



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 346 695**

51 Int. Cl.:

C07D 327/06 (2006.01)	C07D 333/38 (2006.01)
C07D 207/34 (2006.01)	C07D 277/56 (2006.01)
C07D 213/82 (2006.01)	C07D 231/14 (2006.01)
C07D 307/68 (2006.01)	A01N 43/08 (2006.01)
A01N 43/10 (2006.01)	A01N 43/32 (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01)	A01N 43/40 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)	A01N 43/78 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **06830067 .2**

96 Fecha de presentación : **21.11.2006**

97 Número de publicación de la solicitud: **1960379**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **27.08.2008**

54

Título: **Derivados de N-(1-alquil-2-feniletil)-carboxamida y su uso como fungicidas.**

30

Prioridad: **22.11.2005 EP 05356202**

45

Fecha de publicación de la mención BOPI:
19.10.2010

45

Fecha de la publicación del folleto de la patente:
19.10.2010

73

Titular/es: **Bayer CropScience AG.**
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim, DE

72

Inventor/es: **Coqueron, Pierre-Yves;**
Mansfield, Darren, James;
Desbordes, Philippe;
Rieck, Heiko;
Genix, Pierre;
Villier, Alain y
Grosjean-Cournoyer, Marie-Claire

74

Agente: **Carpintero López, Mario**

ES 2 346 695 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 N-(1-alquil-2-feniletil)-carboxamida y su uso como fungicidas.

La presente invención se refiere a derivados de N-(1-alquil-2-feniletil)carboxamida, a su procedimiento de preparación, a su uso como fungicidas, en particular en forma de composiciones fungicidas y a procedimientos para el control de hongos fitopatógenos de plantas usando estos compuestos o sus composiciones.

La solicitud internacional de patente WO 00/026191 da a conocer derivados de picolinamida de fórmula general que comprenden los compuestos de acuerdo con la presente invención y su uso como fungicidas. No obstante, no se dan a conocer en la solicitud de patente compuestos de acuerdo con la presente invención.

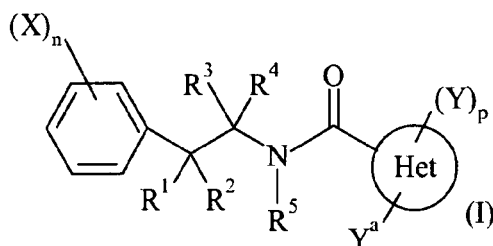
La solicitud de patente europea EP 296673 da a conocer derivados de 5-tiazolcarboxamida y su uso como fungicidas. No obstante, no se dan a conocer en la solicitud de patente compuestos de acuerdo con la presente invención.

Siempre es de gran interés en el campo de los productos agroquímicos el uso de compuestos plaguicidas más activos que los compuestos ya conocidos por el experto en la técnica, con lo cual puede usarse menos compuesto manteniendo una eficacia equivalente.

Además, el suministro de compuestos plaguicidas novedosos con una eficacia superior reduce considerablemente el riesgo de aparición de cepas resistentes en los hongos que se tratan.

Hemos descubierto una nueva familia de compuestos que muestran una actividad fungicida mejorada con respecto a la familia conocida general de tales compuestos.

En consecuencia, la presente invención se refiere a derivados de N-(1-alquil-2-feniletil)carboxamida de fórmula general (I)



en la que:

- n es 1, 2, 3, 4 ó 5;

- p es 1, 2, 3, 4 ó 5;

- X son iguales o diferentes y son un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo (C_1-C_6), un alquilo (C_1-C_8), un haloalquilo (C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo (C_2-C_8), un alquinilo (C_2-C_8), un alquil (C_1-C_8)-amino, un di-alquil (C_1-C_8)-amino, un alcoxi (C_1-C_8), un haloalcoxi (C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-sulfanilo, un haloalquil (C_1-C_8)-sulfanilo que tiene de 1 a 5 átomos de hidrógeno, un alquenil (C_2-C_8)-oxi, un haloalquenil (C_2-C_8)-oxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquinil (C_3-C_8)-oxi, un haloalquinil (C_3-C_8)-oxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C_3-C_8), un halocicloalquilo (C_3-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-carbonilo, un haloalquil (C_1-C_8)-carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-carbamoilo, un di-alquil (C_1-C_8)-carbamoilo, un N-alquil (C_1-C_8)-oxicarbamoilo, un alcoxi (C_1-C_8)-carbamoilo, un N-alquil (C_1-C_8)-alcoxi (C_1-C_8)-carbamoilo, un alcoxi (C_1-C_8)-carbonilo, un haloalcoxi (C_1-C_8)-carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-carboniloxi, un haloalquil (C_1-C_8)-carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-aminocarboniloxi, un di-alquil (C_1-C_8)-aminocarboniloxi, un alquil (C_1-C_8)-oxicarboniloxi, un alquil (C_1-C_8)-sulfenilo, un haloalquil (C_1-C_8)-sulfenilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-sulfinilo, un haloalquil (C_1-C_8)-sulfinilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-sulfonilo, un haloalquil (C_1-C_8)-sulfonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxi (C_1-C_6)-imino)-alquilo (C_1-C_6), un (alquenil (C_1-C_6)-oxiimino)-alquilo (C_1-C_6), un (alquinil (C_1-C_6)-oxiimino)-alquilo (C_1-C_6), un (benciloxiimino)-alquilo (C_1-C_6), un benciloxi, un bencilsulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo o un fenilamino;

ES 2 346 695 T3

- R^1 , R^2 , R^3 y R^4 se eligen, independientemente unos de otros, de modo que sean un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_6) o un alquil (C_1-C_6)-cicloalquilo (C_3-C_7); o R^1 y R^2 pueden representar halógeno;

con la condición de que al menos uno de los sustituyentes R^1 , R^2 , R^3 y R^4 sea distinto de hidrógeno;

- R^5 es un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_6) o un cicloalquilo (C_3-C_7);

- Het se selecciona del grupo constituido por 2-furano, 3-furano, 4,5-dihidro-3-furano, 2-tiofeno, 3-tiofeno, 2-pirrol, 3-pirrol, 5-oxazol, 4-oxazol, 5-tiazol, 4-tiazol, 5-pirazol, 4-pirazol, 3-pirazol, 3-isoxazol, 4-isoxazol, 5-isoxazol, 3-isotiazol, 4-1,2,3-triazol, 4-tiadiazol, 5-tidiazol, 2-piridina, 3-piridina, 4-piridina, 2-oxatiina, 4,5-dihidro-3-pirano, 4,5-dihidro-2-tiopirano, 4,5-dihidro-3-tiopirano o 2-pirazina; estando enlazado Het mediante un átomo de carbono;

- Y^a es un sustituyente orto y es un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanilo, un grupo formilo, un alquilo (C_1-C_8), un grupo haloalquilo (C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo (C_2-C_8), un alquinilo (C_2-C_8), un alcoxi (C_1-C_8), un haloalcoxi (C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-sulfanilo, un haloalquil (C_1-C_8)-sulfanilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenil (C_2-C_8)-oxi, un haloalquenil (C_2-C_8)-oxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquinil (C_3-C_8)-oxi, un haloalquinil (C_3-C_8)-oxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C_3-C_8) o un halocicloalquilo (C_3-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y

- Y son iguales o diferentes y son un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_6); un haloalquilo (C_1-C_6), un grupo amino, un grupo ciano, un alquil (C_1-C_4)-amino o un di-(alquil (C_1-C_4))-amino;

así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metalóidicos e isómeros ópticamente activos.

En el contexto de la presente invención:

- halógeno significa flúor, bromo, cloro o yodo.

- carboxi significa $-C(=O)OH$;

- carbonilo significa $-C(=O)-$;

- carbamoilo significa $-C(=O)NH_2$;

- N-hidroxicarbamoilo significa $-C(=O)NHOH$;

- un grupo alquilo, un grupo alquenilo y un grupo alquinilo, así como restos que contienen estos términos, pueden ser lineales o ramificados; y

- heteroátomo significa azufre, nitrógeno u oxígeno.

En el contexto de la presente invención, también se entiende que en el caso de amino disustituido y de radicales carbamoilo disustituidos, los dos sustituyentes pueden formar conjuntamente con el átomo de nitrógeno que los porta un anillo heterocíclico saturado que contiene de 3 a 7 átomos.

Cualquiera de los compuestos de la presente invención puede existir en una o más formas isómeras ópticas o quirales, dependiendo del número de centros asimétricos del compuesto. Así, la presente invención se refiere igualmente a todos los isómeros ópticos y a sus mezclas racémicas o escalémicas (el término "escalémica" denomina una mezcla de enantiómeros en diferentes proporciones) y a las mezclas de todos los posibles estereoisómeros, en todas las proporciones. Los diastereoisómeros y/o los isómeros ópticos pueden separarse de acuerdo con los procedimientos que son conocidos por sí mismos por el experto en la técnica.

Cualquiera de los compuestos de la presente invención puede existir también en una o más formas isómeras geométricas, dependiendo del número de enlaces dobles del compuesto. Así, la invención se refiere igualmente a todos los isómeros geométricos y a todas las mezclas posibles en todas las proporciones. Los isómeros geométricos pueden separarse según procedimientos generales, que son conocidos por sí mismos por el experto en la técnica.

Todos los compuestos de fórmula general (I) en los que X representa un hidroxilo, un grupo sulfanilo o un grupo amino pueden encontrarse en su forma tautómera, como resultado del desplazamiento del protón de dicho grupo hidroxilo, sulfanilo o amino. Dichas formas tautómeras de dichos compuestos son también parte de la presente invención. Dicho de forma más general, todas las formas tautómeras de compuestos de la fórmula general (I) en las X representa un hidroxilo, un grupo sulfanilo o un grupo amino, así como las formas tautómeras de los compuestos que pueden usarse opcionalmente como intermedios en los procedimientos de preparación y que se definirán en la descripción de estos procedimientos, también son parte de la presente invención.

ES 2 346 695 T3

De acuerdo con la presente invención, el grupo fenilo puede estar sustituido en cualquier posición por (X)_n, siendo X y n como se han definido anteriormente. Preferentemente, la presente invención se refiere a derivados de N-(1-alkil-2-feniletíl)carboxamida de fórmula general (I) en los que las distintas características pueden elegirse por separado o en combinación, de modo que sean:

- con respecto a n, n se elige de modo que sea 1, 2 ó 3. Más preferentemente n es 1 ó 2; y
- con respecto a X, X se elige de modo que sea un átomo de halógeno, un grupo (hidroxiimino)-alquilo (C1-C6), un alquilo (C1-C8), un haloalquilo (C1-C8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxi (C1-C6)-imino)-alquilo (C1-C6), un (alquenil (C1-C6)oxiimino)-alquilo (C1-C6) o un (alquil (C1-C6)-oxiimino)-alquilo (C1-C6). Más preferentemente, X se elige de modo que sea un átomo de halógeno o un haloalquilo C1-C8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

De acuerdo con la presente invención, los átomos de carbono del resto etilamida del compuesto de fórmula (I) están sustituidos con R¹, R², R³ y R⁴, siendo R¹, R², R³ y R⁴ tal como se han definido anteriormente. Preferentemente, la presente invención también se refiere a derivados de N-(1-alkil-2-feniletíl)carboxamida de fórmula general (I) en la que las distintas características pueden elegirse por separado o en combinación, de modo que sean:

- con respecto a R¹ y R², R¹ y R² se eligen, independientemente uno de otro, de modo que sean un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno;
- con respecto a R³ y R⁴, R³ y R⁴ se eligen, independientemente uno de otro, de modo que sean un átomo de hidrógeno o un alquilo (C₁-C₈). Más preferentemente, R³ se elige de modo que sea un grupo metilo y R⁴ se elige de modo que sea un átomo de hidrógeno.

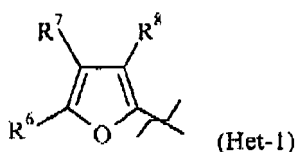
De acuerdo con la presente invención, el átomo de nitrógeno del resto carboxamida del compuesto de fórmula (I) está sustituido con R⁵, siendo R⁵ un átomo de hidrógeno, un alquilo (C₁-C₆) o un cicloalquilo (C₃-C₇). Preferentemente, el cicloalquilo (C₃-C₇) es ciclopropilo.

De acuerdo con la presente invención, "Het" en el compuesto de fórmula general (I) es un heterociclo no condensado de 5, 6 ó 7 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes, estando enlazado Het mediante un átomo de carbono y estando sustituido al menos en posición orto con Y^a, siendo Y^a tal como se ha definido anteriormente. Preferentemente, la presente invención también se refiere a derivados de N-(1-alkil-2-feniletíl)carboxamida de fórmula general (I) en la que las distintas características pueden elegirse por separado o en combinación, de modo que sean:

- con respecto a Het, Het se elige de modo que sea 2-furano, 3-furano, 4,5-dihidro-3-furano, 2-tiofeno, 3-tiofeno, 2-pirrol, 3-pirrol, 5-oxazol, 4-oxazol, 5-tiazol, 4-tiazol, 5-pirazol, 4-pirazol, 3-pirazol, 3-isoxazol, 4-isoxazol, 5-isoxazol, 3-isotiazol, 4-1,2,3-triazol, 4-tiadiazol, 5-tidiazol, 2-piridina, 3-piridina, 4-piridina, 2-oxatiina, 4,5-dihidro-3-pirano, 4,5-dihidro-2-tiopirano, 4,5-dihidro-3-tiopirano o 2-pirazina;
- con respecto a Y^a, Y^a se elige de modo que sea un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₈), un haloalquilo (C₁-C₈) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- con respecto a p, p es 1, 2 ó 3. Más preferentemente p es 1 ó 2; y
- con respecto a Y, Y se elige de modo que sea un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₆).

De acuerdo con la presente invención, "Het" en el compuesto de fórmula general (I) puede ser un heterociclo de cinco miembros anulares. Ejemplos específicos de compuestos de la presente invención en los que Het es un heterociclo de cinco miembros incluyen:

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-1)



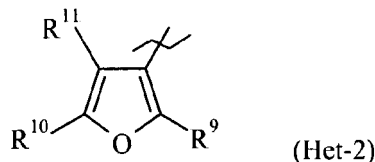
en la que

- R⁶ y R⁷ pueden ser iguales o diferentes y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo (C₁-C₄) o un haloalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y

ES 2 346 695 T3

- R^8 puede ser un átomo de halógeno, un grupo nitro, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

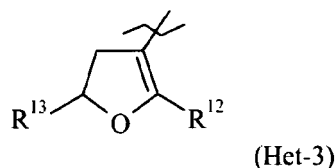
* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-2)



en la que:

- R^9 puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
 - R^{10} y R^{11} pueden ser iguales o diferentes y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- con la condición de que R^9 y R^{11} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

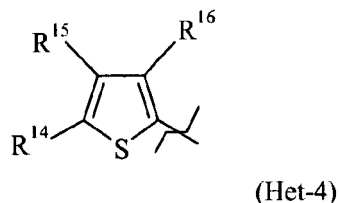
* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-3)



en la que:

- R^{12} puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R^{13} puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-4)

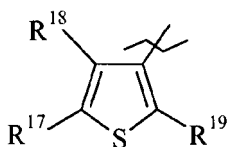


en la que:

- R^{14} y R^{15} pueden ser iguales o diferentes y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_4)-tio, un alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4) o un piridilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4); y
- R^{16} puede ser un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un haloalcoxi (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

ES 2 346 695 T3

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-5)



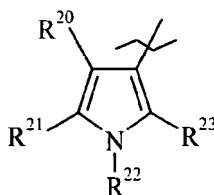
(Het-5)

en la que:

- R^{17} y R^{18} pueden ser iguales o diferentes y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4), un alquil (C_1-C_4)-oxi o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R^{19} puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

con la condición de que R^{18} y R^{19} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-6)



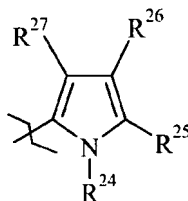
(Het-6)

en la que:

- R^{20} puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- R^{21} y R^{23} pueden ser iguales o diferentes y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R^{22} puede ser un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), un hidroxialquilo (C_1-C_4), un alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, un di(alquil (C_1-C_4))-aminosulfonilo, un alquil (C_1-C_6)-carbonilo, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4) o un benzoilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4);

con la condición de que R^{20} y R^{23} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-7)



(Het-7)

en la que:

- R^{24} puede ser un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), un hidroxialquilo (C_1-C_4), un alquil (C_1-C_4)-

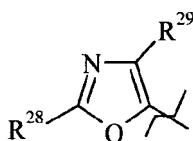
ES 2 346 695 T3

sulfonilo, un di(alquilo (C₁-C₄))-aminosulfonilo, un alquilo (C₁-C₆)-carbonilo, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄) o un benzoilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄);

- R²⁵, R²⁶ y R²⁷ pueden ser iguales o diferentes y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄) o un haloalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o alquilo (C₁-C₄)-carbonilo;

con la condición de que R²⁴ y R²⁷ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-8)

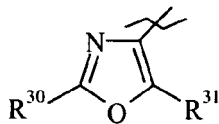


(Het-8)

en la que:

- R²⁸ puede ser un átomo de hidrógeno o un alquilo (C₁-C₄); y
- R²⁹ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un haloalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-9)

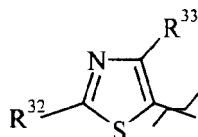


(Het-9)

en la que:

- R³⁰ puede ser un átomo de hidrógeno o un alquilo (C₁-C₄); y
- R³¹ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄), un haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄).

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-10)



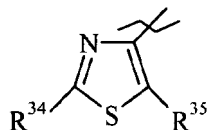
(Het-10)

en la que:

- R³² puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄)-amino, un di-(alquilo (C₁-C₄))-amino, un alquilo (C₁-C₄), un haloalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄); y
- R³³ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un haloalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

ES 2 346 695 T3

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-11)

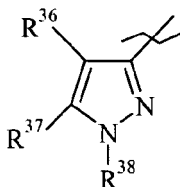


(Het-11)

en la que:

- R^{34} puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo ciano, un alquil (C_1-C_4)-amino, un di-(alquil (C_1-C_4))-amino, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R^{35} puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-12)

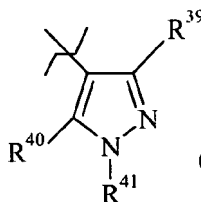


(Het-12)

en la que:

- R^{36} puede ser un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C_3-C_6), un alcoxi (C_1-C_4), un haloalcoxi (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_4)-tio, un haloalquil (C_1-C_4)-tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un grupo aminocarbonilo o un aminocarbonilalquilo (C_1-C_4);
- R^{37} puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo (C_1-C_4), un alcoxi (C_1-C_4) o un alquil (C_1-C_4)tio; y
- R^{38} puede ser un átomo de hidrógeno, un fenilo, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo (C_1-C_4), un alquenilo (C_2-C_6), un cicloalquilo (C_3-C_6), un alquil (C_1-C_4)-tio-alquilo (C_1-C_4), un haloalquil (C_1-C_4)-tio-alquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4) o haloalcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-13)



(Het-13)

en la que:

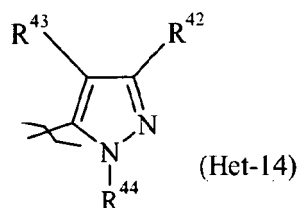
- R^{39} puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C_3-C_6), un alcoxi (C_1-C_4), un haloalcoxi (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_4)-tio, un haloalquil (C_1-C_4)-tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un grupo aminocarbonilo o un aminocarbonilalquilo (C_1-C_4);
- R^{40} puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un alcoxi (C_1-C_4) o un haloalcoxi (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o alquil (C_1-C_4)-tio;

ES 2 346 695 T3

- R^{41} puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo (C_1-C_4), un alquenilo (C_2-C_6), un cicloalquilo (C_3-C_6), un alquil (C_1-C_4)-tioalquilo (C_1-C_4), un haloalquil (C_1-C_4)-tioalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4) o haloalcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4), un alcoxi (C_1-C_4)-alquilo o un grupo nitro.

con la condición de que R^{39} y R^{40} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-14)

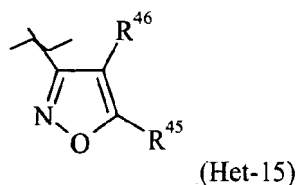


en la que:

- R^{42} puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C_3-C_6), un alcoxi (C_1-C_4), un haloalcoxi (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_4)-tio, un haloalquil (C_1-C_4)-tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un grupo aminocarbonilo o un aminocarbonilalquilo (C_1-C_4);
- R^{43} puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un alcoxi (C_1-C_4), un alquiltio (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- R^{44} puede ser un átomo de hidrógeno, un fenilo, un bencilo, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo (C_1-C_4), un alquenilo (C_2-C_6), un cicloalquilo (C_3-C_6), un alquil (C_1-C_4)-tioalquilo (C_1-C_4), un haloalquil (C_1-C_4)-tioalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), un haloalcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

con la condición de que R^{43} y R^{44} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

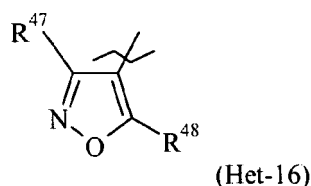
* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-15)



en la que:

- R^{45} puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R^{46} puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-16)

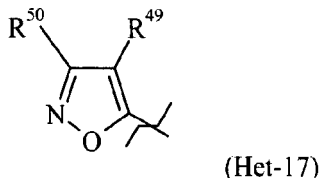


ES 2 346 695 T3

en la que R^{47} y R^{48} pueden ser iguales o diferentes y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4) o un heterociclo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4);

con la condición de que R^{47} y R^{48} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

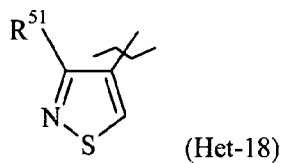
* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-17)



en la que

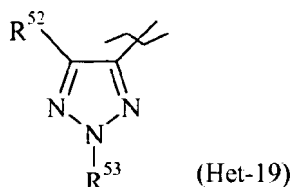
- R^{49} puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R^{50} puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-18)



en la que R^{51} puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

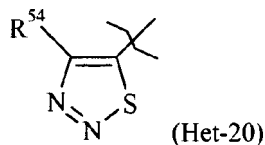
* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-19)



en la que:

- R^{52} puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R^{53} puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4).

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-20)

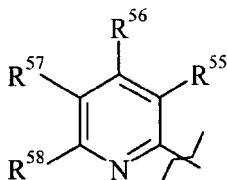


en la que R^{54} puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

ES 2 346 695 T3

De acuerdo con la presente invención, "Het", en el compuesto de fórmula general (I) puede ser un heterociclo de seis miembros anulares. Ejemplos específicos de compuestos de la presente invención en la que Het es un heterociclo de seis miembros incluyen:

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-21)

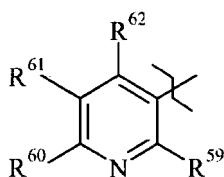


(Het-21)

en la que:

- R^{55} puede ser un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4), un alquil (C_1-C_4)-tio, un haloalquil (C_1-C_4)-tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un haloalcoxi (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- R^{56} , R^{57} y R^{58} , que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4), un alquil (C_1-C_4)-tio, un haloalcoxi (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de hidrógeno, un alquil (C_1-C_4)-sulfinilo o un alquil (C_1-C_4)-sulfonilo.

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-22)



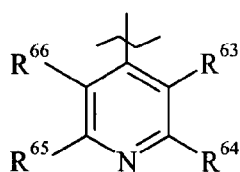
(Het-22)

en la que:

- R^{59} puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4), un alquil (C_1-C_5)-tio, un alquenil (C_2-C_5)-tio, un haloalquil (C_1-C_4)-tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un haloalcoxi (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4) o un feniltio opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4);
- R^{60} , R^{61} y R^{62} , que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4), un alquil (C_1-C_4)-tio, un haloalcoxi (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, un alquil (C_1-C_4)-sulfonilo o N-morfolina opcionalmente sustituida con un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4) o un tienilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4);

con la condición de que R^{59} y R^{62} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-23)



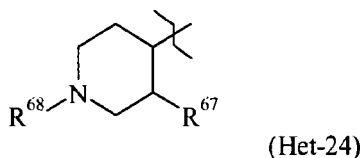
(Het-23)

ES 2 346 695 T3

en la que R^{63} , R^{64} , R^{65} y R^{66} , que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4), un alquil (C_1-C_4)-tio, un haloalquil (C_1-C_4)-tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, haloalcoxi (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un alquil (C_1-C_4)-sulfinilo o un alquilsulfonylo (C_1-C_4),

con la condición de que R^{63} y R^{66} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

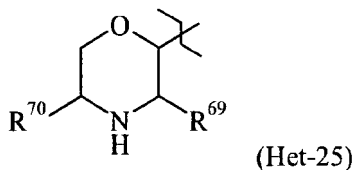
* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-24)



en la que:

- R^{67} puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- R^{68} puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_6)-carbonilo, un bencilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 átomos de halógeno, un benciloxycarbonilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 átomos de halógeno o un heterociclilo.

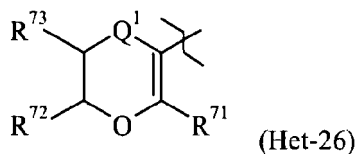
* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-25)



en la que:

- R^{69} puede ser un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4), un alquil (C_1-C_4)-tio, un haloalquil (C_1-C_4)-tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un haloalcoxi (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- R^{70} puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un bencilo; y

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-26)

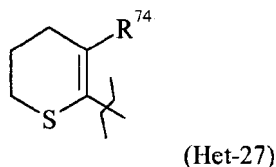


en la que:

- Q^1 puede ser un átomo de azufre, $-SO-$, $-SO_2-$ o $-CH_2-$;
- R^{71} puede ser un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R^{72} y R^{73} pueden ser iguales o diferentes y pueden ser un átomo de hidrógeno o un alquilo (C_1-C_4).

ES 2 346 695 T3

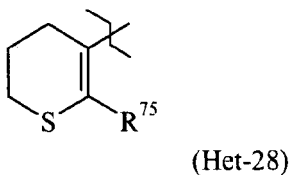
* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-27)



en la que:

- R^{74} puede ser un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y

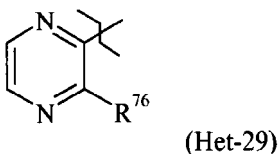
* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-28)



en la que:

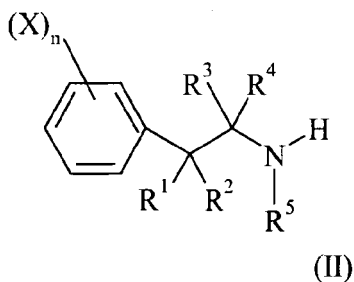
- R^{75} puede ser un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-29)

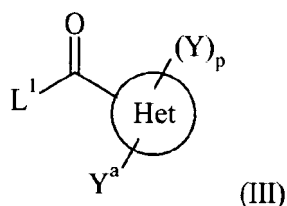


en la que R^{76} puede ser un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un haloalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

La presente invención se refiere también a un procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). Así, de acuerdo con otro aspecto de la presente invención se proporciona un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula general (I) que comprende hacer reaccionar un derivado de 1-alquil-2-feniletilamina de fórmula general (II) o una de sus sales

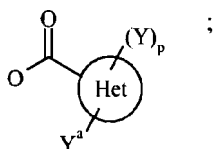


en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , X y n , son como se ha definido anteriormente; con un derivado de ácido carboxílico de la fórmula general (III)



en la que:

- Het, Y^a , Y y p son como se han definido anteriormente; y
- L^1 es un grupo saliente elegido de modo que sea un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, $-OR^{77}$, $-OCOR^{77}$, siendo R^{77} un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula

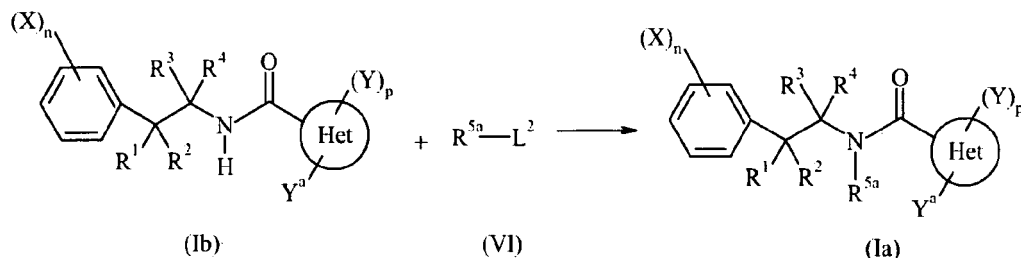


en presencia de un catalizador y, si L^1 es un grupo hidroxilo, en presencia de un agente condensante.

El procedimiento de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de un catalizador. Puede elegirse un catalizador adecuado de modo que sea 4-dimetil-aminopiridina, 1-hidroxibenzotriazol o dimetilformamida.

En caso de que L^1 sea un grupo hidroxilo, el procedimiento de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de un agente condensante. Puede elegirse un agente condensante adecuado de modo que sea un formador de haluros de ácidos, tal como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, tricloruro óxido de fósforo o cloruro de tionilo; formador de anhídrido, tal como cloroformato de etilo, cloroformato de metilo, cloroformato de isopropilo, cloroformato de isobutilo o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas, tales como N,N' -diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes condensantes habituales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N' -carbonil-diimidazol, 2-etoxi- N -etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano, hidrato de cloruro de 4-(4,6-dimetoxi[1.3.5]triazin-2-il)-4-metilmorfolinio o bromo-tripirrolidino-fosfonio-hexafluorofosfato.

Cuando R^5 es un átomo de hidrógeno, el procedimiento mencionado anteriormente para la preparación del compuesto de fórmula general (I) puede completarse opcionalmente mediante una etapa adicional de acuerdo con el siguiente esquema de reacción:



en el que:

- R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , X , n , Het, Y^a , Y y p son como se han definido anteriormente;
- L^2 es un grupo saliente elegido de modo que sea un átomo de halógeno, un 4-metilfenilsulfonilo o un metil-sulfonilo; y
- R^{5a} es un grupo alquilo (C_1-C_6) o un cicloalquilo (C_3-C_7);

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Ib) con un compuesto de fórmula general (VI) proporcionando un compuesto de fórmula general (Ia).

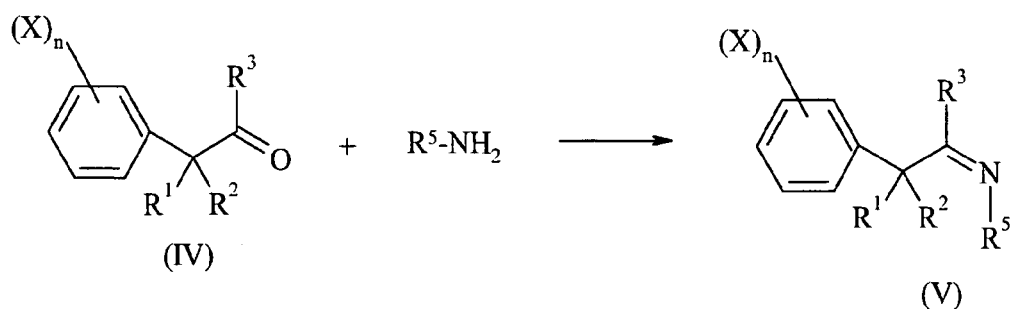
Dependiendo de la definición de R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , X y n , pueden prepararse derivados de amina de fórmula general (II) por medio de diferentes procedimientos. Un ejemplo (A) de tal procedimiento puede ser cuando:

- R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , X y n son como se han definido anteriormente; y
- R^4 es un átomo de hidrógeno;

entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) puede prepararse de acuerdo con un procedimiento que comprende:

- una primera etapa de acuerdo con el esquema de reacción A-1:

Esquema A-1

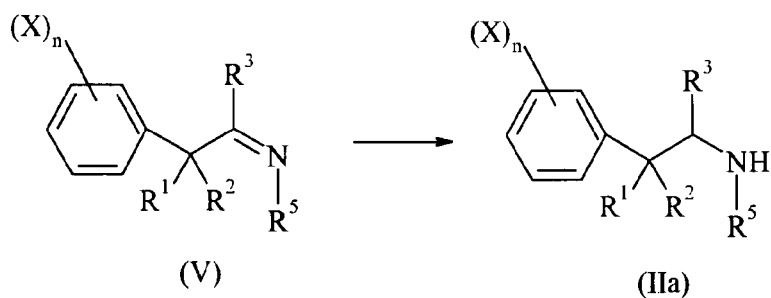


en el que R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , X y n son tal como se han definido anteriormente;

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (IV) con una amina de fórmula $R^5\text{-NH}_2$, proporcionando un derivado de imina de fórmula general (V);

- una segunda etapa de acuerdo con el esquema de A-2:

Esquema A-2



en el que R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , X y n son tal como se han definido anteriormente;

que comprende la reducción de un derivado de imina de fórmula general (V) por hidrogenación o mediante un donante de hidruros, en el mismo recipiente o en uno diferente, proporcionando un derivado de imina de fórmula general (IIa) o una de sus sales. Preferentemente, el donante de hidruros se elige de modo que sea un hidruro de metales o metaloides tal como LiAlH_4 , NaBH_4 , NaBH_3CN , KBH_4 , B_2H_6 .

El compuesto de acuerdo con la presente invención puede prepararse de acuerdo con los procedimientos generales de preparación descritos anteriormente. No obstante, se entiende que, sobre la base de sus conocimientos generales y de publicaciones disponibles, el operario experto será capaz de adaptar este procedimiento de acuerdo con la especificidad de cada uno de los compuestos, lo que es deseable para su síntesis.

Sobre la base de sus conocimientos generales y de publicaciones disponibles, el operario experto también será capaz de preparar compuestos intermedios de fórmula (V) de acuerdo con la presente invención.

La presente invención también se refiere a una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un material activo de fórmula general (I). De este modo, de acuerdo con la presente invención, se proporciona una composición fungicida que comprende, como ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula general (I) tal como se ha definido anteriormente y un soporte, vehículo o carga agrícolamente aceptable.

En la presente memoria descriptiva, el término “soporte” designa un material natural o sintético, orgánico o inorgánico, con el cual se combina el material activo para facilitar la aplicación, de forma notable a las partes de la planta. Este soporte es, por lo tanto, generalmente inerte y deberá ser agrícolamente aceptable. El soporte puede ser un sólido o un líquido. Los ejemplos de soportes adecuados incluyen arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, agua, alcoholes, en particular butanol, disolventes orgánicos, aceites minerales o vegetales y sus derivados. También pueden usarse mezclas de tales soportes.

La composición puede comprender también componentes adicionales. En particular, la composición puede comprender adicionalmente un tensioactivo. El tensioactivo puede ser un emulsionante, un agente dispersante o un agente humectante de tipo iónico o no iónico o una mezcla de tales tensioactivos. Puede hacerse mención, por ejemplo, de sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (en particular alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (en particular tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polioxietilados, ésteres de ácido graso de polioles y derivados de los compuestos anteriores que contienen funciones sulfato, sulfonato y fosfato. La presencia de al menos un tensioactivo es esencial, generalmente, cuando el material activo y/o el soporte inerte son insolubles en agua y cuando el agente vector para la aplicación es agua. Preferentemente, el contenido de tensioactivo puede comprender entre el 5% y el 40% en peso de la composición.

Opcionalmente, pueden incluirse también otros componentes adicionales, por ejemplo coloides protectores, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, penetrantes, estabilizantes, secuestrantes. De forma más general, los materiales activos pueden combinarse con cualquier aditivo sólido o líquido que satisfaga las técnicas de formulación habituales.

En general, la composición de acuerdo con la invención puede contener entre el 0,05 y el 99% (en peso) de material activo, preferentemente entre el 10 y el 70% en peso.

Las composiciones de acuerdo con la presente invención pueden usarse en formas variadas, tales como dispensador de aerosol, suspensión en cápsula, concentrado de niebla fría, polvo espolvoreable, concentrado emulsionante, emulsión de aceite en agua, emulsión de agua en aceite, gránulo encapsulado, gránulo fino, concentrado fluidizable para el tratamiento de semillas, gas (bajo presión), producto generador de gas, gránulo, concentrado de niebla caliente, macrogránulo, microgránulo, polvo dispersable en aceite, concentrado fluidizable miscible en aceite, líquido miscible en aceite, pasta, varilla para plantas, polvo para tratamiento de semillas en seco, semillas recubiertas con un pesticida, concentrado soluble, polvo soluble, solución para tratamiento de semillas, concentrado de suspensión (concentrado fluidizable), líquido de volumen ultra bajo (ULV), suspensión de volumen ultra bajo (ULV), gránulos o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento de suspensión, gránulos o comprimidos solubles en agua, polvo soluble en agua para tratamiento de semillas y polvo humectable.

Estas composiciones incluyen no sólo composiciones preparadas para aplicar a las plantas o semillas que hay que tratar por medio de dispositivos adecuados, tales como dispositivos para pulverizar o espolvorear, sino también composiciones comerciales concentradas que deben diluirse antes de la aplicación al cultivo.

Los compuestos de la invención también pueden mezclarse con uno o más insecticidas, fungicidas, bactericidas, atrayentes, acaricidas o feromonas u otros compuestos con actividad biológica. Las mezclas obtenidas de este modo tienen un espectro de actividad ampliado. Las mezclas con otros fungicidas son particularmente ventajosas. Ejemplos de asociados de mezcla fungicidas adecuados pueden seleccionarse de la siguiente lista:

- 1) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de ácido nucleico tal como benalaxilo, benalaxilo-M, bupirimato, quiralaxilo, clozilacon, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxilo, metalaxilo-M, ofurace, oxadixilo y ácido oxolínico;
- 2) un compuesto capaz de inhibir la mitosis y la división celular tal como benomilo, carbendazim, dietofencarb, etaboxam, fuberidazol, pencicuron, tiabendazol, tiofanato-metilo y zoxamida;
- 3) un compuesto capaz de inhibir la respiración, por ejemplo
 - como inhibidor de la respiración tal como diflumentorim;
 - como inhibidor de la respiración CII tal como boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanilo, furametpir, furmeciclox, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tiofluzamida;
 - como inhibidor de la respiración CIII tal como amisulbrom, azoxistrobina, ciazofamid, dimoxistrobina, enestroburina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominoestrobina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, piribencarb, trifloxistrobina;

ES 2 346 695 T3

- 4) un compuesto capaz de actuar como desacoplador tal como dinocap, dluazinam, meptildinocap;
- 5) un compuesto capaz de inhibir la producción ATP tal como acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, siltiofam;
- 6) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de aminoácidos y proteínas tal como andoprim, blasticidina-S, ciprodinilo, kasugamicina, kasugamicina clorhidrato hidrato, mepanipirim y pirimetanilo;
- 7) un compuesto capaz de inhibir la transducción de señal tal como fenciclonilo, fludioxonilo, quinoxifeno;
- 8) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de lípidos y la membrana tal como bifenilo, clozolinato, edifenfos, etridiazol, iodicarb, iprobenfos, iprodiona, isoprotiolano, procimidona, propamocarb, propamocarb clorhidrato, pirazofos, tolclofos-metilo y vinclozolina.
- 9) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de ergosterol tal como aldimorf, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, dodemorf, acetato de dodemorf, epoxiconazol, etaconazol, fenarimol, fenbuconazol, fenhexamid, fenpropidina, fenpropimorf, fluquinconazol, flurprimidol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, naftifina, nuarimol, oxpoconazol, paclobutrazol, pefurazolato, penconazol, procloraz, propiconazol, protioconazol, piributicarb, pirifenox, simeconazol, espiroxamina, tebuconazol, terbufina, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, tridemorf, triflumizol, triforina, triticonazol, uni-conazol, viniconazol, voriconazol.
- 10) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de la pared celular tal como bentiavalicarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas, polioxorim, validamicina A;
- 11) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de melanina tal como carpropamid, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, piroquilon, triciclazol;
- 12) un compuesto capaz de inducir una defensa en el huésped tal como acibenzolar-S-metilo, probenazol, tianidilo;
- 13) un compuesto capaz de tener una acción en múltiples sitios, como, por ejemplo, mezcla burdeos, captafol, captan, clorotalonilo, naftenato de cobre, óxido de cobre, oxiclورو de cobre, preparaciones de cobre tales como hidróxido de cobre, sulfato de cobre, diclofluanid, ditianon, dodina, base exenta de dodina, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, mancozeb, mancozeb, maneb, metiram, metiram cinc, oxina-cobre, propineb, azufre y preparaciones de azufre, incluidos polisulfuro de calcio, tiram, tolfluanida, zineb y ziram.
- 14) un compuesto seleccionado de la lista siguiente: (2E)-2-(2-([6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi)fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (2E)-2-{2-[(1E)-1-(3-[(E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi)fenil]etilideno]amino}oxi)metil]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxilato, 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)nicotinamida, 2-fenilfenol y sales, 3,4,5-tricloropiridina-2,6-dicarbonitrilo, 3,4-dicloro-N-(2-cianofenil)isotiazol-5-carboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, sulfato de 8-hidroquinolina, bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvona, quinometionato, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanilo, dazomet, debacarb, diclorofen, diclomezina, dicloran, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, ferimzona, flumetover, fluopicolida, fluoroimida, flusulfamida, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, hexaclorobenceno, irumamicina, isotianilo, metasulfocarb, (2E)-2-{2-[(ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio)metil]fenil}-3-metoxiacrilato de metilo, 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, isotiocianato de metilo, metrafenona, mildiomicina, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxibenzamida, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metilbencenosulfonamida, N-(4-clorobencil)-3[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloronicotinamida, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodonicotinamida, N-[2-(4-{[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi}-3-metoxifenil)etil]-N<-(metilsulfonil)valinamida, N-{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-fenilacetamida, N-{2-1,1'-bi(ciclopropil)-2-il}fenil}-3-(difluorometil)benzamida, 1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluorometil)benzamida, natamicina, N-etil-N-metil-N'-{2-metil-5-(difluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}imidaformamida, N-etil-N-metil-N'-12-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}imidaformamida, dimetilditiocarbamato de níquel, nitroal-isopropilo, 1H-imidazolo-1-carbotioato de O-{1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropilo}, octilina, oxamocarb, oxifentina, pentaclorofenol y sales, ácido fosforoso y sus sales, piperalina, fosetilato de propamocarb, propanosina-sodio, proquinazid, pirrolnitrina, quintoceno, tecloftalam, tecnaceno, triazoxido, triclamida, valifenal y zarilamida.

La composición de acuerdo con la invención que comprende una mezcla de un compuesto de fórmula (I) con un compuesto bactericida también puede ser particularmente ventajosa. Ejemplos de asociados de mezcla bactericidas adecuados pueden seleccionarse de la siguiente lista: bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilina, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomicina, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Las composiciones fungicidas de la presente invención pueden usarse para controlar curativa o preventivamente hongos fitopatógenos de cultivos. De este modo, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento para controlar curativa o preventivamente hongos fitopatógenos de cultivos caracterizado porque se aplica una composición fungicida tal como se ha definido anteriormente a la semilla, la planta y/o al fruto de la planta o al suelo en el que crece la planta o en el que se desea que crezca.

La composición tal como se usa contra hongos fitopatógenos de cultivos comprende una cantidad eficaz y no fitotóxica de un material activo de fórmula general (I).

La expresión “cantidad eficaz y no fitotóxica” significa una cantidad de composición de acuerdo con la invención que es suficiente para controlar o destruir los hongos presentes o propensos a aparecer en cultivos y que no conlleva ningún síntoma apreciable de fitotoxicidad para dichos cultivos. Una cantidad tal puede variar dentro de un intervalo amplio dependiendo del hongo a controlar, el tipo de cultivo, las condiciones climáticas y los compuestos incluidos en la composición fungicida de acuerdo con la invención.

Esta cantidad puede determinarse mediante ensayos de campo sistemáticos, los cuales están dentro de las capacidades de un experto en la técnica.

El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la presente invención es útil para tratar material de propagación tal como tubérculos o rizomas, pero también semillas, plántulas o plántulas para transplantar y plantas o plantas para transplantar. Este procedimiento de tratamiento también puede ser útil para tratar raíces. El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la invención también puede ser útil para tratar las partes aéreas de la planta tales como troncos, tallos o cañas, hojas, flores y frutos de las plantas implicadas.

Entre las plantas que pueden protegerse por medio del procedimiento de acuerdo con la presente invención, pueden mencionarse algodón, lino, vides, cultivos frutales u hortalizas tales como *Rosaceae* sp. (por ejemplo fruta de pepita, tal como manzanas y peras, pero también fruta de hueso, tal como albaricoques, cerezas, almendras y melocotones), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (por ejemplo árboles y plantaciones de bananas), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (por ejemplo limones, naranjas y pomelo), *Solanaceae* sp. (por ejemplo tomates), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (por ejemplo lechugas), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (por ejemplo guisantes), *Rosaceae* sp. (por ejemplo fresas); cultivos de gran importancia tales como *Graminae* sp. (por ejemplo maíz, césped o cereales tales como trigo, arroz, cebada y triticales), *Asteraceae* sp. (por ejemplo girasol), *Cruciferae* sp. (por ejemplo colza), *Fabaceae* sp. (por ejemplo cacahuetes), *Papilionaceae* sp. (por ejemplo soja), *Solanaceae* sp. (por ejemplo patatas), *Chenopodiaceae* sp. (por ejemplo remolacha de mesa); cultivos hortalizas y silvícolas; así como homólogos de estos cultivos genéticamente modificados.

Entre las enfermedades de plantas o cultivos que pueden combatirse usando los procedimientos de acuerdo con la invención, pueden mencionarse:

enfermedades por mildiú pulverulento tales como:

enfermedades por *Blumeria*, causadas por ejemplo por *Blumeria graminis*;

enfermedades por *Podosphaera*, causadas por ejemplo por *Podosphaera leucotricha*;

enfermedades por *Sphaerotheca*, causadas por ejemplo por *Sphaerotheca fuliginea*;

enfermedades por *Uncinula*, causadas por ejemplo por *Uncinula necator*;

enfermedades de la roya tales como:

enfermedades por *Gymnosporangium*, causadas por ejemplo por *Gymnosporangium sabinae*;

enfermedades por *Hemileia*, causadas por ejemplo por *Hemileia vastatrix*;

enfermedades por *Phakopsora*, causadas por ejemplo por *Phakopsora pachyrhizi* o *Phakopsora meibomia*;

enfermedades por *Puccinia*, causadas por ejemplo por *Puccinia recondita*;

enfermedades por *Uromyces*, causadas por ejemplo por *Uromyces appendiculatus*;

ES 2 346 695 T3

enfermedades por oomicetos tales como:

enfermedades por *Bremia*, causadas por ejemplo por *Bremia lactucae*;

enfermedades por *Peronospora*, causadas por ejemplo por *Peronospora pisi* o *Peronospora brassicae*;

enfermedades por *Phytophthora*, causadas por ejemplo por *Phytophthora infestans*;

enfermedades por *Plasmopara*, causadas por ejemplo por *Plasmopara viticola*;

enfermedades por *Pseudoperonospora*, causadas por ejemplo por *Pseudoperonospora humuli* y *Pseudoperonospora cubensis*;

enfermedades por *Pythium* causadas por ejemplo por *Pythium ultimum*;

enfermedades de la roncha foliar, la mancha foliar y el tizón foliar tales como:

enfermedades por *Alternaria*, causadas por ejemplo por *Alternaria solani*;

enfermedades por *Cercospora*, causadas por ejemplo por *Cercospora beticola*;

enfermedades por *Cladosporium*, causadas por ejemplo por *Cladosporium cucumerinum*;

enfermedades por *Cochliobolus*, causadas por ejemplo por *Cochliobolus sativus*;

enfermedades por *Colletotrichum*, causadas por ejemplo por *Colletotrichum lindemuthianum*;

enfermedades por *Cycloconium*, causadas por ejemplo por *Cycloconium oleaginum*;

enfermedades por *Diaporthe*, causadas por ejemplo por *Diaporthe citri*;

enfermedades por *Elsinoe*, causadas por ejemplo por *Elsinoe fawcettii*;

enfermedades por *Gloeosporium*, causadas por ejemplo *Gloeosporium laeticolor*;

enfermedades por *Glomerella*, causadas por ejemplo *Glomerella cingulata*;

enfermedades por *Guignardia*, causadas por ejemplo por *Guignardia bidwellii*;

enfermedades por *Leptosphaeria*, causadas por ejemplo por *Leptosphaeria maculans*; *Leptosphaeria nodorum*;

enfermedades por *Magnaporthe*, causadas por ejemplo por *Magnaporthe grisea*;

enfermedades por *Mycosphaerella*, causadas por ejemplo por *Mycosphaerella graminicola*; *Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;

enfermedades por *Phaeosphaeria*, causadas por ejemplo por *Phaeosphaeria nodorum*;

enfermedades por *Pyrenophora*, causadas por ejemplo por *Pyrenophora teres*;

enfermedades por *Ramularia*, causadas por ejemplo por *Ramularia collo-cygni*;

enfermedades por *Rhynchosporium*, causadas por ejemplo por *Rhynchosporium secalis*;

enfermedades por *Septoria*, causadas por ejemplo por *Septoria apii* o *Septoria lycopersici*;

enfermedades por *Typhula*, causadas por ejemplo por *Typhula incarnata*;

enfermedades por *Venturia*, causadas por ejemplo por *Venturia inaequalis*;

enfermedades de la raíz y el tallo tales como:

enfermedades por *Corticium*, causadas por ejemplo por *Corticium graminearum*;

enfermedades por *Fusarium*, causadas por ejemplo por *Fusarium oxysporum*;

ES 2 346 695 T3

enfermedades por *Gaeumannomyces*, causadas por ejemplo por *Gaeumannomyces graminis*;

enfermedades por *Rhizoctonia*, causadas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;

enfermedades por *Tapesia*, causadas por ejemplo por *Tapesia acuformis*;

enfermedades por *Thielaviopsis*, causadas por ejemplo por *Thielaviopsis basicola*;

enfermedades de la espiga y la mazorca tales como:

enfermedades por *Alternaria* causadas por ejemplo por *Alternaria spp.*;

enfermedades por *Aspergillus* causadas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;

enfermedades por *Cladosporium*, causadas por ejemplo por *Cladosporium spp.*;

enfermedades por *Claviceps* causadas por ejemplo por *Claviceps purpurea*;

enfermedades por *Fusarium*, causadas por ejemplo por *Fusarium culmorum*;

enfermedades por *Gibberella*, causadas por ejemplo por *Gibberella zeae*;

enfermedades por *Monographella*, causadas por ejemplo por *Monographella nivalis*;

enfermedades del tizón y el hollín tales como:

enfermedades por *Sphacelotheca*, causadas por ejemplo por *Sphacelotheca reiliana*;

enfermedades por *Tilletia*, causadas por ejemplo por *Tilletia caries*;

enfermedades por *Urocystis*, causadas por ejemplo por *Urocystis occulta*;

enfermedades por *Ustilago*, causadas por ejemplo por *Ustilago nuda*;

enfermedades de la podredumbre y el moho de la fruta tales como:

enfermedades por *Aspergillus*, causadas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;

enfermedades por *Botrytis*, causadas por ejemplo por *Botrytis cinerea*;

enfermedades por *Penicillium*, causadas por ejemplo por *Penicillium expansum*;

enfermedades por *Sclerotinia* causadas por ejemplo por *Sclerotinia sclerotiorum*;

enfermedades por *Verticillium* causadas por ejemplo por *Verticillium alboatrum*;

enfermedades de deterioración, moho, marchitado, podredumbre y caída de plántulas transmitidas por las semillas o el suelo:

enfermedades por *Fusarium*, causadas por ejemplo por *Fusarium culmorum*;

enfermedades por *Phytophthora*, causadas por ejemplo por *Phytophthora cactorum*;

enfermedades por *Pythium*, causadas por ejemplo por *Pythium ultimum*;

enfermedades por *Rhizoctonia*, causadas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;

enfermedades por *Sclerotium*, causadas por ejemplo por *Sclerotium rolfsii*;

enfermedades por *Microdochium*, causadas por ejemplo por *Microdochium nivale*;

enfermedades de cancro, escoba y acrenosis tales como:

enfermedades por *Nectria*, causadas por ejemplo por *Nectria galligena*;

enfermedades del tizón tales como:

enfermedades por *Monilinia*, causadas por ejemplo por *Monilinia laxa*;

enfermedades de la ampolla de la hoja y el rizado de la hoja tales como:

enfermedades por *Taphrina*, causadas por ejemplo por *Taphrina deformans*;

enfermedades de declive de plantas leñosas tales como:

enfermedades por Esca, causadas por ejemplo por *Phaemoniella clamydospora*;

enfermedades de flores y semillas tales como:

enfermedades por *Botrytis*, causadas por ejemplo por *Botrytis cinerea*;

enfermedades de tubérculos tales como:

enfermedades por *Rhizoctonia*, causadas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*.

La composición fungicida de acuerdo con la presente invención puede usarse también contra enfermedades fúngicas propensas a desarrollarse sobre o en el interior de la madera. El término “madera” significa todos los tipos de especies de madera y todos los tipos de procesamiento de esta madera destinados a la construcción, por ejemplo madera sólida, madera de alta densidad, madera laminada y madera contrachapada. El procedimiento para tratar madera de acuerdo con la invención consiste principalmente en ponerla en contacto con uno o más compuestos de acuerdo con la invención, o una composición de acuerdo con la invención; esto incluye por ejemplo aplicación directa, pulverización, inmersión, inyección o cualquier otro medio adecuado.

La dosis de material activo que se aplica habitualmente en el tratamiento de acuerdo con la presente invención este generalmente y ventajosamente entre 10 y 800 g/ha, preferentemente entre 50 y 300 g/ha para aplicaciones en tratamiento foliar. La dosis de sustancia activa que se aplica está generalmente y ventajosamente entre 2 y 200 g por cada 100 kg de semillas, preferentemente entre 3 y 150 g por cada 100 kg de semillas, en el caso de tratamiento de semillas. Se entiende claramente que las dosis indicadas anteriormente se dan como ejemplos ilustrativos de la invención. Un experto en la técnica sabrá como adaptar las dosis de aplicación, en particular de acuerdo con la naturaleza de la planta o cultivo que hay que tratar.

La composición fungicida de acuerdo con la presente invención también puede usarse en el tratamiento de organismos genéticamente modificados con los compuestos de acuerdo con la invención o composiciones agroquímicas de acuerdo con la invención. Plantas genéticamente modificadas son plantas en cuyo genoma se ha integrado de forma estable un gen heterólogo que codifica una proteína de interés. La expresión “gen heterólogo que codifica una proteína de interés” significa esencialmente genes que confieren a la planta transformada propiedades agronómicas novedosas, o genes que mejoran la calidad agronómica de la planta transformada.

Las composiciones de acuerdo con la invención pueden usarse también para la preparación de una composición útil para tratar de forma curativa o preventiva enfermedades fúngicas animales o humanas tales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, enfermedades por trichophyton y candidiasis o enfermedades causadas por *Aspergillus spp.*, por ejemplo *Aspergillus fumigatus*.

Los aspectos de la presente invención se ilustrarán a continuación con referencia a las tablas siguientes de compuestos y ejemplos. La tabla siguiente ilustra de un modo no limitante ejemplos de compuestos fungicidas de acuerdo con la presente invención. En los ejemplos siguientes, M+1 (o M-1) significa el pico del ion molecular, más o menos 1 u.m.a. (unidad de masa atómica) respectivamente, tal como se observa en espectroscopía de masas y M (Apcl+) significa el pico del ion molecular tal como se encontró por ionización química positiva a presión atmosférica en espectroscopía de masas.

Tabla A

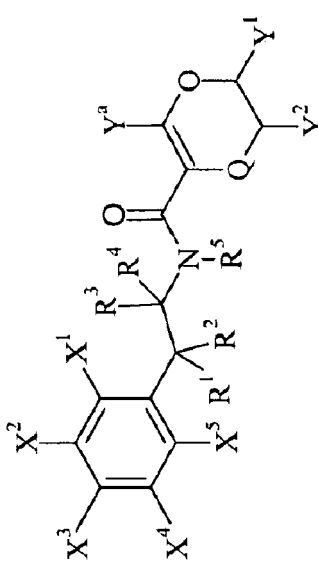
													
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	Q	Y ^a	(M+1)
A-1	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	H	s	CF ₃	406
A-2	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	H	s	Me	352

Tabla B

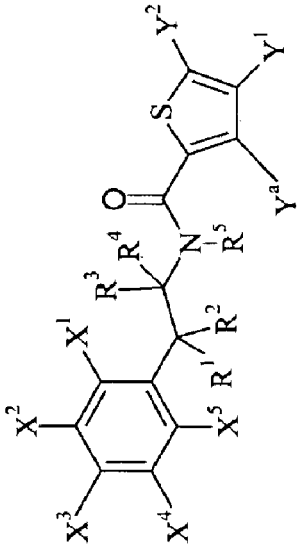
											
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	(M+1)
B-1	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	H	358
B-2	H	H	Me	H	ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	445
B-3	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	H	406
B-4	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	H	294

Tabla C

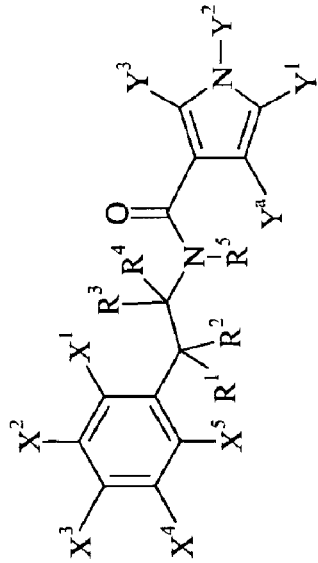
															
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	(M+1)
C-1	H	H	Me	H	ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	CF ₃	H	Me	H	384
C-2	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	H	CF ₃	H	Me	H	345

Tabla D

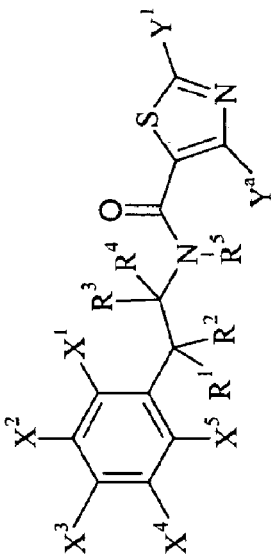
												
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	Y ^a	(M+1)
D-1	H	H	Me	H	ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	CF ₃	403
D-2	H	H	Me	H	ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	CHF ₂	385
D-3	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	H	CHF ₂	345

Tabla E

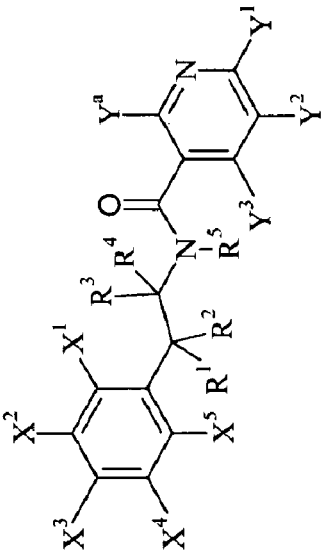
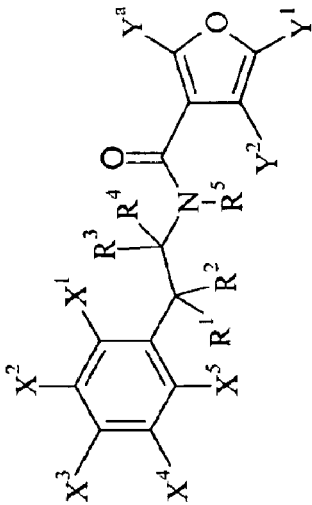
											
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	(M+1)
E-1	H	H	Me	H	H	H	H	H	H	H	348

Tabla F

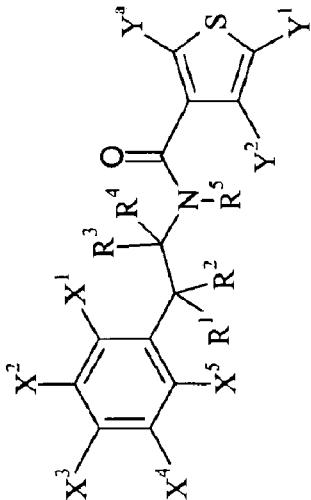
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	(M+1)
F-1	H	H	Me	H	ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	CF ₃	H	Me	386
F-2	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	H	CHF ₂	H	Me	328
F-3	H	H	Me	H	ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	CHF ₂	H	Me	368
F-3	H	H	Me	H	ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	OMe	H	Me	348
F-4	H	H	Me	H	ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	OEt	H	Me	362
F-5	H	H	Me	H	ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	Me	F	Me	349

Tabla G



Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	(M+1)
G-1	H	H	Me	H	ciclopropilo	H	H	H	Cl	H	Me	H	H	317
G-2	H	H	Me	H	H	H	H	H	Cl	H	Me	H	H	278

Tabla H

														
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	X ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	(M+1)
H-1	H	H	Me	H	ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	Br	H	H	399
H-2	H	H	Me	H	ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	Me	H	H	334
H-3	H	H	Me	H	ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	I	H	H	446

Ejemplos de procedimientos para la preparación del compuesto de fórmula general (I)*Preparación de 3-bromo-N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]tiofeno-2-carboxamida (Compuesto B-1)*

5 Se diluyen 140 mg de clorhidrato de 1-(4-clorofenil)propan-2-amina (0,70 mmol) y 0,107 ml de trietilamina (0,77 mmol) en 4 ml de THF a temperatura ambiente; se añaden a la mezcla de reacción 173 mg de cloruro de 3-bromotiofeno-2-carbonilo (0,77 mmol) en solución en 4 ml de THF.

10 Después de agitar durante 48 horas, la mezcla de reacción se filtra sobre alumina básica y después se concentra hasta sequedad proporcionando 0,18 g de 3-bromo-N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]tiofeno-2-carboxamida esencialmente pura (rendimiento = 64%).

$$[M + 1] = 358.$$

15 *Preparación de 2-bromo-N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]-N-ciclopropiltiofeno-3-carboxamida (Compuesto H-1)**Preparación de clorhidrato N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]ciclopropanamina*

20 Se mezclan bajo argón, en 150 ml de metanol, 10,1 g de ciclopropilamina (0,177 mol) y 12,6 ml de ácido acético (0,221 mol). Después se añaden 15,0 g de 1-(4-clorofenil)acetona (0,088 mol) y 15 g de filtros moleculares de 3 Å. La mezcla de reacción se somete a reflujo durante 3 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, se añaden 8,34 g de cianoborohidruro de sodio (0,13 mol) a la mezcla de reacción, que se somete de nuevo a reflujo durante 3 horas. Después de una noche a temperatura ambiente, se añaden 3 g de cianoborohidruro (0,048 mol) y 8 ml de ácido acético (0,126 mol) a la mezcla de reacción, que se somete a reflujo durante tres horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, se añaden 250 ml de diclorometano y 400 ml de NaOH 1 M a la mezcla de reacción.

30 Después de la separación, la fase acuosa se extrae con 250 ml de diclorometano, las fases orgánicas combinadas se lavan con 1.550 ml de agua y 200 ml de salmuera. Después de secar sobre sulfato de magnesio, filtrar y concentrar, la amina bruta se precipita con HCl 2 M en éter proporcionando 19,06 g de clorhidrato de N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]ciclopropanamina (rendimiento = 88%).

$$[M+1-HCl]=210.$$

35 *Preparación de 2-bromo-N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]-N-ciclopropiltiofeno-3-carboxamida*

40 Se someten a reflujo 300 mg de clorhidrato de N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]ciclopropanamina (1,218 mmol), 265 mg de ácido 2-bromotiofeno-3-carboxílico (1,28 mmol), 16 mg de 1-hidroxibenzotriazol (0,12 mmol), 256 mg de clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (1,34 mmol) y 0,171 ml de TEA (1,22 mmol) en 10 ml de diclorometano durante una hora. Después de 48 horas a temperatura ambiente, la reacción se inactiva con 5 ml de HCl 0,5 M.

45 Después de la separación, la fase orgánica se lava con 5 ml de agua y 5 ml de solución saturada de bicarbonato de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio, se filtra y se concentra al vacío. El producto bruto se somete a cromatografía ultrarrápida sobre sílice con heptano/EtOAc proporcionando 190 mg de 2-bromo-N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]-N-ciclopropiltiofeno-3-carboxamida (rendimiento = 39%).

$$[M+1]=399.$$

50 **Ejemplos de actividad biológica del compuesto de fórmula general (I)****Ejemplo A***Ensayo en vivo de Alternaria brassicae (mancha foliar de crucíferas)*

55 Los ingredientes activos analizados se preparan mediante homogeneización en una mezcla de acetona/tween/DMSO; después se diluyen con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

60 Se tratan plantas de rábano (variedad Pernot) en el estadio de cotiledones, sembradas sobre sustrato de suelo de turba/puzolana 50/50 en macetas de siembra y cultivadas a 18-20°C, pulverizando con el ingrediente activo preparado tal como se ha descrito anteriormente.

Las plantas que se usaron como controles se tratan con una mezcla de acetona/tween/DMSO/agua exenta de material activo.

65 Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria brassica* (40.000 esporas por cm³). Las esporas se recogen de un cultivo de 12 a 13 días de edad.

ES 2 346 695 T3

Las plantas de rábano contaminadas se incuban durante 6-7 días a aproximadamente 18°C, en atmósfera húmeda.

La evaluación se realiza de 6 a 7 días después de la contaminación, mediante comparación con las plantas control.

- 5 En estas condiciones, se observa una protección buena (al menos el 70%) o total a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: B-1, B-2, B-4, C-1, C-2, D-2, D-3, F-2, F-3, F-4, F-6, F-7, G-2 y H-1.

Ejemplo B

- 10 *Ensayo en vivo de Botrytis cinerea (moho gris del pepino)*

Los ingredientes activos analizados se preparan mediante homogeneización en una mezcla de acetona/tween/DMSO; después se diluyen con agua para obtener el material activo deseado.

- 15 Se tratan plantas de pepinillo (variedad Vert petit de Paris) en el estadio de cotiledones Z11, sembradas sobre sustrato de suelo de turba/puzolana 50/50 en macetas de siembra y cultivadas a 18-20°C, pulverizando con el ingrediente activo preparado tal como se ha descrito anteriormente.

- 20 Las plantas que se usan como controles se tratan con una mezcla de acetona/tween/DMSO/agua exenta de material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan depositando gotas de suspensión acuosa de esporas de *Botrytis cinerea* (150.000 esporas por ml) sobre la superficie del anverso de las hojas. Las esporas se recogen de un cultivo de 15 días de edad y se suspenden en una solución de nutrientes compuesta por:

- 25 20 g/l de gelatina
50 g/l de azúcar de caña
30 2 g/l de NH_4NO_3
1 g/l de KH_2PO_4

- 35 Las plantas de pepino contaminadas se mantienen durante 5/7 días en una cámara climática a 15-11°C (día/noche) y al 80% de humedad relativa.

La evaluación se realiza 5/7 días después de la contaminación, mediante comparación con las plantas control. En estas condiciones, se observa una protección buena (al menos el 50%) o total a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: B-1, C-2, D-3, F-2, F-6 y G-2.

- 40 Ejemplo C

Ensayo en vivo de Sphaerotheca fuliginea (mildíu pulverulento de calabaza)

- 45 Los ingredientes activos analizados se preparan mediante homogeneización en una mezcla de acetona/tween/DMSO; después se diluyen con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

- 50 Se tratan plantas de pepinillo (variedad Vert petit de Paris) en el estadio de dos hojas, sembradas sobre sustrato de suelo de turba/puzolana 50/50 en macetas de siembra y cultivadas a 20°C/23°C, pulverizando con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las plantas que se usan como controles, se tratan con la mezcla de acetona/tween/DMSO/agua exenta de material activo.

- 55 Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Sphaerotheca fuliginea* (100.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de plantas contaminadas. Las plantas de pepinillo contaminadas se incuban a aproximadamente 20°C/25°C y al 60/70% de humedad relativa.

La evaluación (% de eficacia) se realiza 21 días después de la contaminación, mediante comparación con las plantas control.

- 60 En estas condiciones, se observa una protección buena (al menos el 70%) o total a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: B-3, D-1, D-2, F-2, F-3, F-4 y F-6.

Ejemplo D

- 65 *Ensayo en vivo de Mycosphaerella graminicola (mancha foliar de trigo)*

Los ingredientes activos analizados se preparan mediante homogeneización en una mezcla de acetona/tween/DMSO; después se diluyen con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

ES 2 346 695 T3

Se tratan plantas de trigo (variedad Scipion) en el estadio 1 hoja (10 cm de altura), sembradas sobre sustrato de suelo de turba/puzolana 50/50 en macetas de siembra y cultivadas a 12°C, pulverizando con el ingrediente activo preparado tal como se ha descrito anteriormente.

Las plantas que se usan como controles se tratan con una mezcla de acetona/tween/DMSO/agua exenta de material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Mycosphaerella graminicola* (500.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de un cultivo de 7 días de edad. Las plantas de trigo contaminadas se incuban durante 72 horas a 18°C y al 100% de humedad relativa, y después durante 21 a 28 días al 90% de humedad relativa.

La evaluación (% de eficacia) se realiza de 21 a 28 días después de la contaminación, mediante comparación con las plantas control.

En estas condiciones, se observa una protección buena (al menos el 70%) o total:

- a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: B-1, C-2, D-3, F-5 y F6, y.
- a una dosis de 500 g/ha con el siguiente compuesto: F-4.

Ejemplo E

Ensayo en vivo de Pyrenophora teres (mancha en red de la cebada)

Los ingredientes activos analizados se preparan mediante homogeneización en una mezcla de acetona/tween/DMSO; después se diluyen con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

Se tratan plantas de trigo (variedad Express) en el estadio 1 hoja (10 cm de altura), sembradas sobre sustrato de suelo de turba/puzolana 50/50 en macetas de siembra y cultivadas a 12°C, pulverizando con el ingrediente activo preparado tal como se ha descrito anteriormente. Las plantas que se usan como controles se tratan con una mezcla de acetona/tween/DMSO/agua exenta de material activo.

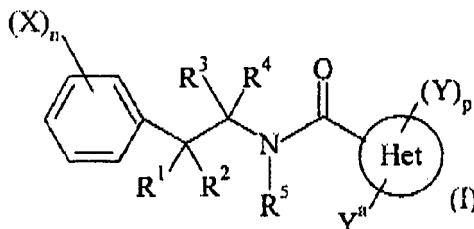
Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Pyrenophora teres* (12.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de un cultivo de 12 días de edad. Las plantas de cebada contaminadas se incuban durante 24 horas a aproximadamente 20°C y al 100% de humedad relativa y después durante 12 días al 80% de humedad relativa.

La evaluación se realiza 12 días después de la contaminación, mediante comparación con las plantas control.

En estas condiciones, se observa una protección buena (al menos el 70%) o total a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: B-3, B-4, C1, D1, D2, F1, F2, F3, F4, F6 y F7.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula general (II):



en la que:

- n es 1, 2, 3, 4 ó 5;

- p es 1, 2, 3, 4 ó 5;

- X son iguales o diferentes y son un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxycarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo (C_1-C_6), un alquilo (C_1-C_8), un haloalquilo (C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo (C_2-C_8), un alquinilo (C_2-C_8), un alquil (C_1-C_8)-amino, un di-alquil (C_1-C_8)-amino, un alcoxi (C_1-C_8), un haloalcoxi (C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-sulfanilo, un haloalquil (C_1-C_8)-sulfanilo que tiene de 1 a 5 átomos de hidrógeno, un alquenil (C_2-C_8)-oxi, un haloalquenil (C_2-C_8)-oxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquinil (C_3-C_8)-oxi, un haloalquinil (C_3-C_8)-oxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C_3-C_8), un halocicloalquilo (C_3-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-carbonilo, un haloalquil (C_1-C_8)-carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-carbamoilo, un di-alquil (C_1-C_8)-carbamoilo, un N-alquil (C_1-C_8)-oxicarbamoilo, un alcoxi (C_1-C_8)-carbamoilo, un N-alquil (C_1-C_8)-alcoxi (C_1-C_8)-carbamoilo, un alcoxi (C_1-C_8)-carbonilo, un haloalcoxi (C_1-C_8)-carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-carboniloxi, un haloalquil (C_1-C_8)-carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-carbonilamino, un haloalquil (C_1-C_8)-carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-aminocarboniloxi, un di-alquil (C_1-C_8)-aminocarboniloxi, un alquil (C_1-C_8)-oxicarboniloxi, un alquil (C_1-C_8)-sulfenilo, un haloalquil (C_1-C_8)-sulfenilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-sulfinilo, un haloalquil (C_1-C_8)-sulfinilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-sulfonilo, un haloalquil (C_1-C_8)-sulfonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxi (C_1-C_6)-imino)-alquilo (C_1-C_6), un (alquenil (C_1-C_6)-oxiimino)-alquilo (C_1-C_6), un (alquinil (C_1-C_6)-oxiimino)-alquilo (C_1-C_6), un (benciloxiimino)-alquilo (C_1-C_6), un benciloxi, un bencilsulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo o un fenilamino;

- R^1 , R^2 , R^3 y R^4 se eligen, independientemente unos de otros, de modo que sean un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_6) o un alquil (C_1-C_6)-cicloalquilo (C_3-C_7); o R^1 y R^2 pueden representar halógeno;

con la condición de que al menos uno de los sustituyentes R^1 , R^2 , R^3 y R^4 sea distinto de hidrógeno;

- R^5 es un átomo de hidrógeno, un alquilo (C_1-C_6) o un cicloalquilo (C_3-C_7);

- Het se selecciona del grupo constituido por 2-furano, 3-furano, 4,5-dihidro-3-furano, 2-tiofeno, 3-tiofeno, 2-pirrol, 3-pirrol, 5-oxazol, 4-oxazol, 5-tiazol, 4-tiazol, 4-pirazol, 3-pirazol, 3-isoxazol, 4-isoxazol, 5-isoxazol, 3-isotiazol, 4-1,2,3-triazol, 4-tiadiazol, 5-tidiazol, 2-piridina, 3-piridina, 4-piridina, 2-oxatiina, 4,5-dihidro-3-pirano, 4,5-dihidro-2-tiopirano, 4,5-dihidro-3-tiopirano o 2-pirazina; estando enlazado Het mediante un átomo de carbono;

- Y^a es un sustituyente orto y es un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanilo, un grupo formilo, un alquilo (C_1-C_8), un grupo haloalquilo (C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo (C_2-C_8), un alquinilo (C_2-C_8), un alcoxi (C_1-C_8), un haloalcoxi (C_1-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C_1-C_8)-sulfanilo, un haloalquil (C_1-C_8)-sulfanilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenil (C_2-C_8)-oxi, un haloalquenil (C_2-C_8)-oxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquinil (C_3-C_8)-oxi, un haloalquinil (C_3-C_8)-oxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C_3-C_8) o un halocicloalquilo (C_3-C_8) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y

ES 2 346 695 T3

- Y son iguales o diferentes y son un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₆); un haloalquilo (C₁-C₆), un grupo amino, un grupo ciano, un alquil (C₁-C₄)-amino o un di-(alquil (C₁-C₄))-amino;

así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metalóidicos e isómeros ópticamente activos.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizado** porque n se elige de modo que sea 1, 2 ó 3.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, **caracterizado** porque X se elige de modo que sea un átomo de halógeno, un grupo (hidroxiimino)-alquilo (C₁-C₆), un alquilo (C₁-C₈), un haloalquilo (C₁-C₈) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxi (C₁-C₆)-imino)-alquilo (C₁-C₆), un (alquenil (C₁-C₆)-oxiimino)-alquilo (C₁-C₆) o un (alquil (C₁-C₆)-oxiimino)-alquilo (C₁-C₆).

4. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, **caracterizado** porque R¹ y R² se eligen, independientemente uno de otro, de modo que sean un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno.

5. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, **caracterizado** porque R³ y R⁴ se eligen, independientemente uno de otro, de modo que sean un átomo de hidrógeno o alquilo (C₁-C₈). Más preferentemente, R³ se elige de modo que sea un grupo metilo y R⁴ se elige de modo que sea un átomo de hidrógeno.

6. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, **caracterizado** porque Het es un heterociclo de cinco miembros.

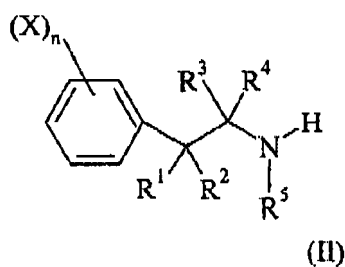
7. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, **caracterizado** porque Het es un heterociclo de seis miembros.

8. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, **caracterizado** porque Y^a se elige de modo que sea un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₈), un haloalquilo (C₁-C₈) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

9. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, **caracterizado** porque p es 1, 2 ó 3.

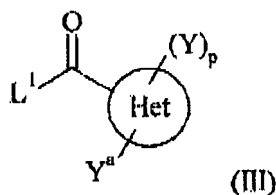
10. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, **caracterizado** porque Y se elige de modo que sea un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₆).

11. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula general (I) tal como se define en la reivindicación 1, que comprende hacer reaccionar un derivado de 1-alquil-2-feniletilamina de fórmula general (II) o una de sus sales.



en la que R¹, R², R³, R⁴, R⁵, X y n son tal como se definen en la reivindicación 1;

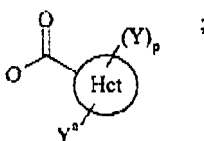
con un derivado de ácido carboxílico de la fórmula general (III)



en la que:

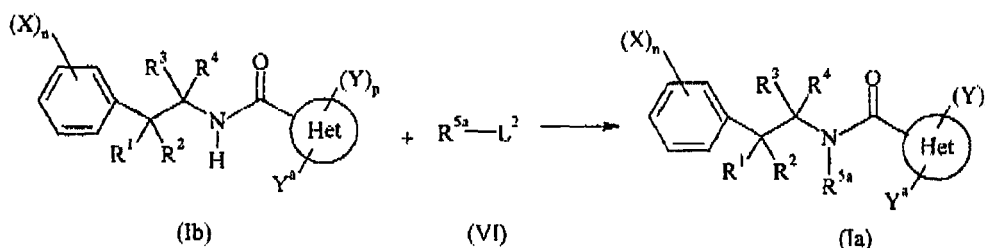
Het, Y^a, Y y p son como se definen en la reivindicación 1; y

L^1 es un grupo saliente elegido de modo que sea un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, $-OR^{77}$, $-OCOR^{77}$, siendo R^{77} un alquilo (C_1-C_6), un haloalquilo (C_1-C_6), un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula



en presencia de un catalizador y, si L^1 es un grupo hidroxilo, en presencia de un agente condensante.

12. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 12, **caracterizado** porque R^5 es un átomo de hidrógeno y porque el procedimiento se completa con una etapa adicional de acuerdo con el esquema de reacción siguiente:



en el que:

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , X , n , Het , Y^a , Y y p son como se definen anteriormente;

L^2 es un grupo saliente elegido de modo que sea un átomo de halógeno, un 4-metilfenilsulfonilo o un metilsulfonilo; y

R^{5a} es un grupo alquilo (C_1-C_6) o un cicloalquilo (C_3-C_7);

que comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula general (Ib) con un compuesto de fórmula general (VI) para proporcionar un compuesto de fórmula general (Ia).

13. Una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 y un soporte aceptable para la agricultura.

14. Un procedimiento para combatir preventiva o curativamente los hongos fitopatógenos de cultivos, **caracterizado** porque se aplica una cantidad eficaz y no fitotóxica de una composición de acuerdo con la reivindicación 13 a las semillas de plantas o a las hojas de plantas y/o a los frutos de plantas o al suelo en el que las plantas crecen o en el que se desea que crezcan.