi C₁₋₄carbonilo, cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₂, fenilalquilo C₀₋₂, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo o fenilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{6B}; y

R^{6B} representa metilo, metoxi o halógeno;

R^{4C} representa alquilo C₁₋₆, alqueno C₂₋₆ o alquino C₂₋₆, en donde alquilo C₁₋₆ está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5C};

R^{5C} representa halógeno, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, hidroxilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo;

R^{4D} representa un fenilalquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5D};

R^{5D} representa ciano, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alqueno C₂₋₄, alquino C₂₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, dialquil C₁₋₄aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilamino, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆, fenilalquilo C₀₋₆, heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos, seleccionados individualmente de N, O y S, heterociclilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterociclilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{6D}; y

R^{6D} representa metilo, metoxi o halógeno; y

R^{4E} representa heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₆ está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5E};

R^{5E} representa ciano, amino, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alqueno C₂₋₄, alquino C₂₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄amino, dialquil C₁₋₄amino, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, dialquil C₁₋₄aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilamino, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆, fenilalquilo C₀₋₆, heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos, seleccionados individualmente de N, O y S, heterociclilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en

donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterociclilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{6E}; y

R^{6E} representa metilo, metoxi o halógeno;

o una sal o un N-óxido del mismo; en donde,

5 cuando R⁴ es R^{4A}, el compuesto de acuerdo con la Fórmula (I) no es:

2-fluoro-N-(pirrolidin-3-il)-4-[(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)]benzamida,

2-fluoro-N-(1-(pirrolidin-1-il)propan-2-il)-4-[(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)]benzamida,

2-fluoro-N-(1-(piperidin-1-il)propan-2-il)-4-[(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)]benzamida,

2-fluoro-N-(1-morfolinopropan-2-il)-4-[(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)]benzamida, o

10 2-fluoro-N-(4-metoxipirrolidin-3-il)-4-[(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)]benzamida;

cuando R⁴ es R^{4C}, el compuesto de acuerdo con la Fórmula (I) no es:

2-fluoro-N-(1-hidroxiopropan-2-il)-4-[(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)]benzamida; y

cuando R⁴ es R^{4E}, el compuesto de acuerdo con la Fórmula (I) no es:

N-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)benzamida.

15 Sorprendentemente, se ha encontrado que los nuevos compuestos de fórmula (I) tienen, para fines prácticos, un nivel muy ventajoso de actividad biológica para proteger a las plantas contra enfermedades que son provocadas por hongos.

20 De acuerdo con la invención, se proporciona una composición agroquímica que comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de fórmula (I) opcionalmente, que comprende, además, al menos un ingrediente activo adicional y/o un diluyente o portador agroquímicamente aceptable.

25 De acuerdo con la invención, se proporciona un método para controlar o prevenir la infestación de plantas útiles por microorganismos fitopatógenos, en el que una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de fórmula (I), o una composición que comprende este compuesto como ingrediente activo se aplica a las plantas, a partes de las mismas o al emplazamiento de las mismas.

De acuerdo con la invención, se proporciona el uso de un compuesto de fórmula (I) en calidad de un fungicida.

30 En los casos en los que los sustituyentes se indican como opcionalmente sustituidos, esto significa que pueden o no llevar uno o más sustituyentes idénticos o diferentes.

Ciano se refiere a un grupo -CN.

35 Hidroxi se refiere a un grupo -OH.

Halógeno (halo) se refiere a flúor, cloro, bromo o yodo.

Amino se refiere a un grupo -NH₂.

40 Como se usa en este documento, el término "alquilo C₁₋₆" se refiere a un radicar de cadena hidrocarbonada lineal o ramificada que consiste únicamente en átomos de carbono e hidrógeno, que no contiene insaturación, que tiene de uno a seis átomos de carbono, y que está fijado al resto de la molécula por un enlace sencillo. El término "alquilo C₁₋₄" debe interpretarse en consecuencia. Ejemplos de alquilo C₁₋₆ incluyen, pero no se limitan a metilo, etilo, n-propilo, 1-metiletilo (iso-propilo), n-butilo, n-pentilo y 1,1-dimetiletilo (*t*-butilo).

45 Como se usa en este documento, el término "alqueno C₂₋₆" se refiere a un radicar de cadena hidrocarbonada lineal o ramificada que consiste únicamente en átomos de carbono e hidrógeno, que contiene al menos un doble enlace que puede ser de configuración (*E*) o (*Z*), que tiene de dos a seis átomos de carbono, y que está fijado al resto de la molécula por un enlace sencillo. El término "alqueno C₂₋₄" debe interpretarse en consecuencia. Ejemplos de alqueno C₂₋₆ incluyen, pero no se limitan a etenilo, prop-1-enilo, but-1-enilo.

50 Como se usa en este documento, el término "alquino C₂₋₆" se refiere a un grupo radical de cadena hidrocarbonada lineal o ramificada que consiste únicamente en átomos de carbono e hidrógeno, que contiene al menos un triple enlace, que tiene de dos a seis átomos de carbono, y que está fijado al resto de la molécula por un enlace sencillo. El término "alquino C₂₋₄" debe interpretarse en consecuencia. Ejemplos de alquino C₂₋₆ incluyen, pero no se limitan a etinilo, prop-1-inilo, but-1-inilo.

60 Como se usa en este documento, el término "haloalquilo C₁₋₄" se refiere a un radical alquilo C₁₋₄ como se define arriba, sustituido con uno o más radicales halo, como se define arriba. Ejemplos de haloalquilo C₁₋₄ incluyen, pero no se limitan a trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, triclorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 1-fluorometil-2-fluoroetilo, 3-bromo-2-fluoropropilo y 1-bromometil-2-bromoetilo.

65 Como se usa en este documento, el término "alcoxi C₁₋₄" se refiere a un radical de fórmula -O-R_a, en donde R_a es un radical alquilo C₁₋₄ como se define en general arriba. Ejemplos de alcoxi C₁₋₄ incluyen, pero no se limitan a metoxi, etoxi, propoxi, iso-propoxi, n-butoxi.

Como se usa en este documento, el término "alquil C₁₋₄amino" se refiere a un radical de fórmula -NH-R_a, en que R_a es un radical alquilo C₁₋₄ como se define arriba.

Como se usa en este documento, el término "dialquil C₁₋₄amino" se refiere a un radical de la fórmula -N(R_a)(R_b), en que R_a y R_b, independientemente, pueden ser un radical alquilo C₁₋₄ igual o diferente como se define arriba.

Como se usa en este documento, el término "alquil C₁₋₄carbonilo" se refiere a un radical de la fórmula -C(O)-R_a, en que R_a es un radical alquilo C₁₋₄ como se define arriba.

Como se usa en este documento, el término "alcoxi C₁₋₄carbonilo" se refiere a un radical de fórmula -C(O)-O-R_a, en que R_a es un radical alquilo C₁₋₄ como se define arriba.

Como se usa en este documento, el término "alcoxi C₁₋₄carbonilamino" se refiere a un radical de fórmula -NH-C(O)-O-R_a, en que R_a es un radical alquilo C₁₋₄ como se define arriba.

Como se usa en este documento, el término "aminocarbonilo" se refiere a un radical de la fórmula -C(O)-NH₂.

Como se usa en este documento, el término "alquil C₁₋₄aminocarbonilo" se refiere a un radical de la fórmula -C(O)-NH-R_a, en que R_a es un radical alquilo C₁₋₄ como se define arriba.

Como se usa en este documento, el término "dialquil C₁₋₄aminocarbonilo" se refiere a un radical de fórmula -C(O)-N(R_a)-R_a, en que R_a es un radical alquilo C₁₋₄, que puede ser el mismo o diferente, como se define arriba.

Como se usa en este documento, el término "cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆" se refiere a un radical hidrocarbonado monocíclico, no aromático, estable, que consiste únicamente en átomos de carbono e hidrógeno, teniendo el grupo cicloalquilo de tres a ocho átomos de carbono, y que está saturado o parcialmente insaturado y está fijado al resto de la molécula por un enlace sencillo o por un radical alquilo C₁₋₆ como se definió arriba. Los términos "cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₂" y "cicloalquil C₃₋₄alquilo C₀₋₂" deben interpretarse en consecuencia. Ejemplos de cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆ incluyen, pero no se limitan a ciclopropilo, ciclopropil-metilo, ciclobutilo, ciclobutilo-etilo, ciclopentilo, ciclopentil-propilo, ciclohexilo, cicloheptilo y ciclooctilo.

Como se usa en este documento, el término "fenilalquilo C₀₋₆" se refiere a un anillo fenilo unido al resto de la molécula por un enlace sencillo o por un radical alquilo C₁₋₆ como se define arriba. El término "fenilalquilo C₀₋₂" debe interpretarse en consecuencia. Ejemplos de fenilalquilo C₀₋₆ incluyen, pero no se limitan a fenilo y bencilo.

Como se usa en este documento, el término "heterociclilo" o "heterocíclico" se refiere a un radical de anillo monocíclico no aromático de 5 o 6 miembros estable que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos, seleccionados individualmente de nitrógeno, oxígeno y azufre. El radical heterociclilo puede estar unido al resto de la molécula a través de un átomo de carbono o heteroátomo. Ejemplos de heterociclilo incluyen, pero no se limitan a pirrolinilo, pirrolidilo, tetrahidrofurilo, tetrahidrotienilo, piperidilo, piperazinilo, tetrahidropirranilo, morfolinilo o perhidroazepinilo.

Como se usa en este documento, el término "heterociclilalquilo C₀₋₆" se refiere a un anillo heterocíclico como se define arriba que está fijado al resto de la molécula por un enlace sencillo o por un radical alquilo C₁₋₆ como se define arriba. El término "heterociclilalquilo C₀₋₂" debe interpretarse en consecuencia.

Como se usa en este documento, el término "heteroarilo" se refiere a un radical de anillo monocíclico aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados individualmente de nitrógeno, oxígeno y azufre. El radical heteroarilo puede estar unido al resto de la molécula a través de un átomo de carbono o heteroátomo. Ejemplos de heterociclilo incluyen, pero no se limitan a furilo, pirrolilo, tienilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, pirazinilo, piridazinilo, pirimidilo o piridilo.

Como se usa en este documento, el término "heteroarilalquilo C₀₋₆" se refiere a un anillo heteroarilo como se define arriba que está fijado al resto de la molécula por un enlace sencillo o por un radical alquilo C₁₋₆ como se define arriba. De igual manera, los términos "heteroarilalquilo C₀₋₂" y "heteroarilalquilo C₀₋₁" deben interpretarse en consecuencia.

La presencia de uno o más átomos de carbono asimétricos posibles en un compuesto de fórmula (I) significa que los compuestos pueden aparecer en formas ópticamente isoméricas, es decir, formas enantioméricas o diastereoméricas. También pueden existir atropoisómeros como resultado de la rotación restringida alrededor de un enlace sencillo. La fórmula (I) pretende incluir todas esas formas isoméricas posibles y mezclas de las mismas. La presente invención incluye todas esas formas isoméricas posibles y mezclas de las mismas para un compuesto de Fórmula (I). Del mismo modo, la Fórmula (I) pretende incluir todos los tautómeros posibles. La presente invención incluye todas las formas tautoméricas posibles para un compuesto de Fórmula (I).

En cada caso, los compuestos de Fórmula (I) de acuerdo con la invención están en forma libre, en forma oxidada como un N-óxido, en forma hidratada covalentemente o en forma de sal, p. ej., una forma de sal agroquímicamente aceptable.

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

La siguiente lista proporciona definiciones, incluyendo las definiciones preferidas, para los sustituyentes R¹, R², R³, R⁴ (es decir, R^{4A}, R^{4B}, R^{4C}, R^{4D}, R^{4E}), R⁵ (es decir, R^{5A}, R^{5B}, R^{5C}, R^{5D}, R^{5E}) y R⁶ (es decir, R^{6B}, R^{6D}, R^{6E}) con referencia a compuestos de fórmula (I). Para uno cualquiera de estos sustituyentes, cualquiera de las definiciones dadas a continuación puede combinarse con cualquier definición de cualquier sustituyente dado a continuación o en otra parte en este documento.

R¹ es hidrógeno.

R² es halógeno, metilo o metoxi. Preferiblemente, R² es halógeno. Más preferiblemente, R² es cloro o flúor. Lo más preferiblemente, R² es flúor.

R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄. Preferiblemente, R³ es hidrógeno o metilo. Lo más preferiblemente, R³ es hidrógeno.

R⁴ representa R^{4A}, R^{4B}, R^{4C}, R^{4D} o R^{4E}.

En una realización de la invención, R⁴ es R^{4A}. En otra realización de la invención, R⁴ es R^{4B}. En otra realización de la invención, R⁴ es R^{4C}. En otra realización de la invención, R⁴ es R^{4D}. En otra realización de la invención, R⁴ es R^{4E}.

R^{4A} representa heterociclilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionado de R^{5A}.

Preferiblemente, R^{4A} representa heterociclilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heterociclilalquilo C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5A}. Más preferiblemente, R^{4A} representa heterociclilalquilo C₀₋₁, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heterociclilalquilo C₀₋₁ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5A}. Incluso más preferiblemente, R^{4A} representa heterociclilalquilo C₀₋₁, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente de N y O, y en donde el resto heterociclilalquilo C₀₋₁ está opcionalmente sustituido con 1 sustituyente seleccionado de R^{5A}.

En determinadas realizaciones, R^{4A} puede ser un pirrolidinilo, piperidinilo, (pirrolidinil)metilo, (piperidinil)metilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, 1,4-dioxanilo, (tetrahidrofuranil)metilo, (tetrahidropiranil)metilo, (1,4-dioxanil)metilo, 1,3-dioxolanilo, (1,3-dioxolanil)metilo, tetrahidrotienilo, tetrahidropiranilo, (tetrahidrotienil)metilo o (tetrahidropiranil)metilo, que está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5A}.

R^{4B} representa cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5B}.

Preferiblemente, R^{4B} representa cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₂, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5B}. Más preferiblemente, R^{4B} representa cicloalquil C₃₋₄alquilo C₀₋₂, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5B}. Preferiblemente, R^{4B} es ciclopropilo, (ciclopropil)metilo, 1-(ciclopropil)etilo, ciclobutilo, (ciclobutil)metilo, ciclopentilo, (ciclopentil)metilo, ciclohexilo, 1-(ciclohexil)etilo o ciclooctilo, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5B}.

R^{4C} representa alquilo C₁₋₆, alqueno C₂₋₆ o alquino C₂₋₆, en donde alquilo C₁₋₆ está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5C}.

Preferiblemente, R^{4C} representa alquilo C₁₋₆, alqueno C₂₋₆ o alquino C₂₋₆, en donde alquilo C₁₋₆ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5C}, en donde R^{5C} representa alcoxi C₁₋₄ o hidroxilo. Más preferiblemente, R^{4C} representa alquilo C₁₋₆, alqueno C₂₋₆ o alquino C₂₋₆, en donde alquilo C₁₋₆ está opcionalmente sustituido con 1 sustituyente seleccionado de R^{5C}, en donde R^{5C} representa alcoxi C₁₋₄ o hidroxilo. Incluso más preferiblemente, R^{4C} representa alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con 1 sustituyente seleccionado de R^{5C}, en donde R^{5C} representa hidroxilo; o R^{4C} representa alqueno C₂₋₆ o alquino C₂₋₆.

R^{4D} representa un fenilalquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5D}.

Preferiblemente, R^{4D} representa fenilalquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5D}. Más preferiblemente, R^{4D} representa fenilalquilo C₀₋₂ sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5D}.

R^{4E} representa heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₆ está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5E}.

Preferiblemente, R^{4E} representa heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5E}. Más preferiblemente, R^{4E} representa heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo de R^{4E} es un anillo aromático de 5 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5E}. En algunas realizaciones de la invención, R^{4E} comprende al menos un heteroátomo que es azufre, tal como un resto tienilo, en particular, un resto 2-tienilo. En algunas realizaciones de la invención, R^{4E} puede ser piridinilo, pirazolilo, furanilo, triazolilo, imidazolilo, tiazolilo. En algunas realizaciones de la invención, R^{4E} no está sustituido.

R^{5A} representa alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄carbonilo, fenilalquilo C₀₋₂. Preferiblemente, R^{5A} representa metilo, metoxi, metoxicarbonilo, terc.butiloxicarbonilo o bencilo.

R^{5B} representa ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, alquinilo C₂₋₄, alcoxi C₁₋₄carbonilo, cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₂, fenilalquilo C₀₋₂, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo o fenilo está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{6B}.

Preferiblemente, R^{5B} representa ciano, fluoro, metilo, etinilo, ciclopropilo, fenilo o bencilo, en donde los restos ciclopropilo y fenilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{6B}.

R^{5C} representa halógeno, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, hidroxilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo. En determinadas realizaciones, R^{5C} también puede ser haloalcoxi C₁₋₄.

R^{5D} representa ciano, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alquenilo C₂₋₄, alquinilo C₂₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, dialquil C₁₋₄aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilamino, cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₆, fenilalquilo C₀₋₆, heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos, seleccionados individualmente de N, O y S, heterocicilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterocicililo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterocicililo están opcionalmente sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{6D}.

Preferiblemente, R^{5D} representa halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₆, fenilalquilo C₀₋₆, heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, heterocicilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterocicililo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S. Más preferiblemente, R^{5D} representa halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄ o heterocicilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterocicililo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S. Incluso más preferiblemente, R^{5D} se selecciona de fluoro, cloro, metoxi, metilo, etilo, trifluorometilo y N-morfolinilo, en particular, cuando hay 1 o 2 sustituyentes R^{5D}, que pueden ser iguales o diferentes, estos son sustituyentes del anillo fenilo.

R^{5E} representa ciano, amino, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alquenilo C₂₋₄, alquinilo C₂₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄amino, dialquil C₁₋₄amino, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, dialquil C₁₋₄aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilamino, cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₆, fenilalquilo C₀₋₆, heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos, seleccionados individualmente de N, O y S, heterocicilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterocicililo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterocicililo está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{6E}.

Preferiblemente, R^{5E} representa ciano, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alqueno C₂₋₃, alquino C₂₋₃, haloalquilo C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂, alquil C₁₋₂carbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₂aminocarbonilo, dialquil C₁₋₂aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilamino, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₂, fenilalquilo C₀₋₂, heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos, seleccionados individualmente de N, O y S, heterocicliclalquilo C₀₋₂, en donde el resto heterociclico es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterociclico están opcionalmente sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{6E}. Más preferiblemente, R^{5E} representa amino, ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂, alquil C₁₋₂carbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₂aminocarbonilo, dialquil C₁₋₂aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilamino, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₂, en donde cualquiera de dichos restos está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{6E}. Incluso más preferiblemente, R^{5E} representa amino, ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂, aminocarbonilo, en donde cualquiera de dichos restos está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{6E}. Lo más preferiblemente, R^{5E} se selecciona de amino, ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂ o alcoxi C₁₋₂.

R^{6B} representa metilo, metoxi o halógeno. Preferiblemente, R^{6B} representa cloro.

R^{6D} representa metilo, metoxi o halógeno. Preferiblemente, R⁶ representa metilo, metoxi, fluoro o cloro.

R^{6E} representa metilo, metoxi o halógeno. Preferiblemente, R^{6E} representa metilo, metoxi, fluoro o cloro.

Preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es fluoro;

R³ representa hidrógeno, metilo, etilo o n-propilo; y

R⁴ es R^{4A} y representa pirrolidinilo, piperidinilo, (pirrolidinil)metilo, (piperidinil)metilo, tetrahidrofurano, (tetrahidrofurano)metilo, (tetrahidropirano)metilo, (1,4-dioxano)metilo, (1,3-dioxolano)metilo, tetrahidrotieno o tetrahidropirano, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5A}, en donde R^{5A} se selecciona de metilo, metoxi, metoxicarbonilo o terc.-butoxicarbonilo.

Preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es halógeno (preferiblemente fluoro);

R³ es hidrógeno; y

R⁴ es R^{4B} y representa ciclopropilo, (ciclopropil)metilo, 1-(ciclopropil)etilo, ciclobutilo, (ciclobutil)metilo, ciclopentilo, (ciclopentil)metilo, ciclohexilo, 1-(ciclohexil)etilo o ciclooctilo, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5B}, en donde R^{5B} representa ciano, fluoro, metilo, etilo, ciclopropilo, fenilo o bencilo, en donde los restos ciclopropilo y fenilo están opcionalmente sustituidos con 1 sustituyente seleccionado de R^{6B}, en donde R^{6B} es cloro.

Preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es halógeno;

R³ representa hidrógeno, metilo o etilo; y

R⁴ es R^{4C} y representa alqueno C₂₋₆, alquino C₂₋₆ o alquilo C₁₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5C}, en donde R^{5C} representa alcoxi C₁₋₄ o hidroxilo.

Incluso más preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es flúor;

R³ representa hidrógeno o metilo; y

R⁴ es R^{4C} y representa alqueno C₂₋₆, alquino C₂₋₆ o alquilo C₁₋₆, opcionalmente sustituido con 1 sustituyente seleccionado de R^{5C}, en donde R^{5C} representa alcoxi C₁₋₄ o hidroxilo.

Aún más preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es flúor;

R³ es hidrógeno; y

R⁴ es R^{4C} y representa alqueno C₂₋₆, alquino C₂₋₆ o alquilo C₁₋₆, opcionalmente sustituido con 1 sustituyente seleccionado de R^{5C}, en donde R^{5C} representa alcoxi C₁₋₄ o hidroxilo.

Preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es fluoro;

R³ representa hidrógeno o metilo;

R⁴ es R^{4D} y representa un fenilalquilo C₀₋₁, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5D}.

Más preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es fluoro;

R³ representa hidrógeno o metilo;

R⁴ es R^{4D} y representa un fenilalquilo C₀₋₁, opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5D}.

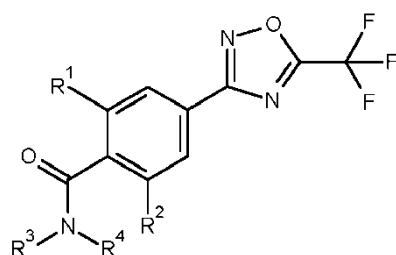
Preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es fluoro;

R³ representa hidrógeno; y

Preferiblemente, R⁴ es R^{4E} y representa heteroarilalquilo C₀₋₁, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto

heteroarilalquilo C₀₋₁ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5E}, en donde R^{5E} se selecciona de amino, ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂ o alcoxi C₁₋₂.

- 5 También, de acuerdo con esta divulgación, se proporciona un método para controlar o prevenir la infestación de una planta útil por microorganismos fitopatógenos, que comprende aplicar a la planta, a una parte de la misma o al emplazamiento de la misma, una cantidad fungicidamente efectiva de un compuesto de fórmula (I):



(I)

10 en donde

R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi;

R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄;

15 R⁴ representa alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, halogenoalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆alquilo C₁₋₆, alquil C₁₋₆carbonilalquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆carbonilalquilo C₁₋₆, hidroxilalquilo C₁₋₆, aminoalquilo C₁₋₆, alquil C₁₋₄aminoalquilo C₁₋₆, dialquil C₁₋₄aminoalquilo C₁₋₆, aminocarbonilalquilo C₁₋₆, alquil C₁₋₄aminocarbonilalquilo C₁₋₆, dialquil C₁₋₄aminocarbonilalquilo C₁₋₆, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆, fenilalquilo C₀₋₆, fenilalquil C₀₋₆aminoalquilo C₁₋₆, fenilalquil C₀₋₆amino(alquil C₁₋₄)alquilo C₁₋₆, heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, heterocicilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo, restos heteroarilo y heterociclilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵;

25 R⁵ representa ciano, amino, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alquenilo C₂₋₄, alquinilo C₂₋₄, halogenoalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄amino, dialquil C₁₋₄amino, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, dialquil C₁₋₄aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilamino, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆, fenilalquilo C₀₋₆, heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos, seleccionados individualmente de N, O y S, heterocicilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterociclilo está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶; y

30 R⁶ representa metilo, metoxi o halógeno;

o una sal o un N-óxido del mismo.

35 La siguiente lista proporciona definiciones, incluyendo definiciones preferidas, para los sustituyentes R¹, R², R³, R⁴, R⁵ y R⁶ con referencia a compuestos de fórmula (I) para uso en el método de controlar o prevenir la infestación de una planta útil por microorganismos fitopatógenos. Para uno cualquiera de estos sustituyentes, cualquiera de las definiciones dadas a continuación puede combinarse con cualquier definición de cualquier sustituyente dado a continuación o en otra parte en este documento.

40 Preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno o halógeno. Más preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, flúor o cloro. Lo más preferiblemente, R¹ y R² son hidrógeno o R¹ es hidrógeno y R² es flúor.

45 Preferiblemente, R³ representa hidrógeno o metilo. Lo más preferiblemente, R³ representa hidrógeno.

Preferiblemente, R⁴ representa (i) heterocicilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos individualmente seleccionados de N, O y S; (ii) cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆; (iii) alquilo C₁₋₆, en donde alquilo C₁₋₆ está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, que es alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, hidroxilo, amino, alquil C₁₋₄amino, dialquil C₁₋₄amino, aminocarbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, dialquil C₁₋₄aminocarbonilo; (iv) alquenilo C₂₋₆; (v) alquinilo C₂₋₆; (vi) fenilalquilo C₀₋₆; o (vii) heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos individualmente seleccionados de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterociclilo está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵. Más preferiblemente, dichos restos heterociclilo, cicloalquilo, fenilo o heteroarilo están sustituidos opcionalmente con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵.

Incluso más preferiblemente, R⁴ representa (i) pirrolidinilo, piperidinilo, (pirrolidinil)metilo, (piperidinil)metilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, 1,4-dioxanilo, (tetrahidrofuranil)metilo, (tetrahidropiranil)metilo, (1,4-dioxanil)metilo, 1,3-dioxolanilo, (1,3-dioxolanil)metilo, tetrahidrotienilo, tetrahidropiranilo, (tetrahidrotienil)metilo o (tetrahidropiranil)metilo, que está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes seleccionados de R⁵; (ii) ciclopropilo, (ciclopropil)metilo, 1-(ciclopropil)etilo, ciclobutilo, (ciclobutil)metilo, ciclopentilo, (ciclopentil)metilo, ciclohexilo, 1-(ciclohexil)etilo o ciclooctilo, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵; (iii) alquilo C₁₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, que es alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, hidroxilo, amino, alquil C₁₋₄amino, dialquil C₁₋₄amino, aminocarbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, dialquil C₁₋₄aminocarbonilo; (iv) alqueno C₂₋₆; (v) alquino C₂₋₆; (vi) fenilalquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵; o (vii) heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo de R⁴ es un anillo de 5 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos individualmente seleccionados de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵.

Lo más preferiblemente, R⁴ representa pirrolidinilo, piperidinilo, (pirrolidinil)metilo, (piperidinil)metilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, 1,4-dioxanilo, (tetrahidrofuranil)metilo, (tetrahidropiranil)metilo, (1,4-dioxanil)metilo, 1,3-dioxolanilo, (1,3-dioxolanil)metilo, tetrahidrotienilo, tetrahidropiranilo, (tetrahidrotienil)metilo o (tetrahidropiranil)metilo, que está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa metilo, etilo, metoxi, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, terc.-butiloxicarbonilo o bencilo; o ciclopropilo, (ciclopropil)metilo, 1-(ciclopropil)etilo, ciclobutilo, (ciclobutil)metilo, ciclopentilo, (ciclopentil)metilo, ciclohexilo, 1-(ciclohexil)etilo o ciclooctilo, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵ en donde R⁵ representa ciano, fluoro, metilo, ciclopropilo, fenilo o bencilo; o alquilo C₁₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa alcoxi C₁₋₄ o hidroxilo; o alqueno C₂₋₆, alquino C₂₋₆; o fenilalquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa fluoro, cloro, metilo, metoxi, etoxi o trifluorometilo; o heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo de R⁴ es un anillo de 5 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa ciano, amino, cloro, bromo, metilo, t-butilo, metoxi o trifluorometilo.

Preferiblemente, R⁵ representa ciano, amino, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alquino C₂₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₆carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₂, fenilalquilo C₀₋₂, heterocicliclquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclico es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos individualmente seleccionados de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo y heterociclico está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶.

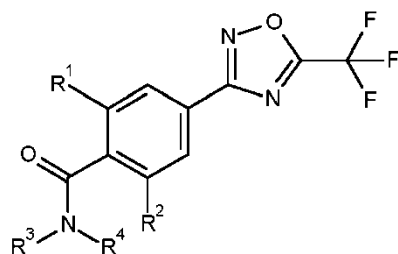
Preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno o halógeno; R³ representa hidrógeno o metilo;

R⁴ representa pirrolidinilo, piperidinilo, (pirrolidinil)metilo, (piperidinil)metilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, 1,4-dioxanilo, (tetrahidrofuranil)metilo, (tetrahidropiranil)metilo, (1,4-dioxanil)metilo, 1,3-dioxolanilo, (1,3-dioxolanil)metilo, tetrahidrotienilo, tetrahidropiranilo, (tetrahidrotienil)metilo o (tetrahidropiranil)metilo, que está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes seleccionados de R⁵; ciclopropilo, (ciclopropil)metilo, 1-(ciclopropil)etilo, ciclobutilo, (ciclobutil)metilo, ciclopentilo, (ciclopentil)metilo, ciclohexilo, 1-(ciclohexil)etilo o ciclooctilo, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵; alquilo C₁₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, que es alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, hidroxilo, amino, alquil C₁₋₄amino, dialquil C₁₋₄amino, aminocarbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, dialquil C₁₋₄aminocarbonilo; fenilalquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵; o heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo de R⁴ es un anillo de 5 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos individualmente seleccionados de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵; R⁵ representa ciano, amino, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alquino C₂₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₆carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₂, fenilalquilo C₀₋₂, heterocicliclquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclico es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos individualmente seleccionados de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo y heterociclico está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶; y R⁶ representa metilo, metoxi o halógeno.

Más preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno o halógeno; R³ representa hidrógeno o metilo;

R⁴ representa pirrolidinilo, piperidinilo, (pirrolidinil)metilo, (piperidinil)metilo, tetrahydrofurano, tetrahidropirano, 1,4-dioxano, (tetrahydrofurano)metilo, (tetrahidropirano)metilo, (1,4-dioxano)metilo, 1,3-dioxolano, (1,3-dioxolano)metilo, tetrahidrotieno, tetrahidropirano, (tetrahidrotieno)metilo o (tetrahidropirano)metilo, que está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa metilo, etilo, metoxi, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, terc.-butoxycarbonilo o bencilo; o ciclopropilo, (ciclopropil)metilo, 1-(ciclopropil)etilo, ciclobutilo, (ciclobutil)metilo, ciclopentilo, (ciclopentil)metilo, ciclohexilo, 1-(ciclohexil)etilo o ciclooctilo, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa ciano, fluoro, metilo, ciclopropilo, fenilo o bencilo; o alquilo C₁₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa alcoxi C₁₋₄ o hidroxilo; o fenilalquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa fluoro, cloro, metilo, metoxi, etoxi o trifluorometilo; o heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo de R⁴ es un anillo de 5 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa ciano, amino, cloro, bromo, metilo, t-butilo, metoxi o trifluorometilo.

También, de acuerdo con esta divulgación, se proporciona un compuesto de fórmula (IA):



(IA)

en donde

R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi;

R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄;

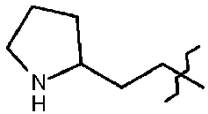
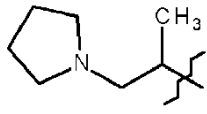
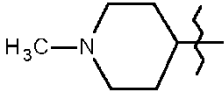
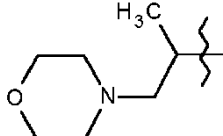
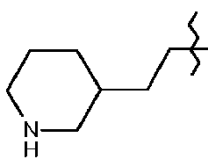
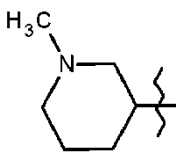
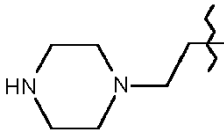
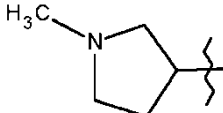
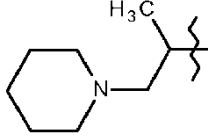
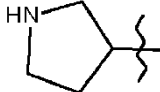
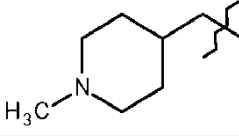
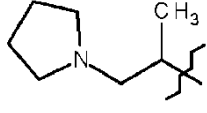
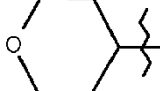
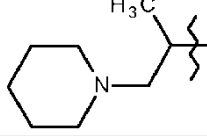
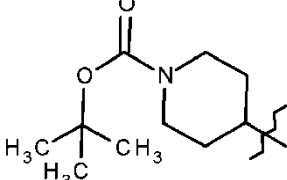
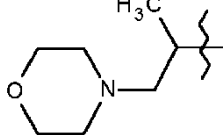
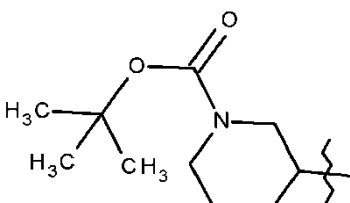
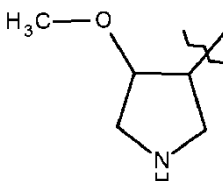
R⁴ representa heterociclilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos individualmente seleccionados de N, O y S, opcionalmente sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵;

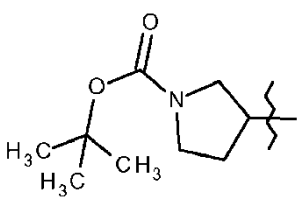
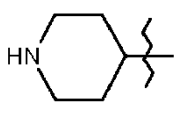
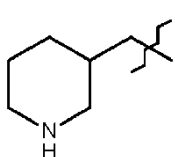
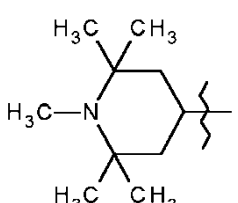
R⁵ representa alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄carbonilo, fenilalquilo C₀₋₂;

o una sal o un N-óxido del mismo;

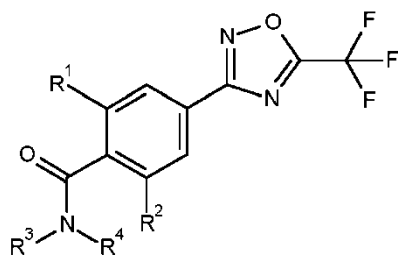
en donde el compuesto de fórmula (IA) no es un compuesto en donde R¹ es hidrógeno y R², R³ y R⁴ son como sigue:

R ²	R ³	R ⁴	R ²	R ³	R ⁴
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	

R ²	R ³	R ⁴	R ²	R ³	R ⁴
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		F	H	
H	H		F	H	
H	H		F	H	
H	H		F	H	
H	H		F	H	

R ²	R ³	R ⁴	R ²	R ³	R ⁴
H	H		H	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	
H	H		H	H	

También, de acuerdo con esta divulgación, se proporciona un compuesto de fórmula (IB):



(IB)

en donde

R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi;

R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄;

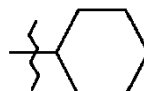
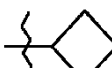
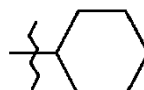
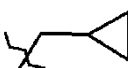
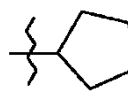
10 R⁴ representa cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵;

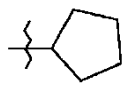
R⁵ representa ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, alquilo C₂₋₄, alcoxi C₁₋₄carbonilo, cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₂, fenilalquilo C₀₋₂, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo o fenilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶; y

15 R⁶ representa metilo, metoxi o halógeno;

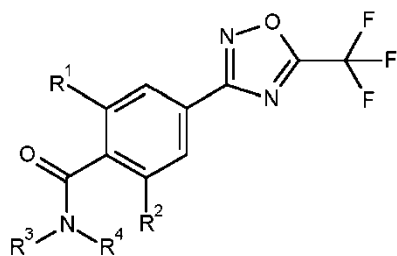
o una sal o un N-óxido del mismo, y

en donde el compuesto de fórmula (IB) no es un compuesto en donde R¹ y R² son ambos hidrógeno y R³ y R⁴ son como sigue:

R ³	R ⁴	R ³	R ⁴
H		H	
H		-CH ₃	
H		-CH ₂ CH ₃	
H		-	-

R ³	R ⁴	R ³	R ⁴
			

También, de acuerdo con esta divulgación, se proporciona un compuesto de fórmula (IC):



(IC)

en donde

R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi;

R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄;

R⁴ representa alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆ o alquinilo C₂₋₆, en donde alquilo C₁₋₆ está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵;

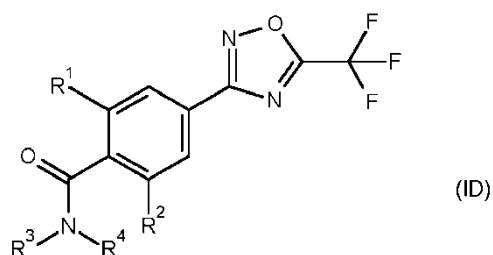
R⁵ representa halógeno, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, hidroxilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo; o una sal o un N-óxido del mismo, y

en donde el compuesto de fórmula (IC) no es un compuesto en donde R¹ y R² son ambos hidrógeno y R³ y R⁴ son como sigue:

R ³	R ⁴	R ³	R ⁴
H	-CH ₃	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
H	-CH ₂ CH ₃	H	-CH(CH ₂ OH)(CH ₂ CH(CH ₃) ₂)
H	-CH ₂ CH ₂ OH	H	-C(CH ₃)(CH ₂ CH ₂ CH ₃)C(O)OCH ₃
H	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	C(CH ₃) ₂ CH ₂ OCH ₃
H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH	H	-CH(CH(CH ₃) ₂)C(O)OCH ₃
H	-C(H)(CH ₃) ₂	H	-CH ₂ C(O)NH(C(CH ₃) ₃)
H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	H	-CH(CH ₃)C(O)OCH ₃
H	-CH ₂ CH ₂ F	-CH ₃	-CH ₃
H	-CH ₂ C(H)(CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₂ CH ₃
H	-CH(CH ₃)CH ₂ OH	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OH
H	-CH(CH ₂ CH ₃) ₂	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃
H	-CH(CH ₂ CH ₃)(CH ₂ OH)	-CH ₃	-CH(CH ₃) ₂
H	-CH ₂ C(O)NHCH ₃	-	-

o no es un compuesto de acuerdo con la Fórmula (IC), en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es hidrógeno y R⁴ es -CH(CH₃)CH₂OH.

También, de acuerdo con esta divulgación, se proporciona un compuesto de fórmula (ID):



en donde

R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi;

R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄;

R⁴ representa un fenilalquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵;

R⁵ representa ciano, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alqueno C₂₋₄, alquino C₂₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄ carbonilo, alcoxi C₁₋₄ carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₄ aminocarbonilo, dialquil C₁₋₄ aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₄ carbonilamino, cicloalquil C₃₋₆ alquilo C₀₋₆, fenilalquilo C₀₋₆, heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un

anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos, seleccionados individualmente de N, O y S, heterociclilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterociclilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶; y

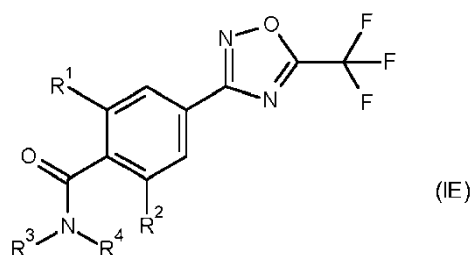
R⁶ representa metilo, metoxi o halógeno;

o una sal o un N-óxido del mismo, y

en donde el compuesto de fórmula (I) no es un compuesto en donde R¹ y R² juntos son hidrógeno y R³ y R⁴ son como sigue:

R ³	R ⁴	R ³	R ⁴
H	-Ph	H	-(2-Cl-5-OCH ₃)Ph
H	-CH ₂ (4-(N-morfolinil)metil)Ph	H	-(3-Cl-6-OCH ₃)Ph
H	-CH ₂ CH ₂ Ph	H	-(2-CH ₃ -4-Cl)Ph
H	-CH ₂ Ph	H	-(2-Cl)Ph
H	-CH(CH ₃)(4-CN)Ph	H	-(4-CH ₃)Ph
H	-CH ₂ (3-CH ₂ OCH ₃)Ph	H	-(2-OCH ₃ -5-OCH ₃)Ph
H	-CH ₂ (3-F-4-(N-piperazinil)Ph	H	-(2-Cl-5-F)Ph
H	-(3-CN)Ph	H	-(2-Cl-4-F)Ph
H	-(3-Cl-4-OCH ₃)Ph	H	-(2-Cl-4-OCH ₃)Ph
H	-CH ₂ CH(OH)(3-F)Ph	H	-(2-OCH ₃ -5-CH ₃)Ph
H	-(2-OH)Ph	H	-(2-OH-5-CN)Ph
H	-(3-OCH ₃ -4-OCH ₃)Ph	H	-(2-C(O)NH(CH ₃))Ph
H	-(2-OH-3-Cl)Ph	H	-(2-Cl-5-CN)Ph
H	-(3-OCH ₃ -5-OCH ₃)Ph	H	-(2-CN-3-F)Ph
H	-(2-OCH ₃ -4-OCH ₃)Ph	-CH ₃	-CH ₂ (2-F)Ph
H	-(3-F-4-CH ₃)Ph	-CH ₃	-CH ₂ Ph
H	-(3-OCH ₃)Ph	-CH ₃	-Ph
H	-(2-CH ₃)Ph	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Ph
H	-(2-OH-5-Cl)Ph	-	-

También, de acuerdo con esta divulgación, se proporciona un compuesto de fórmula (IE):



en donde

R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi;

5 R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄;

R⁴ representa heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₆ está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵;

10 R⁵ representa ciano, amino, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alqueno C₂₋₄, alquino C₂₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄amino, dialquil C₁₋₄amino, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, dialquil C₁₋₄aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilamino, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆, fenilalquilo C₀₋₆, heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos, seleccionados individualmente de N, O y S, heterociclilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterocicilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterocicilo está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶; y

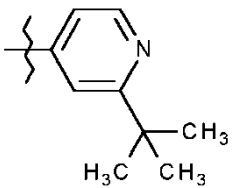
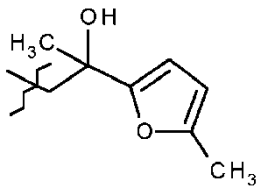
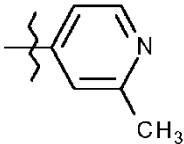
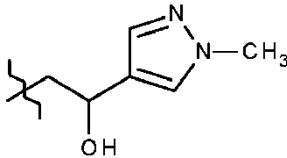
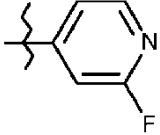
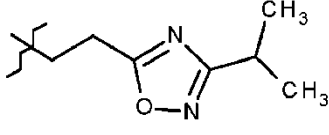
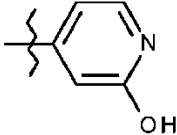
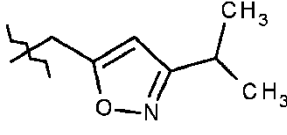
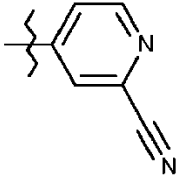
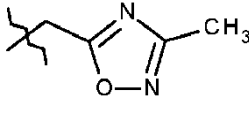
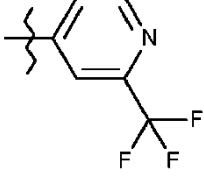
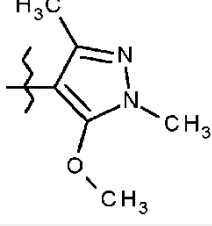
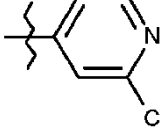
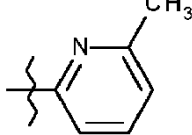
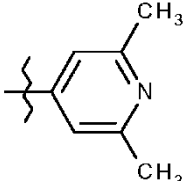
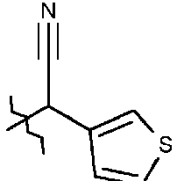
15 R⁶ representa metilo, metoxi o halógeno;

o una sal o un N-óxido del mismo;

en donde el compuesto de fórmula (I) no es un compuesto en donde R¹ es hidrógeno y R², R³ y R⁴ son como sigue:

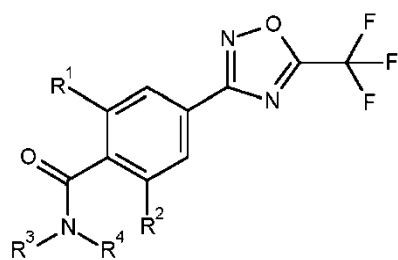
20

R ²	R ³	R ⁴	R ²	R ³	R ⁴
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	CH ₃	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	

R ²	R ³	R ⁴	R ²	R ³	R ⁴
					
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
F	H		H	H	
H	CH ₃		H	H	

R ²	R ³	R ⁴	R ²	R ³	R ⁴
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		-	-	-

Además, de acuerdo con esta divulgación, se puede proporcionar un compuesto de fórmula (ID):

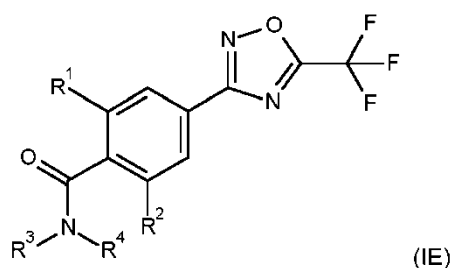


(ID)

- 5 en donde
 R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi;
 R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄;
 R⁴ representa un fenilalquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes,
 10 seleccionados de R⁵;
 R⁵ representa halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄ o heterociclilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo
 es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de
 N, O y S, y en donde dicho resto heterociclilo está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser
 iguales o diferentes, seleccionados de R⁶; y
 15 R⁶ representa metilo, metoxi o halógeno;
 o una sal o un N-óxido del mismo, y
 en donde el compuesto de fórmula (ID) no es un compuesto en donde R¹ y R² son ambos hidrógeno y R³ y R⁴ son
 como sigue:

R ³	R ⁴	R ³	R ⁴
H	-Ph	H	-(3-Cl-6-OCH ₃)Ph
H	-CH ₂ (4-(N-morfolinil)metil)Ph	H	-(2-CH ₃ -4-Cl)Ph
H	-CH ₂ CH ₂ Ph	H	-(2-Cl)Ph
H	-CH ₂ Ph	H	-(4-CH ₃)Ph
H	-CH ₂ (3-CH ₂ OCH ₃)Ph	H	-(2-OCH ₃ -5-OCH ₃)Ph
H	-CH ₂ (3-F-4-(N-piperazinil)Ph	H	-(2-Cl-5-F)Ph
H	-(3-Cl-4-OCH ₃)Ph	H	-(2-Cl-4-F)Ph
H	-(3-OCH ₃ -4-OCH ₃)Ph	H	-(2-Cl-4-OCH ₃)Ph
H	-(3-OCH ₃ -5-OCH ₃)Ph	H	-(2-OCH ₃ -5-CH ₃)Ph
H	-(2-OCH ₃ -4-OCH ₃)Ph	-CH ₃	-CH ₂ (2-F)Ph
H	-(3-F-4-CH ₃)Ph	-CH ₃	-CH ₂ Ph
H	-(3-OCH ₃)Ph	-CH ₃	-Ph
H	-(2-CH ₃)Ph	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ Ph
H	-(2-Cl-5-OCH ₃)Ph	-	-

Además, de acuerdo con esta divulgación, se puede proporcionar un compuesto de fórmula (IE):



5

en donde

R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi;

R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄;

10 R⁴ representa heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₆ está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵;

R⁵ representa ciano, amino, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂ o alcoxi C₁₋₂;

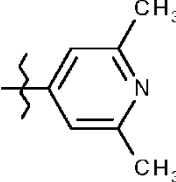
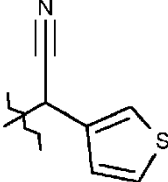
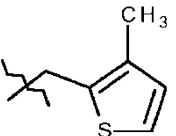
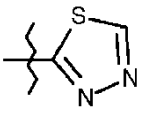
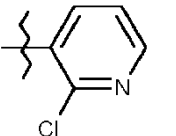
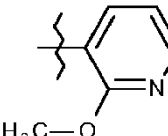
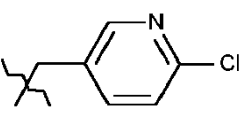
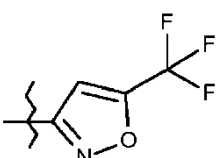
o una sal o un N-óxido del mismo;

15 en donde el compuesto de fórmula (IE) no es un compuesto en donde R¹ es hidrógeno y R², R³ y R⁴ son como sigue:

15

R ²	R ³	R ⁴	R ²	R ³	R ⁴
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	

R ²	R ³	R ⁴	R ²	R ³	R ⁴
H	H		H	CH ₃	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	
F	H		H	H	

R ²	R ³	R ⁴	R ²	R ³	R ⁴
					
H	CH ₃		H	H	
H	H		H	H	
H	H		H	H	

De acuerdo con esta divulgación, en lo que se refiere a un compuesto de Fórmula (IA), (IB), (IC), (ID) o (IE), la siguiente lista proporciona definiciones, incluidas definiciones preferidas, para los sustituyentes R¹, R², R³, R⁴, R⁵ y R⁶. Para uno cualquiera de estos sustituyentes, cualquiera de las definiciones dadas a continuación puede combinarse con cualquier definición de cualquier sustituyente dado a continuación o en otra parte en este documento.

De conformidad con un compuesto de Fórmula (Ia), preferiblemente, R¹ y R² representan independientemente hidrógeno, fluoro, cloro, metilo o metoxi. Más preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es halógeno (preferiblemente flúor), metilo o metoxi. En una realización preferida, R² es un halógeno, en particular, flúor.

Preferiblemente, R³ representa hidrógeno o metilo, y más preferiblemente hidrógeno.

Preferiblemente, R⁴ representa heterociclilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heterociclilalquilo C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵. Más preferiblemente, R⁴ representa heterociclilalquilo C₀₋₁, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heterociclilalquilo C₀₋₁ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵. Incluso más preferiblemente, R⁴ representa heterociclilalquilo C₀₋₁, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente de N y O, y en donde el resto heterociclilalquilo C₀₋₁ está opcionalmente sustituido con 1 sustituyente, que puede ser igual o diferente, seleccionado de R⁵.

En determinadas realizaciones, R⁴ puede ser un pirrolidinilo, piperidinilo, (pirrolidinil)metilo, (piperidinil)metilo, tetrahidrofuranilo, tetrahidropiranilo, 1,4-dioxanilo, (tetrahidrofuranil)metilo, (tetrahidropiranil)metilo, (1,4-dioxanil)metilo, 1,3-dioxolanilo, (1,3-dioxolanil)metilo, tetrahidrotienilo, tetrahidrotienil)metilo o (tetrahidropiranil)metilo, que está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵.

Preferiblemente, R⁵ representa metilo, metoxi, metoxycarbonilo, terc.butiloxycarbonilo o bencilo.

Preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi;

R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄; y

R⁴ representa heterociclilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heterociclilalquilo

C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ se selecciona de alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄carbonilo.

Más preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, fluoro, cloro, metilo o metoxi;

5 R³ representa hidrógeno, metilo, etilo o n-propilo; y

R⁴ representa heterociclilalquilo C₀₋₁, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente de N y O, y en donde el resto heterociclilalquilo C₀₋₁ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵; en donde R⁵ se selecciona de alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄carbonilo.

10 Incluso más preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno o fluoro;
R³ representa hidrógeno, metilo, etilo o n-propilo; y
R⁴ representa heterociclilalquilo C₀₋₁, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente de N y O, y en donde el resto heterociclilalquilo C₀₋₁ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵; en donde R⁵ se selecciona de metilo, metoxi, metoxycarbonilo o terc.-butiloxycarbonilo.

Lo más preferiblemente, R¹ representa hidrógeno y R² representa hidrógeno o fluoro;

R³ representa hidrógeno, metilo, etilo o n-propilo; y

20 R⁴ representa pirrolidinilo, piperidinilo, (pirrolidinil)metilo, (piperidinil)metilo, tetrahydrofuranilo, (tetrahydrofuranil)metilo, (tetrahidropiranil)metilo, (1,4-dioxanil)metilo, (1,3-dioxolanil)metilo, tetrahidrotienilo o tetrahidrotiopiranilo, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ se selecciona de metilo, metoxi, metoxycarbonilo o terc.-butiloxycarbonilo.

25 De conformidad con un compuesto de Fórmula (IB), preferiblemente, R¹ y R² representan independientemente hidrógeno, fluoro, cloro, metilo o metoxi. Más preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es halógeno (preferiblemente flúor), metilo o metoxi. En una realización preferida, R² es un halógeno, en particular, flúor.

Preferiblemente, R³ representa hidrógeno, metilo o etilo, y más preferiblemente hidrógeno.

30 Preferiblemente, R⁴ es ciclopropilo, (ciclopropil)metilo, 1-(ciclopropil)etilo, ciclobutilo, (ciclobutil)metilo, ciclopentilo, (ciclopentil)metilo, ciclohexilo, 1-(ciclohexil)etilo o ciclooctilo, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵.

35 Preferiblemente, R⁵ representa ciano, fluoro, metilo, etinilo, ciclopropilo, fenilo o bencilo, en donde los restos ciclopropilo y fenilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶.

Preferiblemente, R⁶ representa cloro.

40 Preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi;
R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄; y

R⁴ representa cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₂, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa ciano, fluoro, metilo, etinilo, ciclopropilo, fenilo o bencilo, en donde los restos ciclopropilo y fenilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶, en donde R⁶ representa cloro.

Más preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, fluoro, cloro, metilo o metoxi;

R³ representa hidrógeno, metilo o etilo o n-propilo; y

50 R⁴ representa ciclopropilo, (ciclopropil)metilo, 1-(ciclopropil)etilo, ciclobutilo, (ciclobutil)metilo, ciclopentilo, (ciclopentil)metilo, ciclohexilo, 1-(ciclohexil)etilo o ciclooctilo, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, R⁵ representa ciano, fluoro, metilo, etinilo, ciclopropilo, fenilo o bencilo, en donde los restos ciclopropilo y fenilo están opcionalmente sustituidos con 1 sustituyente seleccionado de R⁶, en donde R⁶ representa cloro.

Incluso más preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno o fluoro;

R³ representa hidrógeno, metilo, etilo o n-propilo; y

R⁴ representa cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₂, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa ciano, fluoro, metilo, etinilo, ciclopropilo, fenilo o bencilo, en donde los restos ciclopropilo y fenilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶, en donde R⁶ representa cloro.

Lo más preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es halógeno (preferiblemente flúor),

R³ representa hidrógeno; y

65 R⁴ representa ciclopropilo, (ciclopropil)metilo, 1-(ciclopropil)etilo, ciclobutilo, (ciclobutil)metilo, ciclopentilo, (ciclopentil)metilo, ciclohexilo, 1-(ciclohexil)etilo o ciclooctilo, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que

pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, R⁵ representa ciano, fluoro, metilo, etinilo, ciclopropilo, fenilo o bencilo, en donde los restos ciclopropilo y fenilo están opcionalmente sustituidos con 1 sustituyente seleccionado de R⁶, en donde R⁶ representa cloro.

- 5 De conformidad con un compuesto de Fórmula (IC), preferiblemente, R¹ y R² representan independientemente hidrógeno, fluoro, cloro, metilo o metoxi. Más preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es hidrógeno, halógeno (preferiblemente flúor), metilo o metoxi. En una realización preferida, R¹ es hidrógeno y R² es un halógeno, en particular, flúor, o R¹ y R² son hidrógeno.
- 10 Preferiblemente, R³ representa hidrógeno, metilo, etilo, iso-propilo, y más preferiblemente hidrógeno.
- Preferiblemente, R⁴ representa alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆ o alquinilo C₂₋₆, en donde alquilo C₁₋₆ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa alcoxi C₁₋₄ o hidroxilo. Más preferiblemente, R⁴ representa alquilo C₁₋₆, alquenilo C₂₋₆ o alquinilo C₂₋₆, en donde alquilo C₁₋₆ está opcionalmente sustituido con 1 sustituyente seleccionado de R⁵, en donde R⁵ representa alcoxi C₁₋₄ o hidroxilo. Incluso más preferiblemente, R⁴ representa alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido con 1 sustituyente seleccionado de R⁵, en donde R⁵ representa hidroxilo; o R⁴ representa alquenilo C₂₋₆ o alquinilo C₂₋₆.
- 15
- Preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi; R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄; y R⁴ representa alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆ o alquilo C₁₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa alcoxi C₁₋₄ o hidroxilo.
- 20
- Más preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es halógeno; R³ representa hidrógeno, metilo o etilo; R⁴ representa alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆ o alquilo C₁₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ representa alcoxi C₁₋₄ o hidroxilo.
- 25
- Incluso más preferiblemente, R¹ y R² son hidrógeno o R¹ es hidrógeno y R² es flúor. R³ representa hidrógeno o metilo; R⁴ representa alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆ o alquilo C₁₋₆, opcionalmente sustituido con 1 sustituyente seleccionado de R⁵, en donde R⁵ representa alcoxi C₁₋₄ o hidroxilo.
- 30
- Lo más preferiblemente, R¹ y R² son hidrógeno o R¹ es hidrógeno y R² es flúor; R³ representa hidrógeno; R⁴ representa alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆ o alquilo C₁₋₆, opcionalmente sustituido con 1 sustituyente seleccionado de R⁵, en donde R⁵ representa alcoxi C₁₋₄ o hidroxilo.
- 35
- De conformidad con un compuesto de Fórmula (ID), preferiblemente, R¹ y R² representan independientemente hidrógeno, fluoro, cloro, metilo o metoxi. Más preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno y fluoro. Incluso más preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es halógeno (preferiblemente flúor), metilo o metoxi. En una realización preferida, R² es un halógeno, en particular, flúor.
- 40
- Preferiblemente, R³ representa hidrógeno o metilo.
- 45
- Preferiblemente, R⁴ representa un fenilalquilo C₀₋₂, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵. Más preferiblemente, R⁴ representa un fenilalquilo C₀₋₁, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵. Incluso más preferiblemente, R⁴ representa un fenilalquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵. Más preferiblemente, R⁴ representa fenilalquilo C₀₋₂, opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, que se selecciona preferiblemente de flúor, cloro, metoxi, metilo, etilo, trifluorometilo o N-morfolinilo, en donde preferiblemente los 1 o 2 sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, son sustituyentes del anillo de fenilo.
- 50
- Preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi; R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄; R⁴ representa un fenilalquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵.
- 55
- Más preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, fluoro, cloro, metilo o metoxi; R³ representa hidrógeno o metilo; R⁴ representa un fenilalquilo C₀₋₂, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵.
- 60
- Incluso más preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno y fluoro; R³ representa hidrógeno o metilo;
- 65

R⁴ representa un fenilalquilo C₀₋₁, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵.

Más preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno y fluoro;

R³ representa hidrógeno o metilo;

R⁴ representa un fenilalquilo C₀₋₁, opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵.

Preferiblemente, R⁵ representa ciano, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alqueno C₂₋₃, alquino C₂₋₃, haloalquilo C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂, alquil C₁₋₂carbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₂aminocarbonilo, dialquil C₁₋₂aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilamino, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₂, fenilalquilo C₀₋₂, heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos, seleccionados individualmente de N, O y S, heterociclicilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterociclilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶.

Más preferiblemente, R⁵ representa ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂, alquil C₁₋₂carbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₂aminocarbonilo, dialquil C₁₋₂aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilamino, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₂, fenilalquilo C₀₋₂, heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos, seleccionados individualmente de N, O y S, heterociclicilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterociclilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶.

Incluso más preferiblemente, R⁵ representa ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂, alquil C₁₋₂carbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₂aminocarbonilo, dialquil C₁₋₂aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilamino, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₂, en donde cualquiera de dichos restos está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶.

Lo más preferiblemente, R⁵ representa ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂, aminocarbonilo, en donde cualquiera de dichos restos está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶.

Preferiblemente, R⁶ representa metilo, metoxi, fluoro o cloro.

En determinadas realizaciones de esta divulgación, se prefiere que R⁵ represente halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆, fenilalquilo C₀₋₆, heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, heterociclicilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterociclilo está opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado de R⁶, en donde R⁶ representa metilo, metoxi o halógeno. Más preferiblemente, de acuerdo con esta realización, R⁵ representa halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄ o heterociclicilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S.

De conformidad con un compuesto de Fórmula (IE), preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, fluoro, cloro, metilo o metoxi. Más preferiblemente, R¹ es hidrógeno y R² es halógeno (preferiblemente flúor), metilo o metoxi. En una realización preferida, R² es un halógeno, en particular, flúor.

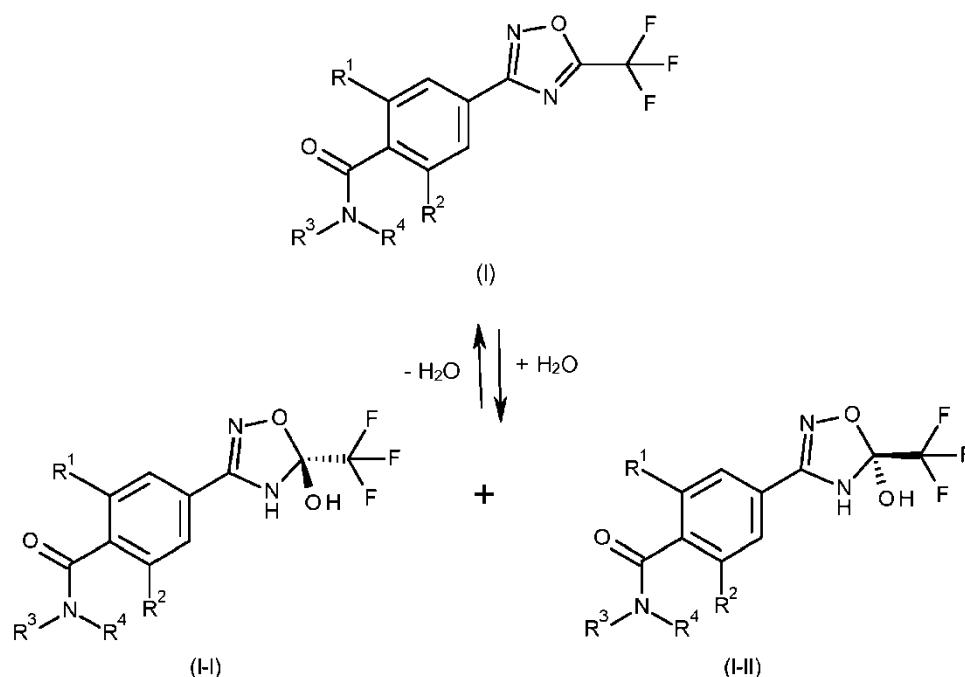
Preferiblemente, R³ representa hidrógeno o metilo, y más preferiblemente hidrógeno.

Preferiblemente, R⁴ representa heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo es un anillo de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵. En algunas realizaciones, R⁴ no es un sustituyente 4-piridilo.

En otra realización, R⁴ representa heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo de R⁴ es un anillo aromático de 5 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵. De acuerdo con esta realización, preferiblemente, al menos un heteroátomo es S, y más preferiblemente, R⁴ es un derivado de tienilo, en particular, un derivado de 2-tienilo.

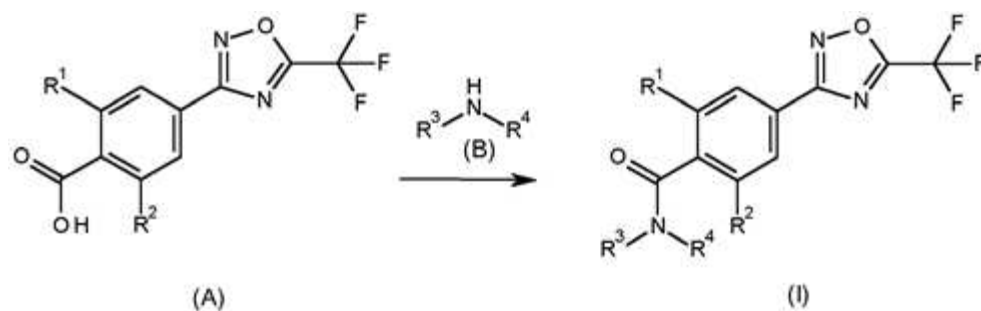
En otras realizaciones de la invención, R⁴ no está sustituido.

- Preferiblemente, R⁵ representa amino, ciano, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alqueno C₂₋₃, alquino C₂₋₃, haloalquilo C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂, alquil C₁₋₂carbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₂aminocarbonilo, dialquil C₁₋₂aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilamino, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₂, fenilalquilo C₀₋₂, heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos, seleccionados individualmente de N, O y S, heterociclicolalquilo C₀₋₂, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterociclicilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶.
- 10 Más preferiblemente, R⁵ representa amino, ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂, alquil C₁₋₂carbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₂aminocarbonilo, dialquil C₁₋₂aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₂carbonilamino, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₂, en donde cualquiera de dichos restos está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶.
- 15 Incluso más preferiblemente, R⁵ representa amino, ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂, alcoxi C₁₋₂, aminocarbonilo, en donde cualquiera de dichos restos está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁶. Lo más preferiblemente, R⁵ se selecciona de amino, ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂ o alcoxi C₁₋₂.
- 20 Preferiblemente, R⁶ representa metilo, metoxi, fluoro o cloro.
- Preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, halógeno, metilo o metoxi;
R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄; y
R⁴ representa un R⁴ representa heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo es un anillo de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ se selecciona de amino, ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂ o alcoxi C₁₋₂, y en donde R⁴ no es un sustituyente 4-piridilo opcionalmente sustituido.
- 25
- 30 Más preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno, fluoro, cloro, metilo o metoxi;
R³ representa hidrógeno o metilo; y
R⁴ representa un R⁴ representa heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo de R⁴ es un anillo de 5 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ se selecciona de amino, ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂ o alcoxi C₁₋₂.
- 35
- Incluso más preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno o fluoro;
R³ representa hidrógeno; y
R⁴ representa un heteroarilalquilo C₀₋₂, en donde el resto heteroarilo es un anillo de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₂ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ se selecciona de amino, ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂ o alcoxi C₁₋₂.
- 40
- Más preferiblemente, R¹ y R², independientemente, representan hidrógeno y fluoro;
R³ representa hidrógeno; y
R⁴ representa un heteroarilalquilo C₀₋₁, en donde el resto heteroarilo es un anillo de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₁ está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R⁵, en donde R⁵ se selecciona de amino, ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, haloalquilo C₁₋₂ o alcoxi C₁₋₂.
- 45
- 50 De acuerdo con la definición de R⁴ para los compuestos de Fórmula (IE), fragmentos de heteroarilo preferidos en la definición de heteroarilalquilo C₀₋₆, heteroarilalquilo C₀₋₂, heteroarilalquilo C₀₋₁, etc., incluyen restos tienilo, pirazolilo, piridilo, triazolilo, furanilo y tiazolilo.
- 55 Se entiende que cuando están en medios acuosos, los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención pueden estar presentes en un equilibrio reversible con las formas hidratadas covalentemente correspondientes (es decir, los compuestos de fórmula (I-I) y de fórmula (I-II) tal como se muestra más adelante) en el motivo CF₃-oxadiazol. Este equilibrio dinámico puede ser importante para la actividad biológica de los compuestos de Fórmula (I). Las designaciones de R¹, R², R³, R⁴ (incluyendo R^{4A}, R^{4B}, R^{4C}, R^{4D}, R^{4E}), R⁵ (incluyendo R^{5A}, R^{5B}, R^{5C}, R^{5D}, R^{5E}) y R⁶ (incluyendo R^{6B}, R^{6D}, R^{6E}), con referencia a los compuestos de fórmula (I) de la presente invención, se aplican generalmente a los compuestos de Fórmula (I-I) y Fórmula (I-II), al igual que las descripciones específicas de combinaciones de R¹, R², R³, R⁴ (incluyendo, R^{4A}, R^{4B}, R^{4C}, R^{4D}, R^{4E}), R⁵ (incluyendo R^{5A}, R^{5B}, R^{5C}, R^{5D}, R^{5E}) y R⁶ (incluyendo, R^{6B}, R^{6D}, R^{6E}) como se representa para los compuestos individuales descritos en las Tablas 1A a 30A, 1B a 29B, 1C a 33C, 1D a 27D o 1E a 27E (que figuran más adelante), o los compuestos individuales descritos en las
- 60
- 65 Tablas T1a, T1b, T2a, T2b, T3a, T3b, T4a, T4b, T5a o T5b (que figuran más adelante).



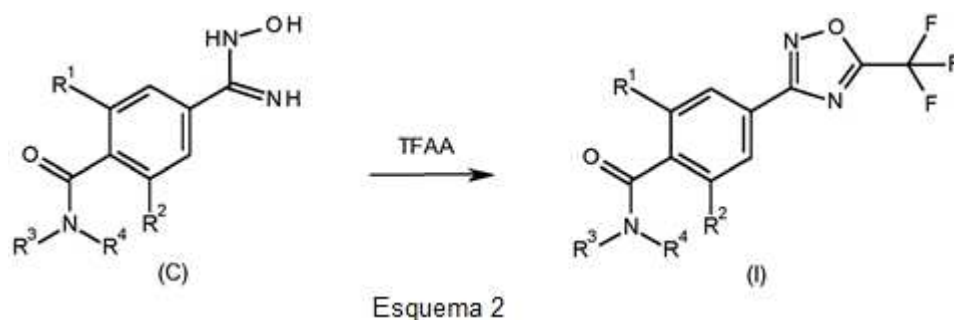
Los compuestos de la presente invención se pueden preparar como se muestra en los siguientes esquemas, en los que, a menos que se indique lo contrario, la definición de cada variable es tal como se ha definido anteriormente para un compuesto de fórmula (I).

Los compuestos de fórmula (I) pueden obtenerse mediante una transformación de acoplamiento de amida con compuestos de fórmula (A) y compuestos de fórmula (B) activando la función de ácido carboxílico de los compuestos de fórmula (A), un procedimiento que habitualmente tiene lugar convirtiendo el -OH del ácido carboxílico en un buen grupo lábil, tal como un grupo cloruro, por ejemplo utilizando (COCl)₂ o SOCl₂, antes del tratamiento con los compuestos de fórmula (B), preferiblemente en un disolvente adecuado (p. ej., dimetilformamida, diclorometano o tetrahidrofurano), preferiblemente a una temperatura de entre 25°C y 100°C y, opcionalmente, en presencia de una base tal como trietilamina o N,N-diisopropiletilamina, o en condiciones descritas en la bibliografía para un acoplamiento de amida. Esta reacción se muestra en el Esquema 1 que figura más adelante. Por ejemplos, véase Valeur, E.; Bradley, M. Chem. Soc. Rev. (2009), 38, 606 y Chinchilla, R., Najera, C. Chem. Soc. Rev. (2011), 40, 5084. Compuestos de fórmula (A) pueden prepararse mediante métodos conocidos a partir de compuestos conocidos o están disponibles comercialmente. Por ejemplo, véase: Liu, K. et al. J. Med. Chem. (2008), 51, 7843 y documento WO 2013/008162 A1. Compuestos de fórmula (B) son compuestos conocidos o están disponibles comercialmente.

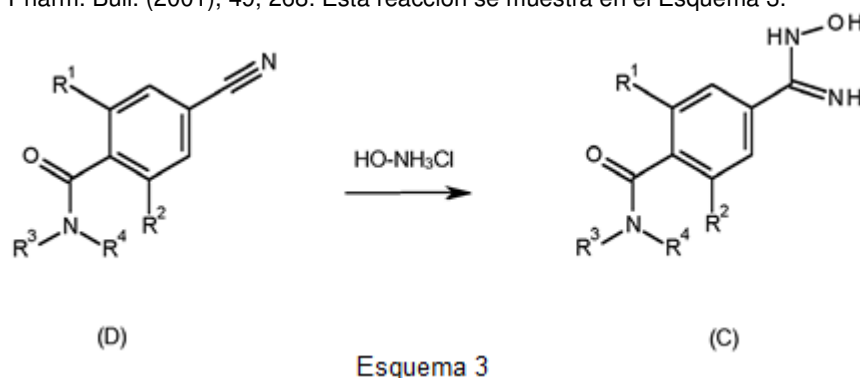


Esquema 1

Alternativamente, compuestos de fórmula (I) pueden prepararse a partir de compuestos de fórmula (C) mediante tratamiento con anhídrido trifluoroacético (TFAA) en un disolvente adecuado, tal como tetrahidrofurano, a una temperatura entre 0°C y 25°C. Para ejemplos relacionados, véase Kitamura, S. et al. Chem. Pharm. Bull. (2001), 49, 268. Esta reacción se muestra en el Esquema 2.



Compuestos de fórmula (C) pueden prepararse a partir de compuestos de fórmula (D) tratándolos con una sal de hidrocloreuro de hidroxilamina en presencia de una base, tal como carbonato de sodio, en un disolvente adecuado, tal como metanol, a una temperatura entre 0°C y 100°C. Para ejemplos relacionados, véase Kitamura, S. et al. Chem. Pharm. Bull. (2001), 49, 268. Esta reacción se muestra en el Esquema 3.



Compuestos de fórmula (D) son conocidos o pueden prepararse por métodos conocidos a partir de compuestos conocidos. Véase, por ejemplo, Chobanian, H. R. et al Tet. Lett. (2006), 47, 3303; o Makovec, F. et al J. Med. Chem. (1992), 35, 3633.

Sorprendentemente, se ha encontrado ahora que los compuestos de fórmula (I) tienen, para fines prácticos, un nivel muy ventajoso de actividad biológica para proteger a las plantas contra enfermedades que son provocadas por hongos.

Los compuestos de fórmula (I) se pueden utilizar en el sector agrícola y campos de uso relacionados, p. ej., como ingredientes activos para controlar plagas de plantas o en materiales no vivos para controlar microorganismos u organismos de descomposición potencialmente dañinos para el hombre. Los compuestos novedosos se diferencian por su excelente actividad con tasas de aplicación bajas, por ser bien tolerados por las plantas y por ser ecológicos. Presentan unas propiedades curativas, preventivas y sistémicas muy útiles, y se pueden emplear para proteger numerosas plantas de cultivo. Los compuestos de fórmula (I) pueden utilizarse para inhibir o destruir las plagas que aparecen en plantas o partes de plantas (frutos, 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, p. ej., a partir de microorganismos fitopatógenos.

La presente invención se refiere, además, a un método para controlar o prevenir la infestación de plantas o material de propagación vegetal y/o cultivos alimentarios cosechados, susceptibles de ataque microbiano mediante el tratamiento de plantas o material de propagación vegetal y/o cultivos alimentarios cosechados en los que una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) se aplica a las plantas, a partes de las mismas o al emplazamiento de las mismas.

La presente invención se refiere también al uso de los compuestos de fórmula (I) en calidad de un fungicida. El término "fungicida", tal como se utiliza en la presente, se refiere a un compuesto que controla, modifica o previene el crecimiento de hongos. La expresión "cantidad eficaz como fungicida" de acuerdo con la presente invención significa la cantidad de compuesto de este tipo o combinación de compuestos de este tipo que es capaz de producir un efecto sobre el crecimiento de hongos. Los efectos de control o modificación incluyen toda desviación del desarrollo natural, tal como su exterminación, ralentización y similares, y la prevención incluye una barrera u otra formación defensiva en una planta o sobre esta para prevenir la infección fúngica.

También es posible utilizar los compuestos de fórmula (I) como agentes de recubrimiento para el tratamiento de material de propagación vegetal, p. ej., semillas, tales como frutos, tubérculos o granos, o esquejes de plantas (p. ej., arroz), para la protección contra infecciones por hongos, así como contra hongos fitopatógenos que se producen en el suelo. El material de propagación se puede tratar con una composición que comprende un compuesto de fórmula

(I) antes de plantar: la semilla, por ejemplo, se puede recubrir antes de sembrar. Los ingredientes activos de acuerdo con la invención también se pueden aplicar a granos (revestimiento), ya sea impregnando las semillas en una formulación líquida o revistiéndolas con una formulación sólida. La composición también se puede aplicar al sitio de siembra cuando el material de propagación está siendo plantado, por ejemplo, al surco de la semilla durante la siembra. La invención se refiere también a métodos de tratamiento del material de propagación vegetal y al material de propagación vegetal tratado de tal modo.

Además, los compuestos de fórmula (I) pueden utilizarse para controlar hongos en zonas relacionadas, por ejemplo en la protección de materiales técnicos, incluyendo madera y productos técnicos relacionados con la madera, en el almacenamiento de alimentos, en la gestión de la higiene.

Además, los compuestos de fórmula (I) pueden utilizarse para proteger materiales no vivos frente al ataque por hongos, p. ej., madera, tableros de pared y pintura.

Los compuestos de fórmula (I) son, por ejemplo, eficaces contra hongos y vectores fúngicos de enfermedades, así como bacterias y virus fitopatógenos. Estos hongos y vectores fúngicos de enfermedades, así como las bacterias y virus fitopatógenos son, por ejemplo:

Absidia corymbifera, *Alternaria* spp, *Aphanomyces* spp, *Ascochyta* spp, *Aspergillus* spp. incluyendo *A. flavus*, *A. fumigatus*, *A. nidulans*, *A. niger*, *A. terreus*, *Aureobasidium* spp. incluyendo *A. pullulans*, *Blastomyces dermatitidis*, *Blumeria graminis*, *Bremia lactucae*, *Botryosphaeria* spp. incluyendo *B. dothidea*, *B. obtusa*, *Botrytis* spp. incluyendo *B. cinerea*, *Candida* spp. incluyendo *C. albicans*, *C. glabrata*, *C. krusei*, *C. lusitaniae*, *C. parapsilosis*, *C. tropicalis*, *Cephalosporium fragrans*, *Ceratocystis* spp, *Cercospora* spp. incluyendo *C. arachidicola*, *Cercosporidium personatum*, *Cladosporium* spp, *Claviceps purpurea*, *Coccidioides immitis*, *Cochliobolus* spp, *Colletotrichum* spp. incluyendo *C. musae*, *Cryptococcus neoformans*, *Diaporthe* spp, *Didymella* spp, *Drechslera* spp, *Elsinoe* spp, *Epidermophyton* spp, *Erwinia amylovora*, *Erysiphe* spp. incluyendo *E. cichoracearum*, *Eutypa lata*, *Fusarium* spp. incluyendo *F. culmorum*, *F. graminearum*, *F. langsethiae*, *F. moniliforme*, *F. oxysporum*, *F. proliferatum*, *F. subglutinans*, *F. solani*, *Gaeumannomyces graminis*, *Gibberella fujikuroi*, *Gloeodes pomigena*, *Gloeosporium musarum*, *Glomerella cingulate*, *Guignardia bidwellii*, *Gymnosporangium juniperi-virginianae*, *Helminthosporium* spp, *Hemileia* spp, *Histoplasma* spp. incluyendo *H. capsulatum*, *Laetisaria fuciformis*, *Leptographium lindbergii*, *Leveillula taurica*, *Lophodermium seditiosum*, *Microdochium nivale*, *Microsporium* spp, *Monilinia* spp, *Mucor* spp, *Mycosphaerella* spp. incluyendo *M. graminicola*, *M. pomi*, *Oncobasidium theobromaeon*, *Ophiostoma piceae*, *Paracoccidioides* spp, *Penicillium* spp. incluyendo *P. digitatum*, *P. italicum*, *Petriellidium* spp, *Peronosclerospora* spp. incluyendo *P. maydis*, *P. philippinensis* y *P. sorghi*, *Peronospora* spp, *Phaeosphaeria nodorum*, *Phakopsora pachyrhizi*, *Phellinus igniarius*, *Phialophora* spp, *Phoma* spp, *Phomopsis viticola*, *Phytophthora* spp. incluyendo *P. infestans*, *Plasmopara* spp. incluyendo *P. halstedii*, *P. viticola*, *Pleospora* spp., *Podosphaera* spp. incluyendo *P. leucotricha*, *Polymyxa graminis*, *Polymyxa betae*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Pseudomonas* spp, *Pseudoperonospora* spp. incluyendo *P. cubensis*, *P. humuli*, *Pseudopeziza tracheiphila*, *Puccinia* Spp. incluyendo *P. hordei*, *P. recondita*, *P. striiformis*, *P. triticea*, *Pyrenopeziza* spp, *Pyrenophora* spp, *Pyricularia* spp. incluyendo *P. oryzae*, *Pythium* spp. incluyendo *P. ultimum*, *Ramularia* spp, *Rhizoctonia* spp, *Rhizomucor pusillus*, *Rhizopus arrhizus*, *Rhynchosporium* spp, *Scedosporium* spp. incluyendo *S. apiospermum* y *S. prolificans*, *Schizothyrium pomi*, *Sclerotinia* spp, *Sclerotium* spp, *Septoria* spp, incluyendo *S. nodorum*, *S. tritici*, *Sphaerotheca macularis*, *Sphaerotheca fusca* (*Sphaerotheca fuliginea*), *Sporothrix* spp, *Stagonospora nodorum*, *Stemphylium* spp., *Stereum hirsutum*, *Thanatephorus cucumeris*, *Thielaviopsis basicola*, *Tilletia* spp, *Trichoderma* spp. incluyendo *T. harzianum*, *T. pseudokoningii*, *T. viride*, *Trichophyton* spp, *Typhula* spp, *Uncinula necator*, *Urocystis* spp, *Ustilago* spp, *Venturia* spp. incluyendo *V. inaequalis*, *Verticillium* spp, y *Xanthomonas* spp.

Dentro del alcance de la presente invención, los cultivos objetivo y/o plantas útiles a proteger comprenden típicamente cultivos perennes y anuales, tales como plantas de bayas, por ejemplo moras, arándanos, arándanos rojos, frambuesas y fresas; cereales, por ejemplo, cebada, maíz (grano), mijo, avena, arroz, centeno, triticale de sorgo y trigo; plantas de fibra, por ejemplo algodón, lino, cáñamo, yute y sisal; cultivos de campo, por ejemplo, remolacha azucarera y forrajera, café, lúpulo, mostaza, colza (canola), amapola, caña de azúcar, girasol, té y tabaco; árboles frutales, por ejemplo, manzano, albaricoquero, aguacate, plátano, cerezo, cítricos, nectarino, melocotonero, peral y ciruelo; hierbas, por ejemplo, hierba de Bermudas, espiguilla, *Agrostis*, grama fina, festuca, hierba de centeno, hierba de San Agustín y hierba de Zoysia; hierbas tales como albahaca, borraja, cebollino, cilantro, lavanda, apio de monte, menta, orégano, perejil, romero, salvia y tomillo; legumbres, por ejemplo, habas, lentejas, guisantes y habas de soja; nueces, por ejemplo, almendras, anacardos, nueces molidas, avellanas, cacahuets, nueces, pistachos y nueces; palmas, por ejemplo, palma aceitera; ornamentales, por ejemplo flores, arbustos y árboles; otros árboles, por ejemplo cacao, coco, olivo y caucho; hortalizas, por ejemplo espárrago, berenjena, brócoli, repollo, zanahoria, pepino, ajo, lechuga, médula, melón, quingombó, cebolla, pimiento, patata, calabaza, ruibarbo, espinacas y tomate; y vides, por ejemplo, uvas.

Debe entenderse que la expresión "plantas útiles" incluye también plantas útiles que se han vuelto tolerantes a herbicidas, tales como bromoxinilo, o clases de herbicidas (tales como, por ejemplo, inhibidores de HPPD, inhibidores de ALS, por ejemplo primisulfurona, prosulfurona y trifloxisulfurona, EPSPS (5-enol-pirovil-shikimate-3-fosfato-sintasa), inhibidores de GS (glutamina sintetasa) o inhibidores de PPO (protoporfirinógeno-oxidasa) como resultado de los métodos convencionales de cultivo o ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que se ha modificado para que

sea 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 los herbicidas o clases de herbicidas mediante métodos de ingeniería genética incluyen variedades de maíz resistentes al glifosato y glufosinato, comercialmente disponibles bajo los nombres comerciales RoundupReady®, Herculex I® y LibertyLink®.

Debe entenderse que la expresión "plantas útiles" incluye también plantas útiles que han sido transformadas de este modo mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que son capaces de sintetizar una o más toxinas de acción selectiva, tal como se conocen, por ejemplo, de bacterias productoras de toxinas, especialmente las del género *Bacillus*.

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

Debe entenderse que el término "cultivos" incluye también plantas de cultivo que han sido transformadas de este modo mediante el uso de técnicas de ADN recombinante que son capaces de sintetizar una o más toxinas de acción selectiva, como las conocidas, por ejemplo, de bacterias productoras de toxinas, especialmente las del género *Bacillus*.

Toxinas que pueden ser expresadas por plantas transgénicas de este tipo incluyen, por ejemplo, proteínas insecticidas de *Bacillus cereus* o *Bacillus popilliae*; o proteínas insecticidas de *Bacillus thuringiensis*, tales como endotoxinas δ , p. ej., Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 o Cry9C, o proteínas insecticidas vegetativas (Vip), p. ej., Vip1, Vip2, Vip3 o Vip3A; o proteínas insecticidas de bacterias que colonizan nematodos, 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 para insectos; toxinas producidas por hongos, tales como toxinas de estreptomicetos, lectinas de plantas, tales como lectinas de guisantes, lectinas de cebada o lectinas de campanilla de invierno; aglutininas; inhibidores de proteinasas, tales como inhibidores de tripsina, inhibidores de serina proteasa, patatina, cistatina, inhibidores de papaína; proteínas inactivadoras de ribosomas (RIP), tales como ricina, RIP de maíz, abrina, lufina, saporina o briodina; enzimas del metabolismo de esteroides, tales como 3-hidroxiesteroxidasa, ecdiesteroid-UDP-glicosil-transferasa, colesterol oxidasas, inhibidores de ecdisona, HMG-COA-reductasa, bloqueadores de canales iónicos, tales como bloqueadores de los canales de sodio o calcio, hormona esterasa juvenil, receptores de hormonas diuréticas, estilbeno sintasa, bibencil sintasa, quitinasas y glucanasas.

En el contexto de la presente invención, las endotoxinas δ deben entenderse, 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 de forma recombinante mediante una nueva combinación de diferentes dominios de esas proteínas (véase, por ejemplo, el documento WO 02/15701). Se conocen toxinas truncadas, por ejemplo, una Cry1Ab truncada. En el caso de las toxinas modificadas, se reemplazan uno o más aminoácidos de la toxina que se produce de forma natural. En reemplazos de aminoácidos de este tipo, se insertan en la toxina preferiblemente secuencias de reconocimiento de proteasa no presentes de forma natural, tales como, por ejemplo, en el caso de Cry3A055, se inserta una secuencia de reconocimiento de catepsina-G en una toxina Cry3A (véase el documento WO 03/018810).

Ejemplos de toxinas de este tipo o plantas transgénicas capaces de sintetizar este tipo de toxinas se describen, por ejemplo, en 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 procedimientos para la preparación de plantas transgénicas de este tipo son generalmente conocidos por la persona experta en la técnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones arriba mencionadas. Ácidos desoxirribonucleicos de tipo CryI y su preparación son conocidos, por ejemplo, por los documentos WO 95/34656, EP-A-0 367 474, EP-A-0 401 979 y WO 90/13651.

La toxina contenida en las plantas transgénicas imparte a las plantas tolerancia a los insectos dañinos. Insectos de este tipo pueden ocurrir en cualquier grupo taxonómico de insectos, pero se encuentran especialmente en escarabajos (Coleoptera), insectos de dos alas (Diptera) y mariposas (Lepidoptera).

Se conocen plantas transgénicas que contienen uno o más genes que codifican una resistencia insecticida y expresan una o más toxinas, y algunas de ellas están disponibles comercialmente. Ejemplos de plantas de este tipo son:

YieldGard® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry1Ab); YieldGard Rootworm® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry3Bb1); YieldGard Plus® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry1Ab y una toxina Cry3Bb1); Starlink® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry9C); Herculex I® (variedad de maíz que expresa una toxina Cry1Fa2 y la enzima fosfinotricina N-acetiltransferasa (PAT) para lograr tolerancia al herbicida glufosinato amonio); NuCOTN 33B® (variedad de algodón que expresa una toxina Cry1Ac); Bollgard I® (variedad de algodón que expresa una toxina Cry1Ac); Bollgard II® (variedad de algodón que expresa una toxina Cry1Ac y una toxina Cry2Ab); VipCot® (variedad de algodón que expresa una toxina Vip3A y una toxina Cry1Ab); NewLeaf® (variedad de patata que expresa una toxina Cry3A); NatureGard®, Agrisure® GT Advantage (GA21 rasgo tolerante a glifosato), Agrisure® CB Advantage (Bt11 rasgo del barrenador del maíz (CB)) y Protecta®.

Ejemplos adicionales de cultivos transgénicos de este tipo 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* genéticamente modificado que se ha vuelto resistente al ataque por el barrenador europeo del maíz (*Ostrinia nubilalis* y *Sesamia nonagrioides*) mediante la expresión transgénica de una toxina Cry1Ab truncada. El maíz Bt11 también expresa transgénicamente la enzima PAT para lograr 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* genéticamente modificado que se ha vuelto resistente al ataque por el barrenador europeo del maíz (*Ostrinia nubilalis* y *Sesamia nonagrioides*) mediante la expresión transgénica de una toxina Cry1Ab. El maíz Bt176 también expresa transgénicamente la enzima PAT para lograr 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 vuelto resistente a los insectos mediante la expresión transgénica de una toxina Cry3A modificada. Esta toxina es Cry3A055 modificada mediante la inserción de una secuencia de reconocimiento de catepsina-G-proteasa. La preparación de plantas de maíz transgénicas de este tipo 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 determinados 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 genéticamente modificado para la expresión de la proteína Cry1F para lograr resistencia a determinados insectos lepidópteros y de la proteína PAT para lograr tolerancia al herbicida glufosinato 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 híbrido cultivadas convencionalmente cruzando las variedades genéticamente modificadas NK603 y MON 810. El maíz NK603 × MON 810 expresa transgénicamente la proteína CP4 EPSPS, obtenida de *Agrobacterium sp.* cepa CP4, que imparte tolerancia al herbicida Roundup® (contiene glifosato), y también una toxina Cry1Ab obtenida de *Bacillus thuringiensis subsp. kurstaki*, que produce tolerancia a determinados lepidópteros, incluido el barrenador europeo del maíz.

El término "emplazamiento", tal como se utiliza en la presente, se refiere a campos en los cuales o sobre los cuales crecen las plantas, o donde se siembran semillas de plantas cultivadas o donde se colocarán semillas en el suelo. Este término incluye la tierra, las semillas y las plántulas, así como también la vegetación establecida.

El término "plantas" se refiere a todas las partes físicas de una planta, incluidas las semillas, plántulas, briznas, raíces, tubérculos, tallos, espigas, follaje y frutos.

Se sobreentiende que la expresión "material de propagación vegetal" se refiere a partes generativas de la planta, tales como las semillas, las cuales se pueden emplear para la multiplicación de esta última, y a material vegetativo, tal como esquejes o tubérculos, por ejemplo, patatas. Se pueden mencionar, por ejemplo, semillas (en el sentido estricto), raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas y partes de plantas. También se pueden mencionar plantas germinadas y plantas jóvenes que se van a trasplantar después de que germinen o después de que emerjan del suelo. Estas plantas jóvenes se pueden proteger antes de trasplantarlas mediante un tratamiento total o parcial de inmersión. Preferiblemente, se entiende que "material de propagación vegetal" designa semillas.

Los compuestos de fórmula (I) pueden utilizarse en forma no modificada o, preferiblemente, junto con los adyuvantes empleados convencionalmente en la técnica de formulación. Para este fin, pueden formularse convenientemente de manera conocida para concentrados emulsionables, pastas revestibles, soluciones o suspensiones directamente pulverizables o diluibles, emulsiones diluidas, polvos humectables, polvos solubles, polvos espolvoreables, granulados y también encapsulaciones, p. ej., en sustancias poliméricas. Al igual que para el tipo de composiciones, los métodos de aplicación, tales como pulverización, atomización, espolvoreo, dispersión, recubrimiento o vertido, se seleccionan de acuerdo con los objetivos deseados y las circunstancias predominantes. Las composiciones también pueden contener otros adyuvantes tales como estabilizantes, antiespumantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes o adherentes, así como fertilizantes, dadores de micronutrientes u otras formulaciones para obtener efectos especiales.

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

Los concentrados en suspensión son formulaciones acuosas en las que se suspenden partículas sólidas finamente divididas del compuesto activo. Formulaciones de este tipo incluyen agentes antisedimentación y agentes dispersantes y pueden incluir, además, un agente humectante para mejorar la actividad, así como también un antiespumante y un inhibidor del crecimiento cristalino. Cuando se utilizan, estos concentrados se diluyen en agua y se aplican normalmente como un aerosol a la zona que se desee tratar. La cantidad de principio activo puede variar entre un 0,5% y un 95% del concentrado.

Los polvos humectables se presentan en forma de partículas finamente divididas que se dispersan fácilmente en agua u otros portadores líquidos. Las partículas contienen el principio activo retenido en una matriz sólida. Las matrices sólidas típicas incluyen tierra de fuller, arcillas caolínicas, sílices y otros sólidos orgánicos o inorgánicos fácilmente humectables. Los polvos humectables normalmente contienen del 5% a 95% del ingrediente activo más una pequeña cantidad de agente humectante, dispersante o emulsionante.

Los concentrados emulsionables son composiciones líquidas homogéneas dispersables en agua u otro líquido y pueden consistir completamente en el compuesto activo con un agente emulsionante líquido o sólido, o también pueden contener un portador líquido, tal como xileno, naftas aromáticas pesadas, isoforona y otros disolventes orgánicos no volátiles. Cuando se utilizan, estos concentrados se dispersan en agua u otro líquido y se aplican normalmente como un aerosol a la zona que se desee tratar. La cantidad de principio activo puede variar entre un 0,5% y un 95% del concentrado.

Las formulaciones granulares incluyen tanto extrudados como partículas relativamente gruesas y se aplican comúnmente sin dilución a la zona en la que se requiere el tratamiento. Los vehículos típicos para formulaciones granulares incluyen arena, tierra de fuller, arcilla atapulgítica, arcillas bentoníticas, arcilla montmorillonítica, vermiculita, perlita, carbonato de calcio, ladrillo, piedra pómez, pirofilita, caolín, dolomita, escayola, harina de madera, mazorcas de maíz molidas, cáscara de cacahuete molida, azúcares, cloruro de sodio, sulfato de sodio, silicato de sodio, borato de sodio, magnesita, mica, óxido de hierro, óxido de cinc, óxido de titanio, óxido de antimonio, criolita, yeso, tierra de diatomeas, sulfato de calcio y otros materiales orgánicos o inorgánicos que absorben el compuesto activo o que pueden recubrirse con éste. Las formulaciones granulares contienen normalmente 5% a 25% de principios activos que pueden incluir agentes tensioactivos, tales como naftas aromáticas pesadas, queroseno y otras fracciones de petróleo o aceites vegetales; y/o adhesivos, tales como dextrinas, pegamentos o resinas sintéticas.

Los polvos finos son mezclas no aglomeradas del principio activo con sólidos finamente divididos tales como talco, arcillas, harinas y otros sólidos orgánicos e inorgánicos que actúan como agentes dispersantes y portadores.

Las microcápsulas son normalmente microgotas o gránulos del principio activo envueltos en una carcasa porosa inerte que permite la salida del material envuelto hacia su entorno en tasas controladas. Las microgotas encapsuladas tienen normalmente un diámetro de entre 1 y 50 micrómetros. El líquido envuelto normalmente constituye entre un 50 y un 95% del peso de la cápsula y puede incluir disolvente además del compuesto activo. Los gránulos encapsulados son generalmente gránulos porosos con membranas porosas que sellan las aberturas de los poros de los gránulos, de este modo se retienen las especies activas en forma líquida dentro de los poros de los gránulos. Los gránulos tienen normalmente un diámetro de entre 1 milímetro y 1 centímetro y, preferentemente, de entre 1 y 2 milímetros. Los gránulos se forman por extrusión, aglomeración o perlado, o son de origen natural. Son ejemplos de tales materiales vermiculita, arcilla sinterizada, caolín, arcilla atapulgítica, serrín y carbón granular. Los materiales de cubierta o membrana incluyen cauchos naturales y sintéticos, materiales celulósicos, copolímeros de estireno-butadieno, poliácridonitrilos, poliácridatos, poliésteres, poliamidas, poliureas, poliuretanos y xantatos de almidón.

Otras formulaciones útiles para aplicaciones agroquímicas incluyen simples soluciones del principio activo en un disolvente en el que sea completamente soluble para la concentración deseada, tal como acetona, naftalenos alquilados, xileno y otros disolventes orgánicos. Se pueden utilizar también pulverizadores presurizados, en los que el principio activo se dispersa de forma finamente dividida como resultado de la vaporización de un portador del disolvente dispersante de bajo punto de ebullición.

Los expertos en la técnica estarán familiarizados con los adyuvantes y portadores agrícolas adecuados que son útiles para formular las composiciones de la invención en los tipos de formulaciones descritos anteriormente.

Portadores líquidos que se pueden emplear incluyen, por ejemplo, agua, tolueno, xileno, nafta de petróleo, aceite de cultivo, acetona, metil etil cetona, ciclohexanona, anhídrido acético, acetonitrilo, acetofenona, acetato de amilo, 2-butanona, clorobenceno, ciclohexano, ciclohexanol, acetatos de alquilo, alcohol diacetónico, 1,2-dicloropropano, dietanolamina, p-dietilbenceno, dietilenglicol, abietato de dietilenglicol, dietilenglicol butil éter, dietilenglicol etil éter, dietilenglicol metil éter, N,N-dimetil formamida, dimetilsulfóxido, 1,4-dioxano, dipropilenglicol, dipropilenglicol metil éter, dibenzoato de dipropilenglicol, diproxitol, alquil pirrolidinona, acetato de etilo, 2-etil hexanol, carbonato de etileno, 1,1,1-

tricloraetano, 2-heptanona, alfa-pineno, d-limoneno, etilenglicol, etilenglicol butil éter, etilenglicol metil éter, gamma-butirolactona, glicerol, diacetato de glicerol, monoacetato de glicerol, triacetato de glicerol, hexadecano, hexilenglicol, acetato de isoamilo, acetato de isobornilo, isooctano, isoforona, isopropilbenceno, miristato de isopropilo, ácido láctico, laurilamina, óxido de mesitilo, metoxi-propanol, metil isoamil cetona, metil isobutil cetona, laurato de metilo, octanoato de metilo, oleato de metilo, cloruro de metileno, m-xileno, n-hexano, n-octilamina, ácido octadecanoico, acetato de octilamina, ácido oleico, oleilamina, o-xileno, fenol, polietilenglicol (PEG400), ácido propiónico, propilenglicol, propilenglicol monometil éter, p-xileno, tolueno, fosfato de trietilo, trietilenglicol, ácido xilenosulfónico, parafina, aceite mineral, tricloroetileno, percloroetileno, acetato de etilo, acetato de amilo, acetato de butilo, metanol, etanol, isopropanol y alcoholes de elevado peso molecular, tal como alcohol amílico, alcohol tetrahidrofurfurílico, hexanol, octanol, etc., etilenglicol, propilenglicol, glicerina y N-metil-2-pirrolidinona. Por lo general, el portador elegido para la dilución de los concentrados es el agua.

Portadores sólidos adecuados incluyen, por ejemplo, talco, dióxido de titanio, arcilla pirofilitica, sílice, arcilla atapulgítica, kieselguhr, tiza, tierra de diatomeas, cal, carbonato de calcio, arcilla bentonítica, tierra de fuller, cáscaras de semillas de algodón, harina de trigo, harina de soja, piedra pómez, harina de madera, harina de cáscara de nuez y lignina.

Se emplea convenientemente una amplia gama de agentes tensioactivos tanto en dichas composiciones líquidas como sólidas, especialmente en las diseñadas para ser diluidas con un portador antes de su aplicación. Estos agentes, cuando se utilizan, normalmente comprenden entre un 0,1% y un 15% en peso de la formulación. Estos pueden ser de naturaleza aniónica, catiónica, no iónica o polimérica y se pueden emplear como agentes emulsionantes, agentes humectantes, agentes de suspensión o con otros fines. Agentes tensioactivos típicos incluyen sales de alquilsulfatos tales como laurilsulfato de dietanolamonio; sales de alquilarilsulfonato tales como dodecilbencenosulfonato de calcio; productos de adición de alquilfenol y óxido de alquileno, tales como etoxilado de nonilfenol C₁₈; productos de adición de alcohol y óxido de alquileno, tales como etoxilato de alcohol tridecílico C₁₆; jabones, tales como estearato de sodio; sales de alquilnaftalenosulfonato, tales como dibutilnaftalenosulfonato de sodio; ésteres dialquílicos de sales de sulfosuccinato, tales como sulfosuccinato sódico de di(2-etilhexilo); ésteres de sorbitol, tales como oleato de sorbitol; aminas cuaternarias, tales como cloruro de lauriltrimetilamonio; ésteres polietilenglicólicos de ácidos grasos, tales como estearato de polietilenglicol; copolímeros en bloque de óxido de etileno y óxido de propileno; y sales de ésteres de fosfato mono- y dialquílicos.

Otros adyuvantes utilizados comúnmente en composiciones agrícolas incluyen inhibidores de la cristalización, modificadores de la viscosidad, agentes de suspensión, modificadores de las microgotas de los aerosoles, pigmentos, antioxidantes, agentes espumantes, agentes antiespumantes, agentes bloqueadores de la luz, agentes compatibilizantes, agentes antiespuma, agentes secuestrantes, tampones y agentes neutralizantes, inhibidores de la corrosión, tintes, odorizantes, agentes de dispersión, potenciadores de la penetración, micronutrientes, emolientes, lubricantes y agentes adhesivos.

Asimismo, pueden combinarse otras composiciones o ingredientes activos como biocidas adicionales con las composiciones de la invención, utilizarse en los métodos de la invención y aplicarse simultánea o secuencialmente con las composiciones de la invención. Cuando se aplican simultáneamente, estos ingredientes activos adicionales pueden formularse junto con las composiciones de la invención o mezclarse, por ejemplo, en el tanque de pulverización. Estos ingredientes activos como biocidas adicionales pueden ser fungicidas, herbicidas, insecticidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas y/o reguladores del crecimiento vegetal.

Los agentes plaguicidas a los que se alude en la presente utilizando su nombre común se conocen, por ejemplo, de "The Pesticide Manual", 15ª Ed., British Crop Protection Council 2009.

Además, las composiciones de la invención también se pueden aplicar con uno o más inductores de resistencia adquirida sistémicamente (inductores "SAR"). Los inductores SAR son conocidos y se describen, por ejemplo, en la Patente de Estados Unidos N.º US 6 919 298 e incluyen, por ejemplo, salicilatos y el inductor SAR comercializado acibenzolar-S-metilo.

Los compuestos de fórmula (I) se utilizan normalmente en forma de composiciones y se pueden aplicar al área de cultivo o planta a tratar, simultáneamente o en sucesión con compuestos adicionales. Estos otros compuestos pueden ser, p. ej., fertilizantes o donantes de micronutrientes u otros preparados que influyan sobre el crecimiento de las plantas. También pueden ser herbicidas selectivos o herbicidas no selectivos, así como también insecticidas, fungicidas, bactericidas, nematocidas, molusquicidas o mezclas de varios de estos preparados, si se desea junto con otros portadores, tensioactivos o adyuvantes que faciliten la aplicación empleados habitualmente en la técnica de la formulación.

Los compuestos de fórmula (I) pueden utilizarse en forma de composiciones (fungicidas) para controlar o proteger contra microorganismos fitopatógenos, que comprenden como ingrediente activo al menos un compuesto de fórmula (I) o de al menos un compuesto individual preferido como el arriba definido, en forma libre o en forma de sal utilizable agroquímicamente, y al menos uno de los adyuvantes arriba mencionados.

La invención, en particular en lo que se refiere a los compuestos de Fórmula (I) (incluyendo las Fórmulas (IA), (IB), (IC), (ID) y (IE)), proporciona una composición, preferiblemente una composición fungicida, que comprende al menos un compuesto de fórmula (I), un portador agrícolamente aceptable y opcionalmente un adyuvante. Un portador agrícola aceptable es, por ejemplo, un portador que sea adecuado para el uso agrícola. Los portadores agrícolas son muy conocidos en la técnica. Preferiblemente, dicha composición puede comprender al menos uno o más compuestos activos como plaguicidas, por ejemplo un ingrediente activo fungicida adicional además del compuesto de fórmula (I).

El compuesto de fórmula (I) puede ser el único ingrediente activo de una composición o puede estar mezclado con uno o más ingredientes activos adicionales tales como un plaguicida, fungicida, compuesto sinérgico, herbicida o regulador del crecimiento vegetal, cuando proceda. En algunos casos, un ingrediente activo adicional puede producir actividades sinérgicas inesperadas.

Ejemplos de ingredientes activos adicionales adecuados incluyen los siguientes: fungicidas aminoácidos acíclicos, fungicidas alifáticos nitrogenados, fungicidas de tipo amida, fungicidas de tipo anilida, fungicidas antibióticos, fungicidas aromáticos, fungicidas que contienen arsénico, fungicidas de tipo cetona aril fenilica, fungicidas de tipo benzamida, fungicidas de tipo benzanilida, fungicidas de tipo bencimidazol, fungicidas de tipo benzotiazol, fungicidas botánicos, fungicidas difenilicos con puente, fungicidas de tipo carbamato, fungicidas de tipo carbanilato, fungicidas de tipo conazol, fungicidas que contienen cobre, fungicidas de tipo dicarboximida, fungicidas de tipo dinitrofenol, fungicidas de tipo ditiocarbamato, fungicidas de tipo ditiolano, fungicidas de tipo furamida, fungicidas de tipo furanilida, fungicidas de tipo hidrazida, fungicidas de tipo imidazol, fungicidas que contienen mercurio, fungicidas morfolínicos, fungicidas organofosforados, fungicidas de organoestaño, fungicidas de tipo oxatiino, fungicidas de tipo oxazol, fungicidas de tipo fenilsulfamida, fungicidas de tipo polisulfuro, fungicidas de tipo pirazol, fungicidas de tipo piridina, fungicidas de tipo pirimidina, fungicidas de tipo pirrol, fungicidas de tipo amonio cuaternario, fungicidas de tipo quinolina, fungicidas de tipo quinona, fungicidas de tipo quinoxalina, fungicidas de tipo estrobilurina, fungicidas de tipo sulfonanilida, fungicidas de tipo tiadiazol, fungicidas de tipo tiazol, fungicidas de tipo tiazolidina, fungicidas de tipo tiocarbamato, fungicidas de tipo tiofeno, fungicidas de tipo triazina, fungicidas de tipo triazol, fungicidas de tipo triazolopirimidina, fungicidas de tipo urea, fungicidas de tipo valinamida y fungicidas que contienen zinc.

Ejemplos de ingredientes activos adicionales adecuados también incluyen los siguientes: (9-Diclorometileno-1,2,3,4-tetrahydro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico, metoxi-[1-metil-2-(2,4,6-triclorofenil)-etil]-amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico, (2-diclorometileno-3-etil-1-metil-indan-4-il)-amida del ácido 1-metil-3-difluorometil-1H-pirazol-4-carboxílico (1072957-71-1), (4'-metilsulfanilbifenil-2-il)-amida del ácido 1-metil-3-difluorometil-1H-pirazol-4-carboxílico, [2-(2,4-dicloro-fenil)-2-metoxi-1-metil-etil]-amida del ácido 1-metil-3-difluorometil-4H-pirazol-4-carboxílico, (5-cloro-2,4-dimetil-piridin-3-il)-(2,3,4-trimetoxi-6-metil-fenil)-metanona, (5-bromo-4-cloro-2-metoxi-piridin-3-il)-(2,3,4-trimetoxi-6-metil-fenil)-metanona, 2-{2-[(E)-3-(2,6-dicloro-fenil)-1-metil-prop-2-en-(E)-ilidenaminooximetil]-fenil}-2-[(Z)-metoxiimino]-N-metil-acetamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetil-isoxazolidin-3-il]-piridina, (E)-N-metil-2-[2-(2,5-dimetilfenoximetil)fenil]-2-metoxi-iminoacetamida, 4-bromo-2-ciano-N, N-dimetil-6-trifluorometilbencimidazol-1-sulfonamida, a-[N-(3-cloro-2,6-xilil)-2-metoxiacetamido]-y-butirolactona, 4-cloro-2-ciano-N, -dimetil-5-p-tolilimidazol-1-sulfonamida, N-alil-4,5-dimetil-2-trimetilsililitiofeno-3-carboxamida, N-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenoxi)propionamida, N-(2-metoxi-5-piridil)-ciclopropano carboxamida, (+-)-cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 2-(1-terc.-butil)-1-(2-clorofenil)-3-(1,2,4-triazol-1-il)-propan-2-ol, 2',6'-dibromo-2-metil-4-trifluorometoxi-4'-trifluorometil-1,3-tiazol-5-carboxanilida, 1-imidazolil-1-(4'-clorofenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ona, (E)-2-[2-[6-(2-cianofenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2-tioamidofenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2-fluorofenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2,6-difluorofenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(pirimidin-2-iloxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(5-metilpirimidin-2-iloxi)-fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(fenil-sulfoniloxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(4-nitrofenoxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-fenoxifenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3,5-dimetilbenzoil)pirrol-1-il]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3-metoxifenoxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(2-feniletén-1-il)-fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3,5-diclorofenoxi)piridin-3-il]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-(2-(3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenoxi)fenil)-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(alfa-hidroxibencil)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-(2-(4-fenoxipiridin-2-iloxi)fenil)-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3-n-propiloxifenoxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3-isopropiloxifenoxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(2-fluorofenoxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3-etoxifenoxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(4-terc.-butil-piridin-2-iloxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[3-(3-cianofenoxi)fenoxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[(3-metil-piridin-2-iloximetil)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2-metil-fenoxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(5-bromo-piridin-2-iloximetil)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(3-(3-yodopiridin-2-iloxi)fenoxi)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2-cloropiridin-3-iloxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E),(E)-2-[2-(5,6-dimetilpirazin-2-ilmetiloximinometil)fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(6-metilpiridin-2-iloxi)pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E),(E)-2-[2-(3-metoxifenil)metiloximinometil]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-(6-(2-azidofenoxi)-pirimidin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E),(E)-2-[2-[6-fenilpirimidin-4-il)-metiloximinometil]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E),(E)-2-[2-(4-clorofenil)-metiloximinometil]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E)-2-[2-[6-(2-n-propilfenoxi)-1,3,5-triazin-4-iloxi]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, (E),(E)-2-[2-[(3-nitrofenil)metiloximinometil]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, 3-cloro-7-(2-aza-2,7,7-trimetil-oct-3-en-5-ina), 2,6-dicloro-N-(4-trifluorometilbencil)-benzamida, alcohol 3-yodo-2-propinílico, 4-clorofenil-3-yodopropargil formal, etilcarbamato de 3-bromo-2,3-di-yodo-2-propenilo, alcohol 2,3,3-triyodoalílico,

alcohol 3-bromo-2,3-diiodo-2-propenílico, n-butilcarbamato de 3-yodo-2-propinilo, n-hexilcarbamato de 3-yodo-2-propinilo, ciclohexil-carbamato de 3-yodo-2-propinilo, fenilcarbamato de 3-yodo-2-propinilo; derivados de fenol, tales como ribromofenol, tetraclorofenol, 3-metil-4-clorofenol, 3,5-dimetil-4-clorofenol, fenoxietanol, diclorofeno, o-fenilfenol, m-fenilfenol, p-fenilfenol, 2-bencil-4-clorofenol, 5-hidroxi-2-(5H)-furanona; 4,5-dicloroditiazolinona, 4,5-benzoditiazolinona, 4,5-trimetilenditiazolinona, 4,5-dicloro-(3H)-1,2-ditio-3-ona, 3,5-dimetil-tetrahidro-1,3,5-hiadiazina-2-tiona, cloruro de N-(2-p-clorobenzoiletil)-hexaminio, acibenzolar, acypetacs, alanycarb, albendazol, aldimorf, alicin, alcohol alílico, ametotradin, amisulbrom, amobam, ampropilfos, anilazina, asomate, aureofungin, azaconazol, azafendin, azitiram, azoxiestrobina, polisulfuro de bario, benalaxil, benalaxil-M, benodanil, benomil, benquinox, bentaluron, bentiavalicarb, bentiazol, cloruro de benzalconio, benzamacril, benzamorf, ácido benzohidroxámicoo, berberina, betoxazin, biloxazol, binapacril, bifenilo, bitertanol, bitionol, bixafen, blastidina-S, boscalid, bromotalonil, bromuconazol, bupirimato, butiobato, butilamina polisulfuro de calcio, captafol, captan, carbamorf, carbendazim, carbendazim clorhidrato, carboxin, carpropamid, carvona, CGA41396, CGA41397, quinometionato, quitosan, clobentiazona, cloraniformetano, cloranil, clorfenazol, cloroneb, cloropicrin, clorotalonil, clorozolinato, clozolinato, climbazol, clotrimazol, clozilacon, compuestos con contenido en cobre, tales como acetato de cobre, carbonato de cobre, hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oleato de cobre, oxiclورو de cobre, oxiquinolato de cobre, silicato de cobre, sulfato de cobre, talato de cobre, cromato de cobre y zinc y mezcla Bordeaux, cresol, cufraneb, cuprobam, óxido cuproso, ciazofamid, ciclafuramid, cicloheximida, ciflufenamid, cimoxanil, cipendazol, ciproconazol, ciprodinil, dazomet, debacarb, decafentin, ácido dehidroacético, disulfuro de di-2-piridilo 1,1'-dióxido, diclofluanid, diclomezina, diclona, dicloran, diclorofen, diclozolina, diclobutrazol, diclocimet, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflumetorim, tiofosfato de O,O-di-iso-propil-S-bencilo, dimefluazol, dimetaclon, dimetconazol, dimetomorf, dimetirimol, diniconazol, diniconazol-M, dinobuton, dinocap, dinocron, dinopenton, dinosulfon, dinoterbon, difenilamina, dipiritiona, disulfiram, ditalimfos, ditanon, ditioéter, cloruro de dodecil dimetil amonio, dodemorf, dodicin, dodina, doguadina, drazoxolon, edifenfos, enestroburina, epoxiconazol, etaconazol, etem, etaboxam, etirimol, etoxiquin, etilicina, (Z)-N-bencil-N [(metil (metil-tioetilidenamino-oxicarbonil)amino) tio]-β-alaninato de etilo, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenaminosulf, fenapanil, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamid, fenitropan, fenoxanil, fenciclonil, fenpropidin, fenpropimorf, fenpirazamina, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonil, flumetover, flumorf, flupicolida, fluopiram, fluoroimida, fluotrimazol, fluoxaestrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutanil, flutolanil, flutriafol, fluxapiroxad, folpet, formaldehído, fosetilo, fuberidazol, furalaxilo, furametpir, furcarbanil, furconazol, furfural, furmeciclox, furofanato, gliodin, griseofulvina, guazatina, halacrinato, hexa clorobenceno, hexaclorobutadieno, hexaclorofeno, hexaconazol, hexiltiofos, hidrargafén, hidroxisoxazol, himexazol, imazalil, imazalil sulfato, imibenconazol, iminoctadina, triacetato de iminoctadina, inezin, yodocarb, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, carbamato de isopropanil butilo, isoprotilano, isopirazam, isotianil, isovalediona, izopamfos, kasugamicina, kresoxim-metilo, LY186054, LY211795, LY248908, mancozeb, mandipropamid, maneb, mebenil, mecarbinzid, mefenoxam, mepanipirim, mepronil, cloruro mercúrico, cloruro mercurioso, meptildinocap, metalaxil, metalaxil-M, metam, metazoxolon, metconazol, metasulfocarb, metfuroxam, bromuro de metilo, yoduro de metilo, isotiocianato de metilo, metiram, metiram-zinc, metominoestrobina, metrafenona, metsulfovax, milneb, moroxidina, miclobutanil, miclozolin, nabam, natamicina, neoasozin, dimetilditiocarbamato de níquel, nitroestireno, nitroal-iso-propilo, nuarimol, octilina, ofurace, compuestos de organomercurio, orisaestrobina, ostol, oxadixilo, oxasulfuron, oxina-cobre, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxin, parinol, pefurazoato, penconazol, pencicuron, penflufen, pentaclorofenol, pentiopirad, fenamacril, óxido de fenazina, fosdifen, fosetil-Al, ácidos fosforosos, ftalida, picoxiestrobina, piperalin, policarbamato, polioxina D, polioxrim, poliram, probenazol, procloraz, procimidona, propamidina, propamocarb, propiconazol, propineb, ácido propiónico, proquinazid, protiocarb, protioconazol, piracarbolid, piracloestrobina, pirametroestrobina, piraoxiestrobina, pirazofos, piribencarb, piridinitrilo, pirifenox, pirimetanil, pirofenona, piroquilon, piroxicloro, piroxifur, pirrolnitrin, compuestos de amonio cuaternario, quinacetol, quinazamid, quinconazol, quinometionato, quinoxifen, quintozeno, rabenzazol, santonina, sedaxano, siltiofam, simeconazol, sipconazol, pentaclorofenato de sodio, solatenol, espiroxamina, estreptomina, azufre, sultropen, tebuconazol, tebfloquin, tecloftalam, tecnazeno, tecoram, tetraconazol, tiabendazol, tiadifluor, ticiofen, tifluzamida, 2-(tiocianometiltio) benzotiazol, tiofanato-metilo, tioquinox, tiram, tiadinil, timibenconazol, tioximid, tolclofos-metilo, tolilfluonid, triadimefon, triadimenol, triamifos, triarimol, triazbutil, triazoxido, triciclazol, tridemorf, trifloxiestrobina, triflumazol, triflorina, triflumizol, triticonazol, uniconazol, urbacide, validamicina, valifenalato, vapam, vinclozolin, zarilamid, zineb, ziram y zoxamida.

Los compuestos de la invención también se pueden utilizar combinados con agentes antihelmínticos. Tales agentes antihelmínticos incluyen compuestos seleccionados entre la clase de compuestos lactónicos macrocíclicos tales como derivados de ivermectina, avermectina, abamectina, emamectina, eprinomectina, doramectina, selamectina, moxidectina, nemadectina y milbemicina como los descritos en EP-357460, EP-444964 y EP-594291. Otros agentes antihelmínticos incluyen derivados de avermectina/milbemicina semisintéticos y biosintéticos tales como los descritos en US-5015630, WO-9415944 y WO-9522552. Otros agentes antihelmínticos incluyen bencimidazoles tales como albendazol, cambendazol, fenbendazol, flubendazol, mebendazol, oxfendazol, oxibendazol, parbendazol y otros miembros de la clase. Otros agentes antihelmínticos incluyen imidazotiazoles y tetrahidropirimidinas tales como tetramisol, levamisol, pamoato de pirantel, oxantel o morantel. Otros agentes antihelmínticos incluyen fluquicidas, tales como triclabendazol y clorsulón, y cestocidas tales como praziquantel y epsiprantel.

Los compuestos de la invención se pueden utilizar combinados con derivados y análogos de la clase paraherquamida/marcfortina de agentes antihelmínticos así como también oxazolinas antiparasitarias tales como las descritas en los documentos US-5478855, US-4639771 y DE-19520936.

Los compuestos de la invención pueden utilizarse en combinación con derivados y análogos de la clase general de agentes antiparasitarios de dioxomorfolina tal como se describe en el documento WO 96/15121 y también con depsipéptidos cíclicos activos antihelmínticos, tales como los descritos en los documentos WO 96/11945, WO 93/19053, WO 93/25543, EP 626375, EP 382173, WO 94/19334, EP 382173 y EP 503538.

Los compuestos de la invención pueden utilizarse en combinación con otros ectoparasitocidas; por ejemplo, fipronil; piretroides; organofosfatos; reguladores del crecimiento de insectos, tales como lufenurón; agonistas de ecdisona, tales como tebufenozida y similares; neonicotinoides, tales como imidacloprid y similares.

Los compuestos de la invención pueden utilizarse en combinación con alcaloides terpénicos, por ejemplo, los descritos en los Números de Publicación de Solicitud de Patente Internacional WO 95/19363 o WO 04/72086, particularmente los compuestos descritos en ellos.

Otros ejemplos de compuestos biológicamente activos de este tipo que los compuestos de la invención pueden utilizarse en combinación incluyen, pero no se limitan a los siguientes:

Organofosfatos: acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilol, bromofos, bromofos-etilo, cadusafos, cloretoxifos, clorpirifos, clorfenvinfos, clormefos, demeton, demeton-S-metilo, demeton-S-metil sulfona, dialifos, diazinon, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, disulfoton, etiona, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitrotriona, fensulfotona, fentiona, flupirazofos, fonofos, formotion, fostiazato, heptenofos, isazofos, isotioato, isoxationa, malationa, metacrifos, metamidofos, metidationa, metil-parationa, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paraoxona, parationa, parationa-metilo, fentoato, fosadona fosfolan, fosfocarb, fosmet, fosfamidón, forato, foxim, pirimifos, pirimifos-metilo, profenofos, propafos, proetamfos, protiofos, piraclorfos, piridapentiona, quinalfos, sulprofos, temefos, terbufos, tebupirimfos, tetraclorvinfos, timeton, triazofos, triclofon, vamidotona.

Carbamatos: alanicarb, aldcarb, metilcarbamato de 2-sec.-butilfenilo, benfuracarb, carbarilo, carbofuran, carbosulfan, cloetocarb, etiofencarb, fenoxicarb, fentiocarb, furatiocarb, HCN-801, isoprocarb, indoxacarb, metiocarb, metomil, (metil)carbamato de 5-metil-m-cumenilbutirilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, UC-51717.

Piretroides: acrinatrina, aletrina, alfametrina, (E) - (1*R*)-cis-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenmetil)ciclopropanocarboxilato de 5-bencil-3-furilmetilo, bifentrina, beta-ciflutrina, ciflutrina, a-cipermetrina, beta-cipermetrina, bioaletrina, bioaletrina ((isómero *S*)-ciclopentilo), bioresmetrina, bifentrina, NCI-85193, cicloprotrina, cihalotrina, cititrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, fluvalinato (isómero *D*), imiprotrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, permetrina, fenotrina, praletrina, piretrinas (productos naturales), resmetrina, tetrametrina, transflutrina, teta-cipermetrina, silafluofen, t-fluvalinato, teflutrina, tralometrina, Zeta-cipermetrina.

Reguladores del crecimiento de artrópodos: a) inhibidores de la síntesis de la quitina: benzoilureas: clorfluazurón, diflubenzurón, fluazurón, flucicloxurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, teflubenzurón, triflumurón, buprofecina, diofenolano, hexitiazox, etoxazol, clorfentacina; b) antagonistas de la ecdisona: halofenocida, metoxifenocida, tebufenocida; c) juvenoides: pirproxifeno, metopreno (incluido el *S*-metopreno), fenoxicarb; d) inhibidores de la biosíntesis de lípidos: espiroclifeno.

Otros antiparasitarios: acequinocil, amitraz, AKD-1022, ANS-118, azadiractina, *Bacillus thuringiensis*, bensultap, bifenazato, binapacril, bromopropilato, BTG-504, BTG-505, canfecloro, cartap, clorobenzilato, clordimeform, clorfenapir, cromafenozida, clotianidina, ciromazina, diaclofen, diafenthiurona, DBI-3204, dinactina, dihidroximetildihidroxipirrolidina, dinobuton, dinocap, endosulfan, etiprol, etofenprox, fenazaquin, flumit, MTI-800, fenpiroximato, fluacripirim, flubenzimina, flubrocitrina, flufenzina, flufenprox, fluproxifeno, halofenprox, hidrametilnona, IKI-220, kanemita, NC-196, neem guard, nidinortefuran, nitenpiram, SD-35651, WL-108477, piridarilo, propargita, protrifenbuta, pimetrozina, piridaben, pirimidifen, NC-1111, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, silafluofen, silomadina, spinosad, tebufenpirad, tetradifon, tetranactina, tiacloprid, tiociclam, tiametoxam, tolfenpirad, triazamato, trietoxiespinosina, trinactina, verbutina, vertalec, YI-5301.

Agentes biológicos: *Bacillus thuringiensis* ssp *aizawai*, *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* delta endotoxina, baculovirus, bacterias entomopatógenas, virus y hongos.

Bactericidas: clortetraciclina, oxitetraciclina, estreptomina.

Otros agentes biológicos: enrofloxacin, febantel, penetamato, moloxicam, cefalexina, kanamicina, pimobendano, clenbuterol, omeprazol, tiamulina, benazeprilo, piriprol, cefquinoma, florfenicol, buserelina, cefovecina, tulatromicina, ceftiour, carprofeno, metaflumizona, praziquantel, triclabendazol.

Se prefieren las siguientes mezclas de los compuestos de fórmula (I) con ingredientes activos (la abreviatura "TX" significa "un compuesto seleccionado del grupo que consiste en los compuestos descritos en las Tablas 1A a 30A, 1B a 29B, 1C a 33C, 1D a 27D o 1E a 27E (más adelante), o en las Tablas T1a, T1b, T2a, T2b, T3a, T3b, T4a, T4b, T5a o T5b (más adelante) ").

un adyuvante seleccionado del grupo de sustancias que consisten en aceites de petróleo (nombre alternativo) (628) + TX,

un acaricida seleccionado del grupo de sustancias que consiste en 1,1-bis(4-clorofenil)-2-etoxietanol (nombre según la IUPAC) (910) + TX, bencenosulfonato de 2,4-diclorofenilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1059) + TX, 2-fluoro-*N*-metil-*N*-1-naftilacetamida (nombre según la IUPAC) (1295) + TX, 4-clorofenil fenil sulfona (nombre según la IUPAC) (981) + TX, abamectina (1) + TX, acequinocil (3) + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, aldicarb (16) + TX, aldoxicarb (863) + TX, alfa-cipermetrina (202) + TX, amiditiona (870) + TX, amidoflumet [CCN] + TX, amidotioato (872) + TX, amiton (875) + TX, amiton hidrógeno oxalato (875) + TX, amitraz (24) + TX, aramita (881) + TX, óxido arsenoso (882) + TX, AVI 382 (código de compuesto) + TX, AZ 60541 (código de compuesto) + TX, azinfos-etilo (44) + TX, azinfos-metilo (45) + TX, azobenceno (nombre según la IUPAC) (888) + TX, azociclotina (46) + TX, azotoato (889) + TX, benomilo (62) + TX, benoxafós (nombre alternativo) [CCN] + TX, benzoximato (71) + TX, benzoato de bencilo (nombre según la IUPAC) [CCN] + TX, bifenazato (74) + TX, bifentrina (76) + TX, binapacril (907) + TX, brofenvalerato (nombre alternativo) + TX, bromocicleno (918) + TX, bromofós (920) + TX, bromofos-etilo (921) + TX, bromopropilato (94) + TX, buprofezin (99) + TX, butocarboxim (103) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, polisulfuro de calcio (nombre según la IUPAC) (111) + TX, canfecloro (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarilo (115) + TX, carbofuran (118) + TX, carbofenotiona (947) + TX, CGA 50'439 (código de desarrollo) (125) + TX, quinometionato (126) + TX, clorbensida (959) + TX, clordimeform (964) + TX, hidrocloreuro de clordimeform (964) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfenetol (968) + TX, clorfenson (970) + TX, clorfensulfuro (971) + TX, clorfenvinfós (131) + TX, clorobencilato (975) + TX, cloromebuform (977) + TX, clorometiurona (978) + TX, cloropropilato (983) + TX, clorpirifos (145) + TX, clorpirifos-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, crotoxifos (1010) + TX, cufraneb (1013) + TX, ciantoato (1020) + TX, ciflumetofeno (n.º de Reg. CAS: 400882-07-7) + TX, cihalotrina (196) + TX, cihexatina (199) + TX, cipermetrina (201) + TX, DCPM (1032) + TX, DDT (219) + TX, demefion (1037) + TX, demefion-O (1037) + TX, demefion-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-metilsulfona (1039) + TX, diafentiurón (226) + TX, dialifos (1042) + TX, diazinona (227) + TX, diclofluanida (230) + TX, diclorvos (236) + TX, diclifos (nombre alternativo) + TX, dicofol (242) + TX, dicrotofos (243) + TX, dienoclor (1071) + TX, dimefox (1081) + TX, dimetoato (262) + TX, dinactina (nombre alternativo) (653) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-dicloxina (1089) + TX, dinobutón (269) + TX, dinocap (270) + TX, dinocap-4 [CCN] + TX, dinocap-6 [CCN] + TX, dinoclon (1090) + TX, dinopenton (1092) + TX, dinosulfon (1097) + TX, dinoterbon (1098) + TX, dioxation (1102) + TX, difenil sulfona (nombre según la IUPAC) (1103) + TX, disulfiram (nombre alternativo) [CCN] + TX, disulfoton (278) + TX, DNOC (282) + TX, dofenapin (1113) + TX, doramectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, endosulfano (294) + TX, endotion (1121) + TX, EPN (297) + TX, eprinomectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, etión (309) + TX, etoato-metilo (1134) + TX, etoxazol (320) + TX, etrimfos (1142) + TX, fenazaflor (1147) + TX, fenazaquin (328) + TX, óxido de fenbutatina (330) + TX, fenotiocarb (337) + TX, fenpropatrina (342) + TX, fenpirad (nombre alternativo) + TX, fenpiroximato (345) + TX, fenson (1157) + TX, fentrifanilo (1161) + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronil (354) + TX, fluacipirim (360) + TX, fluazuron (1166) + TX, flubenzimina (1167) + TX, flucicloxuron (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, hidrocloreuro de formetanato (405) + TX, formotiona (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, gamma-HCH (430) + TX, gliodina (1205) + TX, halfenprox (424) + TX, heptenofos (432) + TX, ciclopropanocarboxilato de hexadecilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1216) + TX, hexitiazox (441) + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, isocarbofós (nombre alternativo) (473) + TX, *O*-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo (nombre según la IUPAC) (473) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolina II (696) + TX, yodofenfos (1248) + TX, lindano (430) + TX, lufenurón (490) + TX, malatión (492) + TX, malonoben (1254) + TX, mecarbam (502) + TX, mefosfolan (1261) + TX, mesulfeno (nombre alternativo) [CCN] + TX, metacriofós (1266) + TX, metamidofos (527) + TX, metidatión (529) + TX, metiocarb (530) + TX, metomilo (531) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, metolcarb (550) + TX, mevinfos (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, monocrotofos (561) + TX, morfotión (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, nikkomicinas (nombre alternativo) [CCN] + TX, nitrilacarb (1313) + TX, complejo de nitrilacarb 1:1 cloruro de zinc (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) + TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxideprofos (1324) + TX, oxidisulfotón (1325) + TX, pp'-DDT (219) + TX, paratión (615) + TX, permetrina (626) + TX, aceites del petróleo (nombre alternativo) (628) + TX, fenkaptón (1330) + TX, fentoato (631) + TX, forato (636) + TX, fosadona (637) + TX, fosfolán (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosfamidona (639) + TX, foxim (642) + TX, pirimifos-metilo (652) + TX, policloroterpenos (nombre tradicional) (1347) + TX, polinactinas (nombre alternativo) (653) + TX, proclonol (1350) + TX, profenofos (662) + TX, promacil (1354) + TX, propargita (671) + TX, propetamfos (673) + TX, propoxur (678) + TX, protidatión (1360) + TX, protoato (1362) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridaben (699) + TX, piridafention (701) + TX, pirimidifen (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, quinalfos (711) + TX, quintiofos (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, RA-17 (código de desarrollo) (1383) + TX, rotenona (722) + TX, schradan (1389) + TX, sebufos (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, sofamida (1402) + TX, espiroclorfenol (738) + TX, espiromesifeno (739) + TX, SSI-121 (código de desarrollo) (1404) + TX, sulfiram (nombre alternativo) [CCN] + TX, sulfuramida (750) + TX, sulfotep (753) + TX, azufre (754) + TX, SZI-121 (código de desarrollo) (757) + TX, taufluvalinato (398) + TX, tebufenpirad (763) + TX, TEPP (1417) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, tetracloreuvinfós

- (777) + TX, tetradifon (786) + TX, tetranactina (nombre alternativo) (653) + TX, tetrasul (1425) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiofanox (800) + TX, tiometón (801) + TX, tioquinox (1436) + TX, turingiensina (nombre alternativo) [CCN] + TX, triamifós (1441) + TX, triarateno (1443) + TX, triazofos (820) + TX, triazuron (nombre alternativo) + TX, triclorfón (824) + TX, trifenofos (1455) + TX, trinactina (nombre alternativo) (653) + TX, vamidotión (847) + TX, vaniliprol [CCN] e YI-5302 (código de compuesto) + TX,
- 5 un algicida seleccionado del grupo de sustancias que consiste en betoxazin [CCN] + TX, dioctanoato de cobre (nombre según la 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 según la IUPAC) (347) e hidróxido de trifenilestaño (nombre según la IUPAC) (347) + TX,
- 10 un antihelmíntico seleccionado del grupo de sustancias que consisten en 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,
- 15 un avicida seleccionado del grupo de sustancias que consiste en cloralosa (127) + TX, endrina (1122) + TX, fentiona (346) + TX, piridin-4-amina (nombre según la IUPAC) (23) y estricnina (745) + TX,
- un bactericida seleccionado del grupo de sustancias que consiste en 1-hidroxi-1*H*-piridina-2-tiona (nombre según la IUPAC) (1222) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)benzenosulfonamida (nombre según la IUPAC) (748) + TX, sulfato de 8-hidroxiquinolina (446) + TX, bronopol (97) + TX, dioctanoato de cobre (nombre según la IUPAC) (170) + TX, hidróxido de cobre (nombre según la IUPAC) (169) + TX, cresol [CCN] + TX, diclorofeno (232) + TX, dipiritiona (1105) + TX, dodicina (1112) + TX, fenaminosulf (1144) + TX, formaldehído (404) + TX, hidrargafeno (nombre alternativo) [CCN] + TX, kasugamicina (483) + TX, clorhidrato de kasugamicina hidrato (483) + TX, bis(dimetilditiocarbamato) de níquel (nombre según la IUPAC) (1308) + TX, nitrapirina (580) + TX, octilina (590) + TX, ácido oxolínico (606) + TX,
- 20 oxitetraciclina (611) + TX, hidroxiquinolinsulfato de potasio (446) + TX, probenazol (658) + TX, estreptomina (744) + TX, sesquisulfato de estreptomina (744) + TX, tecloftalam (766) + TX, y tiomersal (nombre alternativo) [CCN] + TX,
- 25 un agente biológico seleccionado del grupo de sustancias que consisten en *Adoxophyes orana* GV (nombre alternativo) (12) + TX, *Agrobacterium radiobacter* (nombre alternativo) (13) + TX, *Amblyseius* spp. (nombre alternativo) (19) + TX, *Anagrapta falcifera* NPV (nombre alternativo) (28) + TX, *Anagrus atomus* (nombre alternativo) (29) + TX, *Aphelinus abdominalis* (nombre alternativo) (33) + TX, *Aphidius colemani* (nombre alternativo) (34) + TX, *Afidoteles afidimyza* (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, *Cydia 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 dactylopii* (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. *acridum* (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 multicápsida de la poliedrosis nuclear (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, *Typhlodromus occidentalis* (nombre alternativo) (844) y *Verticillium lecanii* (nombre alternativo) (848) + TX,
- 55 un esterilizante del suelo seleccionado del grupo de sustancias que consiste en yodometano (nombre según la IUPAC) (542) y bromuro de metilo (537) + TX,
- un quimioesterilizante seleccionado del grupo de sustancias que consiste en 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 de metilo [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,
- 60 una feromona de insecto seleccionada del grupo de sustancias que consiste en acetato de (*E*)-dec-5-en-1-ilo con (*E*)-dec-5-en-1-ol (nombre según la IUPAC) (222) + TX, acetato de (*E*)-tridec-4-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (829) + TX, (*E*)-6-metilhept-2-en-4-ol (nombre según la IUPAC) (541) + TX, acetato de (*E,Z*)-tetradeca-4,10-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (779) + TX, acetato de (*Z*)-dodec-7-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (285) + TX, (*Z*)-hexadec-11-enal (nombre según la IUPAC) (436) + TX, acetato de (*Z*)-hexadec-11-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (437) + TX,
- 65

- acetato de (Z)-hexadec-13-en-11-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (438) + TX, (Z)-icos-13-en-10-ona (nombre según la IUPAC) (448) + TX, (Z)-tetradec-7-en-1-al (nombre según la IUPAC) (782) + TX, (Z)-tetradec-9-en-1-ol (nombre según la IUPAC) (783) + TX, acetato de (Z)-tetradec-9-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (784) + TX, acetato de (7E,9Z)-dodeca-7,9-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (283) + TX, acetato de (9Z,11E)-tetradeca-9,11-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (780) + TX, acetato de (9Z,12E)-tetradeca-9,12-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (781) + TX, 14-metiloctadec-1-eno (nombre según la IUPAC) (545) + TX, 4-metilnonan-5-ol con 4-metilnonan-5-ona (nombre según la IUPAC) (544) + TX, alfa-multistriatina (nombre alternativo) [CCN] + TX, brevicomina (nombre alternativo) [CCN] + TX, codlelure (nombre alternativo) [CCN] + TX, codlemona (nombre alternativo) (167) + TX, cuclure (nombre alternativo) (179) + TX, disparlure (277) + TX, acetato de dodec-8-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (286) + TX, acetato de dodec-9-en-1-ilo (nombre según la IUPAC) (287) + TX, dodeca-8 + TX, acetato de 10-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (284) + TX, dominicalure (nombre alternativo) [CCN] + TX, 4-metiloctanoato de etilo (nombre según la IUPAC) (317) + TX, eugenol (nombre alternativo) [CCN] + TX, frontalina (nombre alternativo) [CCN] + TX, gosiplure (nombre alternativo) (420) + TX, grandlura (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, hexalura [CCN] + TX, ipsdienol (nombre alternativo) [CCN] + TX, ipsenol (nombre alternativo) [CCN] + TX, japonilure (nombre alternativo) (481) + TX, lineatina (nombre alternativo) [CCN] + TX, litlure (nombre alternativo) [CCN] + TX, looplure (nombre alternativo) [CCN] + TX, medlura [CCN] + TX, ácido megatomoico (nombre alternativo) [CCN] + TX, eugenol metílico (nombre alternativo) (540) + TX, muscalure (563) + TX, acetato de octadeca-2,13-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (588) + TX, acetato de octadeca-3,13-dien-1-ilo (nombre según la IUPAC) (589) + TX, orfralure (nombre alternativo) [CCN] + TX, orictalure (nombre alternativo) (317) + TX, ostramona (nombre alternativo) [CCN] + TX, siglure [CCN] + TX, sordidina (nombre alternativo) (736) + TX, sulcatol (nombre alternativo) [CCN] + TX, acetato de tetradec-11-en-1-ilo (nombre según la 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,
- un repelente insecticida seleccionado del grupo de sustancias que consiste en 2-(octiltio)etanol (nombre según la IUPAC) (591) + TX, butopironoxilo (933) + TX, butoxi(polipropilenglicol) (936) + TX, adipato de dibutilo (nombre según la IUPAC) (1046) + TX, ftalato de dibutilo (1047) + TX, succinato de dibutilo (nombre según la IUPAC) (1048) + TX, dietiltoluamida [CCN] + TX, carbato de dimetilo [CCN] + TX, ftalato de dimetilo [CCN] + TX, etil hexanodiol (1137) + TX, hexamida [CCN] + TX, metoquin-butilo (1276) + TX, metilneodecanamida [CCN] + TX, oxamato [CCN] y picaridina [CCN] + TX,
- un insecticida seleccionado del grupo de sustancias que consiste en 1-dicloro-1-nitroetano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1058) + TX, 1,1-dicloro-2,2-bis(4-etilfenil)etano (nombre según la IUPAC) (1056), + TX, 1,2-dicloropropano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno (nombre según la IUPAC) (1063) + TX, 1-bromo-2-cloroetano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (916) + TX, acetato de 2,2,2-tricloro-1-(3,4-diclorofenil)etilo (nombre según la IUPAC) (1451) + TX, metilfosfato de 2,2-diclorovinilo y 2-etilsulfinitilo (nombre según la IUPAC) (1066) + TX, dimetilcarbamato de 2-(1,3-ditiolan-2-il)fenilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1109) + TX, tiocianato de 2-(2-butoxi)etilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (935) + TX, metilcarbamato de 2-(4,5-dimetil-1,3-dioxolan-2-il)fenilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1084) + TX, 2-(4-cloro-3,5-xililoxi)etanol (nombre según la IUPAC) (986) + TX, fosfato de 2-clorovinil dietilo (nombre según la IUPAC) (984) + TX, 2-imidazolidona (nombre según la IUPAC) (1225) + TX, 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre según la IUPAC) (1246) + TX, metilcarbamato de 2-metil(prop-2-inil)aminofenilo (nombre según la IUPAC) (1284) + TX, laurato de 2-tiocianatoetilo (nombre según la IUPAC) (1433) + TX, 3-bromo-1-cloroprop-1-eno (nombre según la IUPAC) (917) + TX, dimetilcarbamato de 3-metil-1-fenilpirazol-5-ilo (nombre según la IUPAC) (1283) + TX, metilcarbamato de 4-metil(prop-2-inil)amino-3,5-xililo (nombre según la IUPAC) (1285) + TX, dimetilcarbamato de 5,5-dimetil-3-oxociclohex-1-enilo (nombre según la IUPAC) (1085) + TX, abamectina (1) + TX, acefato (2) + TX, acetamiprid (4) + TX, acetión (nombre alternativo) [CCN] + TX, acetoprol [CCN] + TX, acrinatrina (9) + TX, acrilonitrilo (nombre según la 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-ecdisona (nombre alternativo) [CCN] + TX, fosforo de aluminio (640) + TX, amiditiona (870) + TX, amidotioato (872) + TX, aminocarb (873) + TX, amiton (875) + TX, amiton hidrógeno oxalato (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, endotoxinas delta de *Bacillus thuringiensis* (nombre alternativo) (52) + TX, hexafluorosilicato de bario (nombre alternativo) [CCN] + TX, polisulfuro de bario (nombre según la 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, benzovindiflupir + TX, beta-ciflutrina (194) + TX, beta-cipermetrina (203) + TX, bifentrina (76) + TX, bioaletrina (78) + TX, isómero de bioaletrina S-ciclopentenilo (nombre alternativo) (79) + TX, bioetanometrina [CCN] + TX, biopermetrina (908) + TX, bioresmetrina (80) + TX, bis(2-cloroetil) éter (nombre según la IUPAC) (909) + TX, bistrifluron (83) + TX, borax (86) + TX, brofenvalerato (nombre alternativo) + TX, bromfenvinfós (914) + TX, bromocicleno (918) + TX, bromo-DDT (nombre alternativo) [CCN] + TX, bromofós (920) + TX, bromofos-etilo (921) + TX, bufencarb (924) + TX, buprofezin (99) + TX, butacarb (926) + TX, butatíofos (927) + TX, butocarboxim (103) + TX, butonato (932) + TX, butoxicarboxim (104) + TX, butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, cadusafos (109) + TX, arseniato de calcio [CCN] + TX, cianuro de calcio (444) + TX, polisulfuro de calcio (nombre según la IUPAC) (111) + TX, canfecloro (941) + TX, carbanolato (943) + TX, carbarilo (115) + TX, carbofuran (118) + TX, disulfuro de carbono (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (945) + TX, tetracloruro de carbono (nombre según la IUPAC) (946) +

TX, carbofenotión (947) + TX, carbosulfan (119) + TX, cartap (123) + TX, clorhidrato de cartap (123) + TX, cevadina (nombre alternativo) (725) + TX, clorbicicleno (960) + TX, clordano (128) + TX, clordecona (963) + TX, clordimeform (964) + TX, hidrocloreto de clordimeform (964) + TX, cloretoxifos (129) + TX, clorfenapir (130) + TX, clorfeninfos (131) + TX, clorfluazuron (132) + TX, clormefos (136) + TX, cloroformo [CCN] + TX, cloropicrina (141) + TX, clorfoxim (989) + TX, clorprazofos (990) + TX, clorpirifos (145) + TX, clorpirifos-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, clocitrina (nombre alternativo) + TX, cloetocarb (999) + TX, closantel (nombre alternativo) [CCN] + TX, clotianidina (165) + TX, acetoarsenito de cobre [CCN] + TX, arseniato de cobre [CCN] + TX, oleato de cobre [CCN] + TX, coumafos (174) + TX, coumitoato (1006) + TX, crotamitón (nombre alternativo) [CCN] + TX, crotoxifos (1010) + TX, crufomato (1011) + TX, criolito (nombre alternativo) (177) + TX, CS 708 (código de desarrollo) (1012) + TX, cianofenfos (1019) + TX, cianofos (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, decarbofuran (1034) + TX, deltametrina (223) + TX, demefion (1037) + TX, demefion-O (1037) + TX, demefion-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-metilsulfona (1039) + TX, diafentiurón (226) + TX, dialifos (1042) + TX, diamidafos (1044) + TX, diazinona (227) + TX, dicaptón (1050) + TX, diclofentiól (1051) + TX, diclorvos (236) + TX, diclifós (nombre alternativo) + TX, dicresilo (nombre alternativo) [CCN] + TX, dicrotófos (243) + TX, diciclanil (244) + TX, dieldrina (1070) + TX, 5-metilpirazol-3-il fosfato de dietilo (nombre según la IUPAC) (1076) + TX, diflubenzurón (250) + TX, dilor (nombre alternativo) [CCN] + TX, dimeflutrina [CCN] + TX, dimefox (1081) + TX, dimetán (1085) + TX, dimetoato (262) + TX, dimetrina (1083) + TX, dimetilinfos (265) + TX, dimetilan (1086) + TX, dinex (1089) + TX, dinex-diclexina (1089) + TX, dinoprop (1093) + TX, dinosam (1094) + TX, dinoseb (1095) + TX, dinotefurano (271) + TX, diofenolán (1099) + TX, dioxabenzofos (1100) + TX, dioxacarb (1101) + TX, dioxatiól (1102) + TX, disulfotón (278) + TX, diticrofos (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, endosulfan (294) + TX, endotiól (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, etion (309) + TX, etiprol (310) + TX, etoato-metilo (1134) + TX, etoprofos (312) + TX, formiato de etilo (nombre según la 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, etrimfos (1142) + TX, EXD (1143) + TX, famfur (323) + TX, fenamifos (326) + TX, fenazaflo (1147) + TX, fenclorfos (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, fentiona (346) + TX, fentiól-etilo [CCN] + TX, fenvalerato (349) + TX, fipronil (354) + TX, flonicamid (358) + TX, flubendiamida (Nº Reg. CAS: 272451-65-7) + TX, flucufuron (1168) + TX, flucicloxuron (366) + TX, flucitrinato (367) + TX, fluenetilo (1169) + TX, flufenimer [CCN] + TX, flufenoxurón (370) + TX, flufenprox (1171) + TX, flumetrina (372) + TX, fluvalinato (1184) + TX, FMC 1137 (código de desarrollo) (1185) + TX, fonofos (1191) + TX, formetanato (405) + TX, clorhidrato de formetanato (405) + TX, formotiona (1192) + TX, formparanato (1193) + TX, fosmetilán (1194) + TX, fospirato (1195) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietán (1196) + TX, furatiocarb (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, heptaclor (1211) + TX, heptenofos (432) + TX, heterofos [CCN] + TX, hexaflumurón (439) + TX, HHDN (864) + TX, hidrametilnona (443) + TX, cianuro de hidrógeno (444) + TX, hidropreno (445) + TX, hiquincarb (1223) + TX, imidacloprid (458) + TX, imiprotrina (460) + TX, indoxacarb (465) + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, IPSP (1229) + TX, isazofos (1231) + TX, isobenzán (1232) + TX, isocarbofós (nombre alternativo) (473) + TX, isodrina (1235) + TX, isofenfos (1236) + TX, isolano (1237) + TX, isoprocarb (472) + TX, O-(metoxiaminotiofosforil)salicilato de isopropilo (nombre según la IUPAC) (473) + TX, isoprotiolano (474) + TX, isotioato (1244) + TX, isoxatiól (480) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, jasmolina I (696) + TX, jasmolina II (696) + TX, yodofenfos (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, kinopreno (484) + TX, lambda-cihalotrina (198) + TX, arsenato de plomo [CCN] + TX, lepimectina (CCN) + TX, leptofos (1250) + TX, lindano (430) + TX, lirimfos (1251) + TX, lufenuron (490) + TX, litidation (1253) + TX, metilcarbamato de m-cumenilo (nombre según la IUPAC) (1014) + TX, fosfuro de magnesio (nombre según la IUPAC) (640) + TX, malation (492) + TX, malonoben (1254) + TX, mazidox (1255) + TX, mecarbam (502) + TX, mecarfon (1258) + TX, menazon (1260) + TX, mefosolan (1261) + TX, cloruro mercurioso (513) + TX, mesulfenfos (1263) + TX, metaflumizona (CCN) + TX, metam (519) + TX, metam-potasio (nombre alternativo) (519) + TX, metam-sodio (519) + TX, metacrifos (1266) + TX, metamidofos (527) + TX, fluoruro de metanosulfonilo (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1268) + TX, metidatiól (529) + TX, metiocarb (530) + TX, metocrotófos (1273) + TX, metomilo (531) + TX, metopreno (532) + TX, metoquin-butilo (1276) + TX, metotrina (nombre alternativo) (533) + TX, metoxiclor (534) + TX, metoxifeno (535) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, isotiocianato de metilo (543) + TX, metilcloroformo (nombre alternativo) [CCN] + TX, cloruro de metileno [CCN] + TX, metoflutrina [CCN] + TX, metolcarb (550) + TX, metoxadiazona (1288) + TX, mevinfos (556) + TX, mexacarbato (1290) + TX, milbemectina (557) + TX, oxima de milbemectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, mipafox (1293) + TX, mirex (1294) + TX, monocrotófos (561) + TX, morfotión (1300) + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, naftalofós (nombre alternativo) [CCN] + TX, naled (567) + TX, naftaleno (nombre

- según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1303) + TX, NC-170 (código de desarrollo) (1306) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, nicotina (578) + TX, sulfato de nicotina (578) + TX, nifluridida (1309) + TX, nitenpiram (579) + TX, nitiazina (1311) + TX, nitrilcarb (1313) + TX, complejo de nitrilcarb 1:1 cloruro de zinc (1313) + TX, NNI-0101 (código de compuesto) + TX, NNI-0250 (código de compuesto) + TX, nornicotina (nombre tradicional) (1319) + TX, novalurón (585) + TX, noviflumurón (586) + TX, etilfosfonotioato de *O*-5-dicloro-4-yodofenilo (nombre según la IUPAC) (1057) + TX, fosforotioato de *O*,*O*-dietil *O*-4-metil-2-oxo-2*H*-cromen-7-ilo (nombre según la IUPAC) (1074) + TX, fosforotioato de *O*,*O*-dietil *O*-6-metil-2-propilpirimidin-4-ilo (nombre según la IUPAC) (1075) + TX, ditiopirofosfato de *O*,*O*,*O*,*O*-tetrapropilo (nombre según la IUPAC) (1424) + TX, ácido oleico (nombre según la IUPAC) (593) + TX, ometoato (594) + TX, oxamilo (602) + TX, oxidemetón-metilo (609) + TX, oxideprofos (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, laurato de pentaclorofenilo (nombre según la IUPAC) (623) + TX, permetrina (626) + TX, aceites del 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, fosadona (637) + TX, fosfolán (1338) + TX, fosmet (638) + TX, fosnicloro (1339) + TX, fosamidona (639) + TX, fosfina (nombre según la IUPAC) (640) + TX, foxim (642) + TX, foxim-metilo (1340) + TX, piresmetrina (1367) + TX, piretrina I (696) + TX, piretrina II (696) + TX, piretrinas (696) + TX, piridaben (699) + TX, piridalilo (700) + TX, piridafentiión (701) + TX, pirimidifen (706) + TX, pirimitato (1370) + TX, piriproxifeno (708) + TX, cuasia (nombre alternativo) [CCN] + TX, quinalfós (711) + TX, quinalfos-metilo (1376) + TX, quinotiona (1380) + TX, quintiofos (1381) + TX, R-1492 (código de desarrollo) (1382) + TX, rafoxanida (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, escradán (1389) + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, SI-0009 (código de compuesto) + TX, SI-0205 (código de compuesto) + TX, SI-0404 (código de compuesto) + TX, SI-0405 (código de compuesto) + TX, silafluofeno (728) + TX, SN 72129 (código de desarrollo) (1397) + TX, arsenato de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoruro de sodio (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1399) + TX, hexafluorosilicato de sodio (1400) + TX, pentaclorofenóxido de sodio (623) + TX, seleniato de sodio (nombre según la IUPAC) (1401) + TX, tiocianato de sodio [CCN] + TX, sofamida (1402) + TX, espinosad (737) + TX, espiromesifeno (739) + TX, espirotetmat (CCN) + TX, sulcofuron (746) + TX, sulcofurón-sodio (746) + TX, sulfuramida (750) + TX, sulfotep (753) + TX, fluoruro de sulfurilo (756) + TX, sulprofos (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, tebupirimfos (764) + TX, teflubenzurón (768) + TX, teflutrina (769) + TX, temefos (770) + TX, TEPP (1417) + TX, teraletrina (1418) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, terbufos (773) + TX, tetracloroetano [CCN] + TX, tetraclorvinfos (777) + TX, tetrametrina (787) + TX, teta-cipermetrina (204) + TX, tiacloprid (791) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tiametoxam (792) + TX, ticofos (1428) + TX, tiocarboxima (1431) + TX, tiociclam (798) + TX, hidrógeno oxalato de tiociclam (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, tralometrina (812) + TX, transflutrina (813) + TX, transpermetrina (1440) + TX, triamifos (1441) + TX, triazamato (818) + TX, triazofos (820) + TX, triazuron (nombre alternativo) + TX, triclorfon (824) + TX, triclorometafós-3 (nombre alternativo) [CCN] + TX, tricloronat (1452) + TX, trifenofos (1455) + TX, triflumurón (835) + TX, trimetacarb (840) + TX, tripreno (1459) + TX, vamidotión (847) + TX, vaniliprol [CCN] + TX, veratrídina (nombre alternativo) (725) + TX, veratrina (nombre alternativo) (725) + TX, XMC (853) + TX, xilicarb (854) + TX, YI-5302 (código de compuesto) + TX, zeta-cipermetrina (205) + TX, zetametrina (nombre alternativo) + TX, fosfuro de zinc (640) + TX, zolaprofos (1469) y ZXI 8901 (código de desarrollo) (858) + TX, ciantraniliprol [736994-63-19 + TX, clorantraniliprol [500008-45-7] + TX, cienopirafeno [560121-52-0] + TX, ciflumetofeno [400882-07-7] + TX, pirifluquinazón [337458-27-2] + TX, espinetoram [187166-40-1 + 187166-15-0] + TX, espirotetmat [203313-25-1] + TX, sulfoxaflor [946578-00-3] + TX, flufiprol [704886-18-0] + TX, meperflutrina [915288-13-0] + TX, tetrametilflutrina [84937-88-2] + TX, triflumezopirim (descrito en el documento WO 2012/092115) + TX,
- 55 un molusquicida seleccionado del grupo de sustancias constituido por óxido de bis(tributilestaño) (nombre según la 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 según la 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 según la IUPAC) (347) + TX, hidróxido de trifenilestaño (nombre según la IUPAC) (347) + TX, piriprol [394730-71-3] + TX,
- 60 un nematicida seleccionado del grupo de sustancias que consiste en AKD-3088 (código de compuesto) + TX,
- 1,2-dibromo-3-cloropropano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1045) + TX, 1,2-dicloropropano (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1062) + TX, 1,2-dicloropropano con 1,3-dicloropropeno (nombre según la IUPAC) (1063) + TX, 1,3-dicloropropeno (233) + TX, 3,4-diclorotetrahidrotiofeno 1,1-dióxido (nombre según la IUPAC/Chemical

Abstracts) (1065) + TX, 3-(4-clorofenil)-5-metilrodanina (nombre según la IUPAC) (980) + TX, ácido 5-metil-6-tioxo-1,3,5-tiadiazinan-3-ilacético (nombre según la 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 de compuesto) + TX, benclofiaz [CCN] + TX, benomilo (62) + TX, butilpiridabeno (nombre alternativo) + TX, cadusafos (109) + TX, carbofurano (118) + TX, disulfuro de carbono (945) + TX, carbosulfan (119) + TX, cloropicrina (141) + TX, clorpirifos (145) + TX, cloetocarb (999) + TX, citocininas (nombre alternativo) (210) + TX, dazomet (216) + TX, DBCP (1045) + TX, DCIP (218) + TX, diamidafos (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, fenamifos (326) + TX, fempirad (nombre alternativo) + TX, fensulfotión (1158) + TX, fostiazato (408) + TX, fostietán (1196) + TX, furfural (nombre alternativo) [CCN] + TX, GY-81 (código de desarrollo) (423) + TX, heterofos [CCN] + TX, yodometano (nombre según la IUPAC) (542) + TX, isamidofos (1230) + TX, isazofos (1231) + TX, ivermectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, kinetina (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, oxima de milbemicina (nombre alternativo) [CCN] + TX, moxidectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, composición de *Myrothecium verrucaria* (nombre alternativo) (565) + TX, NC-184 (código de compuesto) + TX, oxamilo (602) + TX, forato (636) + TX, fosfamidona (639) + TX, fosfocarb [CCN] + TX, sebufós (nombre alternativo) + TX, selamectina (nombre alternativo) [CCN] + TX, espinosad (737) + TX, terbam (nombre alternativo) + TX, terbufos (773) + TX, tetraclorotiofeno (nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts) (1422) + TX, tiafenox (nombre alternativo) + TX, tionazina (1434) + TX, triazofos (820) + TX, triazuron (nombre alternativo) + TX, xilenoles [CCN] + TX, YI-5302 (código de compuesto) y zeatina (nombre alternativo) (210) + TX, fluensulfona [318290-98-1] + TX, un inhibidor de la nitrificación seleccionado del grupo de sustancias que consisten en etilxantato de potasio [CCN] y nitrapirin (580) + TX, un activador vegetal seleccionado del grupo de sustancias que consiste en acibenzolar (6) + TX, acibenzolar-S-metil (6) + TX, probenazol (658) y extracto de *Reynoutria sachalinensis* (nombre alternativo) (720) + TX, un rodenticida seleccionado del grupo de sustancias que consiste en 2-isovalerilindan-1,3-diona (nombre según la IUPAC) (1246) + TX, 4-(quinoxalin-2-ilamino)benzenosulfonamida (nombre según la IUPAC) (748) + TX, alfa-clorohidrina [CCN] + TX, fosfuro de aluminio (640) + TX, antu (880) + TX, óxido arsenoso (882) + TX, carbonato de bario (891) + TX, bistiosemi (912) + TX, brodifacoum (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, coumafurilo (1005) + TX, coumatetrililo (175) + TX, crimidina (1009) + TX, difenacoum (246) + TX, difetialona (249) + TX, difacinona (273) + TX, ergocalciferol (301) + TX, flocoumafen (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 según la IUPAC) (542) + TX, lindano (430) + TX, fosfuro de magnesio (nombre según la IUPAC) (640) + TX, bromuro de metilo (537) + TX, norbormida (1318) + TX, fosacetim (1336) + TX, fosfina (nombre según la IUPAC) (640) + TX, fosforoso [CCN] + TX, pindona (1341) + TX, arsenito de potasio [CCN] + TX, pirinurón (1371) + TX, escilirósido (1390) + TX, arseniato de sodio [CCN] + TX, cianuro de sodio (444) + TX, fluoro-acetato de sodio (735) + TX, estricnina (745) + TX, sulfato de talio [CCN] + TX, warfarina (851) y fosfuro de zinc (640) + TX, un compuesto sinérgico seleccionado del grupo de sustancias que consiste en piperonilato de 2-(2-butoxi)etilo (nombre según la IUPAC) (934) + TX, 5-(1,3-benzodioxol-5-il)-3-hexilciclohex-2-enona (nombre según la IUPAC) (903) + TX, farnesol con nerolidol (nombre alternativo) (324) + TX, MB-599 (código de desarrollo) (498) + TX, MGK 264 (código de desarrollo) (296) + TX, piperonil butóxido (649) + TX, piprotal (1343) + TX, isómero de propilo (1358) + TX, S421 (código de desarrollo) (724) + TX, sesamex (1393) + TX, sesamolina (1394) y sulfóxido (1406) + TX, un repelente de animales seleccionado del grupo que consiste en antraquinona (32) + TX, cloralosa (127) + TX, naftenato de cobre [CCN] + TX, oxiclورو de cobre (171) + TX, diazinona (227) + TX, diciclopentadieno (nombre químico) (1069) + TX, guazatina (422) + TX, acetatos de guazatina (422) + TX, metiocarb (530) + TX, piridin-4-amina (nombre según la IUPAC) (23) + TX, tiram (804) + TX, trimetacarb (840) + TX, naftenato de zinc [CCN] y ziram (856) + TX, un virucida seleccionado del grupo de sustancias que consiste en imanina (nombre alternativo) [CCN] y ribavirina (nombre alternativo) [CCN] + TX, un protector de lesiones seleccionado del grupo de sustancias que consiste en óxido de mercurio (512) + TX, octilina (590) y tiofanato-metilo (802) + TX, y compuestos biológicamente activos seleccionados del grupo que consiste en azaconazol (60207-31-0) + TX, biteranol [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, imazalilo [35554-44-0] + TX, imibenconazol [86598-92-7] + TX, ipconazol [125225-28-7] + TX, metconazol [125116-23-6] + TX, miclobutanilo [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, ancimímol [12771-68-5] + TX, fenarimol [60168-88-9] + TX, nuarimol [63284-71-9] + TX, bupirimol [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, pirimetanilo [53112-28-0] + TX, fenciclonilo [74738-17-3] + TX, fludioxonilo [131341-86-1] + TX, benalaxilo [71626-11-4] + TX, furalaxilo [57646-30-7] + TX, metalaxilo [57837-19-1] + TX, R-metalaxilo [70630-17-0] + TX, ofurace [58810-48-3] + TX, oxadixilo [77732-09-3] + TX, benomilo [17804-35-2] + TX, carbandazim [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, flutolanilo [66332-96-5] + TX, mepronilo [55814-41-0] + TX, oxicarboxina [5259-88-1] + TX, pentiopirad [183675-82-3] + TX, tipluzamida [130000-40-7] + TX, guazatina [108173-90-6] + TX, dodina [2439-10-3] [112-65-2] (base libre) + TX, iminocetadina [13516-27-3] + TX, azoxiestrobina [131860-33-8] + TX, dimoxiestrobina [149961-52-4] + TX, enestroburina {Congr. Int. Proc. BCPC, Glasgow, 2003, 1, 93} + TX, fluoxaestrobina [361377-29-9] + TX, kresoxim-metilo [143390-89-0] + TX, metominioestrobina [133408-50-1] + TX, trifloxiestrobina [141517-21-7] + TX, orisaestrobina [248593-16-0] + TX, picoxiestrobina [117428-22-5] + TX, piracloestrobina [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, zineb [12122-67-7] + TX, ziram [137-30-4] + TX, captafol [2425-06-1] + TX, captan [133-06-2] + TX, diclofluanid [1085-98-9] + TX, fluoroimidaz [41205-21-4] + TX, folpet [133-07-3] + TX, tolilfluanida [731-27-1] + TX, mezcla bordeaux [8011-63-0] + TX, hidróxido de cobre [20427-59-2] + TX, oxiclورو de cobre [1332-40-7] + TX, sulfato de cobre [7758-98-7] + TX, óxido de cobre [1317-39-1] + TX, mancobre [53988-93-5] + TX, oxina-cobre [10380-28-6] + TX, dinocap [131-72-6] + TX, nitrotal-isopropilo [10552-74-6] + TX, edifenfos [17109-49-8] + TX, iprobenfos [26087-47-8] + TX, isoprotilano [50512-35-1] + TX, fosdifen [36519-00-3] + TX, pirazofos [13457-18-6] + TX, tolclofos-metilo [57018-04-9] + TX, acibenzolar-S-metilo [135158-54-2] + TX, anilazina [101-05-3] + TX, bentialicarb [413615-35-7] + TX, blasticidina-S [2079-00-7] + TX, quinometionato [2439-01-2] + TX, cloroneb [2675-77-6] + TX, clorotalonilo [1897-45-6] + TX, ciflufenamida [180409-60-3] + TX, cimoxanil [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, ditianon [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, fentina [668-34-8] + TX, ferimzona [89269-64-7] + TX, fluazinam [79622-59-6] + TX, fluopicolida [239110-15-7] + TX, flusulfamida [106917-52-6] + TX, fenhexamida [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, metasulfocarb [66952-49-6] + TX, metrafenona [220899-03-6] + TX, pencicurón [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, piroquilón [57369-32-1] + TX, quinoxifeno [124495-18-7] + TX, quitozeno [82-68-8] + TX, azufre [7704-34-9] + TX, tiadinilo [223580-51-6] + TX, triazóxido [72459-58-6] + TX, triciclazol [41814-78-2] + TX, triflorina [26644-46-2] + TX, validamicina [37248-47-8] + TX, zoxamida (RH7281) [156052-68-5] + TX, mandipropamida [374726-62-2] + TX, isopirazam [881685-58-1] + TX, sedaxano [874967-67-6] + TX, (9-diclorometileno-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (descrito en el documento WO 2007/048556) + TX, (3',4',5'-trifluoro-bifenil-2-il)-amida del ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (descrito en el documento WO 2006/087343) + TX, [(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(ciclopropilcarbonil)oxi]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-6,12-dihidroxi-4,6a,12b-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2H,11H-nafto[2,1-b]pirano[3,4-e]piran-4-il]metil-ciclopropanocarboxilato [915972-17-7] + TX y 1,3,5-trimetil-N-(2-metil-1-oxopropil)-N-[3-(2-metilpropil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-metoxi-1-(trifluorometil)etil]fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida [926914-55-8] + TX.

Las referencias entre paréntesis detrás de los ingredientes activos, p. ej. [3878-19-1] se refieren al número de Registro de Chemical Abstracts. Los componentes de las mezclas descritos anteriormente son conocidos. En los casos en los que los ingredientes activos están incluidos en "The Pesticide Manual"[The Pesticide Manual - A World Compendium; Decimotercera Edición; Editor: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council], se describen en el mismo bajo el número de entrada entre paréntesis para el compuesto particular; por ejemplo, el compuesto "abamectina" se describe bajo el número de entrada (1). En los casos en los que se añade "[CCN]" anteriormente en esta memoria al compuesto particular, el compuesto en cuestión se incluye en el "Compendium of Pesticide Common Names", que es accesible en internet [A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995-2004]; 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 en esta memoria mediante el denominado "nombre común", utilizándose el "nombre común ISO" u otro "nombre común" relevante en casos individuales. Si la denominación no es un "nombre común", la naturaleza de la denominación empleada en su lugar se indica entre paréntesis para el compuesto particular; en este caso, se emplea el nombre según la IUPAC, el nombre según la IUPAC/Chemical Abstracts, un "nombre químico", un "nombre tradicional", un "nombre de compuesto" o un "código de desarrollo" o, si no se emplea ninguna de estas denominaciones ni ningún "nombre común", se empleará un "nombre alternativo". "Nº de Reg. CAS" significa el Número de Registro de Chemical Abstracts.

La mezcla de ingredientes activos de los compuestos de fórmula (I) seleccionados de un compuesto descrito en una de las Tablas 1A a 30A, 1B a 29B, 1C a 33C, 1D a 27D o 1E a 27E (más adelante), o una de las Tablas T1a, T1b, T2a, T2b, T3a, T3b, T4a, T4b, T5a o T5b (más adelante) y un ingrediente activo tal como se describe arriba están preferiblemente en una 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, incluso más especialmente de 10:1 a 1:10, muy especialmente de 5:1 y 1:5, dando

preferencia especial a una relación de 2:1 a 1: 2, y también se prefiere una relación de 4:1 a 2:1, sobre todo en 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 1:2, 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 Estas relaciones de mezcla están en peso.

Las mezclas arriba descritas pueden utilizarse en un método para controlar plagas, que comprende aplicar una composición que comprende una mezcla tal como se describe arriba a las plagas o su entorno, con la excepción de un método para el tratamiento del cuerpo humano o animal mediante cirugía o Terapia y métodos de diagnóstico practicados en el cuerpo humano o animal.

Las mezclas que comprenden un compuesto de fórmula (I) seleccionado de una de las Tablas 1A a 30A, 1B a 29B, 1C a 33C, 1D a 27D o 1E a 27E (más adelante), o una de las Tablas T1a, T1b, T2a, T2b, T3a, T3b, T4a, T4b, T5a o T5b (más adelante) y uno o más ingredientes activos tal como se describe arriba se pueden aplicar, por ejemplo, en una sola forma de "mezcla preparada", en una mezcla de pulverización combinada compuesta de formulaciones separadas de los componentes de un solo ingrediente activo, como una "mezcla de tanque", y en un uso combinado de los ingredientes activos individuales cuando se aplican de manera secuencial, es decir, uno tras otro con un período razonablemente corto, como unas pocas horas o días. El orden de aplicación de los compuestos de fórmula (I) seleccionados de las Tablas 1A a 30A, 1B a 29B, 1C a 33C, 1D a 27D o 1E a 27E (más adelante), o las Tablas T1a, T1b, T2a, T2b, T3a, T3b, T4a, T4b, T5a o T5b (más adelante), y el o los ingredientes activos tal como se describe arriba, no son esenciales para el funcionamiento de la presente invención.

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

Las composiciones de acuerdo con la invención se preparan de una manera conocida per se, en ausencia de agentes auxiliares, por ejemplo moliendo, tamizando y/o comprimiendo un ingrediente activo sólido y en presencia de al menos un agente auxiliar, por ejemplo, mezclando y/o moliendo íntimamente el ingrediente activo con el agente auxiliar (agentes auxiliares). Estos procedimientos para la preparación de las composiciones y el uso de los compuestos (I) para la preparación de estas composiciones también son objeto de la invención.

Otro aspecto de la invención está relacionado con el uso de un compuesto de fórmula (I) o de un compuesto individual preferido de acuerdo con estas fórmulas generales tal como se define en la presente, de una composición que comprende al menos un compuesto de fórmula (I) o al menos un compuesto individual preferido tal como se define en la presente, o de una mezcla fungicida o insecticida que comprende al menos un compuesto de fórmula (I) o al menos un compuesto individual preferido tal como se define en la presente, en mezcla con otros fungicidas o insecticidas tal como se describe arriba, para controlar o prevenir la infestación de plantas (p. ej., plantas útiles tales como plantas de cultivo), material de propagación de las mismas (p. ej., semillas), cultivos cosechados (p. ej., cultivos alimenticios cosechados) o materiales no vivos por insectos o por microorganismos fitopatógenos, preferiblemente organismos fúngicos.

Un aspecto adicional de la invención se refiere a un método para controlar o prevenir una infestación de plantas (p. ej., plantas útiles tales como plantas de cultivo), material de propagación de las mismas (p. ej., semillas), cultivos cosechados (p. ej., cultivos alimenticios cosechados), o de materiales no vivos por insectos o por microorganismos u organismos fitopatógenos o en descomposición potencialmente dañinos para el hombre, especialmente organismos fúngicos, que comprende la aplicación de un compuesto de fórmula (I) o de un compuesto individual preferido tal como se define en la presente como ingrediente activo para las plantas, a partes de las plantas o al emplazamiento de las mismas, al material de propagación de las mismas o a cualquier parte de los materiales no vivos.

Controlar o prevenir los medios para reducir la infestación por parte de insectos o por parte de microorganismos fitopatógenos o de descomposición u organismos potencialmente dañinos para el hombre, especialmente organismos fúngicos, a tal nivel que se demuestre una mejora.

Un método preferido para controlar o prevenir una infestación de plantas de cultivo por parte de microorganismos fitopatógenos, especialmente organismos fúngicos o insectos, que comprende la aplicación de un compuesto de fórmula (I), o una composición agroquímica que contiene al menos uno de dichos compuestos, es la aplicación foliar. La frecuencia de aplicación y la tasa de aplicación dependerán del riesgo de infestación por parte del patógeno o insecto correspondiente. Sin embargo, los compuestos de fórmula (I) también pueden penetrar en la planta a través de las raíces a través del suelo (acción sistémica) empapando el emplazamiento de la planta con una formulación líquida, o aplicando los compuestos en forma sólida al suelo, p. ej., en forma granular (aplicación al suelo). En cultivos de arrozales, estos granulados se pueden aplicar al campo de arroz inundado. Los compuestos de fórmula (I) también se pueden aplicar a las semillas (revestimiento) impregnando las semillas o los tubérculos con una formulación líquida del fungicida o revistiéndolos con una formulación sólida

Una formulación, p. ej., una composición que contiene el compuesto de fórmula (I) y, si se desea, un adyuvante sólido o líquido o monómeros para encapsular el compuesto de fórmula (I), puede prepararse de una manera conocida, típicamente mezclando íntimamente y/o triturando el compuesto con extendedores, por ejemplo disolventes, portadores sólidos y, opcionalmente, compuestos tensioactivos (surfactantes).

5 Tasas ventajosas de aplicación son normalmente de 5 g a 2 kg de ingrediente activo (i.a.) por hectárea (ha), preferiblemente de 10 g a 1 kg de i.a./ha, lo más preferiblemente de 20 g a 600 g de i.a./ha. Cuando se emplea como un agente para empapar las semillas, las dosis convenientes son de 10 mg a 1 g de sustancia activa por kg de semillas.

10 Cuando las combinaciones de la presente invención se utilizan para tratar semillas, generalmente son suficientes tasas de 0,001 a 50 g de un compuesto de fórmula (I) por kg de semilla, preferiblemente de 0,01 a 10 g por kg de semilla.

Las composiciones de la invención pueden emplearse en cualquier forma convencional, por ejemplo en forma de un paquete doble, un polvo para el tratamiento de semillas secas (DS), una emulsión para el tratamiento de semillas (ES),
15 un concentrado fluido para el tratamiento de semillas (FS), una solución para el tratamiento de semillas (LS), un polvo dispersable en agua para el tratamiento de semillas (WS), una suspensión de cápsulas para el tratamiento de semillas (CF), un gel para el tratamiento de semillas (GF), un concentrado de emulsión (EC), un concentrado en suspensión (SC), una suspo-emulsión (SE), una suspensión de cápsula (CS), un gránulo dispersable en agua (WG), un gránulo emulsionable (EG), una emulsión, agua en aceite (EO), una emulsión, aceite en agua (EW), una microemulsión (ME),
20 una dispersión de aceite (OD), un fluido miscible con aceite (OF), un líquido miscible con aceite (OL), un concentrado soluble (SL), una suspensión de volumen ultra bajo (SU), un líquido de volumen ultra bajo (UL), un concentrado técnico (TK), un concentrado dispersable (DC), un polvo humectable (WP) o cualquier formulación técnicamente factible en combinación con adyuvantes aceptables en agricultura.

25 Dichas composiciones pueden producirse de manera convencional, p. ej., mezclando los ingredientes activos con agentes inertes de formulación apropiados (diluyentes, disolventes, cargas y opcionalmente otros ingredientes de formulación, tales como tensioactivos, biocidas, anticongelantes, adhesivos, espesantes y compuestos que proporcionan efectos de adyuvancia). Cuando se desee obtener una eficacia de duración prolongada, también se
30 pueden emplear formulaciones de liberación lenta convencionales. En particular, las formulaciones que se van a aplicar en formas de pulverización, tales como los concentrados dispersables en agua (p. ej., CE, CS, CD, DO, SE, EAg, EAc y similares), gránulos y polvos humectables, pueden contener surfactantes tales como agentes humectantes y dispersantes y otros compuestos que proporcionen efectos adyuvantes, p. ej., el producto de condensación del formaldehído con naftalenosulfonato, un alquilarsulfonato, un ligninosulfonato, un sulfato de alquilo graso, alquilfenol etoxilado y un alcohol graso etoxilado.

35 Una formulación para el revestimiento de semillas se aplica con métodos conocidos por sí mismos a las semillas, empleando la combinación de la invención y un diluyente en una forma de formulación para el revestimiento de semillas adecuada, por ejemplo, como una suspensión acuosa o en una forma de polvo seco que tenga una adherencia satisfactoria a las semillas. Dichas formulaciones para el revestimiento de semillas son conocidas en la técnica. Las
40 formulaciones de recubrimiento de semillas pueden contener los ingredientes activos individuales o la combinación de ingredientes activos en forma encapsulada, p. ej., como cápsulas o microcápsulas de liberación lenta.

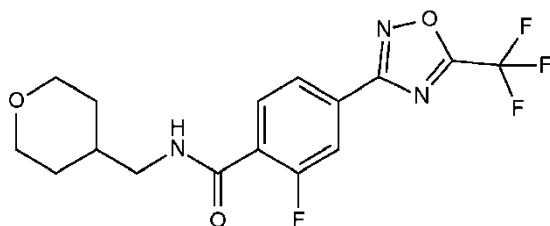
En general, las formulaciones incluyen de 0,01 a 90% en peso de agente activo, de 0 a 20% de tensioactivo aceptable en agricultura y de 10 a 99,99% de agentes inertes y adyuvantes de formulación sólida o líquida, consistiendo el agente
45 activo en al menos el compuesto de fórmula (I) junto con el componente (B) y (C) y, opcionalmente, otros agentes activos, particularmente microbicidas o conservantes o similares. Formas concentradas de composiciones contienen generalmente entre aproximadamente 2 y 80%, preferiblemente entre aproximadamente 5 y 70% en peso de agente activo. Las formas de aplicación de la formulación pueden contener, por ejemplo, de un 0,01 a un 20 % en peso, preferiblemente de un 0,01 a un 5 % en peso de agente activo. Si bien los productos comerciales se formularán
50 preferiblemente como concentrados, el usuario final normalmente empleará formulaciones diluidas

Los ejemplos que siguen sirven para ilustrar la invención. Los compuestos de la invención pueden distinguirse de compuestos conocidos en virtud de su mayor eficacia a bajas tasas de aplicación, que pueden verificarse por lo
55 expertos en la materia usando los procedimientos experimentales resumidos en los ejemplos, usando menores tasas de aplicación si fuera necesario, por ejemplo, 50 ppm, 12,5 ppm, 6 ppm, 3 ppm, 1,5 ppm o 0,8 ppm.

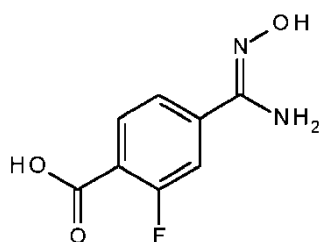
Compuestos de Fórmula (I) (incluidos los de acuerdo con la invención) pueden poseer cualquier número de beneficios que incluyen, *inter alia*, niveles ventajosos de actividad biológica para proteger las plantas contra enfermedades provocadas por hongos o propiedades superiores para su uso como ingredientes agroquímicos activos (por ejemplo,
60 una mayor actividad biológica, un espectro de actividad ventajoso, un perfil de seguridad incrementado (que incluye una tolerancia mejorada a los cultivos), propiedades fisico-químicas mejoradas o una mayor biodegradabilidad).

Ejemplos de Preparación

65 **Ejemplo 1:** Este ejemplo ilustra la preparación de 2-fluoro-N-(tetrahidropiran-4-ilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida (Compuesto 1b.18 de la Tabla T1b que figura más adelante)



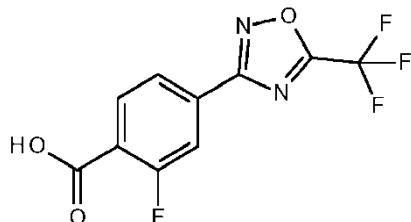
5

Etapla 1: Preparación de ácido 2-fluoro-4-(N-hidroxicarbamimidoil)-benzoico

10 Una solución de hidrocloreto de hidroxilamina (3,0 g) en agua (20 mL) se añadió, a temperatura ambiente, a una solución agitada de ácido 4-ciano-2-fluorobenzoico (3,52 g, 21,3 mmol) en etanol (35 mL), seguido de adición gota a gota de carbonato de potasio (1,60 g). Luego se añadió 8-hidroxiquinolina (0,04 g, 0,28 mmol) y la suspensión espesa resultante se calentó a reflujo durante 3 horas para obtener una solución amarilla. Después de separar el etanol a presión reducida, el residuo se acidificó con HCl 2 N a pH 3. El precipitado blanco se filtró, se lavó con agua y se secó a presión reducida a 50°C para producir ácido 2-fluoro-4-(N-hidroxicarbamimidoil)-benzoico en forma de un sólido beige. P.f: > 250 °C. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 13,22 (s, 1H), 10,00 (s, 1H), 7,85 (t, 1H), 7,63 (m, 1H), 7,54-7,61(m, 1H).

Etapla 2: Preparación de ácido 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)benzoico

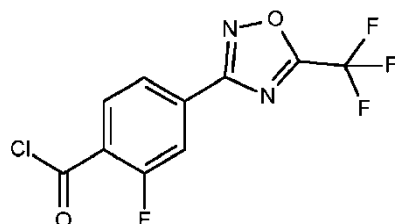
20



25 Anhídrido trifluoroacético (4,1 mL) se añadió gota a gota a una temperatura de 10 a 15°C a una suspensión agitada de ácido 2-fluoro-4-(N-hidroxicarbamimidoil)-benzoico (3,80 g, 19,0 mmol) en THF (77 mL). La suspensión beige se calentó a temperatura ambiente y se agitó durante la noche. Después de la evaporación, el producto bruto se agitó con heptano/acetato de etilo (95:5), se filtró y se secó a presión reducida a 50°C para producir ácido 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)benzoico en forma de un sólido amarillo. P.f: 175-177 °C. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 13,55 (s, 1H), 8,12 (t, 1H), 8,00 (d, 1H), 7,94(d, 1 H).

Etapla 3: Preparación de cloruro de 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-[1,2,4]oxadiazol-3-il)-benzoílo

30



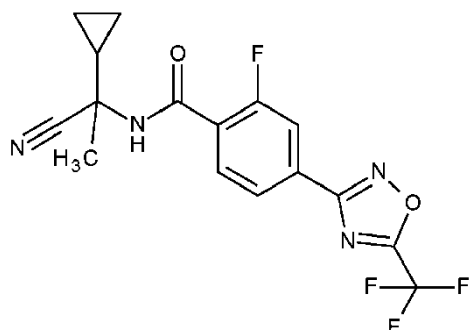
35 A una suspensión blanca que consiste en ácido 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)benzoico (3,6 g, 13,0 mmol) y CH₂Cl₂ (130 mL) se añadió gota a gota, a temperatura ambiente, cloruro de tionilo (1,51 mL). La suspensión resultante se calentó a reflujo y se agitó durante 3 horas, para obtener una solución amarilla. El disolvente se evaporó a presión reducida a 30°C para producir cloruro de 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-[1,2,4]oxadiazol-3-il)-benzoílo en forma

de un sólido amarillento que se utilizó directamente sin purificación. ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: 8,26 (t, 1H), 8,07 (m, 1H), 7,99 (m, 1H).

Etap 4: Preparación de 2-fluoro-N-(tetrahidropiran-4-ilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida

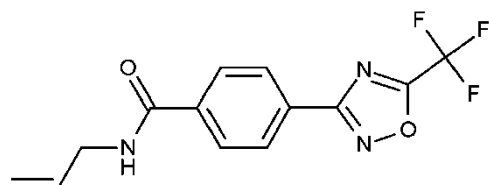
A un vial con tapón de rosca que contiene cloruro 2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoílo (0,13 g) suspendido en CH_2Cl_2 (12 mL), enfriado a 0°C se añadió tetrahidropiran-4-ilmetanamina (0,05 g) en forma de una solución de CH_2Cl_2 (1 mL). Luego se introdujo lentamente trietilamina (0,12 mL) y la solución amarilla resultante se agitó durante la noche. Los contenidos de reacción se vertieron luego en un embudo de separación y se diluyó con CH_2Cl_2 y agua. La capa orgánica se separó y luego se lavó con HCl 1 N, NaOH 1 N, salmuera, y luego se secó sobre sulfato de sodio. El disolvente se separó a presión reducida y el residuo bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea sobre gel de sílice (gradiente de heptano:acetato de etilo) para dar el compuesto del título en forma de un sólido blanco (punto de fusión: $134\text{--}136^\circ\text{C}$), LC/MS tiempo de retención = 0,96 minutos, 374,4 (M+H).

Ejemplo 2: Este ejemplo ilustra la preparación de N-(1-ciano-1-ciclopropil-etil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida (Compuesto 2b.9 de la Tabla T2b que figura más adelante)



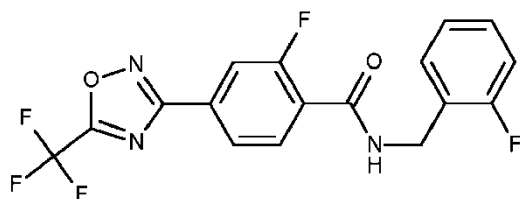
A un vial con tapón de rosca que contiene 2-amino-2-ciclopropil-propanonitrilo (0,05 g) suspendido en CH_2Cl_2 (12 mL) enfriada a 0°C se introdujo lentamente trietilamina (0,12 mL). Luego, se añadió cloruro de 2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoílo (0,13 g) en una porción y la solución amarilla resultante se agitó durante la noche. El disolvente se separó a presión reducida y el residuo bruto resultante se purificó por cromatografía de resolución instantánea sobre gel de sílice (gradiente de eluyente heptano:acetato de etilo) para dar el compuesto del título en forma de un aceite amarillo. LC/MS tiempo de retención = 1,04 minutos, 369,4 (M+H).

Ejemplo 3 (Referencia): Este ejemplo ilustra la preparación de N-alil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida (Compuesto 3a.1 de la Tabla T3a que figura más adelante)

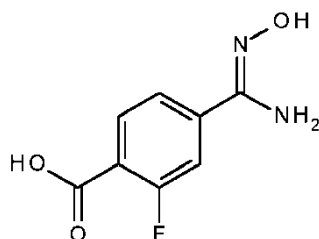


A una solución agitada de ácido 4-5-trifluorometil-1,2,4-oxadiazol-3-il benzoico (0,08 g) en DMF seca (1,2 mL) bajo una atmósfera de nitrógeno se añadió N-etil-N-isopropilpropan-2-amina (0,14 mL), HATU (0,13 g) y alilamina (0,02 g). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas y luego se añadieron acetato de etilo y agua. La mezcla resultante se agitó y las capas se separaron. La capa acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo y las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio y se filtraron. Se añadió Isolut al filtrado y la mezcla resultante se evaporó a sequedad y luego se purificó por cromatografía en columna (gradiente de eluyente de ciclohexano:acetato de etilo). El compuesto del título se obtuvo en forma de un sólido blanco (punto de fusión: $135\text{--}136^\circ\text{C}$), LC/MS tiempo de retención = 0,95 minutos, 298,2 (M+H).

Ejemplo 4: Este ejemplo ilustra la preparación de 2-fluoro-N-[(2-fluorofenil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida (Compuesto 4b.1 de la Tabla T4b que figura más adelante)

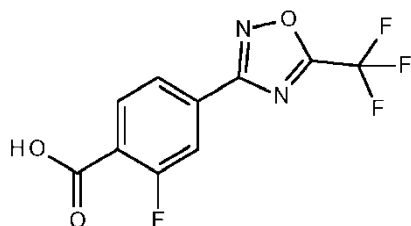


Etapa 1: Preparación de ácido 2-fluoro-4-(N-hidroxicarbamimidoil)-benzoico



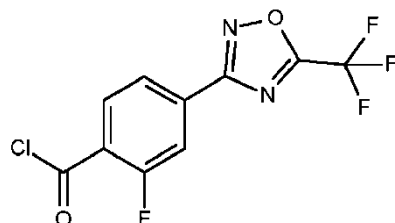
Una solución de hidrocloreto de hidroxilamina (3,0 g) en agua (20 mL) se añadió, a temperatura ambiente, a una solución agitada de ácido 4-ciano-2-fluorobenzoico (3,52 g, 21,3 mmol) en etanol (35 mL), seguido de adición gota a gota de carbonato de potasio (1,60 g). Luego se añadió 8-hidroxiquinolina (0,041g, 0,28 mmol) y la suspensión espesa resultante se calentó a reflujo durante 3 horas para obtener una solución amarilla. Después de separar el etanol a presión reducida, el residuo se acidificó con HCl 2 N a pH 3. El precipitado blanco se filtró, se lavó con agua y se secó a presión reducida a 50°C para producir ácido 2-fluoro-4-(N-hidroxicarbamimidoil)-benzoico en forma de un sólido beige. P.f: > 250 °C. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 13,22 (s, 1H), 10,00 (s, 1H), 7,85 (t, 1H), 7,63 (m, 1H), 7,54-7,61(m, 1H).

Etapa 2: Preparación de ácido 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)benzoico



Anhídrido trifluoroacético (4,1 mL) se añadió gota a gota a una temperatura de 10 a 15°C a una suspensión agitada de ácido 2-fluoro-4-(N-hidroxicarbamimidoil)-benzoico (3,80 g, 19,0 mmol) en THF (77 mL). La suspensión beige se calentó a temperatura ambiente y se agitó durante la noche. Después de la evaporación, el producto bruto se agitó con heptano/acetato de etilo (95:5), se filtró y se secó a presión reducida a 50°C para producir ácido 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)benzoico en forma de un sólido amarillo. P.f: 175-177 °C. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ ppm: 13,55 (s, 1H), 8,12 (t, 1H), 8,00 (d, 1H), 7,94(d, 1 H).

Etapa 3: Preparación de cloruro de 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-[1,2,4]oxadiazol-3-il)-benzoilo

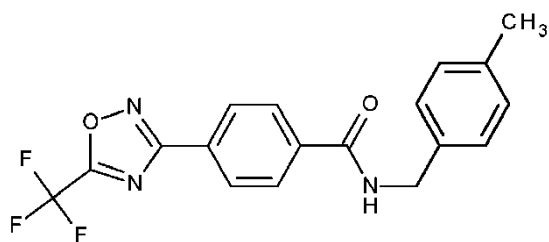


A una suspensión blanca que consiste en ácido 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)benzoico (3,6 g, 13,0 mmol) y CH₂Cl₂ (130 mL) se añadió gota a gota, a temperatura ambiente, cloruro de tionilo (1,51 mL). La suspensión resultante se calentó a reflujo y se agitó durante 3 horas, para obtener una solución amarilla. El disolvente se evaporó a presión reducida a 30°C para producir cloruro de 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-[1,2,4]oxadiazol-3-il)-benzoilo en forma de un sólido amarillento que se utilizó directamente sin purificación. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm: 8,26 (t, 1H), 8,07 (m, 1H), 7,99 (m, 1H).

Etapa 4: Preparación de 2-fluoro-N-[(2-fluorofenil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida

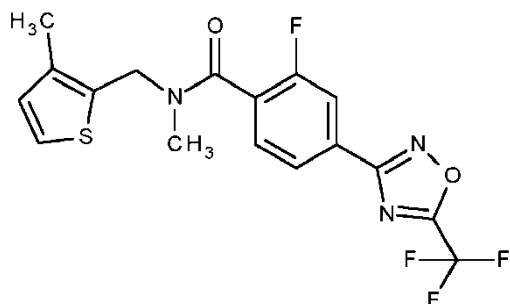
A un vial con tapón de rosca que contiene cloruro 2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoílo (0,13 g) suspendido en CH_2Cl_2 (1,2 mL), enfriado a 0°C se añadió (2-fluorofenil)metanamina (0,60 g) en forma de una solución de CH_2Cl_2 (1 mL). Luego se introdujo lentamente trietilamina (0,12 mL) y la solución amarilla resultante se agitó durante 4 horas. Los contenidos de reacción se vertieron luego en un embudo de separación y se diluyó con CH_2Cl_2 y agua. La capa orgánica se separó y luego se lavó con HCl 1 N, NaOH 1 N y salmuera. El disolvente se separó a presión reducida y el residuo bruto se purificó por cromatografía de resolución instantánea sobre gel de sílice (gradiente de ciclohexano:acetato de etilo) para dar el compuesto del título en forma de un sólido blanco (p.f.: $132\text{--}136^\circ\text{C}$). LC/MS tiempo de retención = 1,08 minutos, 384 (M+H).

Ejemplo 5 (Referencia): Este ejemplo ilustra la preparación de N-(p-tolilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida (Compuesto 4a.1 de la Tabla T4a)

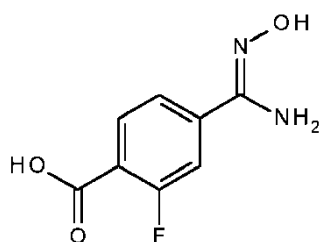


A una solución agitada de ácido 4-5-trifluorometil-1,2,4-oxadiazol-3-il benzoico (0,08 g, 0,31 mmol) en DMF seca (1,2 ml) bajo una atmósfera de nitrógeno se añadió N-etil-N-isopropilpropan-2-amina (0,11 g, 0,77 mmol), HATU (0,13 g, 0,34 mmol) y 4-metilbencilamina (0,04 g, 0,31 mmol). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas y luego se añadieron acetato de etilo y agua. La mezcla resultante se agitó y las capas se separaron. La capa acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo y las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron sobre sulfato de sodio y se filtraron. Se añadió Isolut al filtrado y la mezcla resultante se evaporó a sequedad y luego se purificó por cromatografía en columna (mezcla de eluyente de ciclohexano:acetato de etilo). El compuesto del título se obtuvo en forma de un sólido blanco (p. f.: $198\text{--}203^\circ\text{C}$), LC/MS tiempo de retención = 1,09 minutos, 362 (M+H).

Ejemplo 6: Este ejemplo ilustra la preparación de 2-fluoro-N-metil-N-[(3-metil-2-tienil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida (Compuesto 5b.3 de la Tabla T5b que figura más adelante)



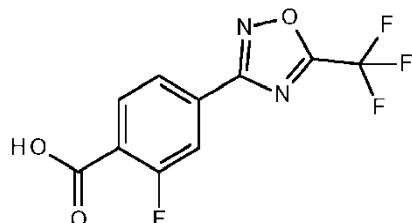
Etapla 1: Preparación de ácido 2-fluoro-4-(N-hidroxicarbamimidoil)-benzoico



Una solución de hidroccloruro de hidroxilamina (3,0 g) en agua (20 mL) se añadió, a temperatura ambiente, a una solución agitada de ácido 4-ciano-2-fluorobenzoico (3,52 g, 21,3 mmol) en etanol (35 mL), seguido de adición gota a gota de carbonato de potasio (1,60 g). Luego se añadió 8-hidroxiquinolina (0,04 g, 0,28 mmol) y la suspensión espesa resultante se calentó a reflujo durante 3 horas para obtener una solución amarilla. Después de separar el etanol a presión reducida, el residuo se acidificó con HCl 2 N a pH 3. El precipitado blanco se filtró, se lavó con agua y se secó a presión reducida a 50°C para producir ácido 2-fluoro-4-(N-hidroxicarbamimidoil)-benzoico en forma de un sólido

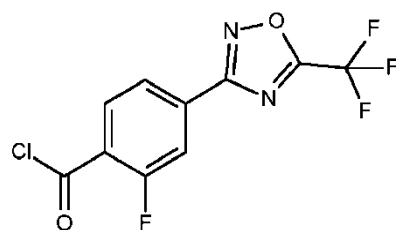
beige. P.f: > 250 °C. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 13,22 (s, 1H), 10,00 (s, 1H), 7,85 (t, 1H), 7,63 (m, 1H), 7,54-7,61(m, 1H).

Etapa 2: Preparación de ácido 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)benzoico



Anhídrido trifluoroacético (4,1 mL) se añadió gota a gota a una temperatura de 10 a 15°C a una suspensión agitada de ácido 2-fluoro-4-(N-hidroxycarbamimidoyl)-benzoico (3,80 g, 19,0 mmol) en THF (77 mL). La suspensión beige se calentó a temperatura ambiente y se agitó durante la noche. Después de la evaporación, el producto bruto se agitó con heptano/acetato de etilo (95:5), se filtró y se secó a presión reducida a 50°C para producir ácido 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)benzoico en forma de un sólido amarillo. P.f: 175-177 °C. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ ppm: 13,55 (s, 1H), 8,12 (t, 1H), 8,00 (d, 1H), 7,94(d, 1 H).

Etapa 3: Preparación de cloruro de 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-[1,2,4]oxadiazol-3-il)-benzoílo

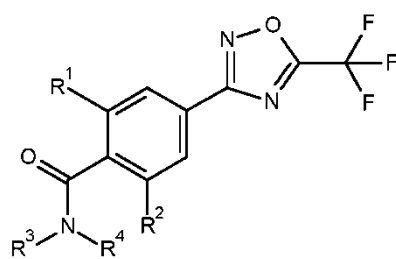


A una suspensión blanca que consiste en ácido 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)benzoico (3,6 g, 13,0 mmol) y CH_2Cl_2 (130 mL) se añadió gota a gota, a temperatura ambiente, cloruro de tionilo (1,51 mL). La suspensión resultante se calentó a reflujo y se agitó durante 3 horas, para obtener una solución amarilla. El disolvente se evaporó a presión reducida a 30°C para producir cloruro de 2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-[1,2,4]oxadiazol-3-il)-benzoílo en forma de un sólido amarillento que se utilizó directamente sin purificación. ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ ppm: 8,26 (t, 1H), 8,07 (m, 1H), 7,99 (m, 1H).

Etapa 4: Preparación de 2-fluoro-N-metil-N-[(3-metil-2-tienil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida

A un vial con tapón de rosca que contiene cloruro 2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoílo (0,13 g) suspendido en CH_2Cl_2 (1,2 mL), enfriado a 0°C se añadió hidrocloreto de N-metil-1-(3-metil-2-tienil)metanamina (0,08 g) en forma de una solución de CH_2Cl_2 (1 mL). Luego se introdujo lentamente trietilamina (0,25 mL) y la solución amarilla resultante se agitó durante 14 horas. Los contenidos de reacción se vertieron luego en un embudo de separación y se diluyó con CH_2Cl_2 y agua. La capa orgánica se separó y luego se lavó con HCl 1 N, NaOH 1 N y salmuera. El disolvente se separó a presión reducida y el residuo bruto resultante se purificó por cromatografía de resolución instantánea sobre gel de sílice (gradiente de ciclohexano:acetato de etilo) para dar el compuesto del título en forma de un aceite amarillo. LC/MS tiempo de retención = 1,13 minutos, 400,4 (M+H).
HATU = 3-oxido-hexafluorofosfato de 1-[bis(dimetilamino)metileno]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]piridinio

Tabla 1A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A)



(T-1A)

en donde R^1 y R^3 son hidrógeno, R^2 es flúor y R^4 o R^{4A} (cuando R^4 es R^{4A}) es como se define abajo en la tabla

N.º	R ⁴ /R ^{4A}	N.º	R ⁴ /R ^{4A}
1,001	tetrahidropiran-2-ilo	1,040	1-etilcarboxilatopiperidin-3-ilo
1,002	tetrahidropiran-3-ilo	1,041	1-metilpiperidin-3-ilo
1,003	tetrahidropiran-4-ilo	1,042	1-etilpiperidin-3-ilo
1,004	3-metiltetrahidropiran-3-ilo	1,043	1-bencilpiperidin-3-ilo
1,005	4-metiltetrahidropiran-4-ilo	1,044	(1-etilcarboxilato piperidin-3-il)metilo
1,006	(tetrahidropiran-2-il)metilo	1,045	(1-terc.-butilcarboxilato piperidin-3-il)metilo
1,007	(tetrahidropiran-2-il)etilo	1,046	(1-metilpiperidin-3-il)metilo
1,008	1-(tetrahidropiran-2-il)etilo	1,047	(1-etilpiperidin-3-il)metilo
1,009	(tetrahidropiran-3-il)metilo	1,048	(1-bencilpiperidin-3-il)metilo
1,010	(tetrahidropiran-3-il)etilo	1,049	1-etilcarboxilato pirrolidin-3-ilo
1,011	1-(tetrahidropiran-3-il)etilo	1,050	1-terc.-butilcarboxilato pirrolidin-3-ilo
1,012	(tetrahidropiran-4-il)metilo	1,051	1-metilpirrolidin-3-ilo
1,013	(tetrahidropiran-4-il)etilo	1,052	1-etilpirrolidin-3-ilo
1,014	1-(tetrahidropiran-4-il)etilo	1,053	1-bencil-pirrolidin-3-ilo
1,015	tetrahidrofuran-2-ilo	1,054	(1-etilcarboxilato pirrolidin-3-il)metilo
1,016	tetrahidrofuran-3-ilo	1,055	(1-terc.-butilcarboxilato pirrolidin-3-il)metilo
1,017	(tetrahidrofuran-3-il)metilo	1,056	(1-metilpirrolidin-3-il)metilo
1,018	(tetrahidrofuran-2-il)metilo	1,057	(1-etilpirrolidin-3-il)metilo
1,019	(tetrahidrofuran-2-il)etilo	1,058	(1-bencil-pirrolidin-3-il)metilo
1,020	1-(tetrahidrofuran-2-il)etilo	1,059	(1-piperidil)etilo
1,021	(tetrahidrofuran-3-il)metilo	1,060	1-(1-piperidil)propilo
1,022	(tetrahidrofuran-3-il)etilo	1,061	(1,4-dioxan-2-il)metilo
1,023	1-(tetrahidrofuran-3-il)etilo	1,062	(1,4-dioxan-2-il)etilo
1,024	2-metilisoxazolidin-4-ilo	1,063	1-(1,4-dioxan-2-il)etilo
1,025	1-(2-metilisoxazolidin-4-il)etilo	1,064	tetrahidrotiopiran-3-ilo
1,026	1-metoxipiperidin-4-ilo	1,065	(tetrahidrotiopiran-3-il)metilo
1,027	(1-metoxipiperidin-4-il)metilo	1,066	tetrahidrotiopiran-4-ilo
1,028	1-(1-metoxipiperidin-4-il)etilo	1,067	(tetrahidrotiopiran-4-il)metilo
1,029	1-metoxi-4-ciano-piperidin-4-ilo	1,068	tetrahidrotiofen-3-ilo
1,030	1-metoxi-4-metil-piperidin-4-ilo	1,069	(tetrahidrotiofen-3-il)metilo
1,031	4-metilcarboxilato 1-metoxipiperidin-4-ilo	1,070	(1,3-dioxolan-2-il)metilo
1,032	(2,6-dimetilpiperidin-1-il)metilo	1,071	1-(1,3-dioxolan-2-il)etilo
1,033	(2,6-dimetilpiperidin-1-il)etilo	1,072	(2,2-dimetil-1,3-dioxolan-4-il)metilo
1,034	3-metilcarboxilato 1-metoxipiperidin-3-ilo	1,073	1-(2,2-dimetil-1,3-dioxolan-4-il)etilo
1,035	(1-metil-piperidin-2-il)metilo	1,074	(2-metil-1,3-dioxolan-2-il)metilo
1,036	1-etilcarboxilatopiperidin-4-ilo	1,075	1-(2-metil-1,3-dioxolan-2-il)etilo
1,037	1-terc.-butilcarboxilato piperidin-4-ilo	1,076	(2-metil-1,3-dioxolan-2-il)metilo
1,038	1-metilpiperidin-4-ilo	1,077	1-(2-metil-1,3-dioxolan-2-il)etilo

N.º	R ⁴ /R ^{4A}	N.º	R ⁴ /R ^{4A}
1,039	1-bencilpiperidin-4-ilo	1,078	1-terc.-butilcarboxilato piperidin-3-ilo

Tabla 2A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es metilo y R^{4A} es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 3A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es etilo y R^{4A} es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 4A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es etilo y R^{4A} es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 5A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es cloro y R^{4A} es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 6A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es cloro, R³ es metilo y R^{4A} es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 7A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es cloro, R³ es etilo y R^{4A} es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 8A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es metilo y R^{4A} es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 9A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metilo, R³ es metilo y R^{4A} es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 10A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A), en donde R¹ es hidrógeno, R² es metilo, R³ es etilo y R^{4A} es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 11A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A), en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es metoxi y R^{4A} es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 12A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metoxi, R³ es metilo y R^{4A} es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 13A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metoxi, R³ es etilo y R^{4A} es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 14A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es isopropilo y R^{4A} es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 15A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ , R² y R³ son hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 16A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A), en donde R¹, R² son hidrógeno, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 17A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A), en donde R¹, R² son hidrógeno, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 18A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A), en donde R¹ y R² son hidrógeno, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 19A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A), en donde R¹ y R² son flúor, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 20A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A), en donde R¹ y R² son flúor, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 21A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A), en donde R¹ y R² son cloro, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 22A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 23A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 24A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 25A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es metilo v R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 26A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A), en donde R¹ y R² son metilo, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

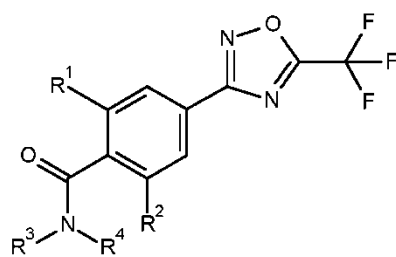
Tabla 27A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 28A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 29A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 30A: Esta tabla describe 78 compuestos específicos de fórmula (T-1A), en donde R¹ y R² son hidrógeno, R³ es isopropilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1A.

Tabla 1B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B)



(T-1B)

en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es flúor y R⁴ o R^{4B} (cuando R⁴ es R^{4B}) es como se define abajo en la tabla

N.º	R ⁴ /R ^{4B}	N.º	R ⁴ /R ^{4B}
1,001	ciclopropilo	1,023	1-(ciano-1-ciclopropil)etilo
1,002	ciclobutilo	1,024	2,2-difluorociclopentilo
1,003	ciclopentilo	1,025	1-((4-clorofenil)metil)ciclopropilo
1,004	ciclohexilo	1,026	2-fenilciclopropilo
1,005	cicloheptilo	1,027	(2,2,3,3-tetrafluorociclobutilo
1,006	ciclooctilo	1,028	(2,2,3,3-tetrafluorociclobutil)metilo
1,007	(ciclopropil)metilo	1,029	1-metilciclobutilo
1,008	(ciclobutil)metilo	1,030	2-metilciclobutilo
1,009	(ciclopentil)metilo	1,031	2,2-dimetilciclobutilo
1,010	(ciclohexil)metilo	1,032	2,2-difluorociclobutilo
1,011	(cicloheptil)metilo	1,033	2-cianociclobutilo
1,012	1-(ciclooctil)etilo	1,034	1-metilciclopentilo
1,013	1-(ciclopropil)etilo	1,035	2,2-difluorociclopentilo
1,014	1-(ciclobutil)etilo	1,036	3,3-difluorociclopentilo
1,015	1-(ciclopentil)etilo	1,037	2-metilciclopentilo
1,016	1-(ciclohexil)etilo	1,038	2,2-dimetilciclopentilo
1,017	1-(cicloheptil)etilo	1,039	2-metilciclohexilo
1,018	1-(ciclooctil)etilo	1,040	3-metilciclohexilo
1,019	1-ciclopropilciclopropilo	1,041	4-metilciclohexilo
1,020	1-cianociclopropilo	1,042	4,4-dimetilciclohexilo
1,021	(1-cianociclopropil)metilo	1,043	1-etinilciclohexilo
1,022	1-cianociclopropilo		

5

Tabla 2B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es metilo y R^{4B} es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 3B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es etilo y R^{4B} es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

10 **Tabla 4B:** Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es cloro y R^{4B} es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 5B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es cloro, R³ es metilo y R^{4B} es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

15 **Tabla 6B:** Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es cloro, R³ es etilo y R^{4B} es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 7B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es metilo y R^{4B} es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 8B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metilo, R³ es metilo y R^{4B} es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

20 **Tabla 9B:** Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metilo, R³ es etilo y R^{4B} es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 10B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es metoxi y R^{4B} es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 11B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metoxi, R³ es metilo y R^{4B} es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 12B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metoxi, R³ es etilo y R^{4B} es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 13B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es isopropilo y R^{4B} es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 14B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ , R² y R³ son hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 15B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹, R² son hidrógeno, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 16B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹, R² son hidrógeno, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 17B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R² son flúor, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 18B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R² son flúor, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 19B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R² son flúor, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 20B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 21B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 22B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 23B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 24B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 25B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

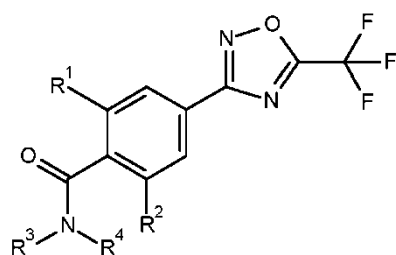
Tabla 26B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 27B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 28B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 29B: Esta tabla describe 43 compuestos específicos de fórmula (T-1B) ,en donde R¹ y R² son hidrógeno, R³ es un isopropilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1B.

Tabla 1C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C)



(T-1C)

en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es flúor y R⁴ o R^{4C} (cuando R⁴ es R^{4C}) es como se define abajo en la tabla

N.º	R ⁴ /R ^{4C}	N.º	R ⁴ /R ^{4C}
1,001	metilo	1,058	1-etil-2-propinilo
1,002	etilo	1,059	2-hexinilo
1,003	propilo	1,060	3-hexinilo
1,004	butilo	1,061	4-hexinilo
1,005	pentilo	1,062	5-hexinilo
1,006	hexilo	1,063	2-metoxietilo

ES 2 810 827 T3

N.º	R ⁴ /R ^{4C}	N.º	R ⁴ /R ^{4C}
1,007	iso-propilo	1,064	2-etoxietilo
1,008	sec.-butilo	1,065	2-propoxietilo
1,009	iso-butilo	1,066	2-iso-propoxietilo
1,010	terc.-butilo	1,067	2-butoxietilo
1,011	3,3-dimetilpropilo	1,068	2-sec.-butoxietilo
1,012	4-metilpentilo	1,069	2-terc.-butoxietilo
1,013	1-metilpentilo	1,070	2-metoxipropilo
1,014	1,3-dimetilbutilo	1,071	2-etoxipropilo
1,015	2-etilbutilo	1,072	2-propoxipropilo
1,016	2-propenilo	1,073	2-iso-propoxipropilo
1,017	2-butenilo	1,074	2-butoxipropilo
1,018	3-butenilo	1,075	2-sec.-butoxipropilo
1,019	2-metil-2-propenilo	1,076	2-terc.-butoxipropilo
1,020	2-pentenilo	1,077	3-metoxipropilo
1,021	3-pentenilo	1,078	3-etoxipropilo
1,022	4-pentenilo	1,079	3-propoxipropilo
1,023	1-metil-2-butenilo	1,080	3-iso-propoxipropilo
1,024	2-metil-2-butenilo	1,081	3-butoxipropilo
1,025	3-metil-2-butenilo	1,082	3-sec.-butoxipropilo
1,026	1-metil-3-butenilo	1,083	3-terc.-butoxipropilo
1,027	2-metil-3-butenilo	1,084	1-(metoximetil)propilo
1,028	3-metil-3-butenilo	1,085	1-(metoximetil)etilo
1,029	1,1-dimetil-2-propenilo	1,086	2-hidroxipropilo
1,030	1,2-dimetil-2-propenilo	1,087	3-hidroxipropilo
1,031	1-etil-2-propenilo	1,088	1-hidroxibutilo
1,032	1-hexenilo	1,089	2-hidroxibutilo
1,033	2-hexenilo	1,090	3-hidroxibutilo
1,034	3-hexenilo	1,091	4-hidroxibutilo
1,035	4-hexenilo	1,092	2-hidroxibutilo
1,036	5-hexenilo	1,093	5-hidroxipentilo
1,037	1-metil-4-pentenilo	1,094	1-(hidroximetil)-isopropilo
1,038	2-metil-4-pentenilo	1,095	2-hidroxi-2-metil-propilo
1,039	3-metil-4-pentenilo	1,096	3-hidroxi-1,1-dimetil-propilo
1,040	4-metil-4-pentenilo	1,097	2-hidroxibutilo
1,041	1,1-dimetil-2-butenilo	1,098	3-hidroxi-1-metil-propilo
1,042	1,1-dimetil-3-butenilo	1,099	1,1-dimetilprop-2-ino
1,043	1,2-dimetil-2-butenilo	1,100	2-cloroetilo
1,044	1,2-dimetil-3-butenilo	1,101	3-cloropropilo
1,045	1,3-dimetil-2-butenilo	1,102	4-clorobutilo
1,046	1,3-dimetil-3-butenilo	1,103	1-fluoroetilo

N.º	R ⁴ /R ^{4C}	N.º	R ⁴ /R ^{4C}
1,047	2-propinilo	1,104	2-fluoroetilo
1,048	2-butinilo	1,105	1-fluoropropilo
1,049	3-butinilo	1,106	2-fluoropropilo
1,050	1-metil-2-propinilo	1,107	3-fluoropropilo
1,051	2-pentinilo	1,108	4-fluorobutilo
1,052	3-pentinilo	1,109	2-(terc.-butilamino)-2-oxo-etilo
1,053	4-pentinilo	1,110	2-(iso-propilamino)-2-oxo-etilo
1,054	1-metil-2-butinilo	1,111	2-(etilamino)-2-oxo-etilo
1,055	1-metil-3-butinilo	1,112	2-acetamidoetilo
1,056	2-metil-3-butinilo	1,113	3-butanoato de etilo
1,057	1,1-dimetil-2-propinilo		

Tabla 2C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es metilo y R^{4C} es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 3C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es etilo y R^{4C} es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 4C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es cloro y R^{4C} es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 5C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es cloro, R³ es metilo y R^{4C} es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 9C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es cloro, R³ es etilo y R^{4C} es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 10C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es metilo y R^{4C} es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 11C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metilo, R³ es metilo y R^{4C} es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 12C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metilo, R³ es etilo y R^{4C} es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 13C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es metoxi y R^{4C} es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 14C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metoxi, R³ es metilo y R^{4C} es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 15C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metoxi, R³ es etilo y R^{4C} es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 16C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es isopropilo y R^{4C} es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 17C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es cloro, R³ es isopropilo y R^{4C} es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 18C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ , R² y R³ son hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 19C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹, R² son hidrógeno, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C

Tabla 20C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹, R² son hidrógeno, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 21C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R² son flúor, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 22C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R² son flúor, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 23C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R² son flúor, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 24C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 25C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 26C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 27C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 28C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 29C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

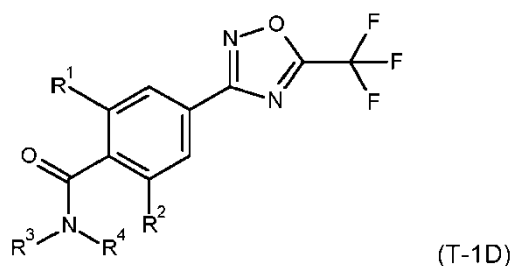
5 Tabla 30C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 31C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

10 Tabla 32C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 33C: Esta tabla describe 113 compuestos específicos de fórmula (T-1C) ,en donde R¹ y R² son hidrógeno, R³ es isopropilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1C.

Tabla 1D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D)



en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es flúor y R⁴ o R^{4D} (cuando R⁴ es R^{4D}) es como se define abajo en la tabla

N.º	R ⁴ /R ^{4D}	N.º	R ⁴ /R ^{4D}
1,001	2-fluorofenilo	1,088	4-etinilbencilo
1,002	3-fluorofenilo	1,089	2-fenilbencilo
1,003	4-fluorofenilo	1,090	3-fenilbencilo
1,004	2-clorofenilo	1,091	4-fenilbencilo
1,005	3-clorofenilo	1,092	2-ciclopropilbencilo
1,006	4-clorofenilo	1,093	3-ciclopropilbencilo
1,007	2-bromofenilo	1,094	4-ciclopropilbencilo
1,008	3-bromofenilo	1,095	2,3-difluorobencilo
1,009	4-bromofenilo	1,096	2,4-difluorobencilo
1,010	2-cianofenilo	1,097	2,5-difluorobencilo
1,011	3-cianofenilo	1,098	2,6-difluorobencilo
1,012	4-cianofenilo	1,099	3,4-difluorobencilo
1,013	2-metilfenilo	1,100	3,5-difluorobencilo
1,014	3-metilfenilo	1,101	2,3-diclorobencilo
1,015	4-metilfenilo	1,102	2,4-diclorobencilo
1,016	2-etilfenilo	1,103	2,5-diclorobencilo
1,017	3-etilfenilo	1,104	2,6-diclorobencilo
1,018	4-etilfenilo	1,105	3,4-diclorobencilo
1,019	2-trifluorofenilo	1,106	3,5-diclorobencilo
1,020	3-trifluorofenilo	1,107	2-fluoro-3-cianobencilo
1,021	4-trifluorofenilo	1,108	2-fluoro-4-cianobencilo
1,022	2-metoxifenilo	1,109	2-fluoro-5-cianobencilo
1,023	3-metoxifenilo	1,110	2-fluoro-6-cianobencilo
1,024	4-metoxifenilo	1,111	3-fluoro-2-cianobencilo

N.º	R ⁴ /R ^{4D}	N.º	R ⁴ /R ^{4D}
1,025	2-etoxifenilo	1,112	3-fluoro-4-cianobencilo
1,026	3-etoxifenilo	1,113	3-fluoro-5-cianobencilo
1,027	4-etoxifenilo	1,114	3-fluoro-6-cianobencilo
1,028	2-etinilfenilo	1,115	4-fluoro-2-cianobencilo
1,029	3-etinilfenilo	1,116	4-fluoro-3-cianobencilo
1,030	4-etinilfenilo	1,117	2-fluorofenetilo
1,031	2-fenilfenilo	1,118	3-fluorofenetilo
1,032	3-fenilfenilo	1,119	4-fluorofenetilo
1,033	4-fenilfenilo	1,120	2-clorofenetilo
1,034	2-ciclopropilfenilo	1,121	3-clorofenetilo
1,035	3-ciclopropilfenilo	1,122	4-clorofenetilo
1,036	4-ciclopropilfenilo	1,123 '	2-bromofenetilo
1,037	2,3-difluorofenilo	1,124	3-bromofenetilo
1,038	2,4-difluorofenilo	1,125	4-bromofenetilo
1,039	2,5-difluorofenilo	1,126	2-cianofenetilo
1,040	2,6-difluorofenilo	1,127	3-cianofenetilo
1,041	3,4-difluorofenilo	1,128	4-cianofenetilo
1,042	3,5-difluorofenilo	1,129	2-metilfenetilo
1,043	2,3-diclorofenilo	1,130	3-metilfenetilo
1,044	2,4-diclorofenilo	1,131	4-metilfenetilo
1,045	2,5-diclorofenilo	1,132	2-etilfenetilo
1,046	2,6-diclorofenilo	1,133	3-etilfenetilo
1,047	3,4-diclorofenilo	1,134	4-etilfenetilo
1,048	3,5-diclorofenilo	1,135	2-trifluorofenetilo
1,049	2-fluoro-3-cianofenilo	1,136	3-trifluorofenetilo
1,050	2-fluoro-4-cianofenilo	1,137	4-trifluorofenetilo
1,051	2-fluoro-5-cianofenilo	1,138	2-metoxifenetilo
1,052	2-fluoro-6-cianofenilo	1,139	3-metoxifenetilo
1,053	3-fluoro-2-cianofenilo	1,140	4-metoxifenetilo
1,054	3-fluoro-4-cianofenilo	1,141	2-etoxifenetilo
1,055	3-fluoro-5-cianofenilo	1,142	3-etoxifenetilo
1,056	3-fluoro-6-cianofenilo	1,143	4-etoxifenetilo
1,057	4-fluoro-2-cianofenilo	1,144	2-etinilfenetilo
1,058	4-fluoro-3-cianofenilo	1,145	3-etinilfenetilo
1,059	2-fluorobencilo	1,146	4-etinilfenetilo
1,060	3-fluorobencilo	1,147	2-fenilfenetilo
1,061	4-fluorobencilo	1,148	3-fenilfenetilo
1,062	2-clorobencilo	1,149	4-fenilfenetilo
1,063	3-clorobencilo	1,150	2-ciclopropilfenetilo
1,064	4-clorobencilo	1,151	3-ciclopropilfenetilo

N.º	R ⁴ /R ^{4D}	N.º	R ⁴ /R ^{4D}
1,065	2-bromobencilo	1,152	4-ciclopropilfenetilo
1,066	3-bromobencilo	1,153	2,3-difluorofenetilo
1,067	4-bromobencilo	1,154	2,4-difluorofenetilo
1,068	2-cianobencilo	1,155	2,5-difluorofenetilo
1,069	3-cianobencilo	1,156	2,6-difluorofenetilo
1,070	4-cianobencilo	1,157	3,4-difluorofenetilo
1,071	2-metilbencilo	1,158	3,5-difluorofenetilo
1,072	3-metilbencilo	1,159	2,3-diclorofenetilo
1,073	4-metilbencilo	1,160	2,4-diclorofenetilo
1,074	2-etilbencilo	1,161	2,5-diclorofenetilo
1,075	3-etilbencilo	1,162	2,6-diclorofenetilo
1,076	4-etilbencilo	1,163	3,4-diclorofenetilo
1,077	2-trifluorobencilo	1,164	3,5-diclorofenetilo
1,078	3-trifluorobencilo	1,165	2-fluoro-3-cianofenetilo
1,079	4-trifluorobencilo	1,166	2-fluoro-4-cianofenetilo
1,080	2-metoxibencilo	1,167	2-fluoro-5-cianofenetilo
1,081	3-metoxibencilo	1,168	2-fluoro-6-cianofenetilo
1,082	4-metoxibencilo	1,169	3-fluoro-2-cianofenetilo
1,083	2-etoxibencilo	1,170	3-fluoro-4-cianofenetilo
1,084	3-etoxibencilo	1,171	3-fluoro-5-cianofenetilo
1,085	4-etoxibencilo	1,172	3-fluoro-6-cianofenetilo
1,086	2-etinilbencilo	1,173	4-fluoro-2-cianofenetilo
1,087	3-etinilbencilo	1,174	4-fluoro-3-cianofenetilo

Tabla 2D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es metilo y R^{4D} es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

5 **Tabla 3D:** Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es etilo y R^{4D} es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 4D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es cloro y R^{4D} es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 5D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es cloro, R³ es metilo y R^{4D} es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

10 **Tabla 6D:** Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es cloro, R³ es etilo y R^{4D} es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 7D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metilo, R³ es hidrógeno y R^{4D} es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

15 **Tabla 8D:** Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metilo, R³ es metilo y R^{4D} es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 9D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metilo, R³ es etilo y R^{4D} es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 10D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metoxi, R³ es hidrógeno y R^{4D} es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

20 **Tabla 11D:** Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metoxi, R³ es metilo y R^{4D} es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 12D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metoxi, R³ es etilo y R^{4D} es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

25 **Tabla 13D:** Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ , R² y R³ son hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 14D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ , R² son hidrógeno, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D

Tabla 15D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹, R² son hidrógeno, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 16D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ y R² son flúor, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 17D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ y R² son flúor, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 18D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ y R² son flúor, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 19D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 20D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 21D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 22D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 23D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

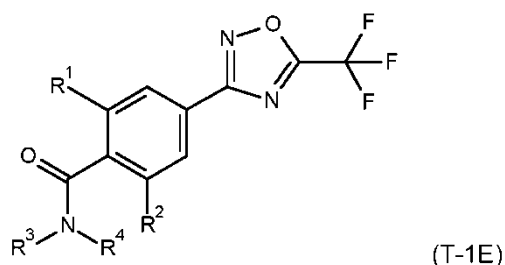
Tabla 24D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 25D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ and R² son metoxi, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 26D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 27D: Esta tabla describe 174 compuestos específicos de fórmula (T-1D) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1D.

Tabla 1E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E)



en donde R¹ y R³ son hidrógeno, R² es flúor, R⁴ o R^{4E} (cuando R⁴ es R^{4E}) es como se define abajo en la tabla

N.º	R ⁴ /R ^{4E}	N.º	R ⁴ /R ^{4E}
1,001	2-tienilo	1,111	(2,5-difluoro-3-tienil)metilo
1,002	5-fluoro-2-tienilo	1,112	(5-cloro-2-tienil)metilo
1,003	3,5-difluoro-2-tienilo	1,113	(3,5-dicloro-2-tienil)metilo
1,004	2,5-difluoro-3-tienilo	1,114	(2,5-dicloro-3-tienil)metilo
1,005	5-cloro-2-tienilo	1,115	(5-metil-2-tienil)metilo
1,006	3,5-dicloro-2-tienilo	1,116	(3,5-dimetil-2-tienil)metilo
1,007	2,5-dicloro-3-tienilo	1,117	(2,5-dimetil-3-tienil)metilo
1,008	5-metil-2-tienilo	1,118	(5-ciano-2-tienil)metilo
1,009	3,5-dimetil-2-tienilo	1,119	(2-piridil)metilo
1,010	2,5-dimetil-3-tienilo	1,120	(3-piridil)metilo
1,011	5-ciano-2-tienilo	1,121	(4-piridil)metilo
1,012	2-piridilo	1,122	(6-fluoro-2-piridil)metilo
1,013	6-fluoro-2-piridilo	1,123	(5-fluoro-2-piridil)metilo
1,014	5-fluoro-2-piridilo	1,124	(4-fluoro-2-piridil)metilo
1,015	4-fluoro-2-piridilo	1,125	(3-fluoro-2-piridil)metilo

ES 2 810 827 T3

N.º	R ⁴ /R ^{4E}	N.º	R ⁴ /R ^{4E}
1,016	3-fluoro-2-piridilo	1,126	(6-cloro-2-piridil)metilo
1,017	6-cloro-2-piridilo	1,127	(5-cloro-2-piridil)metilo
1,018	5-cloro-2-piridilo	1,128	(4-cloro-2-piridil)metilo
1,019	4-cloro-2-piridilo	1,129	(3-cloro-2-piridil)metilo
1,020	3-cloro-2-piridilo	1,130	(6-metil-2-piridil)metilo
1,021	6-metil-2-piridilo	1,131	(5-metil-2-piridil)metilo
1,022	5-metil-2-piridilo	1,132	(4-metil-2-piridil)metilo
1,023	4-metil-2-piridilo	1,133	(3-metil-2-piridil)metilo
1,024	3-metil-2-piridilo	1,134	(6-ciano-2-piridil)metilo
1,025	6-ciano-2-piridilo	1,135	(5-ciano-2-piridil)metilo
1,026	5-ciano-2-piridilo	1,136	(4-ciano-2-piridil)metilo
1,027	4-ciano-2-piridilo	1,137	(3-ciano-2-piridil)metilo
1,028	3-ciano-2-piridilo	1,138	(3,4-difluoro-2-piridil)metilo
1,029	3,4-difluoro-2-piridilo	1,139	(3,5-difluoro-2-piridil)metilo
1,030	3,5-difluoro-2-piridilo	1,140	(3,6-difluoro-2-piridil)metilo
1,031	3,6-difluoro-2-piridilo	1,141	(3,4-dicloro-2-piridil)metilo
1,032	3,4-dicloro-2-piridilo	1,142	(3,5-dicloro-2-piridil)metilo
1,033	3,5-dicloro-2-piridilo	1,143	(3,6-dicloro-2-piridil)metilo
1,034	3,6-dicloro-2-piridilo	1,144	(3-cloro-5-fluoro-2-piridil)metilo
1,035	3-cloro-5-fluoro-2-piridilo	1,145	(5-cloro-3-fluoro-2-piridil)metilo
1,036	5-cloro-3-fluoro-2-piridilo	1,146	(3-cloro-5-trifluorometil-2-piridil)metilo
1,037	3-cloro-5-trifluorometil-2-piridilo	1,147	(6-fluoro-3-piridil)metilo
1,038	6-fluoro-3-piridilo	1,148	(5-fluoro-3-piridil)metilo
1,039	5-fluoro-3-piridilo	1,149	(4-fluoro-3-piridil)metilo
1,040	4-fluoro-3-piridilo	1,150	(2-fluoro-3-piridil)metilo
1,041	2-fluoro-3-piridilo	1,151	(6-cloro-3-piridil)metilo
1,042	6-cloro-3-piridilo	1,152	(5-cloro-3-piridil)metilo
1,043	5-cloro-3-piridilo	1,153	(4-cloro-3-piridil)metilo
1,044	4-cloro-3-piridilo	1,154	(2-cloro-3-piridil)metilo
1,045	2-cloro-3-piridilo	1,155	(6-metil-3-piridil)metilo
1,046	6-metil-3-piridilo	1,156	(5-metil-3-piridil)metilo
1,047	5-metil-3-piridilo	1,157	(4-metil-3-piridil)metilo
1,048	4-metil-3-piridilo	1,158	(2-metil-3-piridil)metilo
1,049	2-metil-3-piridilo	1,159	(6-ciano-3-piridil)metilo
1,050	6-ciano-3-piridilo	1,160	(5-ciano-3-piridil)metilo
1,051	5-ciano-3-piridilo	1,161	(4-ciano-3-piridil)metilo
1,052	4-ciano-3-piridilo	1,162	(2-ciano-3-piridil)metilo
1,053	2-ciano-3-piridilo	1,163	(4,5-difluoro-3-piridil)metilo
1,054	4,5-difluoro-3-piridilo	1,164	(4,6-difluoro-3-piridil)metilo
1,055	4,6-difluoro-3-piridilo	1,165	(2,4-difluoro-3-piridil)metilo

N.º	R ⁴ /R ^{4E}	N.º	R ⁴ /R ^{4E}
1,056	2,4-difluoro-3-piridilo	1,166	(2,5-difluoro-3-piridil)metilo
1,057	2,5-difluoro-3-piridilo	1,167	(2,6-difluoro-3-piridil)metilo
1,058	2,6-difluoro-3-piridilo	1,168	(4,5-dicloro-3-piridil)metilo
1,059	4,5-dicloro-3-piridilo	1,169	(4,6-dicloro-3-piridil)metilo
1,060	4,6-dicloro-3-piridilo	1,170	(2,4-dicloro-3-piridil)metilo
1,061	2,4-dicloro-3-piridilo	1,171	(2,5-dicloro-3-piridil)metilo
1,062	2,5-dicloro-3-piridilo	1,172	(2,6-dicloro-3-piridil)metilo
1,063	2,6-dicloro-3-piridilo	1,173	(6-fluoro-4-piridil)metilo
1,064	6-fluoro-4-piridilo	1,174	(5-fluoro-4-piridil)metilo
1,065	5-fluoro-4-piridilo	1,175	(3-fluoro-4-piridil)metilo
1,066	2-fluoro-4-piridilo	1,176	(2-fluoro-4-piridil)metilo
1,067	6-cloro-4-piridilo	1,177	(6-cloro-4-piridil)metilo
1,068	5-cloro-4-piridilo	1,178	(5-cloro-4-piridil)metilo
1,069	2-cloro-4-piridilo	1,179	(3-cloro-4-piridil)metilo
1,070	6-metil-4-piridilo	1,180	(2-cloro-4-piridil)metilo
1,071	5-metil-4-piridilo	1,181	(6-metil-4-piridil)metilo
1,072	2-metil-4-piridilo	1,182	(5-metil-4-piridil)metilo
1,073	6-ciano-4-piridilo	1,183	(3-metil-4-piridil)metilo
1,074	5-ciano-4-piridilo	1,184	(2-metil-4-piridil)metilo
1,075	2-ciano-4-piridilo	1,185	(6-ciano-4-piridil)metilo
1,076	3,5-difluoro-4-piridilo	1,186	(5-ciano-4-piridil)metilo
1,077	3,6-difluoro-4-piridilo	1,187	(3-ciano-4-piridil)metilo
1,078	3,5-dicloro-4-piridilo	1,188	(2-ciano-4-piridil)metilo
1,079	3,6-dicloro-4-piridilo	1,189	(3,5-difluoro-4-piridil)metilo
1,080	4-pirimidinilo	1,190	(3,6-difluoro-4-piridil)metilo
1,081	5-pirimidinilo	1,191	(3,5-dicloro-4-piridil)metilo
1,082	5-fluoro-pirimidinilo	1,192	(3,6-dicloro-4-piridil)metilo
1,083	5-cloro-pirimidinilo	1,193	(4-pirimidinil)metilo
1,084	5-metil-pirimidinilo	1,194	(5-pirimidinil)metilo
1,085	5-metil-pirimidinilo	1,195	(5-fluoro-pirimidinil)metilo
1,086	2-tiazolilo	1,196	(5-cloro-pirimidinil)metilo
1,087	5-fluoro-2-tiazolilo	1,197	(5-metil-pirimidinil)metilo
1,088	5-cloro-2-tiazolilo	1,198	(5-metil-pirimidinil)metilo
1,089	5-metil-2-tiazolilo	1,199	(2-tiazolil)metilo
1,090	5-ciano-2-tiazolilo	1,200	(5-fluoro-2-tiazolil)metilo
1,091	1H-imidazol-5-ilo	1,201	(5-cloro-2-tiazolil)metilo
1,092	2-metil-1H-imidazol-5-ilo	1,202	(5-metil-2-tiazolil)metilo
1,093	2-ciano-1H-imidazol-5-ilo	1,203	(5-ciano-2-tiazolil)metilo
1,094	5-metil-1H-imidazol-2-ilo	1,204	(1H-imidazol-5-il)metilo
1,095	5-ciano-1H-imidazol-2-ilo	1,205	(2-metil-1H-imidazol-5-il)metilo

N.º	R ⁴ /R ^{4E}	N.º	R ⁴ /R ^{4E}
1,096	1,2-dimetilimidazol-5-ilo	1,206	(2-ciano-1H-imidazol-5-il)metilo
1,097	2-ciano-1-metil-imidazol-5-ilo	1,207	(5-metil-1H-imidazol-2-il)metilo
1,098	1,5-dimetilimidazol-2-ilo	1,208	(5-ciano-1H-imidazol-2-il)metilo
1,099	5-ciano-1-metil-imidazol-2-ilo	1,209	(1,2-dimetilimidazol-5-il)metilo
1,100	oxazol-2-ilo	1,210	(2-ciano-1-metil-imidazol-5-il)metilo
1,101	oxazol-5-ilo	1,211	(1,5-dimetilimidazol-2-il)metilo
1,102	2-metiloxazol-5-ilo	1,212	(5-ciano-1-metil-imidazol-2-il)metilo
1,103	2-cianooxazol-5-ilo	1,213	(oxazol-2-il)metilo
1,104	5-metiloxazol-2-ilo	1,214	(oxazol-5-il)metilo
1,105	5-cianooxazol-5-ilo	1,215	(2-metiloxazol-5-il)metilo
1,106	2-metil-1,2,4-triazol-3-ilo	1,216	(2-cianooxazol-5-il)metilo
1,107	(2-tienil)metilo	1,217	(5-metiloxazol-2-il)metilo
1,108	(2-tienil)metilo	1,218	(5-cianooxazol-5-il)metilo
1,109	(5-fluoro-2-tienil)metilo	1,219	(2-metil-1,2,4-triazol-3-il)metilo
1,110	(3,5-difluoro-2-tienil)metilo		

Tabla 2E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es metilo y R^{4E} es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 3E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es flúor, R³ es etilo y R^{4E} es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 4E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es cloro, R³ es hidrógeno y R^{4E} es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 5E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es cloro, R³ es metilo y R^{4E} es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 6E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es cloro, R³ es etilo y R^{4E} es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 7E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metilo, R³ es hidrógeno y R^{4E} es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 8E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metilo, R³ es metilo y R^{4E} es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 9E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metilo, R³ es etilo y R^{4E} es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 10E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metilo, R³ es hidrógeno y R^{4E} es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 11E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metoxi, R³ es metilo y R^{4E} es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 12E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ es hidrógeno, R² es metoxi, R³ es etilo y R^{4E} es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 13E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ , R² y R³ son hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 14E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ , R² son hidrógeno, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E

Tabla 15E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ , R² son hidrógeno, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 16E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ y R² son flúor, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 17E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ y R² son flúor, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 18E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ y R² son flúor, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 19E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 20E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 21E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ y R² son cloro, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 22E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 23E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 24E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ y R² son metilo, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 25E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es hidrógeno y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 26E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es metilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

Tabla 27E: Esta tabla describe 219 compuestos específicos de fórmula (T-1E) ,en donde R¹ y R² son metoxi, R³ es etilo y R⁴ es como se definió anteriormente en la Tabla 1E.

A lo largo de esta descripción, las temperaturas se dan en grados Celsius (°C) y "p.f." significa punto de fusión. LC/MS significa cromatografía líquida espectrometría de masas y la descripción del aparato y los métodos (A y B) utilizados para el análisis por LC/MS se dan a continuación.

La descripción del aparato y el método A es:

SQ Detector 2 de Waters

Método de ionización: Electroyección

Polaridad: iones positivos y negativos

Capilar (kV) 3.0, Cono (V) 30.00, Extractor (V) 2.00, Temperatura de fuente (°C) 150, Temperatura de desolvatación (°C) 350, Flujo de gas de cono (L/H) 0, Flujo de gas de desolvatación (L/H) 650

Intervalo de masa: de 100 a 900 Da

Intervalo de longitud de onda del DAD (nm): de 210 a 500

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

(Disolvente A: Agua/Metanol 20:1 + ácido fórmico al 0,05% y Disolvente B: Acetonitrilo + ácido fórmico al 0,05%)

Tiempo (minutos)	A (%)	B (%)	Caudal (ml/min)
0	100	0	0,85
1,2	0	100	0,85
1,5	0	100	0,85

Tipo de columna: Waters ACQUITY UPLC HSS T3; longitud de columna: 30 mm; diámetro interno de columna: 2,1 mm; tamaño de partícula: 1,8 micrómetros; temperatura: 60 °C.

La descripción del aparato y el método B es:

SQ Detector 2 de Waters

Método de ionización: Electroyección

Polaridad: iones positivos

Capilar (kV) 3.5, Cono (V) 30.00, Extractor (V) 3.00, Temperatura de fuente (°C) 150, Temperatura de desolvatación (°C) 400, Flujo de gas de cono (L/H) 60, Flujo de gas de desolvatación (L/H) 700

Intervalo de masa: de 140 a 800 Da

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

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

(Disolvente A: Agua/Metanol 9:1 + ácido fórmico al 0,1% y Disolvente B: Acetonitrilo + ácido fórmico al 0,1%)

Tiempo (minutos)	A (%)	B (%)	Caudal (ml/min)
0	100	0	0,75
2,5	0	100	0,75
2,8	0	100	0,75
3,0	100	0	0,75

Tipo de columna: Waters ACQUITY UPLC HSS T3; longitud de columna: 30 mm; diámetro interno de columna: 2,1 mm; tamaño de partícula: 1,8 micrómetros; temperatura: 60 °C.

Cuando sea necesario, se pueden obtener compuestos finales enantioméricamente puros a partir de materiales racémicos según sea apropiado mediante técnicas de separación física estándares, tales como cromatografía quiral de fase inversa, o mediante técnicas sintéticas estereoselectivas, p. ej., utilizando materiales de partida quirales.

5 Ejemplos de Formulaciones

<u>Polvos humectables</u>	a)	b)	c)
ingrediente activo [compuesto de fórmula (I)]	25 %	50 %	75 %
lignosulfonato de sodio	5 %	5 %	-
laurilsulfato de sodio	3 %	-	5 %
diisobutilnaftalenosulfonato de sodio	-	6 %	10 %
fenol polietilenglicol éter (7-8 moles de óxido de etileno)	-	2 %	-
ácido silícico muy dispersado	5 %	10 %	10 %
Caolín	62 %	27 %	-

El ingrediente activo se mezcla a fondo con los adyuvantes y la mezcla se muele a fondo en un molino adecuado, proporcionando polvos humectables que pueden diluirse con agua para dar suspensiones de la concentración deseada.

10

<u>Polvos para el tratamiento de semillas en seco</u>	a)	b)	c)
principio activo [compuesto de fórmula (I)]	25 %	50 %	75 %
aceite mineral ligero	5 %	5 %	5 %
ácido silícico altamente dispersado	5 %	5 %	-
Caolín	65 %	40 %	-
Talco	-	-	20 %

El ingrediente activo se mezcla a fondo con los adyuvantes y la mezcla se muele a fondo en un molino adecuado, proporcionando polvos que pueden diluirse directamente para el tratamiento de las semillas.

15 Concentrado emulsionable

ingrediente activo [compuesto de fórmula (I)]	10 %
octilfenol polietilenglicol éter (4-5 moles de óxido de etileno)	3 %
dodecibencenosulfonato de calcio	3 %
aceite de ricino poliglicol éter (35 moles de óxido de etileno)	4 %
Ciclohexanona	30 %
mezcla de xilenos	50 %

Las emulsiones de cualquier dilución requerida, que se puede utilizar en la protección de las plantas, se pueden obtener de este concentrado por dilución con agua.

20

<u>Polvos espolvoreables</u>	a)	b)	c)
ingrediente activo [compuesto de fórmula (I)]	5 %	6 %	4 %
Talco	95 %	-	-
Caolín	-	94 %	-
carga mineral	-	-	96 %

Los polvos espolvoreables listos para usar se obtienen mezclando el ingrediente activo con el portador y moliendo la mezcla en un molino adecuado. Dichos polvos también se pueden usar para revestimientos en seco de las semillas.

Gránulos extrudidos

ingrediente activo [compuesto de fórmula (I)]	15 %
lignosulfonato de sodio	2 %
Carboximetilcelulosa	1 %
Caolín	82 %

El ingrediente activo se mezcla y se muele con los adyuvantes, y la mezcla se humedece con agua. La mezcla se extrude y luego se seca en una corriente de aire.

5 Gránulos recubiertos

ingrediente activo [compuesto de fórmula (I)]	8 %
polietilenglicol (peso molecular 200)	3 %
Caolín	89 %

El ingrediente activo finamente molido se aplica uniformemente, en una mezcladora, al caolín humedecido con polietilenglicol. De esta forma se obtienen gránulos recubiertos que no generan polvo.

10 Concentrado en suspensión

principio activo [compuesto de fórmula (I)]	40 %
propilenglicol	10 %
nonilfenol polietilenglicol éter (15 moles de óxido de etileno)	6 %
lignosulfonato de sodio	10 %
Carboximetilcelulosa	1 %
aceite de silicona (en forma de una emulsión al 75% en agua)	1 %
Agua	32 %

El ingrediente activo finamente molido se mezcla íntimamente con los adyuvantes, dando un concentrado en suspensión a partir del cual se pueden obtener suspensiones de cualquier dilución deseada por dilución con agua. Utilizando diluciones de este tipo, las plantas vivas, así como el material de propagación de plantas, pueden tratarse y protegerse contra la infestación por microorganismos, mediante pulverización, vertido o inmersión.

Concentrado fluido para el tratamiento de semillas

ingrediente activo [compuesto de fórmula (I)]	40 %
propilenglicol	5 %
copolímero de butanol OP/OE	2 %
triestirenofenol con 10-20 moles de OE	2 %
1,2-bencisotiazolin-3-ona (en forma de una disolución al 20% en agua)	0,5 %
sal cálcica de pigmento monoazo	5 %
aceite de silicona (en forma de una emulsión al 75% en agua)	0,2 %
Agua	45,3 %

El ingrediente activo finamente molido se mezcla íntimamente con los adyuvantes, dando un concentrado en suspensión a partir del cual se pueden obtener suspensiones de cualquier dilución deseada por dilución con agua. Utilizando diluciones de este tipo, las plantas vivas, así como el material de propagación de plantas, pueden tratarse y protegerse contra la infestación por microorganismos, mediante pulverización, vertido o inmersión.

Suspensión de Cápsulas de Liberación Lenta

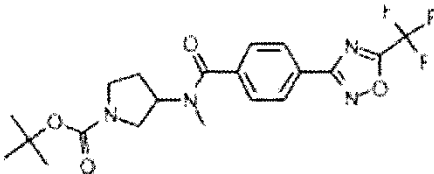
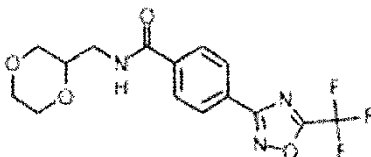
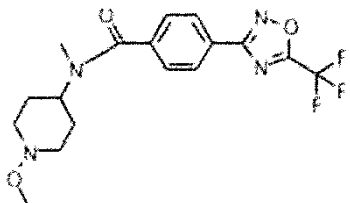
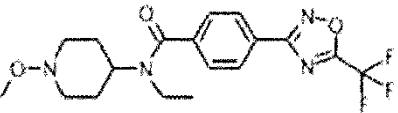
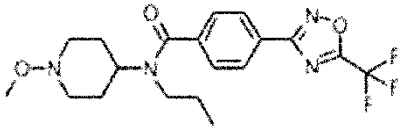
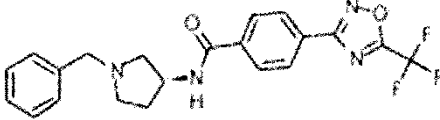
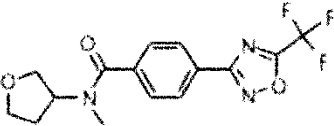
Se mezclan 28 partes de una combinación del compuesto de fórmula (I) con 2 partes de un disolvente aromático y 7 partes de mezcla de diisocianato de tolueno/polifenilisocianato de polimetileno (8:1). Esta mezcla se emulsiona en una mezcla de 1,2 partes de poli(alcohol vinílico), 0,05 partes de un antiespumante y 51,6 partes de agua hasta que

se alcanza el tamaño de partícula deseado. Se añade a esta emulsión una mezcla de 2,8 partes de 1,6-diaminohexano en 5,3 partes de agua. Se agita la mezcla hasta que finaliza la reacción de polimerización.

- 5 La suspensión de cápsulas obtenida se estabiliza añadiendo 0,25 partes de un espesante y 3 partes de un agente dispersante. La formulación de la suspensión de la cápsula contiene 28% de los ingredientes activos. El diámetro medio de la cápsula es de 8-15 micras. La formulación resultante se aplica a las semillas en forma de una suspensión acuosa en un aparato adecuado para ese propósito.

Tabla T1a: Datos del punto de fusión (p.f.) y/o tiempos de retención (R_t) para compuestos de acuerdo con la Fórmula (I) (las Entradas 1a.1 to 1a.11 representan compuestos de referencia).

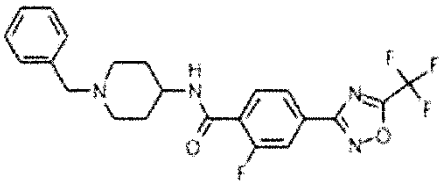
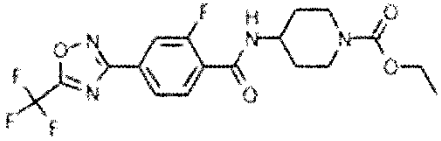
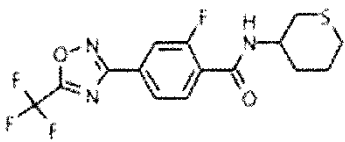
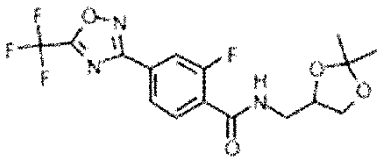
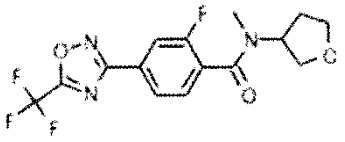
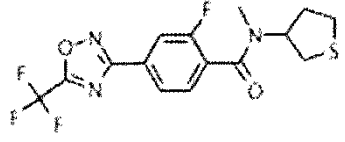
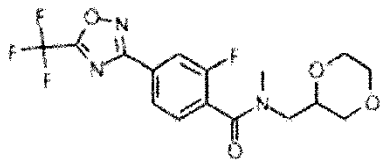
10

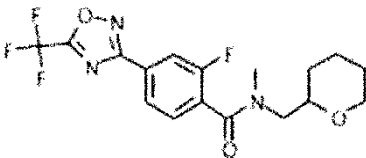
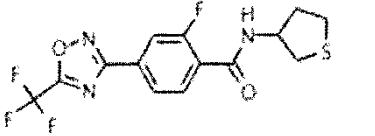
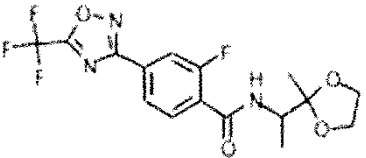
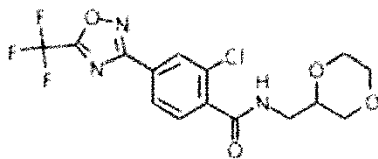
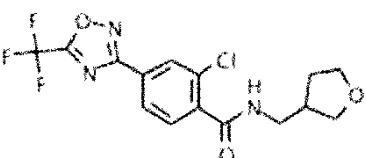
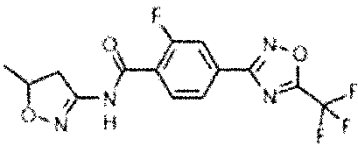
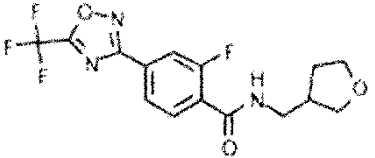
Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
1a.1	3-[Metil-[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoi]amino]pirrolidina-1-carboxilato de terc.-butilo		1,77	441,2	B	
1a.2	N-(1,4-dioxan-2-ilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,35	358,1	B	
1a.3	N-(1-metoxi-4-piperidil)-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,98	385,4	A	
1a.4	N-etil-N-(1-metoxi-4-piperidil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,03	399,4	A	
1a.5	N-(1-metoxi-4-piperidil)-N-propil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,08	413,3	A	
1a.6	N-[(3S)-1-bencilpirrolidin-3-il]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,11	417,0	B	
1a.7	N-metil-N-tetrahidrofuran-3-il-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,41	342,2	B	

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
1a.8	1-Metoxi-3-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoi]amino]piperidina-3-carboxilato de metilo		1,52	429,2	B	
1a.9	N-metil-N-tetrahidrotiofen-3-il-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,64	358,2	B	
1a.10	N-metil-N-[(1-metil-2-piperidil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,95	383,0	B	
1a.11	4-[[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoi]amino]metil]piperidina-1-carboxilato de terc.-butilo		1,82	455,3	B	

Tabla T1b: Datos del punto de fusión (p.f.) y/o tiempos de retención (R_t) para compuestos de acuerdo con la Fórmula (I) cuando R⁴ es R^{4A}.

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
1b.1	N-[[[(2R)-1-etilpirrolidin-2-il]metil]-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,98	387,2	B	
1b.2	N-(1,3-dioxolan-2-ilmetil)-2-fluoro-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,51	376,2	B	
1b.3	N-(1-bencil-4-piperidil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,09	448,9	B	

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
						
1b.4	4-[[2-Fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoyl]amino]piperidina-1-carboxilato de etilo		1,64	431,2	B	
1b.5	2-fluoro-N-tetrahidrotiopiran-3-il-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,75	376,1	B	
1b.6	N-[(2,2-dimetil-1,3-dioxolan-4-il)metil]-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,6	390,2	B	
1b.7	2-fluoro-N-metil-N-tetrahidrofuran-3-il-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,47	360,2	B	
1 b.8	2-fluoro-N-metil-N-tetrahidrotiofen-3-il-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,69	376,1	B	
1b.9	N-(1,4-dioxan-2-ilmetil)-2-fluoro-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,5	390,2	B	

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
1b.10	2-fluoro-N-metil-N-(tetrahidropiran-2-ilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,77	388,2	B	
1b.11	2-fluoro-N-tetrahidrotiofen-3-il-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,64	362,1	B	
1b.12	2-fluoro-N-[1-(2-metil-1,3-dioxolan-2-il)etil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,61	390,2	B	
1b.13	2-cloro-N-(1,4-dioxan-2-ilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,73	392,0	B	
1b.14	2-cloro-N-(tetrahidrofuran-3-ilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,74	376,0	B	
1b.15	2-fluoro-N-(5-metil-4,5-dihidroisoxazol-3-il)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,91	359,2	A	152,5 - 155,9
1b.16	2-fluoro-N-(tetrahidrofuran-3-ilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,41	360,1	B	124,2 - 126,2
1b.17	2-fluoro-N-(tetrahidrofuran-2-ilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,95	360,0	A	95,6 - 96,7

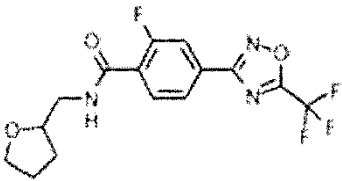
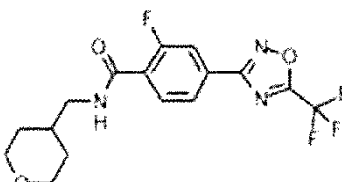
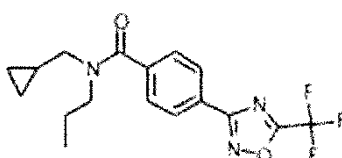
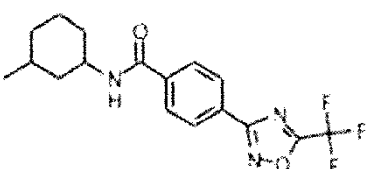
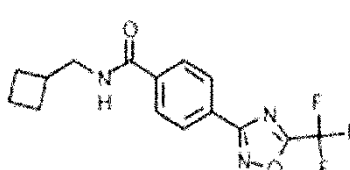
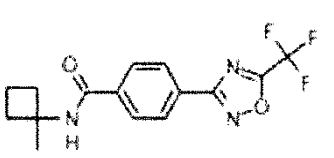
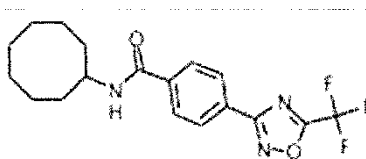
Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
						
1b.18	2-fluoro-N-(tetrahidropiran-4-ilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,96	374,0	A	134-135,4

Tabla T2a: Datos del punto de fusión (p.f.) y/o tiempos de retención (R_t) para compuestos de acuerdo con la Fórmula (I) (las Entradas 2a.1 to 2a.9 representan compuestos de referencia).

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
2a.1	N-(ciclopropilmetil)-N-propil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,84	354,1	B	
2a.2	N-(3-metilciclohexil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,87	354,2	B	
2a.3	N-(ciclobutilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,71	326,2	B	
2a.4	N-(1-metilciclobutil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,71	326,2	B	
2a.5	N-ciclooctil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,97	368,2	B	
2a.6	N-(4-metilciclohexil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,9	354,2	B	

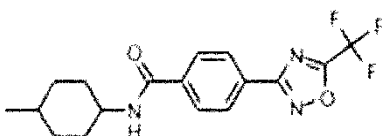
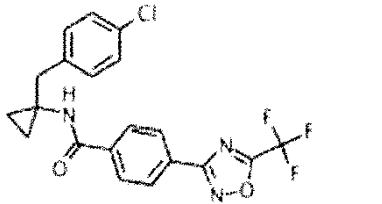
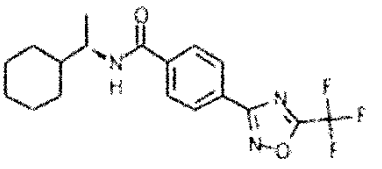
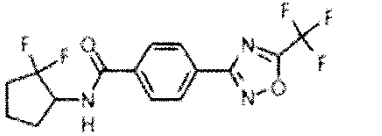
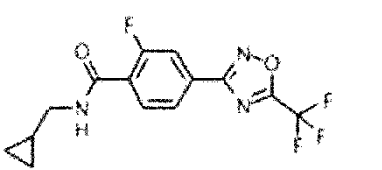
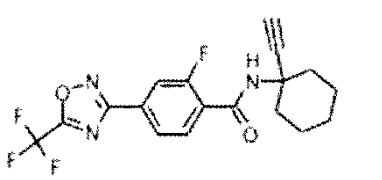
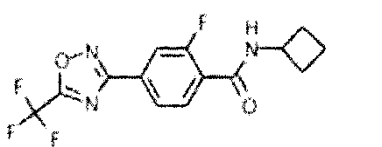
Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
						
2a.7	N-[1-[(4-clorofenil)metil]ciclopropil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,93	422,2	B	
2a.8	N-[(1R)-1-ciclohexiletil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,97	368,2	B	
2a.9	N-(2,2-difluorociclopentil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,62	361,9	B	

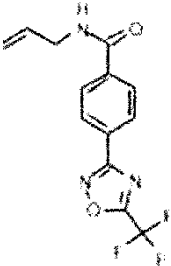
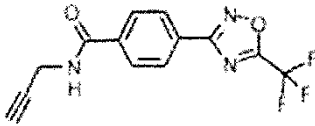
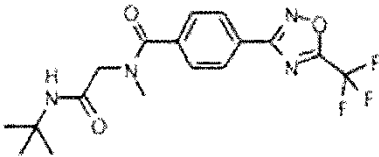
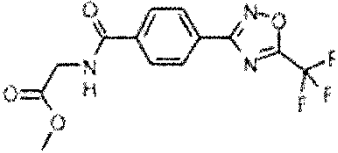
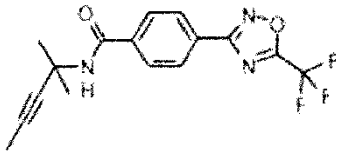
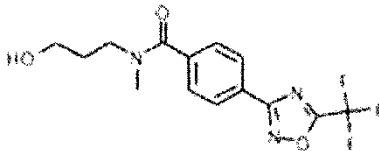
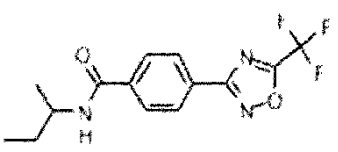
Tabla T2b: Datos del punto de fusión (p.f.) y/o tiempos de retención (R_t) para compuestos de acuerdo con la Fórmula (I) cuando R⁴ es R^{4B}:

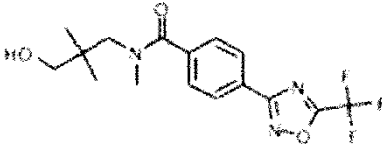
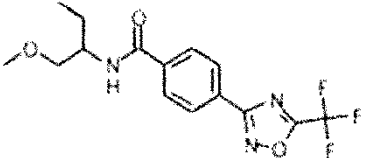
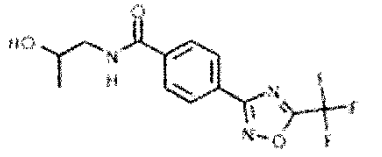
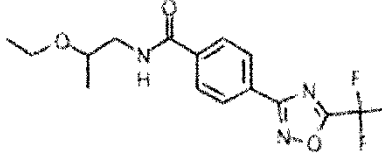
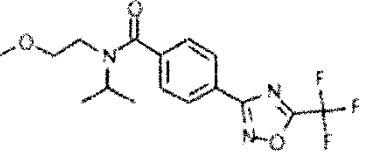
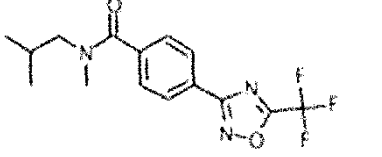
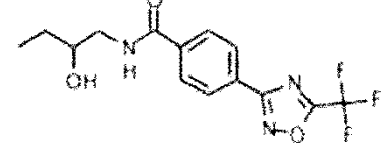
Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
2b.1	N-(ciclopropilmetil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,03	330,0	A	113,5 - 114,7
2b.2	N-(1-etinilciclohexil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,87	382,1	B	
2b.3	N-ciclobutil-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,64	330,1	B	

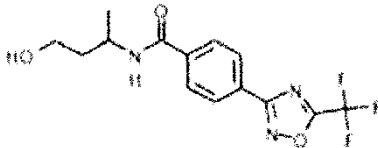
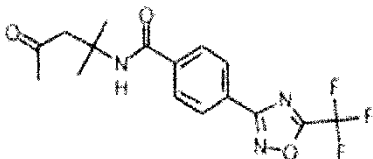
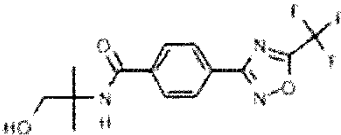
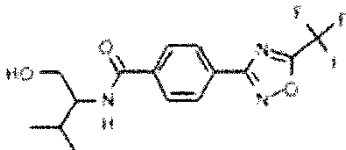
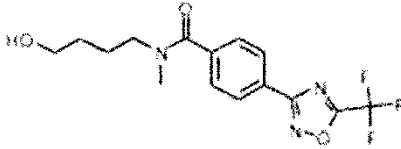
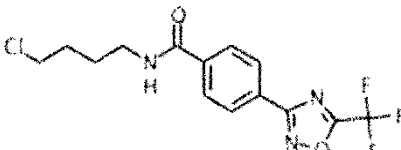
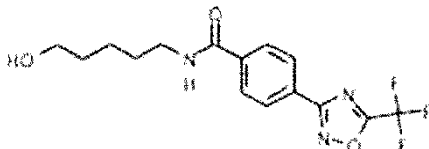
Entrada en Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
2b.4	2-fluoro-N-[(2,2,3,3-tetrafluorociclobutil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		2,46	416,0	B	
2b.5	N-(1-ciclopropiletil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,73	344,1	B	
2b.6	N-(1-ciclopropilciclopropil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,73	356,1	B	
2b.7	2-fluoro-N-(2-fenilciclopropil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,84	392,1	B	
2b.8	N-(ciclopentilmetil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,13	358,0	A	122-125,6
2b.9	N-(1-ciano-1-ciclopropil-etil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,05	369,0	A	
2b.10	2-fluoro-N-(3-metilciclohexil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					

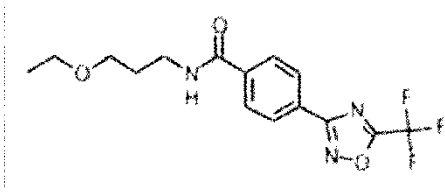
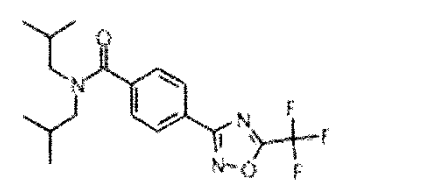
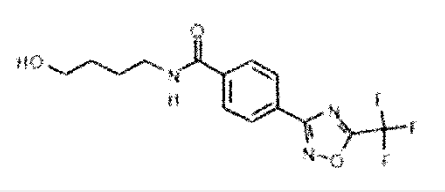
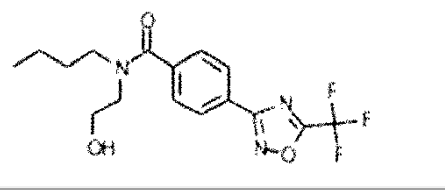
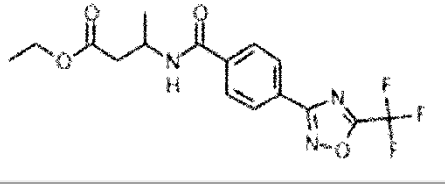
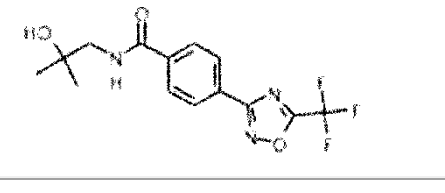
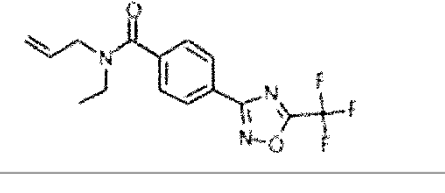
Entrada en Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
2b.11	N-(ciclobutilmetil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,78	344,2	B	
2b.12	2-fluoro-N-(1-metilciclobutil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,79	344,2	B	
2b.13	2-cloro-N-(ciclopropilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,87	345,9	B	
2b.14	2-cloro-N-[(2,2,3,3-tetrafluorociclobutil) metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					
2b.15	2-cloro-N-(1-ciclopropiletil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,93	359,9	B	
2b.16	2-cloro-N-(1-ciclopropilciclopropil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					
2b.17	N-(2,2-difluorociclopentil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,68	379,9	B	

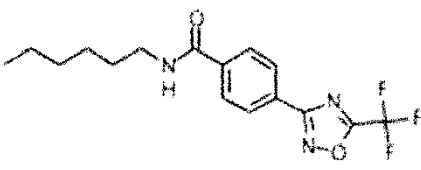
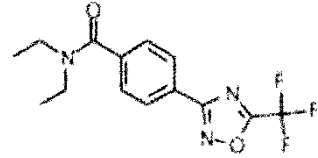
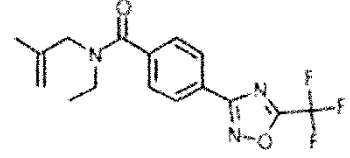
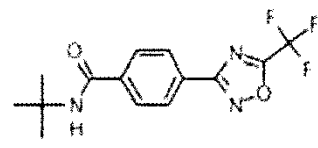
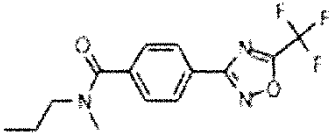
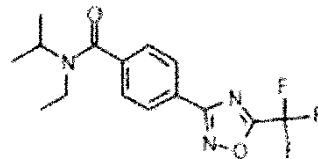
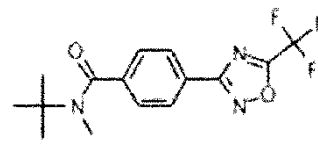
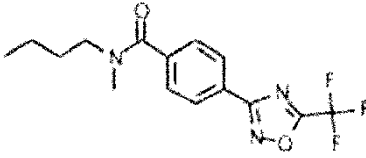
Tabla T3a: Datos del punto de fusión (p.f.) y/o tiempos de retención (R_t) para compuestos de acuerdo con la Fórmula (I) (Las entradas 3a. 1 a 3a.45 representan compuestos de referencia)

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
3a.1	N-alil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,95	298,3	A	135 - 146
3a.2	N-prop-2-inil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,88	296,0	A	168,5 - 170
3a.3	N-[2-(terc.-butilamino)-2-oxo-etil]-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,49	385,3	A	
3a.4	2-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoil]amino]acetato de metilo		1,32	330,1	A	165 - 166
3a.5	N-(1,1-dimetilbut-2-inil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,05	338,0	A	104-105,1
3a.6	N-(3-hidroxi-2,2-dimetil-propil)-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,26	330,1	B	
3a.7	N-sec.-butil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,64	314,1	B	
3a.8	N-(3-hidroxi-2,2-dimetil-propil)-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,54	358,2	B	

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
						
3a.9	N-[1-(metoximetil)propil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,58	344,1	B	
3a.10	N-(2-hidroxipropil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,25	316,0	B	
3a.11	N-(2-etoxipropil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,58	344,0	B	
3a.12	N-isopropil-N-(2-metoxietil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,68	358,2	B	
3a.13	N-isobutil-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,75	328,1	B	
3a.14	N-(2-hidroxibutil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,35	330,1	B	
3a.15	N-(3-hidroxi-1-metil-propil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,31	330,1	B	

Entrada en Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
						
3a.16	N-(1,1-dimetil-3-oxo-butil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,6	356,0	B	
3a.17	N-(2-hidroxi-1,1-dimetil-etil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,4	330,0	B	130 - 135
3a.18	N-[1-(hidroximetil)-2-metil-propil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,45	344,0	B	
3a.19	N-(4-hidroxi-butil)-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,30	344,1	B	
3a.20	N-(4-clorobutil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,64	347,9	B	
3a.21	N-(5-hidroxi-pentil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,33	344,1	B	
3a.22	N-(3-etoxipropil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,56	344,0	B	

Entrada en Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
						
3a.23	N,N-diisobutil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		2,05	370,3	B	
3a.24	N-(4-hidroxibutil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,26	330,2	B	
3a.25	N-butil-N-(2-hidroxietil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,54	358,2	B	
3a.26	3-[[4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoil]amino]butanoato de etilo		1,60	372,0	B	
3a.27	N-(2-hidroxi-2-metil-propil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,32	330,0	B	
3a.28	N-alil-N-etil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,71	326,1	B	
3a.29	N-hexil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,90	342,0	B	

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
						
3a.30	N,N-dietil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,63	314,1	B	
3a.31	N-etil-N-(2-metilalil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,81	340,0	B	
3a.32	N-terc.-butil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,71	314,1	B	
3a.33	N-metil-N-propil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,64	314,1	B	
3a.34	N-etil-N-isopropil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,73	328,1	B	
3a.35	N-terc.-butil-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,82	328,0	B	
3a.36	N-butil-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,76	328,1	B	

Entrada en Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
3a.37	N-(2-metoxi-1-metil-etil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,48	330,1	B	
3a.38	N-isopentil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,77	328,1	B	
3a.39	N-(2-etilbutil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,87	342,2	B	
3a.40	N-(2-isopropoxietil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,59	344,0	B	
3a.41	N-metil-N-prop-2-inil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,52	310,0	B	
3a.42	N-(3-hidroxi-1,1-dimetil-propil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,44	344,0	B	
3a.43	N-[2-(difluorometoxi)-1-metil-etil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					128-130
3a.44	N-[2-(difluorometoxi)etil]-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					

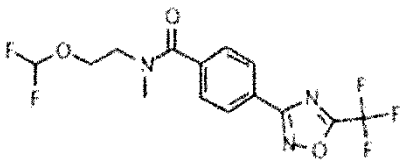
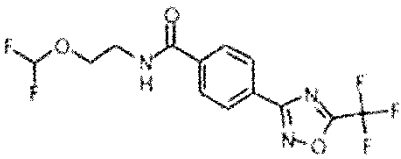
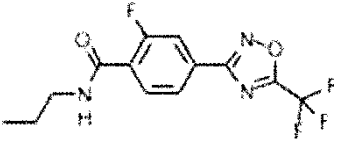
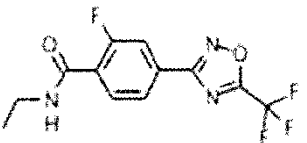
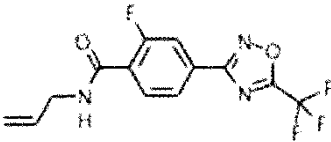
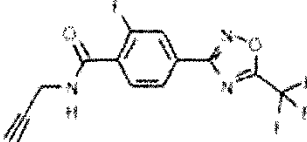
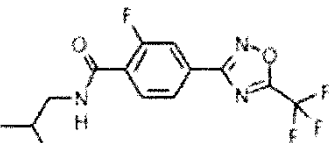
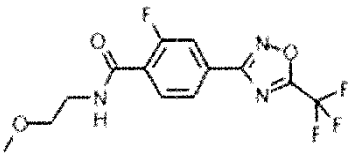
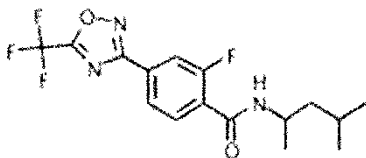
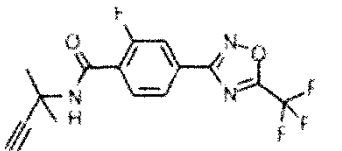
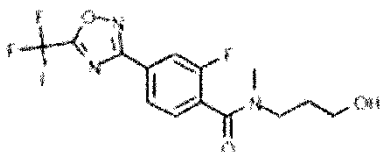
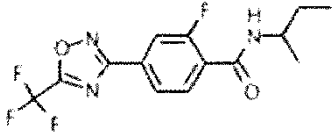
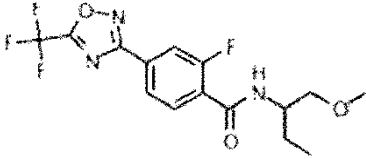
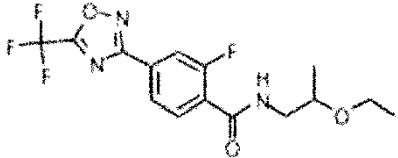
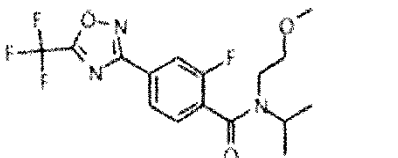
Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
						
3a.45	N-[2-(difluorometoxi)etil (trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					117 - 120

Tabla T3b: Datos del punto de fusión (p.f.) y/o tiempos de retención (R_t) para compuestos de acuerdo con la Fórmula (I) cuando R⁴ es R^{4C}.

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
3b.1	2-fluoro-N-propil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,01	318,3	A	118,5 - 119,9
3b.2	N-etil-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,96	304,3	A	125 - 127
3b.3	N-alil-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,00	316,3	A	108 - 109,3
3b.4	2-fluoro-N-prop-2-inil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,96	314,3	A	128,2 - 129,4
3b.5	2-fluoro-N-isobutil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,07	332,4	A	126,6 - 128,3
3b.6	2-fluoro-N-(2-metoxietil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,94	334,3	A	87,6 - 89

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
						
3b.7	N-(1,3-dimetilbutil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,9	360,1	B	108,5 - 110,4
3b.8	N-(1,1-dimetilprop-2-inil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,04	342,0	A	69,2 - 69,7
3b.9	2-fluoro-N-(3-hidroxipropil)-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,3	348,0	B	
3b.10	2-fluoro-N-sec.-butil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,71	332,1	B	
3b.11	2-fluoro-N-[1-(metoximetil)propil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,66	362,1	B	
3b.12	N-(2-etoxipropil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,68	362,0	B	
3b.13	2-fluoro-N-isopropil-N-(2-metoxietil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,74	376,0	B	

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
3b.14	2-fluoro-N-isobutil-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,80	346,1	B	
3b.15	N-(1,1-dimetil-3-oxo-butil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,65	374,0	B	
3b.16	2-fluoro-N-(2-hidroxi-butil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,40	348,0	B	
3b.17	2-fluoro-N-(3-hidroxi-1-metil-propil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,34	348,0	B	
3b.18	2-fluoro-N-[1-(hidroximetil)-2-metil-propil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					
3b.19	2-fluoro-N-(2-metoxietil)-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,50	362,0	B	
3b.20	N-(4-clorobutil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,51	348,1	B	
3b.21	2-fluoro-N-(2-hidroxi-etil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,70	366,0	B	

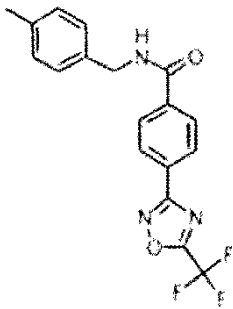
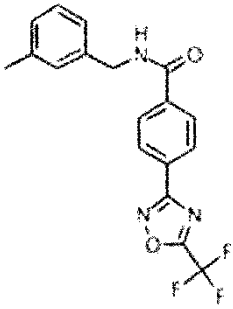
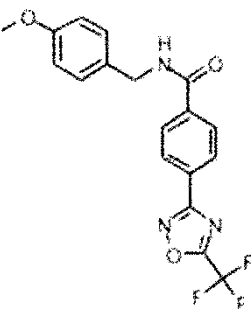
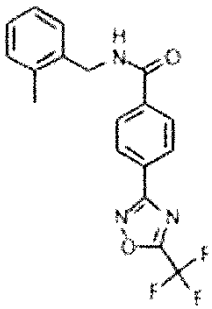
Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
3b.22	2-fluoro-N-(5-hidroxipentil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,20	319,9	B	
3b.23	2-fluoro-N-(3-hidroxipropil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,37	362,0	B	
3b.24	N-(3-etoxipropil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,25	334,0	B	
3b.25	2-fluoro-N-(2-hidroxietil)-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,64	362,0	B	
3b.26	2-fluoro-N-(4-hidroxibutil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,25	334,0	B	
3b.27	2-fluoro-N-isopropil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,29	348,0	B	
3b.28	3-[[2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzoil]amino]butanoato de etilo		1,60	318,1	B	
3b.29	2-fluoro-N-(2-hidroxi-2-metil-propil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					

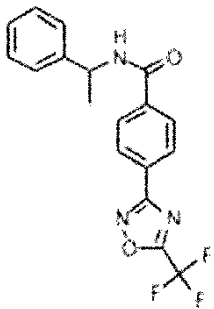
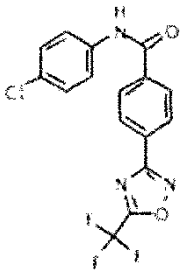
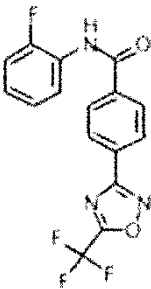
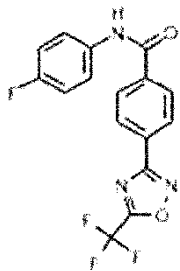
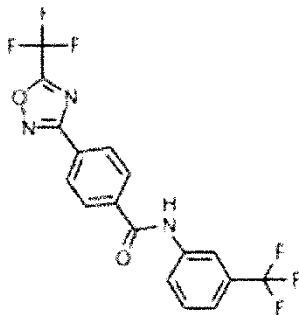
Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
3b.30	N-alil-N-etil-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,66	390,0	B	
3b.31	2-fluoro-N-hexil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,37	348,0	B	
3b.32	N,N-dietil-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,74	344,1	B	
3b.33	N-etil-2-fluoro-N-(2-metilalil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,97	360,0	B	
3b.34	2-fluoro-N-metil-N-propil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,68	332,1	B	
3b.35	N-etil-2-fluoro-N-isopropil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,85	358,1	B	
3b.36	2-fluoro-N-isopropil-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,69	332,1	B	
3b.37	N-terc.-butil-2-fluoro-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,78	346,1	B	

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
3b.38	N-butil-2-fluoro-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,67	332,0	B	
3b.39	N-(2-etoxietil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,85	346,0	B	
3b.40	2-fluoro-N-(2-metoxi-1-metiletil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,81	346,0	B	
3b.41	2-fluoro-N-isopentil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,56	348,0	B	
3b.42	N-(2-etilbutil)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,56	348,0	B	
3b.43	2-fluoro-N-(2-isopropoxietil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,84	346,0	B	
3b.44	2-fluoro-N-metil-N-prop-2-inil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,95	360,1	B	

Tabla T4a: Datos del punto de fusión (p.f.) y/o tiempos de retención (R_t) para compuestos de acuerdo con la Fórmula (I) (las Entradas 4a.1 a 4a.13 representan compuestos de referencia).

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
4a.1	N-(p-tolilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,09	362,3	A	198 - 203

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
						
4a.2	N-(m-tolilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,09	362,4	A	135 - 141
4a.3	N-[(4-metoxifenil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,04	378,2	A	154-159
4a.4	N-(o-tolil metil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,08	362,4	A	135 - 141
4a.5	N-(1-feniletil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,07	362,3	A	144-148

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
						
4a.6	N-(4-clorofenil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,14	368,2	A	
4a.7	N-(2-fluorofenil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,07	352,2	A	
4a.8	N-(4-fluorofenil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,08	352,3	A	
4a.9	4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]-N-[3-(trifluorometil)fenil]benzamida		1,17	402,4	A	

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
4a. 10	N-(3-etilfenil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,16	362,4	A	
4a. 11	N-[(2,5-dimetilfenil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida				B	
4a. 12	N-(4-morfolinofenil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,62	418,99	B	
4a. 13	N-[(2,4-dimetoxifenil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,7	407,98	B	

Tabla T4b: Datos del punto de fusión (p.f.) y/o tiempos de retención (R_t) para compuestos de acuerdo con la Fórmula (I) cuando R⁴ es R^{4D}.

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
4b.1	2-fluoro-N-[(2-fluorofenil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					132 - 136
4b.2	2-fluoro-N-[(4-fluorofenil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					145 - 147

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
4b.3	2-fluoro-N-(1-feniletíl)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					121,1 - 123,7
4b.4	2-fluoro-N-[(3-fluorofenil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					129,4 - 130,9
4b.5	2-fluoro-N-[(2-metoxifenil)metil(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					113,3 - 114,8
4b.6	N-bencil-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					146 - 147,7
4b.7	2-fluoro-N-[2-(4-fluorofenil)etil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					128,2 - 129,4
4b.8	2-fluoro-N-(2-feniletíl)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					130-131,9
4b.9	2-fluoro-N-[(2-fluorofenil)metil]-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					
4b.10	2-fluoro-N-(4-fenilbutil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					

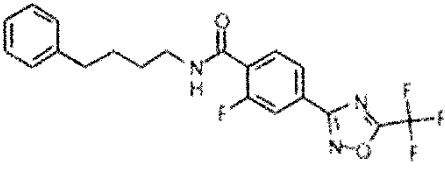
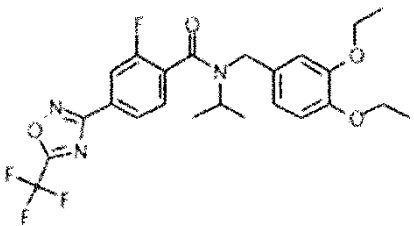
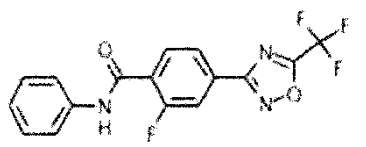
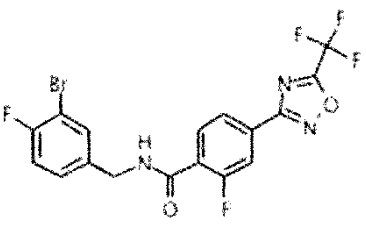
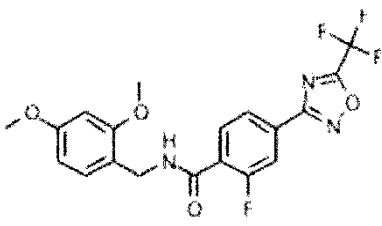
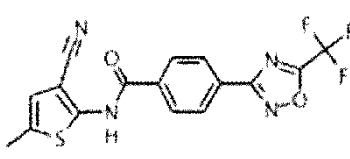
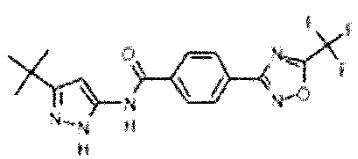
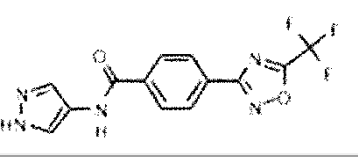
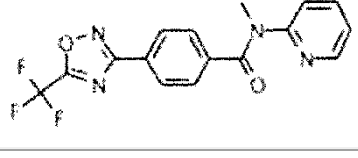
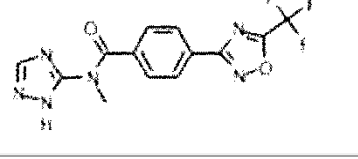
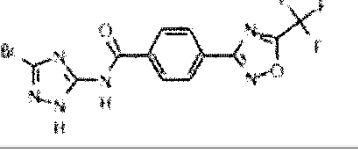
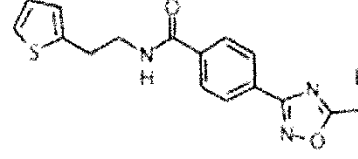
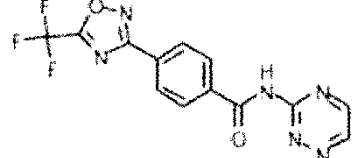
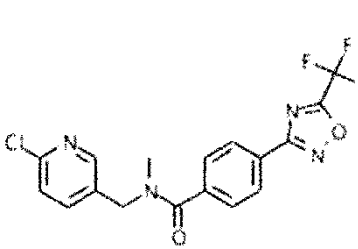
Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
						
4b.11	N-[(3,4-dietoxifenil)metil]-2-fluoro-N-isopropil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					
4b.12	2-fluoro-N-fenil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					
4b.13	N-[(3-bromo-4-fluorofenil)metil]-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					
4b.14	N-[(2,4-dimetoxifenil)metil]-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida					

Tabla T5a: Datos del punto de fusión (p.f.) y/o tiempos de retención (R_t) para compuestos de acuerdo con la Fórmula (I) (las Entradas 5a.1 a 5a.10 representan compuestos de referencia).

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
5a.1	N-(3-ciano-5-metil-2-tienil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,86	379,1	B	
5a.2	N-(3-terc.-butil-1H-pirazol-5-il)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,68	380,1	B	

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
						
5a.3	N-(1 <i>H</i> -pirazol-4-il)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,29	324	B	
5a.4	N-metil-N-(2-piridil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,5	349,1	B	
5a.5	N-metil-N-(1 <i>H</i> -1,2,4-triazol-5-il)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,98	339,1	B	125-128
5a.6	N-(3-bromo-1 <i>H</i> -1,2,4-triazol-5-il)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		2,07	403,3	B	
5a.7	N-[2-(2-tienil)etil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,71	368	B	
5a.8	N-(1,2,4-triazin-3-il)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		2,14	336,9	B	
5a.9	N-[(6-cloro-3-piridil)metil]-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,6	396,92	B	

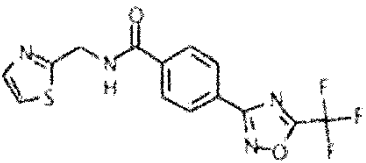
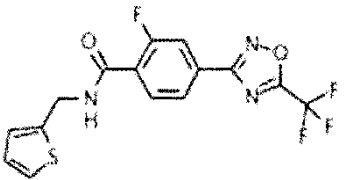
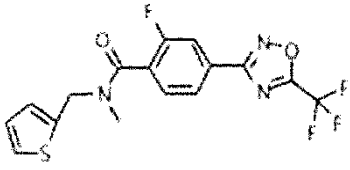
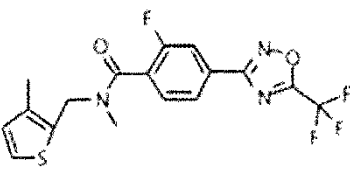
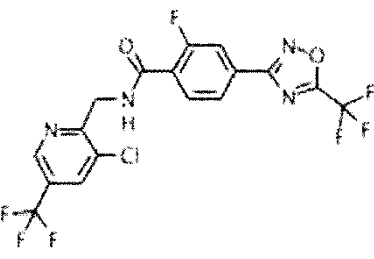
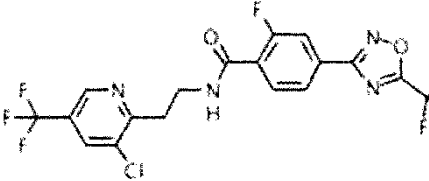
Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
5a.10	N-(tiazol-2-ilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,4	354,04	B	

Tabla T5b: Datos del punto de fusión (p.f.) y/o tiempos de retención (R_t) para compuestos de acuerdo con la Fórmula (I) cuando R⁴ es R^{4E}.

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
5b.1	2-fluoro-N-(2-tienilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,06	372,3	A	142,7 - 143
5b.2	2-fluoro-N-metil-N-(2-tienilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,08	386,3	A	
5b.3	2-fluoro-N-metil-N-[(3-metil-2-tienil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,13	400,4	A	
5b.4	N-[[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridil]etil]-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,17	469,7	A	126,6 - 128,3
5b.5	N-[2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridil]etil]-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,16	483,7	A	144,9 - 146,5

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
5b.6	N-(3-terc.-butil-1 <i>H</i> -pirazol-5-il)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,68	398,1	B	
5b.7	2-fluoro-N-(1 <i>H</i> -pirazol-4-il)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,27	342	B	
5b.8	2-fluoro-N-(5-metoxi-1-metil-1-tia-2,4,6-triazaciclohexa-2,4,6-trien-3-il)-N-metil-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,61	433,3	B	
5b.9	2-fluoro-N-[(5-metil-2-furil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,71	370,1	B	
5b.10	N-(3-bromo-1 <i>H</i> -1,2,4-triazol-5-il)-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,43	421	B	
5b.11	2-fluoro-N-(2-furilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,61	356,1	B	
5b.12	2-fluoro-N-(3-imidazol-1-ilpropil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,89	384,1	A	
5b.13	2-fluoro-N-[2-(2-tienil)etil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,77	386,1	B	

Entrada en la Tabla	Nombre del compuesto	Estructura	R _t (mins)	Carga de masa (M+H) ⁺	Método	p.f. (°C)
5b.14	N-[(2-clorotiazol-5-il)metil]-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,01	407,7	A	127,8 - 130,8
5b.15	2-fluoro-N-metil-N-[(2-metiltiazol-4-il)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,99	401,4	A	96,3 - 98,4
5b.16	2-cloro-N-[(5-metil-2-furil)metil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,92	385,94	A	
5b.17	2-cloro-N-(2-furilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,86	371,92	A	
5b.18	2-cloro-N-[2-(2-tienil)etil]-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		0,95	401,92	A	
5b.19	2-fluoro-N-(tiazol-2-ilmetil)-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,44	373,05	B	
5b.20	N-[ciano(2-tienil)metil]-2-fluoro-4-[5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il]benzamida		1,06	395	A	138,1 - 139,2

EJEMPLOS BIOLÓGICOS

Ejemplos generales de ensayos de discos foliares en placas con pocillos:

Los discos foliares o segmentos foliares de diversas especies de plantas se cortan de plantas cultivadas en un invernadero. Los discos o segmentos foliares cortados se colocan en placas de pocillos múltiples (formato de 24 pocillos) en agar agua. Los discos foliares se rocían con una solución de ensayo antes (preventiva) o después de la inoculación (curativa). Los compuestos a ensayar se preparan como soluciones de DMSO (máx. 10 mg/ml) que se diluyen a la concentración apropiada con Tween20 al 0,025% justo antes de la pulverización. Los discos o segmentos foliares inoculados se incuban en condiciones definidas (temperatura, humedad relativa, luz, etc.) de acuerdo con el sistema de ensayo respectivo. Una sola evaluación del nivel de la enfermedad se lleva a cabo de 3 a 14 días después de la inoculación, dependiendo del sistema patológico. Luego se calcula el porcentaje de control de la enfermedad con relación a los discos o segmentos foliares de control no tratados.

Ejemplos generales de ensayos de cultivos líquidos en placas con pocillos:

Fragmentos de *Mycelia* o las suspensiones de conidios de un hongo recién preparado a partir de cultivos líquidos del hongo o del almacenamiento criogénico, se mezclan directamente en el caldo de nutrientes. Soluciones de DMSO del compuesto de ensayo (máx. 10 mg/ml) se diluyen con Tween20 al 0,025% en un factor de 50 y se pipetea 10 µl de esta solución en una placa de microtitulación (formato de 96 pocillos). El caldo de nutrientes que contiene las esporas de hongos/fragmentos de micelios se añade luego para dar una concentración final del compuesto testado. Las placas de ensayo se incuban en la oscuridad a 24°C y 96% de humedad relativa. La inhibición del crecimiento fúngico se determina fotométricamente después de 2 a 7 días, dependiendo del sistema de patología, y se calcula el porcentaje de actividad antifúngica en relación con el control no tratado.

Ejemplo 1: Actividad fungicida contra *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* / trigo / disco foliar preventivo (Roya parda)

Segmentos foliares de trigo cv. Kanzler se colocaron en agar en placas de pocillos múltiples (formato de 24 pocillos) y se rociaron con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. Los discos foliares se inocularon con una suspensión de esporas del hongo 1 día después de la aplicación. Los segmentos foliares inoculados se incubaron a 19°C y 75% de humedad relativa (hr) bajo un régimen de luz de 12 horas de luz / 12 horas de oscuridad en un armario climatizado y la actividad de un compuesto se evaluó como porcentaje de control de la enfermedad en comparación con el no tratado cuando un nivel apropiado de daño de la enfermedad aparece en los segmentos foliares de control sin tratar (7 a 9 días después de la aplicación).

Los siguientes compuestos a 200 ppm en la formulación aplicada proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad en este ensayo en comparación con los discos foliares de control no tratados en las mismas condiciones, que muestran un desarrollo extenso de la enfermedad.

Compuestos (de la Tabla T1a) 1a.1, 1a.2, 1a.3, 1a.4, 1a.6, 1a.7, 1a.10, y 1a.11

Compuestos (de la Tabla T1b) 1b.1, 1b.2, 1b.3, 1b.4, 1b.5, 1b.6, 1b.8, 1b.9, 1b.11, 1b.13, 1b.14, 1b.15, 1b.16, 1b.17, y 1b.18.

Compuestos (de la Tabla T2a) 2a.3, 2a.4, 2a.6, 2a.7, y 2a.9.

Compuestos (de la Tabla T2b) 2b.1, 2b.3, 2b.4, 2b.5, 2b.9, 2b.10, 2b.11, 2b.12, 2b.13, 2b.14, 2b.15, 2b.16, y 2b.17.

Compuestos (de la Tabla T3a) 3a.1, 3a.2, 3a.3, 3a.4, 3a.5, 3a.7, 3a.9, 3a.10, 3a.11, 3a.12, 3a.13, 3a.14, 3a.16, 3a.17, 3a.20, 3a.22, 3a.24, 3a.26, 3a.27, 3a.28, 3a.30, 3a.31, 3a.32, 3a.33, 3a.34, 3a.35, 3a.36, 3a.37, 3a.38, 3a.40, 3a.41, 3a.43, 3a.44, y 3a.45.

Compuestos (de la Tabla T3b) 3b.1, 3b.2, 3b.3, 3b.4, 3b.5, 3b.6, 3b.7, 3b.8, 3b.10, 3b.11, 3b.12, 3b.14, 3b.15, 3b.16, 3b.19, 3b.20, 3b.21, 3b.22, 3b.24, 3b.26, 3b.27, 3b.28, 3b.29, 3b.30, 3b.32, 3b.33, 3b.34, 3b.35, 3b.36, 3b.37, 3b.38, 3b.39, 3b.40, 3b.41, 3b.43, y 3b.44.

Compuestos (de la Tabla T4a) 4a.2, 4a.3, 4a.4, 4a.5, y 4a.13.

Compuestos (de la Tabla T4b) 4b.1, 4b.2, 4b.3, 4b.4, 4b.5, 4b.6, 4b.7, 4b.8, 4b.9, 4b.11, 4b.13, y 4b.14.

Compuestos (de la Tabla T5a) 5a.5, 5a.6, 5a.7, 5a.8, 5a.9, y 5a.10.

Compuestos (de la Tabla T5b) 5b.1, 5b.2, 5b.7, 5b.9, 5b.10, 5b.11, 5b.13, 5b.14, 5b.15, 5b.16, 5b.17, 5b.18, 5b.19, y 5b.20.

Ejemplo 2: Actividad fungicida contra *Puccinia recondita* f. sp. *tritici* / trigo / disco foliar preventivo (Roya parda)

- Segmentos foliares de trigo cv. Kanzler se colocan en agar en placas de pocillos múltiples (formato de 24 pocillos). Los segmentos foliares se inoculan luego con una suspensión de esporas del hongo. Las placas se almacenaron en la oscuridad a 19°C y 75% de humedad relativa. El compuesto de ensayo formulado diluido en agua se aplicó 1 día después de la inoculación. Los segmentos foliares inoculados se incubaron a 19°C y 75% de humedad relativa (hr)
- 5 bajo un régimen de luz de 12 horas de luz / 12 horas de oscuridad en un armario climatizado y la actividad de un compuesto se evaluó como porcentaje de control de la enfermedad en comparación con el no tratado cuando un nivel apropiado de daño de la enfermedad aparece en los segmentos foliares de control sin tratar (6 a 8 días después de la aplicación).
- 10 Los siguientes compuestos a 200 ppm en la formulación aplicada proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad en este ensayo en comparación con los discos foliares de control no tratados en las mismas condiciones, que muestran un desarrollo extenso de la enfermedad.
- Compuestos (de la Tabla T1a) 1a.2, 1a.3, 1a.4, 1a.5, 1a.7, 1a.8, y 1a.9.
- 15 Compuestos (de la Tabla T1b) 1b.2, 1b.5, 1b.6, 1b.7, 1b.9, 1b.10, 1b.12, 1b.13, 1b.15, 1b.16, 1b.17, y 1b.18.
- Compuestos (de la Tabla T2a) 2a.3, 2a.4, y 2a.9.
- 20 Compuestos (de la Tabla T2b) 2b.1, 2b.3, 2b.4, 2b.5, 2b.9, 2b.11, 2b.12, 2b.13, y 2b.17.
- Compuestos (de la Tabla T3a) 3a.1, 3a.2, 3a.3, 3a.5, 3a.6, 3a.7, 3a.9, 3a.10, 3a.11, 3a.12, 3a.13, 3a.14, 3a.15, 3a.16, 3a.17, 3a.18, 3a.20, 3a.21, 3a.22, 3a.24, 3a.27, 3a.28, 3a.30, 3a.31, 3a.32, 3a.33, 3a.34, 3a.35, 3a.36, 3a.37, 3a.38, 3a.40, 3a.41, 3a.43, 3a.44, y 3a.45.
- 25 Compuestos (de la Tabla T3b) 3b.1, 3b.2, 3b.3, 3b.4, 3b.5, 3b.6, 3b.8, 3b.9, 3b.10, 3b.11, 3b.12, 3b.14, 3b.15, 3b.16, 3b.17, 3b.18, 3b.19, 3b.20, 3b.21, 3b.22, 3b.23, 3b.24, 3b.27, 3b.28, 3b.29, 3b.30, 3b.31, 3b.32, 3b.33, 3b.34, 3b.35, 3b.36, 3b.37, 3b.38, 3b.39, 3b.40, 3b.41, 3b.43, y 3b.44.
- 30 Compuestos (de la Tabla T4a) 4a.4, 4a.5, y 4a.13.
- Compuestos (de la Tabla T4b) 4b.6, y 4b.9.
- Compuestos (de la Tabla T5a) 5a.4, 5a.5, 5a.6, 5a.8, 5a.9, y 5a.10.
- 35 Compuestos (de la Tabla T5b) 5b.1, 5b.2, 5b.3, 5b.9, 5b.11, 5b.13, 5b.14, 5b.15, 5b.16, 5b.17, 5b.19, y 5b.20.
- Ejemplo 3: Actividad fungicida contra *Phakopsora pachyrhizi* / soja / disco foliar preventiva (Roya de soja asiática)**
- 40 Discos foliares de soja se colocan en agar agua en placas de pocillos múltiples (formato de 24 pocillos) y se rocían con el compuesto de ensayo formulado diluido en agua. . Un día después de la aplicación, los discos foliares se inoculan rociando una suspensión de esporas en el envés de las hojas. Después de un período de incubación en un armario climatizado durante 24-36 horas en la oscuridad a 20°C y 75% de humedad relativa, los discos foliares se
- 45 mantienen a 20°C con 12 h de luz/día y 75% de hr. La actividad de un compuesto se evalúa como el porcentaje de control de la enfermedad en comparación con el no tratado cuando aparece un nivel apropiado de daño de la enfermedad en los discos foliares de verificación sin tratar (12 a 14 días después de la aplicación)
- Los siguientes compuestos a 200 ppm en la formulación aplicada proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad en este ensayo en comparación con los discos foliares de control no tratados en las mismas condiciones, que muestran un desarrollo extenso de la enfermedad.
- 50 Compuestos (de la Tabla T1a) 1a.1 y 1a.2.
- 55 Compuestos (de la Tabla T1b) 1b.1, 1b.2, 1b.3, 1b.5, 1b.6, 1b.9, 1b.14, 1b.15, 1b.16, 1b.17, y 1b.18.
- Compuestos (de la Tabla T2a) 2a.1, 2a.2, 2a.3, 2a.4, 2a.5, 2a.6, 2a.7, 2a.8, y 2a.9
- Compuestos (de la Tabla T2b) 2b.1, 2b.2, 2b.3, 2b.4, 2b.5, 2b.6, 2b.7, 2b.8, 2b.9, 2b.11, 2b.12, 2b.13, 2b.15, y 2b.17.
- 60 Compuestos (de la Tabla T3a) 3a.1, 3a.2, 3a.3, 3a.4, 3a.5, 3a.6, 3a.7, 3a.8, 3a.9, 3a.10, 3a.11, 3a.12, 3a.13, 3a.14, 3a.15, 3a.16, 3a.18, 3a.19, 3a.20, 3a.21, 3a.22, 3a.23, 3a.24, 3a.25, 3a.26, 3a.27, 3a.28, 3a.29, 3a.30, 3a.31, 3a.32, 3a.33, 3a.34, 3a.35, 3a.36, 3a.37, 3a.38, 3a.39, 3a.40, 3a.41, 3a.42, 3a.43, 3a.44, y 3a.45.

Compuestos (de la Tabla T3b) 3b.1, 3b.2, 3b.3, 3b.4, 3b.5, 3b.6, 3b.7, 3b.8, 3b.9, 3b.10, 3b.11, 3b.12, 3b.13, 3b.14, 3b.15, 3b.16, 3b.17, 3b.19, 3b.20, 3b.21, 3b.22, 3b.23, 3b.24, 3b.25, 3b.26, 3b.27, 3b.29, 3b.30, 3b.31, 3b.32, 3b.33, 3b.34, 3b.35, 3b.36, 3b.37, 3b.38, 3b.39, 3b.40, 3b.41, 3b.42, 3b.43, y 3b.44.

5 Compuestos (de la Tabla T4a) 4a.1, 4a.2, 4a.3, 4a.4, 4a.5, 4a.6, 4a.7, 4a.8, 4a.9, 4a.10, 4a.11, 4a.12, 4a.13.

Compuestos (de la Tabla T4b) 4b.1, 4b.2, 4b.3, 4b.4, 4b.5, 4b.6, 4b.7, 4b.8, 4b.9, 4b.10, y 4b.12.

Compuestos (de la Tabla T5a) 5a.1, 5a.2, 5a.3, 5a.4, 5a.5, 5a.6, 5a.7, 5a.8, 5a.9, y 5a.10.

10 Compuestos (de la Tabla T5b) 5b.1, 5b.2, 5b.3, 5b.4, 5b.5, 5b.6, 5b.7, 5b.8, 5b.9, 5b.11, 5b.12, 5b.13, 5b.14, 5b.15, 5b.16, 5b.17, 5b.19, y 5b.20.

Ejemplo 4: Actividad fungicida contra cultivo líquido de *Glomerella lagenarium* (*Colletotrichum lagenarium*) / pepino / preventivo (Antracnosis)

Conidios del hongo del almacenamiento criogénico se mezclan directamente en caldo de nutrientes (PDB - caldo de dextrosa de patata). Después de colocar una solución (DMSO) del compuesto de prueba en una placa de microvaloración (formato de 96 pocillos), se añade el caldo de nutrientes que contiene las esporas fúngicas. Las placas de ensayo se incuban a 24°C y la inhibición del crecimiento se mide fotométricamente 3 a 4 días después de la aplicación.

20 Los siguientes compuestos a 20 ppm en la formulación aplicada proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad en este ensayo en comparación con el control no tratado en las mismas condiciones, que muestran un desarrollo extenso de la enfermedad.

Compuestos (de la Tabla T1a) 1a.1, 1a.2, 1a.3, 1a.4, y 1a.5.

Compuestos (de la Tabla T1b) 1b.5, 1b.9, 1b.14, 1b.15, 1b.16, 1b.17, y 1b.18.

Compuestos (de la Tabla T2a) 2a.1 y 2a.9.

Compuestos (de la Tabla T2b) 2b.1, 2b.2, 2b.3, 2b.4, 2b.5, 2b.6, 2b.8, y 2b.13.

35 Compuestos (de la Tabla T3a) 3a.1, 3a.2, 3a.3, 3a.4, 3a.7, 3a.8, 3a.9, 3a.10, 3a.11, 3a.12, 3a.13, 3a.14, 3a.16, 3a.17, 3a.18, 3a.20, 3a.22, 3a.23, 3a.24, 3a.25, 3a.26, 3a.27, 3a.28, 3a.29, 3a.30, 3a.31, 3a.32, 3a.33, 3a.34, 3a.35, 3a.36, 3a.37, 3a.38, 3a.39, 3a.40, 3a.41, 3a.43, 3a.44, y 3a.45.

40 Compuestos (de la Tabla T3b) 3b.1, 3b.2, 3b.3, 3b.4, 3b.5, 3b.6, 3b.7, 3b.8, 3b.10, 3b.11, 3b.12, 3b.13, 3b.14, 3b.15, 3b.16, 3b.18, 3b.19, 3b.20, 3b.21, 3b.22, 3b.23, 3b.24, 3b.26, 3b.27, 3b.28, 3b.29, 3b.30, 3b.31, 3b.32, 3b.33, 3b.34, 3b.35, 3b.36, 3b.37, 3b.38, 3b.39, 3b.40, 3b.41, 3b.43, y 3b.44.

Compuestos (de la Tabla T4a) 4a.1, 4a.2, 4a.3, 4a.4, 4a.5, y 4a.13.

Compuestos (de la Tabla T4b) 4b.1, 4b.2, 4b.5, 4b.7, 4b.8, 4b.9, 4b.10, y 4b.11.

Compuestos (de la Tabla T5a) 5a.4, 5a.5, 5a.6, 5a.7, 5a.8, 5a.9, y 5a.10.

Compuestos (de la Tabla T5b) 5b.2, 5b.3, 5b.7, 5b.9, 5b.10, 5b.11, 5b.13, 5b.14, 5b.15, 5b.16, 5b.17, 5b.18, 5b.19, y 5b.20.

Ejemplo 5: Actividad fungicida contra *Uromyces viciae-fabae* / habas / disco foliar preventivo (Roya de haba)

Discos foliares de haba de campo se colocan en agar agua en placas de pocillos múltiples (formato de 96 pocillos) y se diluyen 10 µl del compuesto de ensayo formulado en acetona y se pipetea un esparcidor sobre el disco foliar. Dos horas después de la aplicación, los discos foliares se inoculan pulverizando una suspensión de esporas sobre el envés de la hoja. Los discos foliares se incuban en un armario climatizado a 22°C con 18 horas diarias y 70% de humedad relativa. La actividad de un compuesto se evalúa como el porcentaje de control de la enfermedad en comparación con el no tratado cuando aparece un nivel apropiado de daño de la enfermedad en los discos foliares de verificación sin tratar (12 días después de la aplicación)

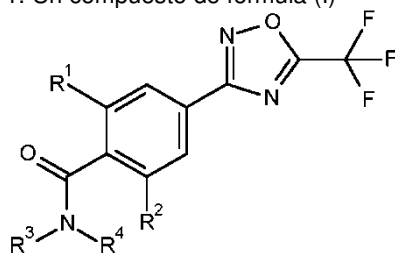
Los siguientes compuestos a 100 ppm en la formulación aplicada proporcionan al menos un 80% de control de la enfermedad en este ensayo en comparación con los discos foliares de control no tratados en las mismas condiciones, que muestran un desarrollo extenso de la enfermedad.

Compuestos (de la Tabla T1a) 1a.2, 1a.3, 1a.4, 1a.5, 1a.6, 1a.7, 1a.8, 1a.9, 1a.10, y 1a.11.

- Compuestos (de la Tabla T1b) 1b.1, 1b.2, 1b.3, 1b.4, 1b.5, 1b.6, 1b.7, 1b.8, 1b.9, 1b.10, 1b.11, 1b.12, 1b.13, 1b.14, 1b.15, 1b.16, 1b.17, y 1b.18.
- 5 Compuestos (de la Tabla T2a) 2a.2, 2a.3, 2a.4, 2a.5, 2a.6, 2a.7, 2a.8, 2a.9.
- Compuestos (de la Tabla T2b) 2b.1, 2b.2, 2b.3, 2b.4, 2b.5, 2b.6, 2b.7, 2b.8, 2b.10, 2b.11, 2b.12, 2b.14, 2b.15, 2b.16, y 2b.17.
- 10 Compuestos (de la Tabla T3a) 3a.1, 3a.2, 3a.3, 3a.4, 3a.5, y 3a.17.
- Compuestos (de la Tabla T3b) 3b.1, 3b.2, 3b.3, 3b.4, 3b.5, 3b.6, 3b.7, y 3b.8.
- Compuestos (de la Tabla T4a) 4a.1, 4a.2, 4a.3, 4a.4, 4a.5, 4a.6, 4a.7, 4a.8, 4a.9, 4a.10, 4a.11, 4a.12, y 4a.13.
- 15 Compuestos (de la Tabla T4b) 4b.1, 4b.2, 4b.3, 4b.4, 4b.5, 4b.6, 4b.7, 4b.8, 4b.9, 4b.10, 4b.11, 4b.12, 4b.13, y 4b.14.
- Compuestos (de la Tabla T5a) 5a.2, 5a.5, 5a.7, 5a.9, y 5a.10.
- 20 Compuestos (de la Tabla T5b) 5b.1, 5b.2, 5b.3, 5b.4, 5b.5, 5b.6, 5b.7, 5b.9, 5b.10, 5b.11, 5b.12, 5b.13, 5b.14, 5b.15, 5b.16, 5b.17, 5b.18, 5b.19, y 5b.20.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I)



(I)

en donde

R¹ es hidrógeno;

R² es halógeno, metilo o metoxi;

R³ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄; y

R⁴ representa R^{4A}, R^{4B}, R^{4C}, R^{4D} o R^{4E}; en donde

R^{4A} representa heterociclilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionado de R^{5A};

R^{5A} representa alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄carbonilo, fenilalquilo C₀₋₂;

R^{4B} representa cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3 o 4 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5B};

R^{5B} representa ciano, halógeno, alquilo C₁₋₄, alquino C₂₋₄, alcoxi C₁₋₄carbonilo, cicloalquil C₃₋₆alquilo C₀₋₂, fenilalquilo C₀₋₂, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo o fenilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{6B}; y

R^{6B} representa metilo, metoxi o halógeno;

R^{4C} representa alquilo C₁₋₆, alqueno C₂₋₆ o alquino C₂₋₆, en donde alquilo C₁₋₆ está opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5C};

R^{5C} representa halógeno, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, hidroxilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo;

R^{4D} representa un fenilalquilo C₀₋₆, opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5D};

R^{5D} representa ciano, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alqueno C₂₋₄, alquino C₂₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, dialquil C₁₋₄aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilamino, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆, fenilalquilo C₀₋₆, heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos, seleccionados individualmente de N, O y S, heterociclilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos restos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterociclilo están opcionalmente sustituidos con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{6D}; y

R^{6D} representa metilo, metoxi o halógeno; y

R^{4E} representa heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heteroarilalquilo C₀₋₆ está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5E};

R^{5E} representa ciano, amino, halógeno, hidroxilo, alquilo C₁₋₄, alqueno C₂₋₄, alquino C₂₋₄, haloalquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, alquil C₁₋₄amino, dialquil C₁₋₄amino, alquil C₁₋₄carbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilo, aminocarbonilo, alquil C₁₋₄aminocarbonilo, dialquil C₁₋₄aminocarbonilo, alcoxi C₁₋₄carbonilamino, cicloalquil C₃₋₈alquilo C₀₋₆, fenilalquilo C₀₋₆, heteroarilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heteroarilo es un anillo aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2, 3 o 4 heteroátomos, seleccionados individualmente de N, O y S, heterociclilalquilo C₀₋₆, en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde cualquiera de dichos cicloalquilo, fenilo, heteroarilo y heterociclilo está opcionalmente sustituido con 1, 2, 3, 4 o 5 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{6E}; y

R^{6E} representa metilo, metoxi o halógeno;

o una sal o un N-óxido del mismo; en donde,

cuando R⁴ es R^{4A}, el compuesto de acuerdo con la Fórmula (I) no es:

2-fluoro-N-(pirrolidin-3-il)-4-[(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)]benzamida,
2-fluoro-N-(1-(pirrolidin-1-il)propan-2-il)-4-[(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)]benzamida,
2-fluoro-N-(1-(piperidin-1-il)propan-2-il)-4-[(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)]benzamida,
2-fluoro-N-(1-morfolinopropan-2-il)-4-[(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)]benzamida, o
2-fluoro-N-(4-metoxipirrolidin-3-il)-4-[(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)]benzamida;

cuando R⁴ es R^{4C}, el compuesto de acuerdo con la Fórmula (I) no es:

2-fluoro-N-(1-hidroxipropan-2-il)-4-[(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)]benzamida; y

cuando R⁴ es R^{4E}, el compuesto de acuerdo con la Fórmula (I) no es:

N-(2,6-dimetilpiridin-4-il)-2-fluoro-4-(5-(trifluorometil)-1,2,4-oxadiazol-3-il)benzamida.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, en donde R^2 es halógeno, y preferiblemente flúor.
3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 o la reivindicación 2, en donde R^3 es hidrógeno o metilo.
4. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde R^{4A} representa heterociclilalquilo C_{0-2} , en donde el resto heterociclilo es un anillo no aromático de 5 o 6 miembros que comprende 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el resto heterociclilalquilo C_{0-2} está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5A} .
5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4 en donde R^{5A} representa metilo, metoxi, metoxycarbonilo, terc.butiloxycarbonilo o bencilo.
6. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde R^{4B} representa cicloalquil C_{3-6} alquilo C_{0-2} , opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5B} .
7. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde R^{4C} representa
 - (i) alquilo C_{1-6} ;
 - (ii) alquilo C_{1-6} sustituido con un único sustituyente seleccionado de R^{5C} , en donde R^{5C} representa alcoxi C_{1-4} o hidroxilo; o
 - (iii) alqueno C_{2-6} o alquino C_{2-6} , preferiblemente alquino C_{2-6} .
8. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde R^{4D} representa fenilalquilo C_{0-2} , opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5D} .
9. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 8, en donde R^{5D} representa ciano, halógeno, alquilo C_{1-4} , haloalquil C_{1-2} alquilo C_{1-2} , alcoxi C_{1-2} , aminocarbonilo, cada uno opcionalmente sustituido con 1, 2 o 3 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionado de R^{6D} .
10. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde R^{4E} representa heteroarilalquilo C_{0-2} , en donde el heteroarilo es un anillo de 5 miembros que comprende 1 o 2 heteroátomos seleccionados individualmente de N, O y S, y en donde el heteroarilalquilo C_{0-2} está opcionalmente sustituido con 1 o 2 sustituyentes, que pueden ser iguales o diferentes, seleccionados de R^{5E} .
11. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 10, en donde R^{5E} representa amino, ciano, halógeno, alquilo C_{1-4} , haloalquilo C_{1-2} o alcoxi C_{1-2} .
12. Una composición agroquímica que comprende una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11.
13. La composición de acuerdo con la reivindicación 12, que comprende, además, al menos un ingrediente activo adicional y/o un diluyente o portador agroquímicamente aceptable.
14. Un método para controlar o prevenir la infestación de plantas útiles por microorganismos fitopatógenos, en el que una cantidad eficaz como fungicida de un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, o una composición que comprende este compuesto como ingrediente activo se aplica a las plantas, a partes de las mismas o al emplazamiento de las mismas.
15. Uso no terapéutico de un compuesto de fórmula (I) de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 como fungicida.