



19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 350 486**

51 Int. Cl.:  
**C07F 7/08** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **04797688 .1**

96 Fecha de presentación : **06.11.2004**

97 Número de publicación de la solicitud: **1687315**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **09.08.2006**

54 Título: **Carboxamidas sililadas.**

30 Prioridad: **21.11.2003 DE 103 54 607**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**24.01.2011**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**24.01.2011**

73 Titular/es: **BAYER CROPSOURCE AG.**  
**Alfred-Nobel-Strasse 50**  
**40789 Monheim, DE**

72 Inventor/es: **Elbe, Hans-Ludwig;**  
**Greul, Jorg, Nico;**  
**Klausener, Alexander;**  
**Dahmen, Peter;**  
**Hartmann, Benoit;**  
**Kuck, Karl-Heinz;**  
**Dunkel, Ralf y**  
**Wachendorff-Neumann, Ulrike**

74 Agente: **Carpintero López, Mario**

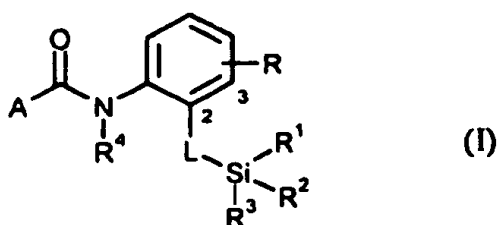
Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar 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).

## DESCRIPCION

La presente invención se refiere a nuevas carboxamidas sililadas, a varios procedimientos para su preparación y a su uso para combatir microorganismos no deseados.

Se sabe ya que numerosas carboxamidas poseen propiedades fungicidas (véanse por ej. los documentos WO 03/080628, WO 03/010149, EP-A 0 589 301. EP-A 0 545 099). Así, el documento WO-A 2003/080628 describe fenilcarboxamidas que contienen silicio, que en la función (tio-)carbonilo están sustituidas con un heterociclo de 5 o 6 miembros y que en la posición *para* orientada hacia el nitrógeno de la anilina presentan un sustituyente que contiene silicio. Estos compuestos presentan una acción microbicida, en especial fungicida. El documento EP-A 545099 describe una pluralidad de carboxamidas que contienen anilina, que en la función carbonilo están sustituidas con fenilo y compuestos heterocíclicos y que pueden presentar igualmente otros sustituyentes en la anilina, así como el uso de las mismas. También estos compuestos son apropiados para combatir hongos fitopatógenos, en especial *Botrytis*. El documento EP-A 0536 231 describe una pluralidad de compuestos, entre ellos también carboxamidas, que están ocupados con compuestos heterocíclicos en la función carbonilo y que son apropiados para combatir *Gaeumannomyces graminis*. La eficacia de estas sustancias es buena, pero en algunos casos, como por ej. si se usan en cantidades bajas, dejan mucho que desear.

Se han encontrado nuevas carboxamidas de fórmula (I)



en la que

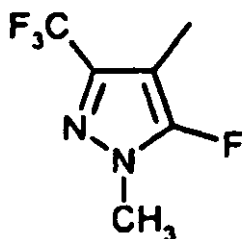
R representa hidrógeno, flúor, cloro, metilo, iso-propilo, metiltio o trifluorometilo,

L representa un enlace directo o alquileo (alcanodiilo), alquenileno (alquenodiilo) o alquinileno (alquinodiilo) de cadena lineal o ramificada y en cada caso eventualmente sustituidos,

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> representan independientemente uno del otro hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

R<sup>3</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o representa fenilo o

		fenilalquilo eventualmente sustituidos en cada caso,
	R <sup>4</sup>	representa hidrógeno, alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> , alquil (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-sulfinilo, alquil (C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )-sulfonilo, alcoxi (C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> , cicloalquilo C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> ; haloalquilo C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> , halo(alquil C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )tio, halo(alquil C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-sulfinilo, halo(alquil C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-sulfonilo, halo(alcoxi C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-
5		alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> , halo(cicloalquilo C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> ) con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; formilo, formilalquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> , (alquil C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )carbonil-alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> , (alcoxi C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )carbonil-alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> ; halo(alquil C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )carbonil-alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> , halo(alcoxi C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )carbonil-alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> con 1 a 13 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; (alquil C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )carbonilo, (alcoxi C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> )carbonilo, alcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-
10		alquil(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )carbonilo, ciclo(alquil C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> )carbonilo; haloalquil(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )carbonilo, haloalcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )carbonilo, haloalcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )-alquil(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )carbonilo, halocicloalquil(C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> )carbonilo con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; o -C(=O)C(=O)R <sup>5</sup> , -CONR <sup>6</sup> R <sup>7</sup> o CH <sub>2</sub> NR <sup>8</sup> R <sup>9</sup> ,
15	R <sup>5</sup>	representa hidrógeno, alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> , alcoxi C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> , alcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> , cicloalquilo C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> ; haloalquilo C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> , haloalcoxi C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> , haloalcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> , halocicloalquilo C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso,
	R <sup>6</sup> y R <sup>7</sup>	representan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> , alcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> , cicloalquilo C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> ; haloalquilo C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> , haloalcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> , halocicloalquilo C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso,
20		en cada caso,
	R <sup>6</sup> y R <sup>7</sup>	forman además, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos un heterociclo saturado con 5 a 8 átomos de anillo y dado el caso sustituido una o varias veces, de manera igual o distinta, con halógeno o alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> , pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no vecinos de la serie formada por oxígeno, azufre o NR <sup>10</sup> .
25		
	R <sup>8</sup> y R <sup>9</sup>	representan independientemente entre sí hidrógeno, alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> , cicloalquilo C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> ; haloalquilo C <sub>1</sub> -C <sub>8</sub> , halocicloalquilo C <sub>3</sub> -C <sub>8</sub> con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso,
30		
	R <sup>8</sup> y R <sup>9</sup>	forman además, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos un heterociclo saturado con 5 a 8 átomos de anillo y dado el caso sustituido una o varias veces, de manera igual o distinta, con halógeno o alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> , pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no vecinos de la serie formada por oxígeno, azufre o NR <sup>10</sup> .
	R <sup>10</sup>	representa hidrógeno o alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> ,
35	A	representa el resto de la fórmula (A9)

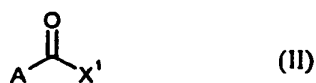


(A-9)

Los compuestos conforme a la invención pueden estar presentes dado el caso como mezclas de distintas formas isoméricas posibles, en especial de estereoisómeros tales como por ej. isómeros E, Z, treo, eritro y ópticos, pero dado el caso también de tautómeros. Se reivindican tanto los isómeros E como también los Z, así como igualmente los isómeros treo, eritro y ópticos, mezclas discrecionales de estos isómeros así como las posibles formas tautoméricas.

Se ha encontrado además que se obtienen carboxamidas siliadas de fórmula (I) haciendo reaccionar

a) derivados de ácido carboxílico de fórmula (II)

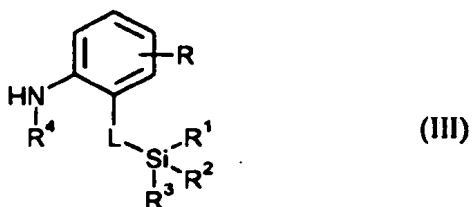


en la que

X<sup>1</sup> representa halógeno o hidroxilo y

A tiene los significados indicados con anterioridad,

con aminas de fórmula (III)

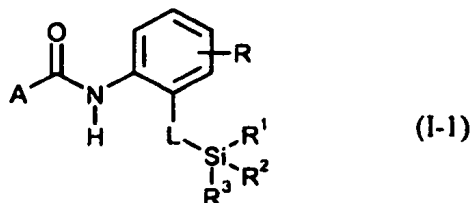


en la que R, L, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> tienen los significados indicados con anterioridad, dado el caso en presencia de un catalizador, dado el caso en presencia de un agente de

condensación, dado el caso en presencia de un aceptor de ácidos y dado el caso en presencia de un diluyente,

o

5 b) carboxamidas sililadas de fórmula (I-1)



en la que R, L, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y A tienen los significados indicados con anterioridad, con halogenuros de fórmula (VIII)



en la que

X<sup>2</sup> representa cloro, bromo o yodo,

R<sup>4a</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinilo, alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)tio, haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)sulfinilo, haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)sulfonilo, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; formilo, formilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>; halo(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halo(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> con 1 a 13 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, cicloalquil(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo; haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, halocicloalquil(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; o -C(=O)C(=O)R<sup>5</sup>, -CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> o -CH<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, teniendo R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> los significados indicados con anterioridad.

en presencia de una base y en presencia de un diluyente. Se ha encontrado finalmente que las nuevas carboxamidas sililadas de fórmula (I) poseen muy buenas propiedades microbicidas y que pueden usarse para combatir microorganismos indeseados tanto en la protección de las plantas como también en la de los materiales.

Las carboxamidas sililadas de acuerdo con la invención están definidas por medio de la fórmula (I). Se indican a continuación definiciones preferidas de los restos de las fórmulas mencionadas con anterioridad y a continuación. Estas definiciones son válidas en igual medida tanto para los productos finales de la fórmula (I) como para todos los productos intermedios.

- 5
- R representa de manera preferente hidrógeno.
- R representa además de manera preferente flúor, estando el flúor de manera especialmente preferente en la posición 4, 5 o 6, de manera muy especialmente preferente en la posición 4 o 6, en especial en la posición 4 del resto anilida [véase anteriormente la fórmula (I)].
- 10 R representa además de manera preferente cloro, estando el cloro de manera especialmente preferente en la posición 5 del resto anilida [véase anteriormente la fórmula (I)].
- R representa además de manera preferente metilo, estando el metilo de manera especialmente preferente en la posición 3 del resto anilida [véase anteriormente la fórmula (I)].
- 15 R representa además de manera preferente trifluorometilo, estando el trifluorometilo de manera especialmente preferente en la posición 4 o 5 del resto anilida [véase anteriormente la fórmula (I)].
- 20 L representa de manera preferente un enlace directo o representa alquileo  $C_1-C_6$ , alquenileno  $C_2-C_6$  o alquinileno  $C_2-C_6$  de cadena lineal o ramificados y dado el caso sustituidos con halógeno.
- L representa de manera especialmente preferente un enlace directo o representa - $CH_2-$ ,  $-(CH_2)_2-$ ,  $-(CH_2)_3-$ ,  $-CH(Me)-$ ,  $-CH(Me)CH_2-$ ,  $-CH_2CH(Me)-$ ,  $-CH(Me)CH(Me)-$ ,  $-C(Me)_2CH_2-$ ,  $-CH(Me)-(CH_2)_2-$ ,  $-CH(Me)-(CH_2)_3-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-C(Me)=CH-$  o  $-C\equiv C$ .
- 25 L representa de manera muy especialmente preferente  $-(CH_2)_2-$ ,  $-(CH_2)_3-$ ,  $-CH(Me)-$ ,  $-CH(Me)CH_2-$ ,  $-CH(Me)-(CH_2)_2-$ ,  $-CH(Me)-(CH_2)_3-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-C(Me)=CH-$  o  $-C\equiv C$ .
- $R^1$  y  $R^2$  representan independientemente entre sí de manera preferente alquilo  $C_1-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_6$ , alcoxi( $C_1-C_3$ )alquilo  $C_1-C_3$  o alquil( $C_1-C_3$ )tioalquilo  $C_1-C_3$ .
- 30  $R^1$  y  $R^2$  representan independientemente entre sí de manera especialmente preferente metilo, etilo, metoxi, etoxi, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, metiltiometilo, etiltiometilo, metiltioetilo o etiltioetilo.
- $R^1$  y  $R^2$  representan independientemente entre sí de manera muy especialmente preferente metilo, metoxi, metoximetilo o metiltiometilo.
- 35  $R^1$  y  $R^2$  representan de manera especialmente preferente metilo en cada caso.

	R <sup>3</sup>	representa alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> , alcoxi C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> , alcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> , alquil(C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )tioalquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> , cicloalquilo C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> , fenilo o bencilo.
5	R <sup>3</sup>	representa <u>de manera especialmente preferente</u> metilo, etilo, n- o isopropilo, <i>sec</i> -, iso- o <i>terc</i> -butilo, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi, <i>sec</i> -, iso o <i>terc</i> -butoxi, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, metiltiometilo, etiltiometilo, metiltioetilo, etiltioetilo, ciclopropilo, fenilo o bencilo.
	R <sup>3</sup>	representa <u>de manera muy especialmente preferente</u> metilo, etilo, n- o isopropilo, iso- o <i>terc</i> -butilo, metoxi, isopropoxi, iso o <i>terc</i> -butoxi, metoximetilo, metiltiometilo o fenilo.
10	R <sup>3</sup>	representa <u>de manera particularmente preferente</u> metilo, etilo, n- o isopropilo, iso- o <i>terc</i> -butilo, metoxi, isopropoxi, iso o <i>terc</i> -butoxi.
	R <sup>3</sup>	representa de manera destacada metilo.
15	R <sup>4</sup>	representa <u>de manera preferente</u> hidrógeno, alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> , alquil(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )sulfinilo, alquil(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )sulfonilo, alcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> , cicloalquilo C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> ; haloalquilo C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> , haloalquil(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )tio, haloalquil(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )sulfinilo, haloalquil(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )sulfonilo, haloalcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )alquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> , halocicloalquilo C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; formilo, formilalquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> , alquil(C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )carbonilalquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> , alcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )carbonilalquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> , haloalquil(C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )carbonilalquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> , haloalcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )carbonilalquilo C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> con 1 a 13 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso;
20	R <sup>4</sup>	alquil(C <sub>1</sub> -C <sub>6</sub> )carbonilo, alcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )carbonilo, alcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )alquil(C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )carbonilo, cicloalquil(C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> )carbonilo; haloalquil(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )carbonilo, haloalcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>4</sub> )carbonilo, haloalcoxi(C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )alquil(C <sub>1</sub> -C <sub>3</sub> )carbonilo, halocicloalquil(C <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> )carbonilo con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; -C(=O)C(=O)R <sup>5</sup> , -CONR <sup>6</sup> R <sup>7</sup> o CH <sub>2</sub> NR <sup>8</sup> R <sup>9</sup> ; representa <u>de manera especialmente preferente</u> hidrógeno, metilo, etilo, n- o isopropilo, iso-, <i>sec</i> -, iso- o <i>terc</i> -butilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o isopropilsulfinilo, iso-, <i>sec</i> -, iso- o <i>terc</i> -butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o isopropilsulfonilo, , iso-, <i>sec</i> -, iso- o <i>terc</i> -butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo,
30		ciclohexilo, trifluorometilo, triclorometilo, trifluoroetilo, difluorometiltio, difluoroclorometiltio, trifluorometiltio, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometoximetilo; formilo, -CH <sub>2</sub> -CHO, -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHO, -CH <sub>2</sub> -CO-CH <sub>3</sub> , -CH <sub>2</sub> -CO-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> , -CH <sub>2</sub> -CO-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CO-CH <sub>3</sub> , -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CO-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> , -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CO-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , -CH <sub>2</sub> -CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> , -CH <sub>2</sub> -CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> , -CH <sub>2</sub> -CO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> , -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> , -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CO <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> , -CH <sub>2</sub> -CO-CF <sub>3</sub> , -CH <sub>2</sub> -CO-CCl <sub>3</sub> , -CH <sub>2</sub> -
35		

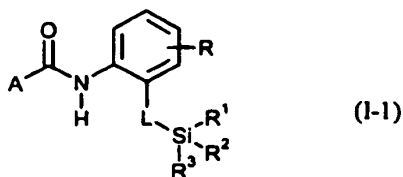
- CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CCl<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CCl<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>; metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, iso-propilcarbonilo, *terc*-butilcarbonilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, *terc*-butoxycarbonilo, ciclopropilcarbonilo; trifluorometilcarbonilo, trifluorometoxycarbonilo, o -C(=O)C(=O)R<sup>5</sup>, -CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> o -CH<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>.
- 5
- R<sup>4</sup> representa de manera muy especialmente preferente hidrógeno, metilo, metoximetilo, formilo, -CH<sub>2</sub>-CHO, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CHO, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)OCHO, -C(=O)C(=O)CH<sub>3</sub>, -C(=O)C(=O)CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, -C(=O)CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -C(=CO)CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>.
- 10
- R<sup>4</sup> representa de manera particularmente preferente hidrógeno.
- R<sup>5</sup> representa de manera preferente hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- 15
- R<sup>5</sup> representa de manera especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o isopropilo, *terc*-butilo, metoxi, etoxi, n- o isopropoxi, *terc*-butoxi, metoximetilo, ciclopropilo, trifluorometilo, trifluorometoxi.
- 20
- R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan independientemente entre sí de manera preferente hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- 25
- R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> forman además, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, de manera preferente un heterociclo con 5 o 6 átomos de anillo, saturado, sustituido dado el caso de manera simple o cuádruple y de manera igual o diferente con halógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no vecinos de la serie formada por oxígeno, azufre o NR<sup>10</sup>.
- 30
- R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan independientemente entre sí de manera especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluorometilo, triclorometilo, trifluoroetilo, trifluorometoximetilo.
- 35
- R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> forman además, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, de manera especialmente preferente un heterociclo saturado, sustituido, dado el caso de manera simple o cuádruple y de manera igual o distinta con flúor, cloro, bromo o



- metilo, de la serie formada por morfolina, tiomorfolina o piperazina, pudiendo estar sustituida la piperazina en el segundo átomo de nitrógeno con R<sup>10</sup>.
- 5 R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> representan independientemente entre sí de manera preferente hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso.
- 10 R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> forman además, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, de manera preferente un heterociclo con 5 o 6 átomos de anillo, saturado, sustituido dado el caso de manera simple o múltiple y de manera igual o diferente con halógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no vecinos de la serie formada por oxígeno, azufre o NR<sup>10</sup>.
- 15 R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> representan independientemente entre sí de manera especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, sec- o *terc*-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluorometilo, triclorometilo, trifluoroetilo, trifluorometoximetilo.
- 20 R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> forman además, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, de manera preferente un heterociclo saturado, sustituido dado el caso de manera simple o cuádruple y de manera igual o diferente con flúor, cloro, bromo o metilo, de la serie formada por morfolina, tiomorfolina o piperazina, pudiendo estar sustituida la piperazina en el segundo átomo de nitrógeno con R<sup>10</sup>.
- 25 R<sup>10</sup> representa de manera preferente hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.  
R<sup>10</sup> representa de manera especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, sec- o *terc*-butilo.
- 30 R<sup>11</sup> representa de manera preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)tio con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso.
- 35 R<sup>11</sup> representa de manera especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, *terc*-butilo, difluorometilo, trifluorometilo, triclorometilo, trifluorometoxi, difluorometoxi, difluoroclorometoxi, triclorometoxi, trifluorometiltio, difluorometiltio, difluoroclorometiltio o triclorometiltio.
- R<sup>11</sup> representa de manera muy especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, difluorometilo, trifluorometilo o triclorometilo.
- R<sup>11</sup> representa de modo particularmente preferente cloro, bromo, yodo, metilo, difluorometilo o trifluorometilo.
- 35 R<sup>12</sup> representa yodo.

- R<sup>12</sup> representa además de manera preferente cloro.
- R<sup>12</sup> representa además de manera preferente diclorometilo.
- R<sup>13</sup> representa de manera preferente metilo, etilo o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- 5 R<sup>13</sup> representa de manera especialmente preferente metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>13</sup> representa de manera muy especialmente preferente metilo, trifluorometilo, difluotometilo o triclorometilo.
- 10 R<sup>14</sup> representa de manera preferente metilo, etilo o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>14</sup> representa de manera especialmente preferente metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>14</sup> representa de manera muy especialmente preferente metilo, trifluorometilo, difluotometilo o triclorometilo.
- 15 R<sup>14</sup> representa de manera particularmente preferente metilo o trifluorometilo.
- R<sup>15</sup> representa de manera preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo o trifluorometilo.
- R<sup>15</sup> representa de manera especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo o trifluorometilo.
- 20 R<sup>16</sup> representa de manera preferente flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso.
- R<sup>16</sup> representa de manera especialmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, *sec*-butilo, *terc*-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo, triclorometilo.
- 25 R<sup>16</sup> representa de manera muy especialmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- R<sup>17</sup> representa de manera preferente metilo, etilo, n-propilo o isopropilo.
- R<sup>17</sup> representa de manera especialmente preferente metilo o etilo.
- X representa de manera preferente O (oxígeno).
- 30 X representa además de manera preferente S (azufre).
- R<sup>18</sup> representa de manera preferente yodo.
- R<sup>18</sup> representa además de manera preferente metilo.
- Cabe destacar además los compuestos de fórmula (I-1)

10

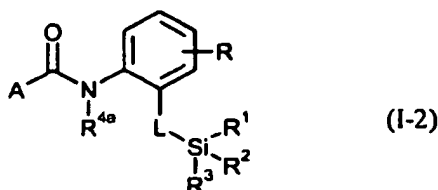


5

en la que R, L, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y A tienen los significados indicados con anterioridad.

Cabe destacar además los compuestos de fórmula (I-2)

10



en la que R, L, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4a</sup> y A tienen los significados indicados con anterioridad.

15

R<sup>4a</sup> representa de manera preferente alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)sulfonilo, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)tio, haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)sulfonilo, haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)sulfonilo, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; formilo, formilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>; haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> con 1 a 13 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, cicloalquil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo; haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, halocicloalquil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; o -C(=O)C(=O)R<sup>5</sup>, -CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> o -CH<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, teniendo R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> los significados indicados con anterioridad.

20

25

30

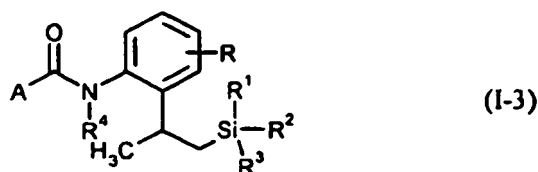
35

R<sup>4a</sup> representa de manera especialmente preferente metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilo, pentilo o hexilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o isopropilsulfonilo, n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilsulfonilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o isopropilsulfonilo, , n-, iso-, *sec*- o *terc*-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, trifluorometilo, triclorometilo, trifluoroetilo, difluorometiltio, difluoroclorometiltio, trifluorometiltio, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometoximetilo; formilo, -CH<sub>2</sub>-CHO, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CHO, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -

CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CCl<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CCl<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>; metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, *tert*-butilcarbonilo, metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, *tert*-butoxycarbonilo, ciclopropilcarbonilo, trifluorometilcarbonilo, trifluorometoxycarbonilo o -C(=O)C(=O)R<sup>5</sup>, -CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> o -CH<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, teniendo R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> los significados indicados con anterioridad.

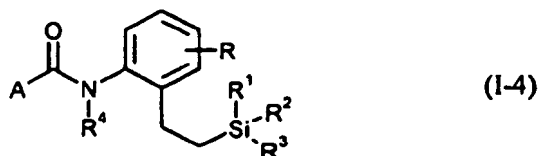
R<sup>4a</sup> representa de manera muy especialmente preferente metilo, metoximetilo, formilo, -CH<sub>2</sub>-CHO, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CHO, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)CHO, -C(=O)C(=O)CH<sub>3</sub>, -C(=O)C(=O)CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, -C(=O)CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -C(=O)CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>.

Cabe destacar además los compuestos de fórmula (I-3)



en la que R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y A tienen los significados indicados con anterioridad.

Cabe destacar además los compuestos de fórmula (I-4)



en la que R, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y A tienen los significados indicados con anterioridad.

Siempre que sea posible, los restos de hidrocarburo saturados o no saturados tales como alquilo o alqueno pueden ser de cadena lineal o ramificada en cada caso, también en compuestos con heteroátomos tales como por ej. alcoxi.

Los restos dado el caso sustituidos pueden estar sustituidos una o varias veces, pudiendo ser iguales o distintos los sustituyentes en el caso de las sustituciones múltiples.

Los restos sustituidos con halógeno, como por ejemplo haloalquilo, están halogenados una o varias veces. En el caso de la halogenación múltiple, los átomos de halógeno pueden ser iguales o distintos. Halógeno representa a este respecto flúor, cloro, bromo y yodo, en especial

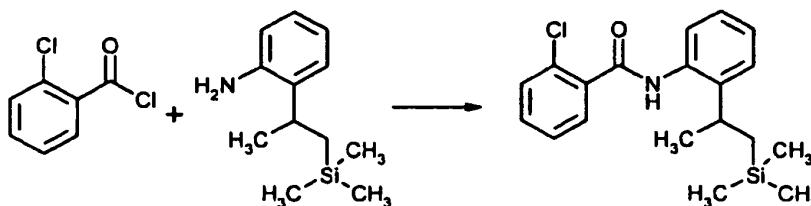
representa flúor, cloro y bromo.

Las definiciones de restos o explicaciones indicadas con anterioridad de modo general o en ámbitos preferentes se pueden combinar de forma discrecional entre cada uno de los ámbitos o ámbitos preferentes. Son válidas de modo correspondiente para los productos finales así como para los productos previos e intermedios.

### **Explicaciones de los procedimientos y de los productos intermedios**

#### **Procedimiento (a)**

Si como materiales de partida se usan por ejemplo cloruro de 2-clorobenzoilo y {2-[1-metil-2-(trimetilsilil)etil]fenil}amina, el desarrollo del procedimiento (a) conforme a la invención se puede ilustrar por medio del siguiente esquema de fórmulas.



Los derivados de ácido carboxílico necesarios como materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento (a) conforme a la invención se definen de manera general por medio de la fórmula (II). En esta fórmula (II), A tiene de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente aquellos significados que en relación con la descripción de los compuestos de fórmula (1) conforme a la invención se indicaron para estos restos de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente. X<sup>1</sup> representa de manera preferente cloro, bromo o hidroxilo.

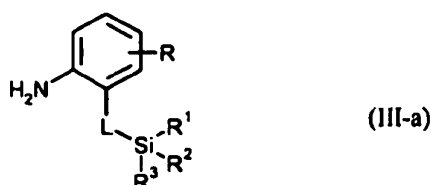
Los derivados de ácido carboxílico de fórmula (II) son conocidos y/o pueden obtenerse según procedimientos conocidos (véanse los documentos WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301, EP-A 0 589 313 y DE-A 103 25 439.0).

Las aminas necesarias además como materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento (a) conforme a la invención se definen de manera general por medio de la fórmula (III). En esta fórmula (III), R, L, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> tienen de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente aquellos significados que en relación con la descripción de los compuestos de fórmula (1) conforme a la invención se

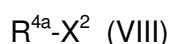
indicaron para estos restos de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente.

Las aminas de fórmula (III) son conocidas y/o se pueden obtener de manera conocida (véase el documento WO 03/080628 o los ejemplos de preparación).

Aminas de fórmula (III) en las que  $R^4$  no represente hidrógeno se pueden obtener, por ejemplo, haciendo reaccionar aminas de fórmula (III-a)



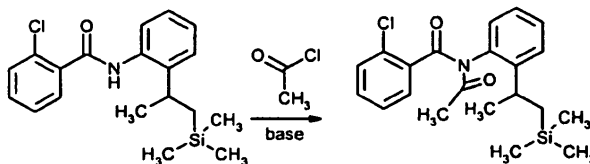
en la que R, L,  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  tienen los significados indicados con anterioridad, con halogenuros de fórmula (VIII)



en la que  $X^2$  y  $R^{4a}$  tienen los significados indicados con anterioridad [son válidas de manera correspondiente las condiciones de reacción del procedimiento (b) de acuerdo con la invención].

### Procedimiento (b)

Si como materiales de partida se usan por ejemplo 2-cloro-N-{2-[1-metil-2-(trimetilsilil)etil]fenil}benzamida y cloruro de acetilo, el desarrollo del procedimiento (b) conforme a la invención se puede ilustrar por medio del siguiente esquema de fórmulas.



Las carboxamidas sililadas necesarias como materiales de partida para llevar a cabo el procedimiento (b) conforme a la invención se definen de manera general por medio de la fórmula (I-1). En esta fórmula (I-1), R, L,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$  y A tienen de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente aquellos significados que en relación con la descripción de los compuestos de fórmula (1) conforme a la invención se

indicaron para estos restos de manera preferente, de manera especialmente preferente o de manera muy especialmente preferente.

Los compuestos de fórmula (I-1) son compuestos de acuerdo con la invención y se pueden preparar conforme al procedimiento (a).

5

### Condiciones de reacción

Como diluyente para llevar a cabo el procedimiento (a) de acuerdo con la invención entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. Entre ellos se encuentran de manera preferente hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos tales como, por ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados tales como, por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres tales como éter etílico, diisopropiléter, éter metil-t-butílico, metil *terc*-amil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano o anisol; nitrilos tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o i-butironitrilo o benzonitrilo; amidas tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico; sus mezclas con agua o agua pura.

Como diluyente para llevar a cabo el procedimiento (b) de acuerdo con la invención entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. Entre ellos se encuentran de manera preferente hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos tales como, por ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados tales como, por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres tales como éter etílico, diisopropiléter, éter metil-t-butílico, metil *terc*-amil éter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano o anisol; amidas tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico.

El procedimiento (a) de acuerdo con la invención se lleva a cabo dado el caso en presencia de un aceptor de ácido adecuado. Como tales entran en consideración todas las bases orgánicas o inorgánicas habituales. Entre ellas se incluyen de manera preferente hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos tales como por ejemplo hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metilato de sodio, etilato de sodio, *terc*-butilato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico o bicarbonato de amonio, así como aminas terciarias tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilbencilamina,

piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

El procedimiento (b) de acuerdo con la invención se lleva a cabo en presencia de una base adecuada. Como tales entran en consideración todas las bases orgánicas o inorgánicas habituales. Entre ellas se incluyen de manera preferente hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos o alcalinotérreos tales como por ejemplo hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metilato de sodio, etilato de sodio, *tert*-butilato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, acetato de amonio, hidróxido sódico, hidróxido potásico, hidróxido amónico, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico o carbonato de cesio; así como aminas terciarias tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetilbencilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

El procedimiento (a) de acuerdo con la invención se lleva a cabo dado el caso en presencia de un agente de condensación apropiado. Como tales entran en consideración todos los agentes de condensación habituales que pueden usarse para las reacciones de amidación de este tipo. Cabe citar a modo de ejemplo agentes formadores de halogenuros de ácidos tales como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, oxiclorigenuro de fósforo o cloruro de tionilo; formadores de anhídrido tales como éster etílico del ácido clorofórmico, éster metílico del ácido clorofórmico, éster isopropílico del ácido clorofórmico, éster butílico del ácido clorofórmico o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas tales como N,N-diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes de condensación habituales tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonildiimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetracloruro de carbono o tripirrolidinofosfonio-hexafluorofosfato de bromo.

El procedimiento (a) de acuerdo con la invención se lleva a cabo dado el caso en presencia de un catalizador. Cabe citar a modo de ejemplo 4-dimetilaminopiridina, 1-hidroxibenzotriazol o dimetilformamida.

Al llevar a cabo el procedimiento (a) de acuerdo con la invención, las temperaturas de reacción pueden variar dentro de un amplio intervalo. Por lo general se trabaja a temperaturas de 0 °C a 150 °C, de manera preferente a temperaturas de 0 °C a 120 °C, de manera especialmente preferente a temperaturas de 10 °C a 80 °C.

Al llevar a cabo el procedimiento (b) de acuerdo con la invención, las temperaturas de reacción pueden variar dentro de un intervalo más amplio. Por lo general se trabaja a temperaturas de 0 °C a 150 °C, de manera preferente a temperaturas de 20 °C a 110 °C.

Para llevar a cabo el procedimiento (a) de acuerdo con la invención con objeto de



preparar los compuestos de fórmula (I), por mol del derivado de ácido carboxílico de fórmula (II) se usan en general de 0,8 a 15 moles, de manera preferente de 0,8 a 8 moles, de amina de fórmula (III) y de 1 a 3 moles de un aceptor de ácido.

5 Para llevar a cabo el procedimiento (b) de acuerdo con la invención, por mol de carboxamida sililada de fórmula (I-1) se usan en general de 0,2 a 5 moles, de manera preferente de 0,5 a 2 moles, de un halogenuro de fórmula (VIII).

Si no se indica lo contrario, todos los procedimientos de acuerdo con la invención se llevan a cabo en general a presión normal. Sin embargo, también es posible trabajar a presión más alta o más baja, en general entre 10 y 1000 kPa.

10 Las sustancias de acuerdo con la invención presentan un fuerte efecto microbicida y pueden usarse para combatir microorganismos no deseados tales como por ejemplo hongos y bacterias, para proteger las cosechas y para la protección de materiales.

15 Los fungicidas pueden usarse en la protección fitosanitaria para combatir plasmodioforomicetos, oomicetos, quitridiomicetos, cigomicetos, ascomicetos, basidiomicetos y deuteromicetos.

Los bactericidas se pueden usar en la protección fitosanitaria para combatir pseudomonadáceas, rizobiáceas, enterobacteriáceas, corinebacteriáceas y estreptomicetáceas.

20 A modo de ejemplo, pero sin ser limitantes, cabría mencionar algunos agentes causales de enfermedades fúngicas y bacterianas que caen dentro de los términos genéricos enumerados con anterioridad:

especies de *Xanthomonas*, como por ejemplo *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

especies de *Pseudomonas*, como por ejemplo *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

especies de *Erwinia*, como por ejemplo *Erwinia amylovora*;

especies de *Pythium*, como por ejemplo *Pythium ultimum*;

25 especies de *Phytophthora*, como por ejemplo *Phytophthora infestans*;

especies de *Pseudoperonospora*, como por ejemplo *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*;

especies de *Plasmopara*, como por ejemplo *Plasmopara viticola*;

especies de *Bremia*, como por ejemplo *Bremia lactucae*;

30 especies de *Peronospora*, como por ejemplo *Peronospora pisi* o *P. brassicae*;

especies de *Erysiphe*, como por ejemplo *Erysiphe graminis*;

especies de *Sphaerotheca*, como por ejemplo *Sphaerotheca fuliginea*;

especies de *Pedospaera*, como por ejemplo *Pedospaera leucotricha*;

especies de *Venturia*, como por ejemplo *Venturia inaequalis*;

35 especies de *Pyrenophora*, como por ejemplo *Pyrenophora teres* o *P. graminea* (forma

conidial: *Drechslera*, sin.: *Helminthosporium*);

especies de *Cochliobolus*, como por ejemplo *Cochliobolus sativus* (forma conidial: *Drechslera*, sin.: *Helminthosporium*);

especies de *Uromyces*, como por ejemplo *Uromyces appendiculatus*;

5 especies de *Puccinia*, como por ejemplo *Puccinia recondita*;

especies de *Sclerotinia*, como por ejemplo *Sclerotinia sclerotiorum*;

especies de *Tilletia*, como por ejemplo *Tilletia caries*;

especies de *Ustilago*, como por ejemplo *Ustilago avenae*;

especies de *Pellicularia*, como por ejemplo *Pellicularia sasakii*;

10 especies de *Pyricularia*, como por ejemplo *Pyricularia oryzae*;

especies de *Fusarium*, como por ejemplo *Fusarium culmorum*;

especies de *Botrytis*, como por ejemplo *Botrytis cinerea*;

especies de *Septoria*, como por ejemplo *Septoria nodorum*;

especies de *Leptosphaeria*, como por ejemplo *Leptosphaeria nodorum*;

15 especies de *Cercospora*, como por ejemplo *Cercospora canescens*;

especies de *Alternaria*, como por ejemplo *Alternaria brassicae*;

especies de *Pseudocercospora*, como por ejemplo *Pseudocercospora herpotrichoides*;

especies de *Rhizoctonia*, como por ejemplo *Rhizoctonia solani*.

20

Los principios activos de acuerdo con la invención presentan también un intenso efecto vigorizante para las plantas. Por lo tanto, son apropiados para la movilización de las defensas propias de las plantas frente a la infestación con microorganismos no deseados.

25 En el presente contexto debe entenderse por sustancias vigorizantes para las plantas (inductoras de resistencia) aquellas sustancias que están en condiciones de estimular el sistema inmunitario de las plantas, de tal manera que al inocular con posterioridad microorganismos no deseados en las plantas tratadas éstas desplieguen una amplia resistencia frente a estos microorganismos.

30 Debe entenderse en este caso por microorganismos no deseados hongos, bacterias y virus fitopatógenos. Las sustancias de acuerdo con la invención pueden usarse por consiguiente para proteger a las plantas dentro de un cierto espacio de tiempo posterior al tratamiento contra la infestación con los mencionados agentes causales perjudiciales. El espacio de tiempo dentro del cual se proporciona protección se extiende por lo general entre 1 y 10 días, de manera preferente entre 1 y 7 días después del tratamiento de las plantas con los principios activos.

35 La buena tolerancia por parte de las plantas a los principios activos en las

concentraciones necesarias para combatir las enfermedades de las plantas permite un tratamiento de las partes aéreas de la planta, las partes subterráneas de la misma y las semillas, así como del suelo.

Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden usar con un éxito especialmente bueno para combatir enfermedades de los cereales, como por ejemplo contra las especies de *Puccinia*, y enfermedades en viticultura, fruticultura y horticultura, como por ejemplo contras las especies de *Botrytis*, *Venturia* y *Alternaria*.

Los principios activos de acuerdo con la invención son adecuados también para aumentar el rendimiento de las cosechas. Son además de escasa toxicidad y muestran una buena tolerancia por parte de las plantas.

En determinadas concentraciones y cantidades de aplicación, los principios activos de acuerdo con la invención pueden usarse dado el caso también como herbicidas, para influir sobre el crecimiento de las plantas y para combatir los parásitos animales. Dado el caso se pueden usar también como productos intermedios o productos precursores para la síntesis de otros principios activos.

De acuerdo con la invención pueden tratarse todas las plantas y partes de las plantas. Se entienden a este respecto por plantas todas las plantas y poblaciones vegetales tales como plantas silvestres deseadas o no deseadas o plantas cultivadas (incluidas las plantas cultivadas existentes de modo natural). Plantas cultivadas pueden ser plantas que pueden obtenerse por medio de procedimientos de cría y optimización convencionales, por medio de procedimientos de biotecnología o de tecnología genética o combinaciones de estos procedimientos, incluidas las plantas transgénicas e incluidas las variedades vegetales que pueden protegerse mediante el derecho de protección de variedades vegetales o que no pueden protegerse. Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y los órganos aéreas y subterráneas de las plantas tales como brote, hoja, flor y raíz, especificándose por ejemplo hojas, acículas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y rizomas. Son partes de las plantas también el material de cosecha así como el material de multiplicación vegetativa y generativa como por ejemplo esquejes, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de las plantas con los principios activos se lleva a cabo de manera directa o haciéndolos actuar sobre su entorno, su hábitat o su lugar de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ej. mediante inmersión, rociado, evaporación, nebulización, dispersión, unción y en el caso del material multiplicativo, en particular en el caso de las semillas, además mediante revestimiento con una o varias capas.

En la protección de materiales, las sustancias de acuerdo con la invención se pueden

usar para proteger materiales técnicos contra la infestación y la destrucción por parte de microorganismos no deseados.

Por materiales técnicos en el presente contexto deben entenderse materiales no vivos que se han preparado para su uso en la técnica. Materiales técnicos que deben protegerse por medio de principios activos de acuerdo con la invención contra la destrucción o la alteración microbiana, pueden ser por ejemplo adhesivos, colas, papel y cartón, materiales textiles, cuero, madera, medios de pintura y artículos de plástico, lubricantes refrigerantes u otros materiales que pueden ser infestados o destruidos por microorganismos. En el marco de los materiales que hay que proteger habría que mencionar también partes o piezas de instalaciones productivas, como por ejemplo circuitos de agua de refrigeración, que pueden resultar afectadas por la multiplicación de microorganismos. En el marco de la presente invención, cabe mencionar como materiales técnicos de manera preferente adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, medios de pintura, lubricantes refrigerantes y líquidos transmisores de calores, de manera especialmente preferente madera.

Como microorganismos que pueden provocar una degradación de los materiales técnicos cabe citar por ejemplo bacterias, hongos, levaduras, algas y organismos mucilaginosos. Los principios activos de acuerdo con la invención actúan de manera preferente contra hongos, en particular mohos, hongos que tiñen la madera y hongos destructores de madera (basidiomicetos), así como organismos mucilaginosos y algas.

Cabe citar por ejemplo microorganismos de los géneros siguientes:

*Alternaria*, tal como *Alternaria tenuis*,

*Aspergillus*, tal como *Aspergillus niger*,

*Chaetomium*, tal como *Chaetomium globosum*,

*Coniophora*, tal como *Coniophora puetana*,

*Lentinus*, tal como *Lentinus tigrinus*,

*Penicillium*, tal como *Penicillium glaucum*,

*Polyporus*, tal como *Polyporus versicolor*,

*Aureobasidium*, tal como *Aureobasidium pullulans*,

*Sclerophoma*, tal como *Sclerophoma pityophila*,

*Trichoderma*, tal como *Trichoderma viride*,

*Escherichia*, tal como *Escherichia coli*,

*Pseudomonas*, tal como *Pseudomonas aeruginosa*,

*Staphylococcus*, tal como *Staphylococcus aureus*.

Dependiendo de las propiedades físicas y/o químicas de cada uno de ellos, los principios activos se pueden trasladar a las formulaciones habituales tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, pastas, granulados, aerosoles, encapsulamientos muy finos en materiales poliméricos y en masas envoltantes para semillas, así como formulaciones UBV (ULV) para nebulización en frío y en caliente.

Estas formulaciones se preparan de manera conocida, por ej. mezclando los principios activos con diluyentes, es decir disolventes líquidos, gases licuificados mantenidos bajo presión y/o vehículos sólidos, dado el caso con el uso de agentes tensioactivos, es decir, emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes espumantes. En el caso de usarse agua como diluyente, pueden usarse también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos hay que considerar en esencia: compuestos aromáticos tales como tolueno o alquilnaftaleno, compuestos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados tales como clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafina, por ej. fracciones de petróleo, alcoholes tales como butanol o glicol así como sus éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como agua. Con los vehículos o diluyentes gaseosos licuificados quiere decirse aquellos líquidos que a temperatura normal y a presión normal son gaseosos, por ej. gases propelentes de aerosoles tales como hidrocarburos halogenados así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono. Como vehículos sólidos entran en consideración: por ej. harinas minerales tales como caolinas, tierras arcillosas, talco, creta, cuarzo, atapulguita, montmorillonita o tierra de diatomeas y harinas minerales sintéticas tales como ácido silícico altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos. Como vehículos sólidos para granulados entran en consideración: por ej. rocas naturales quebradas o fraccionadas tales como calcita, piedra pómez, mármol, sepiolita, dolomita así como granulados sintéticos a partir de harinas orgánicas e inorgánicas así como granulados a partir de material orgánico tal como serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco. Como emulsionantes y/o agentes espumantes entran en consideración: por ej. emulsionantes no ionógenos y aniónicos tales como éster de ácido graso de polioxietileno, éter de alcohol graso de polioxietileno, por ej. poliglicoléter alquilarílico, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo así como hidrolizados de proteínas. Como dispersantes entran en consideración: por ej. lejías de desecho de sulfito-lignina y metilcelulosa.

En las formulaciones se pueden usar agentes adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en forma de polvo, grano o látex tales como goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales tales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Se pueden usar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ej. óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrociano y colorantes orgánicos tales como colorantes de ftalocianina de alizarina, de azoftalocianina y de ftalocianina metálica y nutrientes traza tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

5 Las formulaciones contienen por lo general entre el 0,1 y el 95 por ciento en peso de principio activo, de manera preferente entre el 0,5 y el 90 %.

Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden usar como tales o en sus formulaciones también mezclados con fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas o insecticidas conocidos, para prevenir de esta manera por ej. la ampliación del espectro de acción o el desarrollo de resistencias. En muchos casos se consiguen con ello efectos sinérgicos, es decir, la eficacia de la mezcla es mayor que la de los componentes individuales.

Como acompañantes de la mezcla entran en consideración por ejemplo los compuestos siguientes:

## 15 **Fungicidas:**

2-fenilfenol; sulfato de 8-hidroxiquinolina; acibenzolar-S-metilo; aldimorph; amidoflumet; ampropilfos; ampropilfos-potasio; andoprim; anilazina; azaconazol; azoxistrobina; benalaxilo, benodanilo, bentiavalicarb-isopropilo; benzamacrilo, benismacril-isobutilo; 20 bilanafos; binapacrilo, bifenilo; bitertanol; blasticidin-S; bromuconazol; bupirimate; butiobate; butilamina; polisulfuro de calcio; capsimicina; captafol; captano; carbendazim; carboxina; carpropamid; carvona; quinometionato; clobentiazona; clorofenazol; cloroneb; clorotalonilo, clozolinato; clozilacon; ciazofamida; ciflufenamida; cimoxanilo, ciproconazol; ciprodinilo, ciprofurano; dagger G; debacarb; diclofluanid; diclona; diclorofeno; diclocimet; 25 diclomecina; dicloran; dietofencarb; difenoconazol; diflumetorim; dimetirimol; dimetomorf; dimoxistrobina; diniconazol; diniconazol-M; dinocap; difenilamina; dipiritiona; ditalimfos; ditianona; dodina; drazoxolom; edifenfos; epoxiconazol; etaboxam; etirimol; etridiazol; famoxadona; fenamidona; fenapanilo, fenarimol; fenbuconazol; fenfuram; fenhexamida; fenitropan; fenoxanilo, fencpiclonilo, fenpropidina; fenpropimorf; ferbam; fluazinam; 30 flubenzimina; fludioxonilo, flumetover; flumorf; fluoromida; fluoxastrobina; fluquinconazole; flurprimidol; flusilazol; flusulfamida; flutolanilo, flutriafol; folpet; fosetil-Al; fosetilsodio; fuberidazol; furalaxilo, furametpir; furcarbanilo, furmeciclox; guazatina; hexaclorobenceno; hexaconazol; himexazol; imazalilo, imibenconazol; triacetato de iminoctadina; tris-(albesilato) de iminoctadina; iodocarb; ipconazol; iprobenfos; iprodiona; iprovalicarb; 35 irumamicina; isoprotiolano; isovallediona; kasugamicina; kreoxim-metilo; mancozeb;

maneb; meferimzona; mepanipirim; mepronilo, metalaxilo, metalaxil-M; metconazol; metasulfocarb; metfuroxam; metiram; metominostrobin; metsulfovax; mildiomicina; miclobutanilo, miclozolina; natamicina; nicobifen; nitrofen-isopropilo; noviflumuron; nuarimol; ofurace; orisastrobin; oxadixilo; ácido oxolínico; oxpoconazol; oxicarboxina; oxifenthiina; paclobutrazol; perfurazolato; penconazol; pencicuron; fosdifen; ftaida picoxistrobin; piperalina; polioxinas; polioxirim; probenazol; procloraz; procimidona; propamocarb; propanosina-sodio; propiconazol; propineb; proquizand; protioconazol; piraclostrobin; pirazofos; pirifenox; pirimetanilo, piroquilon; piroxifur; pirrolnitrina; quinconazol; quinoxifeno; quintoceno; simeconazol; espiroxamina; azufre; tebuconazol; tecloftalam; tecnaceno; tetciclacis; tetraconazol; tiabendazol; ticiofeno; tifulzamida; metiltiofanato; thiram; tioximida; metiltolcofos; tolilfluánida; triadimefon; triadimenol; triazbutilo, triazoxido; triciclamida; triciclazol; tridemorf; trifloxistrobin; triflumizol; triflorine; triticonazol; uniconazol; validamicina A; vinclozolina; zineb; ziram; zoxamida; (2S)-N-[2{4-[[3-(4-clorfenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]-etil}-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanamida; 1-(1-naftalenil)-1H-pirrol-2,4-diona; 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina; 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida; 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,13-trimetil-1H-indol-4-il)-3-piridincarboxamida; 3,4,5-tricloro-2,6-piridindicarbonitrilo; actinovate; cis-1-(4-clorfenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol; 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo; monocarbonato de potasio; N-(6-metoxi-3-piridinil)-ciclopropanocarboxamida; N-butil-8-(1,1-dimetiletil)-1-oxaspiro[4.5]decano-3-amina; tetratiocarbonato de sodio; así como sales y preparaciones cobre tales como caldo bordelés; hidróxido de cobre; naftenato de cobre; oxiclورو de cobre; sulfato de cobre; cufraneb; óxido de cobre; Mancopper; Oxine-copper.

## 25 **Bactericidas:**

bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilina, ácido furanocarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomicina, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

30

## **Insecticidas / acaricidas / nematocidas:**

abamectina, ABG-9008, acefato, acequinocilo, acetamiprid, acetoprol, acrinatrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, aletrina, isómeros 1E de aletrina, alfa-cipermetrina (alfametrina), amidoflumet, aminocarb, amitraz, avermectina,

35

AZ-60541, azadiractina, azinfos-metilo, azinfos-etilo, azociclotina, *Bacillus popilliae*,  
*Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, cepa EG-2348 de *Bacillus*  
*thuringiensis*, cepa GC-91 de *Bacillus thuringiensis*, cepa NCTC-11821 de *Bacillus*  
*thuringiensis*, *Beauveria bassiana*, *Beauveria tenella*, bendiocarb, benfluracarb, bensultap,  
 5 benzoximato, beta-ciflutrina, beta-cipermetrina, bifenazato, bifentrina, binapacril,  
 bioaletrina, isómero de bioaletrina-S-ciclopentilo, bioetanometrina, biopermetrina,  
 bioresmetrina, bistrifluron, BPMC, brofenprox, bromofosetilo, bromopropilato, (metilo de)  
 bromfenvinfos, BTG-504, BTG-505, bufencarb, buprofezin, butatiofos, butocarboxim,  
 butoxicarboxim, butilpiridaben, cadusafos, canfeclor, carbarilo, carbofurano,  
 10 carbofenotion, carbosulfano, cartap, CGA-50439, quinometionato, clordano,  
 clorodimeform, cloetocarb, cloroetoxifos, clorofenapir, clorofenvinfos, clorofluazuron,  
 cloromefos, clorobenzilato, cloropicrin, cloroproxifeno, metilo de cloropirifos, (etilo de)  
 cloropirifos, clovaportrin, cromafenozida, cis-cipermetrina, cis-resmetrina, cis-permetrina,  
 clocitrina, cloetocarb, clofentezina, clotianidina, clotiazoben, codlemona, coumafos,  
 15 cianofenfos, cianofos, ciclopreno, cicloprotrin, *Cydia pomonella*, ciflutrina, cihalotrina,  
 cihexatina, cipermetrina, cifenotrina, (isómero 1R-trans), ciromazina, DDT, deltametrina,  
 demeton-S-metilo, demeton-S-metilsulfona, diafentiuron, dialifos, diazinon, diclofention,  
 diclorvos, dicofol, dicrotofos, diciclanilo, diflubenzuron, dimetoato, dimetilvinfos, dinobuton,  
 dinocap, dinotefurano, diofenolano, disulfoton, docusat-sodio, dofenapin, DOWCO-439,  
 20 eflusilanato, emamectin, benzoato de emamectin, empetrina (isómero IR), endosulfano,  
*Entomophthora* spp., EPN, esfenvalerato, etiofencarb, etiprol, etiona, etoprofos, etofenprox,  
 etoxazol, etrimfos, famphur, fenamifos, fenazaquin, óxido de fenbutatina, fenflutrina,  
 fenitrotrion, fenobucarb, fenotiocarb, fenoxacrim, fenoxicarb, fenpropatrin, fenpirad,  
 fenpiritrina, fenpiroximate, fensulfotiona, fentiona, fentrifanilo, fenvalerato, fipronilo,  
 25 flonicamid, fluacripirim, fluazuron, flubenzimina, flubrocitrinato, flucicloxuron, flucitrinato,  
 flufenerim, flufenoxurona, flufenprox, flumetrina, flupirazofos, flutenzin (flufenzina),  
 fluvalinato, fonofos, formetanato, formotion, fosmetilan, fostiazato, fubfenprox  
 (fluproxifeno), furatiocarb, gamma-HCH, gossyplure, grandlure, granulosevireno,  
 halfenprox, halofenozida, HCH, HCN-801, heptenofos, hexaflumuron, hexitiazox,  
 30 hidrametilona, hidropreno, IKA-2002, imidaclorpid, imiprotrina, indoxacarb, iodofenfos,  
 iprobenfos, isazofos, isofenfos, isoprocab, isoxation, ivermectina, japonilure, kadetrina,  
 kernpoliedervireno, kinopreno, lambda-cialotrina, lindano, lufenuron, malation, mecarbam,  
 mesulfenfos, metaldehído, metam-sodio, metacrifos, metamidofos, *Metharhizium*  
*anisopliae*, *Metharhizium flavoviride*, metidation, metiocarb, metomilo, metopreno,  
 35 metoxiclor, metoxifenoazida, metolcarb, metoxadiazona, mevinfos, milbemectina,



milbemicina, MKI-245, MON-45700, monocrotofos, moxidectina, MTI-800, naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, niclosamida, nicotina, nitenpiram, nitiazina, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, novalurona, noviflumuron, OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, ometoato, oxamilo, oxidemeton-metilo, *Paecilomyces fumosoroseus*, paration-metilo, paration(-etilo), permetrina (cis-, trans-), petróleo, PH-6045, fenotrina (isómero 1R-trans), fentoato, forato, fosadona, fosmet, fosfamidon, fosfocarb, foxim, butóxido de piperonilo, pirimicarb, pirimifos-metilo, pirimifos-etilo, praletrina, profenofos, promecarb, propafos, propargita, propetanfos, propoxur, protiofos, protoato, protrifenbuto, pimetozina, piraclofos, piresmetrina, piretro, piridabeno, piridalilo, piridafention, piridation, pirimidifen, piriproxifen, quinalfos, resmetrina, RH-5849, ribavirina, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, salition, sebufos, SI-0009, silafluofeno, espinosad, espiroclorfenol, espiromesifeno, sulfluramida, sulfotep, sulprofos, SZI-121, tau-fluvalinato, tebufenozida, tebufenpirad, tebupirimfos, teflubenzurona, teflutrina, temefos, temivinfos, terbam, terbufos, tetraclorovininfos, tetradifon, tetrametrina, tetrametrina (isómero 1R), tetrasul, theta-cipermetrina, tiacloprid, tiametoxam, tiapronilo, tiatrilfos, tiociclam hidrogenoxalato, tiodicarb, tiofanox, tiometon, tiosultap-sodio, turingiensina, tolfenpirad, tralocitrina, tralometrina, transflutrina, triaratenol, triazamato, triazofos, triazuron, triclofenidina, triclorofon, triflumuron, trimetacarb, vamidotion, vaniliprol, verbutin, *Verticillium lecanii*, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, xililcarb, ZA-3274, zeta-cipermetrina, zolaprofos, ZXI-8901, el compuesto 3-metilfenil-propilcarbamato (tsumacida Z), el compuesto 3-(5-cloro-3-piridinilo)-8-(2,2,2-trifluoroetilo)-8-azabicyclo[3.2.1]octano-3-carbonitrilo (Nº Reg.-CAS 185982-80-3) y los correspondientes 3-endo-isómeros (Nº Reg.-CAS 185984-60-5) (véase el documento WO-96/37494, WO-98/25923), así como preparados que contienen extractos vegetales de acción insecticida, nematodos, hongos o virus.

También es posible una mezcla con otros principios activos conocidos tales como herbicidas o con abonos y reguladores del crecimiento, protectores selectivos (safener) o productos semioquímicos.

Además de lo anterior, los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención presentan también efectos antimicóticos muy buenos. Poseen un espectro de acción antimicótica muy amplio, en particular contra dermatofitos y blastomicetos, mohos y hongos difásicos (por ej. especies de *Candida* tales como *Candida albicans*, *Candida glabrata*) así como *Epidermophyton floccosum*, especies de *Aspergillus* tales como *Aspergillus niger* y *Aspergillus fumigatus*, especies de *Trichophyton* tales como *Trichophyton mentagrophytes*, especies de *Microsporon* tales como

*Microsporon canis* y *Microsporon audouinii*. La enumeración de estos hongos no constituye en ningún caso una limitación del espectro micótico que puede registrarse, sino que tiene únicamente un carácter explicativo.

Los principios activos de acuerdo con la invención se pueden usar como tales, en forma de sus formulaciones o como las formas de uso preparadas a partir de ellos tales como soluciones, suspensiones, polvos rociadores, pastas, polvos solubles, agentes de pulverización y granulados listos para usar. El uso se hace de modo habitual, por ej. regando, rociando, atomizando, nebulizando, espumeando, aplicando con brocha, etc. Es posible además aplicar los principios activos según el procedimiento de ultra bajo volumen o inyectar en el suelo el preparado de principio activo o el propio principio activo. También se pueden tratar las semillas de las plantas.

Al usar como fungicidas los principios activos de acuerdo con la invención, las cantidades usadas pueden variar dentro de un mayor intervalo según el tipo de aplicación. Las cantidades de principio activo usadas al tratar las partes de las plantas se encuentran en general entre 0,1 y 10.000 g/ha, de manera preferente entre 10 y 1.000 g/ha. En el tratamiento de las semillas las cantidades de principio activo usadas se sitúan en general entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semillas, de manera preferente entre 0,01 y 10 g por kilogramo de semillas. En el tratamiento del suelo las cantidades de principio activo usadas se sitúan en general entre 0,1 y 10.000 g/ha, de manera preferente entre 1 y 5.000 g/ha.

Tal como ya se ha mencionado con anterioridad, se pueden tratar de acuerdo con la invención todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferida, las especies vegetales y las variedades de plantas silvestres u obtenidas por medio de procedimientos de cría biológicos convencionales tales como cruce o fusión de protoplastos, así como sus partes, se pueden tratar de acuerdo con la invención. En otra forma de realización preferente se tratan plantas y variedades de plantas transgénicas, que se han obtenido por medio de procedimientos de tecnología genética en combinación con procedimientos convencionales (organismos modificados genéticamente), y sus partes. El término "partes" o "partes de plantas" o "partes vegetales" ya se ha explicado con anterioridad.

De manera especialmente preferente se tratan de acuerdo con la invención plantas de cada una de las variedades vegetales habituales en el comercio o que se encuentran en uso. Se entiende por variedades vegetales plantas con nuevas características ("rasgos"), que se han criado por medio de cría convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Pueden ser variedades, razas, biotipos o genotipos.

Según las especies o variedades de plantas, su hábitat y condiciones de crecimiento (suelos, clima, período vegetativo, nutrición), debido al tratamiento de acuerdo con la invención

pueden aparecer también efectos superaditivos (“sinérgicos”). De este modo son posibles por ejemplo menores cantidades de uso y/o ampliaciones del espectro de acción y/o una intensificación de las sustancias y medios que se pueden usar de acuerdo con la invención, un mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas altas o bajas, mayor tolerancia frente a la sequedad o frente al contenido de agua o de sales del suelo, mayor intensidad de floración, cosecha simplificada, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mejor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos cosechados, mayor capacidad para el almacenaje y/o aptitud para el procesamiento de los productos de la cosecha, que van más allá de los efectos esperados.

Entre las plantas o variedades de plantas transgénicas (obtenidas mediante tecnología genética) preferidas que hay que tratar de acuerdo con la invención se cuentan todas las plantas que mediante la modificación por técnicas genéticas obtuvieron un material genético que les confiere valiosas propiedades (“rasgos”) especialmente ventajosas. Ejemplos de propiedades de este tipo son un mejor crecimiento vegetal, mayor tolerancia frente a temperaturas altas o bajas, mayor tolerancia frente a la sequedad o frente al contenido de agua o de sales del suelo, mayor intensidad de floración, cosecha simplificada, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mejor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos cosechados, mayor capacidad para el almacenaje y/o aptitud para el procesamiento de los productos de la cosecha. Ejemplos adicionales y particularmente destacados de propiedades de este tipo son una mayor defensa de las plantas frente a los parásitos animales y microbianos, tal como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus así como una mayor tolerancia de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas cabe mencionar las plantas cultivadas importantes tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, algodón, tabaco y colza así plantas frutales (con los frutos manzanas, peras, cítricos y uvas), destacándose en particular maíz, soja, patata, algodón, tabaco y colza. Como propiedades (“rasgos”) se destacan en particular la mayor defensa de las plantas frente a insectos, ácaros, nematodos y gasterópodos mediante las toxinas generadas en las plantas, en especial aquellas que se han generado en las plantas (de ahora en adelante “plantas Bt”) debido al material genético procedente de *Bacillus thuringiensis* (por ej. mediante los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así como sus combinaciones). Como propiedades (“rasgos”) se destaca también en especial la mayor defensa de las plantas frente a hongos, bacterias y virus mediante resistencia sistémica adquirida (RSA), sistemina, fitoalexina, elicitores así como genes de resistencia y las correspondientes proteínas y toxinas exprimidas. Como propiedades (“rasgos”) se destacan además en especial la mayor tolerancia de las plantas frente a determinados principios activos

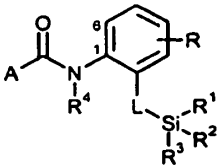
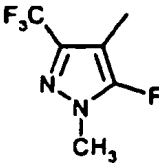
herbicidas, por ej. imidazolinonas, sulfonilureas, glifosatos o fosfinotricina (por ej. gen "PAT"). Los genes que confieren cada una de las propiedades ("rasgos") deseadas pueden estar presentes en las plantas transgénicas también combinados entre sí. Como ejemplos de "plantas Bt" cabe mencionar variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata que se comercializan bajo las denominaciones comerciales de YIELD GARD® (por ej. maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ej. maíz), StarLink® (por ej. maíz), Bollgard® (algodón), Nucoton® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes a los herbicidas cabe mencionar variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan bajo las denominaciones comerciales de Roundup Ready® (tolerancia frente al glifosato por ej. maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia frente a la fosfinotricina, por ej. colza), IMI® (tolerancia frente a la imidazolinona) y STS® (tolerancia frente a las sulfonilureas por ej. maíz). Como plantas resistentes a los herbicidas (crías de modo convencional para lograr resistencia a los herbicidas) cabría mencionar también las variedades (por ej. maíz) comercializadas bajo la denominación de Clearfiel®. Naturalmente, todas estas afirmaciones son válidas también para las variedades vegetales que se desarrollen en el futuro o que lleguen a los mercados en el futuro con estas propiedades ("rasgos") genéticas o las que se desarrollen en el futuro.

Las plantas indicadas pueden tratarse de acuerdo con la invención y de modo particularmente ventajoso con los compuestos de fórmula (I) o las mezclas de principios activos de acuerdo con la invención. Los ámbitos preferentes indicados con anterioridad para los principios activos o las mezclas son válidos también para el tratamiento de estas plantas. Cabe destacar en especial el tratamiento de las plantas con los compuestos o mezclas indicados de modo especial en el presente texto.

La preparación y el uso de los principios activos de acuerdo con la invención se derivan de los ejemplos siguientes.

### **Ejemplos de preparación**

Tabla 1

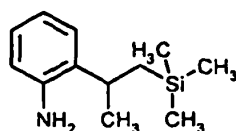
 <span style="margin-left: 20px;">(I)</span>								
Ej.	R	L	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	A	logP
10	H	*-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -#	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H		4,19

5 El enlace marcado con un asterisco (\*) va unido al resto anilina, el enlace marcado con el rombo (#) va unido al sustituyente de silicio.

#### Preparación de los materiales de partida de fórmula (III)

##### Ejemplo (III-1)

10



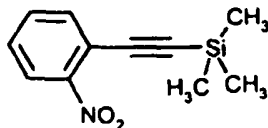
15 Se mezclaron 17,7 g de anilina (0,19 mol), 50 g de aliltrimetilsilano (0,44 mol), 1,5 g de tricloruro de aluminio (0,01 mol) y 0,5 g de polvo de aluminio (0,02 mol) y se agitaron en la autoclave durante 10 h a 255 °C. Después de dejarlo enfriar a temperatura ambiente, se añadieron primero 100 ml de tolueno y después 40 ml de una solución de NaOH al 40 % y 100 ml de agua, y se agitó durante 15 minutos a 35 °C. Después de enfriarlo se extrajo con tolueno, se

20 lavó con agua, se secó sobre carbonato de potasio y se eliminó el disolvente al vacío. Tras destilación (55 °C - 60 °C, 8 Pa) se obtuvieron 1,4 g de 2-(1-metil-2-trimetilsilil-etil)anilina [logP (pH 2,3) = 3,05].

##### Ejemplo (III-2)

*Etapas 1*

5



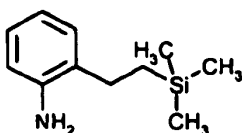
10

15

Se dispusieron bajo una atmósfera de argón 4 g (20 mmol) de orto-bromonitrobenceno, 842 g (1,2 mmol) de cloruro de bis(trifenilfosfin)paladio (II) y 230 g (1,2 mmol) de yoduro de cobre (I). A continuación, a temperatura ambiente y en el plazo de 10 minutos se añadieron gota a gota 2,95 g (30 mmol) de trimetilsililacetileno y se agitó durante 2 días a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se vertió sobre 50 ml de agua, se extrajo 3 veces con 50 ml de éter dietílico cada una, se secó sobre sulfato sódico y se evaporó. Después de la purificación mediante cromatografía en columna con gel de sílice 60 (fase móvil: ciclohexano/acetato de etilo 3:1) se obtuvieron 4,2 g (96 % del valor teórico) de trimetil-(2-nitrofeniletinil)-silano [ $\log P$  (pH 2,3) = 4,12].

*Etapas 2*

20



25

Se disolvieron 10,9 g (50 mmol) de trimetil-(2-nitrofeniletinil)-silano en 200 ml de metanol y se añadieron 0,5 g de carbón de paladio (5 %). A continuación se hidrogenó en autoclave durante 12 h a 4 kPa. Una vez eliminado el disolvente y después de la depuración mediante cromatografía en columna sobre gel de sílice 60 (fase móvil: cloruro de metileno) se obtuvieron 4,1 g de 2-(2-trimetilsililetil)-fenilamina [ $\log P$  (pH 2,3) = 2,58].

30

La determinación de los valores de  $\log P$  indicados se llevó a cabo de acuerdo con la Directiva CEE 79/831 Anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en una columna de fase inversa (C 18). Temperatura: 43 °C.

Eluyentes para la determinación en el intervalo ácido (pH 2,3): ácido fosfórico acuoso al 0,1 %, acetonitrilo; gradiente lineal del 10 % de acetonitrilo al 90 % de acetonitrilo.

35

La calibración se hizo con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono), cuyos valores de  $\log P$  son conocidos (determinación de los valores de  $\log P$  por medio de los

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

### Ejemplo A

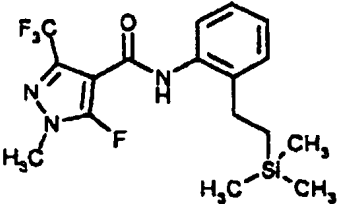
10	Disolvente:	24,5	partes en peso de acetona
		24,5	partes en peso de dimetilacetamida
	Emulsionante:	1	parte en peso de alquilaril poliglicol éter

Para comprobar la eficacia protectora, se rocían las plantas jóvenes con la cantidad de uso indicada de la preparación de principio activo. Una vez seca la capa de rociado se inoculan las plantas con una suspensión acuosa de conidios del agente causante de la sarna del manzano, *Venturia inaequalis*, y se dejan en una cámara de incubación durante 1 día aproximadamente a 20 °C y un 100 % de humedad relativa del aire.

10 días después de la inoculación se lleva a cabo la evaluación. A este respecto, el 0 % significa una eficacia equivalente a la del control correspondiente, mientras que una eficacia del 100 % significa que no se observa ninguna infestación.

35

Tabla A

Prueba de Venturia (manzana) / protectora		
Principio activo de acuerdo con la invención	Cantidad usada de principio activo en g/ha	Eficacia en %
	100	100

## Ejemplo B

## Prueba de Sphaeroteca (pepino) / protectora

5

Disolvente: 49 partes en peso de N,N-dimetilformamida  
Emulsionante: 1 parte en peso de alquilaril poliglicol éter

10

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

15

Para comprobar la eficacia protectora, se rocían plantas de pepino jóvenes con la cantidad de uso indicada de la preparación de principio activo. 1 día después del tratamiento se inoculan las plantas con una suspensión de esporas de *Sphaerotheca fuliginea*. A continuación se colocan las plantas en un invernadero con una humedad relativa del aire de aproximadamente el 70 % y una temperatura de 23 °C.

20

7 días después de la inoculación se lleva a cabo la evaluación. A este respecto, el 0 % significa una eficacia equivalente a la del control correspondiente, mientras que una eficacia del 100 % significa que no se observa ninguna infestación.



Ejemplo C**Prueba de Puccinia (trigo) / protectora**

5	Disolvente:	50	partes en peso de N,N-dimetilacetamida
	Emulsionante:	1	parte en peso de alquilaril poliglicol éter

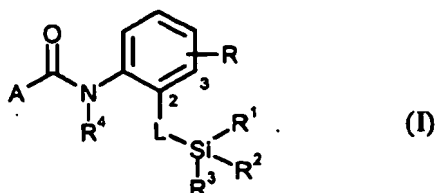
Para preparar una preparación de principio activo apropiada se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

10 Para comprobar la eficacia protectora, se rocían plantas jóvenes con la cantidad de uso indicada de la preparación de principio activo. Una vez seca la capa de rociado se rocían las plantas con una suspensión de conidios de *Puccinia recondita*. Las plantas permanecen en una cámara de incubación durante 48 horas a 20 °C y una humedad relativa del aire del 100 %.

15 A continuación se colocan las plantas en un invernadero con una humedad relativa del aire de aproximadamente el 70 % y una temperatura de 23 °C.

Se colocan después las plantas en un invernadero a una temperatura de aproximadamente 20 °C y una humedad relativa del aire del 80 °C para favorecer el desarrollo de las pústulas de roya.

20 10 días después de la inoculación se lleva a cabo la evaluación. A este respecto, el 0 % significa una eficacia equivalente a la del control correspondiente, mientras que una eficacia del 100 % significa que no se observa ninguna infestación.

**Reivindicaciones****1.** Carboxamidas sililadas de fórmula (I)

en la que

R representa hidrógeno, flúor, cloro, metilo, iso-propilo, metiltio o trifluorometilo,  
L representa un enlace directo o alquileo (alcanodiilo), alquenileo (alquenodiilo)  
o alquinileo (alquinodiilo) de cadena lineal o ramificada y en cada caso  
eventualmente sustituidos,

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> representan independientemente uno del otro hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>,  
alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o  
haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

R<sup>3</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,  
alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,  
haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o representa fenilo o  
fenilalquilo eventualmente sustituidos en cada caso,

R<sup>4</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-sulfinilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
sulfonilo, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,  
halo(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)tio, halo(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfinilo, halo(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonilo,  
halo(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halo(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>) con 1 a 9 átomos de flúor,  
cloro y/o bromo en cada caso; formilo, formilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-  
alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>; halo(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo  
C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halo(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> con 1 a 13 átomos de flúor, cloro  
y/o bromo en cada caso; (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo, alcoxi(C<sub>1</sub>-  
C<sub>4</sub>)-alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, ciclo(alquil C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo; haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo,  
haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo,  
halocicloalquil(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada

caso; o  $-C(=O)C(=O)R^5$ ,  $-CONR^6R^7$  o  $CH_2NR^8R^9$ ,

$R^5$  representa hidrógeno, alquilo  $C_1-C_8$ , alcoxi  $C_1-C_8$ , alcoxi( $C_1-C_4$ )alquilo  $C_1-C_4$ , cicloalquilo  $C_3-C_8$ ; haloalquilo  $C_1-C_6$ , haloalcoxi  $C_1-C_6$ , haloalcoxi( $C_1-C_4$ )alquilo  $C_1-C_4$ , halocicloalquilo  $C_3-C_8$  con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso,  $R^6$  y  $R^7$  representan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, alquilo  $C_1-C_8$ , alcoxi( $C_1-C_4$ )alquilo  $C_1-C_4$ , cicloalquilo  $C_3-C_8$ ; haloalquilo  $C_1-C_8$ , haloalcoxi( $C_1-C_4$ )alquilo  $C_1-C_4$ , halocicloalquilo  $C_3-C_8$  con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso,

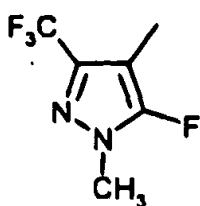
$R^6$  y  $R^7$  forman además, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos un heterociclo saturado con 5 a 8 átomos de anillo y dado el caso sustituido una o varias veces, de manera igual o distinta, con halógeno o alquilo  $C_1-C_4$ , pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no vecinos de la serie formada por oxígeno, azufre o  $NR^{10}$ .

$R^8$  y  $R^9$  representan independientemente entre sí hidrógeno, alquilo  $C_1-C_8$ , cicloalquilo  $C_3-C_8$ ; haloalquilo  $C_1-C_8$ , halocicloalquilo  $C_3-C_8$  con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso,

$R^8$  y  $R^9$  forman además, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos un heterociclo saturado con 5 a 8 átomos de anillo y dado el caso sustituido una o varias veces, de manera igual o distinta, con halógeno o alquilo  $C_1-C_4$ , pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no vecinos de la serie formada por oxígeno, azufre o  $NR^{10}$ .

$R^{10}$  representa hidrógeno o alquilo  $C_1-C_6$ ,

A representa el resto de fórmula (A9)



(A9)

2. Carboxamidas sililadas de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizadas porque

R representa hidrógeno, flúor, cloro, metilo o trifluorometilo,

L representa un enlace directo o alquileo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenileo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquinileo de cadena lineal o ramificada en cada caso eventualmente sustituidos con halógeno,

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> representan independientemente uno del otro alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>,  
5      alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> o alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>,

R<sup>3</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, fenilo o bencilo,

R<sup>4</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfinilo, alquil (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonilo, alcoxi (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,  
10      halo(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)tio, halo(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfinilo, halo(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-sulfonilo,

halo(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halo(cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>) con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; formilo, formilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-

alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>; halo(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halo(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> con 1 a 13 átomos de flúor, cloro  
15      y/o bromo en cada caso; alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, cicloalquil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo; haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo,

haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, halocicloalquil(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; o representa -C(=O)C(=O)R<sup>3</sup>, -CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> o -CH<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>,

R<sup>5</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso  
20      R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> representan independientemente entre sí en cada caso hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso,  
25      R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> forman además, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos un heterociclo saturado con 5 a 6 átomos de anillo y dado el caso sustituido una o cuatro veces, de manera igual o distinta, con halógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, pudiendo

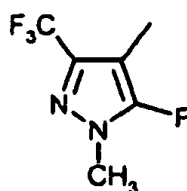
contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no vecinos de la serie formada por oxígeno, azufre o NR<sup>10</sup>,  
30      R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> representan independientemente entre sí hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso,

R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> forman además, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos un  
35      R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> forman además, junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos un

heterociclo saturado con 5 a 6 átomos de anillo y dado el caso sustituido una o varias veces, de manera igual o distinta, con halógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no vecinos de la serie formada por oxígeno, azufre o NR<sup>10</sup>,

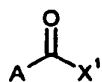
R<sup>10</sup> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

A representa el resto de fórmula (A9)



(A9)

3. Procedimiento para la preparación de carboxamidas sililadas de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque se hacen reaccionar  
a) derivados de ácido carboxílico de fórmula (II)



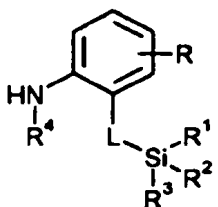
(II)

en la que

X<sup>1</sup> representa halógeno o hidroxilo y

A tiene los significados indicados en la reivindicación 1,

con aminas de fórmula (III)



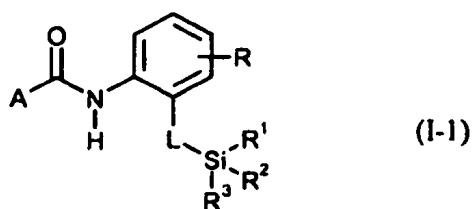
(III)

en la que R, L, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

dado el caso en presencia de un catalizador, dado el caso en presencia de un agente de condensación, dado el caso en presencia de un aceptor de ácidos y dado el caso en presencia de un diluyente,

o

b) carboxamidas siliadas de fórmula (I-1)



en la que R, L, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> y A tienen los significados indicados en la reivindicación 1, con halogenuros de fórmula (VIII)



en la que

X<sup>2</sup> representa cloro, bromo o yodo,

R<sup>4a</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfinilo, alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)sulfonilo, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)tio, haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)sulfinilo, haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)sulfonilo, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; formilo, formilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>; halo(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halo(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> con 1 a 13 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo, alcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, cicloalquil(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo; haloalquil(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, haloalcoxi(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)alquil(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, halocicloalquil(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo con 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo en cada caso; o -C(=O)C(=O)R<sup>5</sup>, -CONR<sup>6</sup>R<sup>7</sup> o -CH<sub>2</sub>NR<sup>8</sup>R<sup>9</sup>, teniendo R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> los significados indicados en la reivindicación 1.

en presencia de una base y en presencia de un diluyente.

4. Agente para combatir microorganismos no deseados, caracterizado por un contenido de al menos una carboxamida sililada de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 además de diluyentes y/o sustancias tensioactivas.
- 5 5. Uso de carboxamidas sililadas de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 para combatir microorganismos no deseados.
6. Procedimiento para combatir microorganismos no deseados, caracterizado porque se esparcen carboxamidas sililadas de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 sobre los microorganismos y/o su hábitat.
- 10 7. Procedimiento para la preparación de agentes para combatir microorganismos no deseados, caracterizado porque se mezclan carboxamidas de fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 1 con diluyentes y/o sustancias tensioactivas.