



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 359 865**

51 Int. Cl.:
C07D 401/12 (2006.01)
A61K 31/4412 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **06781208 .1**
96 Fecha de presentación : **12.07.2006**
97 Número de publicación de la solicitud: **1915365**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **30.04.2008**

54 Título: **Compuesto de carboxamida y el uso del mismo.**

30 Prioridad: **14.07.2005 JP 2005-205247**
28.11.2005 JP 2005-341611
30.03.2006 JP 2006-93740

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
27.05.2011

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
27.05.2011

73 Titular/es:
SUMITOMO CHEMICAL COMPANY LIMITED
27-1, Shinkawa 2-chome
Chuo-ku, Tokyo 104-8260, JP

72 Inventor/es: **Souma, Shin-Ichiro y**
Kinoshita, Yoshiharu

74 Agente: **Ungría López, Javier**

ES 2 359 865 T3

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

DESCRIPCIÓN

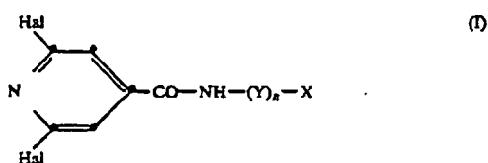
Compuesto de carboxamida y el uso del mismo

5 La presente invención se refiere a un compuesto de carboxamida y al uso del mismo.

El desarrollo de un agente de control fitopatológico ha evolucionado, y se han descubierto compuestos que tienen actividad de control sobre muchas fitopatologías.

10 Sin embargo, actividad de control fitopatológico de estos compuestos no es suficiente en algunos casos.

El documento EP-A2-0 334 809 se refiere a amidas de ácido isonicotínico sustituidas y a hidrazidas de ácido isonicotínico de la fórmula general:



en la que

20 cada Hal es independientemente flúor, cloro, bromo o yodo;

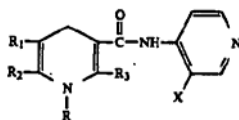
Y es CH-R₁ o NH;

n es 1 ó 0;

25 R₁ es hidrógeno o alquilo C₁-C₄;

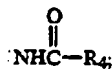
X es un heterociclo de 5 miembros saturado o insaturado, sin sustituir o sustituido con alquil C₁-C₈-, halógeno-, trifluorometilo-, ciano- o nitro-, que tiene de 1 a 3 heteroátomos, tales como N, O o S, en el que el heterociclo puede, además, contener un grupo oxo o tioxo.

30 El documento US-A-4 578 394 se refiere a un compuesto que tiene la fórmula



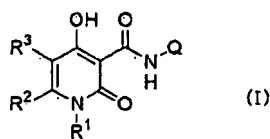
35 en la que R es un alquilo inferior o Ar alquilo inferior;

R₁, R₂ y R₃ pueden ser iguales o diferentes y son hidrógeno, alquilo inferior o halógeno; X es hidrógeno, NH₂ o



y R₄ es hidrógeno o a alquilo inferior.

El documento WO 2006/129432 A se refiere a un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I):

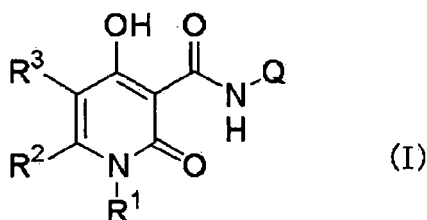


en la que Q representa un grupo heterocíclico nitrogenoso de 5 miembros que puede condensarse con un anillo benceno, R¹ es grupo alquilo C1-C3, etc., R² es un átomo de hidrógeno, etc. y R³ es un átomo de hidrógeno.

Un objeto de la presente invención es proporcionar un compuesto que tenga una actividad de control de fitopatología excelente.

La presente invención es como se indica a continuación:

[1] Un compuesto de carboxamida (en lo sucesivo, denominado como compuesto de la presente invención) representado por la Fórmula (I):



[en la que Q representa un grupo heterocíclico aromático de 6 miembros que contiene nitrógeno, opcionalmente condensado con un anillo benceno, uno de los átomos constitucionales del grupo heterocíclico es un átomo de nitrógeno y el grupo heterocíclico puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro;

R¹ representa un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilquilo C2-C5, R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, o R¹ y R² se unen entre sí en un extremo para representar un grupo alquileno C3-C4; y R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, o un grupo alquilo C1-C3.]

[2] El compuesto de carboxamida de acuerdo con [1], en el que Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo quinolín-2-ilo, un grupo quinolín-3-ilo o un grupo isoquinolín-3-ilo, y el grupo heterocíclico puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro. [3] El compuesto de carboxamida de acuerdo con [1], en el que Q es un grupo piridilo y el grupo piridilo puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro.

[4] El compuesto de carboxamida de acuerdo con [1] a [3], en el que R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.

[5] El compuesto de carboxamida de acuerdo con [1] a [3], en el que R³ es un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno.

[6] Un agente de control fitopatológico que comprende el compuesto de carboxamida como se ha definido de [1] a [5] como un ingrediente activo y un vehículo inerte.

[7] Un método de controlar una fitopatología, que comprende una etapa de tratar una planta o un suelo, en el que una planta crece con una cantidad eficaz del compuesto de carboxamida como se ha definido en [1] a [5].

[8] Uso del compuesto de carboxamida como se ha definido en [1] a [5] para controlar una fitopatología.

Los ejemplos del grupo alquilo C1-C3 representado por R¹ incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo y un grupo isopropilo, y los ejemplos del grupo alcohalquilo C2-C5 incluyen un grupo metoximetilo, un grupo etoximetilo y un grupo propoximetilo.

5 Los ejemplos del grupo alquilo C1-C3 representado por R² incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo y un grupo isopropilo.

Los ejemplos del grupo alquileo C3-C4 en el que R¹ y R² se unen entre sí en un extremo incluyen un grupo trimetileno y un grupo tetrametileno.

10 Los ejemplos del átomo de halógeno representado por R³ incluyen un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.

15 Los ejemplos del grupo alquilo C1-C3 representado por R³ incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo y un grupo isopropilo.

Q representa un grupo heterocíclico aromático de 6 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente condensado con un anillo benceno, uno de los átomos constitucionales del anillo es un átomo de nitrógeno y el grupo heterocíclico puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro.

20 Los ejemplos de dicho grupo heterocíclico incluyen un grupo piridilo (un grupo 2-piridilo, un grupo 4-piridilo y un 3-piridilo), un grupo heterocíclico condensado en el que un anillo de piridina está condensado con un anillo benceno (por ejemplo, un grupo quinolin-2-ilo, un grupo quinolin-3-ilo y un grupo isoquinolin-3-ilo) y un grupo heterocíclico condensado en el que un grupo piridilo o un anillo piridilo está condensado con un grupo benceno, estando dicho grupo heterocíclico condensado sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3 (por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo y un grupo propilo), un grupo haloalquilo C1-C3 (por ejemplo, grupo trifluorometilo), un grupo alcoxi C1-C3 (por ejemplo, un grupo metoxi y un grupo etoxi), un átomo de halógeno (por ejemplo, un átomo de flúor y un átomo de cloro), un grupo ciano y un grupo nitro.

Los ejemplos específicos del grupo heterocíclico aromático de 6 miembros que contiene nitrógeno condensado con un anillo benceno representado por Q incluyen:

35 un grupo 2-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-metil-2-piridilo, un grupo 5-metil-2-piridilo, un grupo 5-trifluorometil-2-piridilo, un grupo 5-metoxi-2-piridilo, un grupo 5-ciano-2-piridilo, un grupo 5-nitro-2-piridilo, un grupo 6-cloro-3-piridilo, un grupo 6-trifluorometil-3-piridilo, un grupo 6-metoxi-3-piridilo, un grupo 5-metoxi-3-piridilo, un grupo 6-ciano-3-piridilo, un grupo 6-nitro-3-piridilo, un grupo quinolin-2-ilo, un grupo quinolin-3-ilo y un grupo isoquinolin-3-ilo.

40 Las realizaciones del compuesto de la presente invención incluyen los siguientes compuestos de carboxamida en los compuestos de la presente invención.

45 Un compuesto de carboxamida en el que, Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo quinolin-2-ilo, un grupo quinolin-3-ilo o un grupo isoquinolin-3-ilo y el grupo heterocíclico puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro en la fórmula (I);

50 un compuesto de carboxamida, en el que Q es un grupo piridilo, y el grupo piridilo puede estar sustituido con al menos un átomo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro en la fórmula (I);

55 un compuesto de carboxamida, en el que R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 en la fórmula (I);

60 un compuesto de carboxamida, en el que Q es un grupo piridilo, el grupo piridilo puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro, y R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 en la fórmula (I);

- 5 un compuesto de carboxamida, en el que Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo quinolin-2-ilo, un grupo quinolin-3-ilo o un grupo isoquinolin-3-ilo, el grupo heterocíclico puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro y R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 en la fórmula (I);
- 10 un compuesto de carboxamida, en el que Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-piridilo, un grupo 4-piridilo o un grupo 3-piridilo, el grupo heterocíclico puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro y R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 en la fórmula (I);
- 15 un compuesto de carboxamida, en el que Q es un grupo 2-piridilo y el grupo 2-piridilo puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro en la fórmula (I);
- 20 un compuesto de carboxamida, en el que Q es un grupo 3-piridilo y el grupo 3-piridilo puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro en la fórmula (I);
- 25 un compuesto de carboxamida, en el que R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es un átomo de hidrógeno en la fórmula (I);
- 30 un compuesto de carboxamida, en el que R^2 es un grupo metilo y R^3 es un átomo de hidrógeno en la fórmula (I);
- 35 un compuesto de carboxamida, en el que R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es un grupo metilo en la fórmula (I);
- un compuesto de carboxamida, en el que R^1 es un grupo metilo, R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es un átomo de hidrógeno en la fórmula (I);
- un compuesto de carboxamida, en el que R^1 es un grupo metilo, R^2 es un grupo metilo y R^3 es un átomo de hidrógeno en la fórmula (I);
- 40 un compuesto de carboxamida, en el que R^1 es un grupo metilo, R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es un grupo metilo en la fórmula (I);
- un compuesto de carboxamida, en el que R^1 y R^2 están unidos entre sí en un extremo para ser un grupo metilo y R^3 es un átomo de hidrógeno en la fórmula (I);
- un compuesto de carboxamida, en el que R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es un átomo de flúor en la fórmula (I);
- 45 un compuesto de carboxamida, en el que R^2 es un grupo metilo y R^3 es un átomo de flúor en la fórmula (I);
- un compuesto de carboxamida, en el que R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es un átomo de cloro en la fórmula (I);
- 50 un compuesto de carboxamida, en el que R^2 es un grupo metilo y R^3 es un átomo de cloro en la fórmula (I);
- un compuesto de carboxamida, en el que R^1 es un grupo metilo, R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es un átomo de flúor en la fórmula (I);
- 55 un compuesto de carboxamida, en el que R^1 es un grupo metilo, R^2 es un grupo metilo y R^3 es un átomo de flúor en la fórmula (I);
- un compuesto de carboxamida, en el que R^1 es un grupo metilo, R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es un átomo de cloro en la fórmula (I);
- 60 un compuesto de carboxamida, en el que R^1 es un grupo metilo, R^2 es un grupo metilo y R^3 es un átomo de cloro en

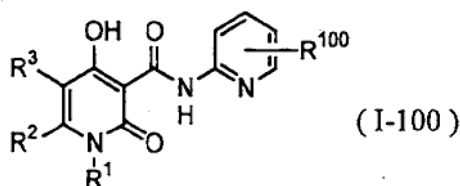
la fórmula (I);

un compuesto de carboxamida, en el que R¹ y R² están unidos entre sí en un extremo para ser un grupo trimetileno, y R³ es un átomo de hidrógeno en la fórmula (I);

un compuesto de carboxamida, en el que R¹ y R² están unidos entre sí en un extremo para ser un grupo trimetileno, y R³ es un átomo de flúor en la fórmula (I);

un compuesto de carboxamida, en el que R¹ y R² están unidos entre sí en un extremo para ser un grupo trimetileno, y R³ es un átomo de cloro en la fórmula (I);

un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I-100):



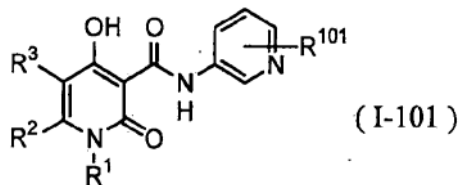
(en la que R¹ representa un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilquilo C2-C5,

R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3,

R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3,

R¹⁰⁰ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro);

un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I-101):



(en la que R¹ representa un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilquilo C2-C5,

R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3,

R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3,

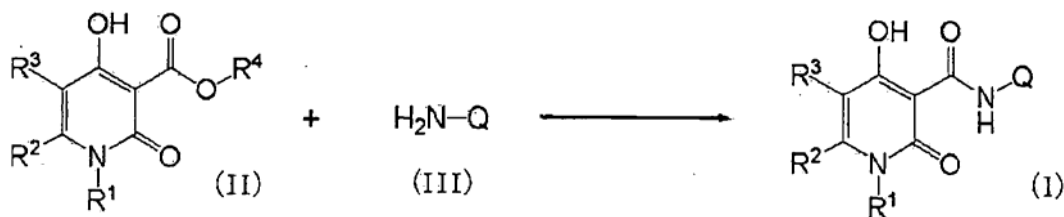
R¹⁰¹ representa un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro.)

A continuación, se explicará un proceso para preparar el compuesto de la presente invención. El compuesto de la presente invención puede prepararse, por ejemplo, de acuerdo con el (Proceso A), (Proceso B) y (Proceso C) siguientes.

En el (Proceso A), (Proceso B), (Proceso C) y Procesos de referencia siguientes, si es necesario, puede usarse un grupo protector para proteger un grupo funcional en particular, y el grupo protector puede desprotegerse en las condiciones adecuadas.

(Proceso A)

El compuesto de la presente invención puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (II) y un compuesto representado por la fórmula (III).



5

[en las que Q representa un grupo heterocíclico aromático de 6 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente condensado con un anillo benceno, uno de los átomos constitucionales del grupo heterocíclico es un átomo de nitrógeno y el grupo heterocíclico puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro,

10

R¹ representa un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilquilo C2-C5, R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, o R¹ y R² están unidos entre sí en un extremo para representar un grupo alquileo C3-C4, R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R⁴ representa un grupo alquilo C1-C10.]

15

Normalmente, la reacción se realiza en presencia de un disolvente. Si es necesario, la reacción puede realizarse mientras un alcohol C1-C10 producido junto con el desarrollo de la reacción, se retira por absorción, destilación o destilación azeotrópica o similares.

20

Los ejemplos del disolvente que se usa en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, xileno y similares, amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida y similares, y mezclas de los mismos.

En la reacción, el compuesto representado por la fórmula (II) se usa normalmente en una proporción de 0,1 a 5 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (III).

25

Una temperatura de reacción en la reacción está normalmente en el intervalo de 80 a 180 °C y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

30

Después de que se complete la reacción, el compuesto de la presente invención representado por la fórmula (I) puede aislarse, por ejemplo, realizando el siguiente procedimiento post-tratamiento.

La mezcla de reacción se enfría a temperatura ambiente, el sólido resultante se recoge por filtración, y el sólido se lava con un disolvente orgánico y se seca;

35

la mezcla de reacción se concentra a presión reducida y el sólido resultante se lava además con un disolvente orgánico y se seca.

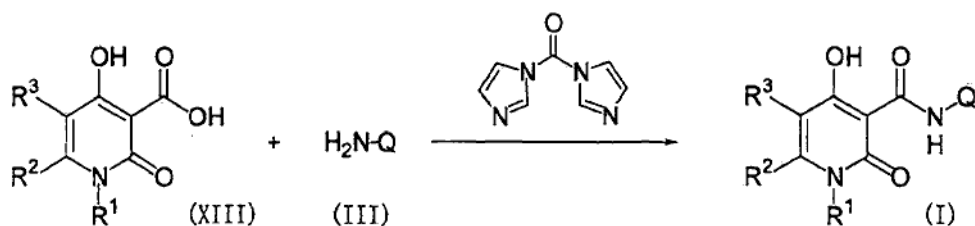
El compuesto de la presente invención aislado representado por la fórmula (I) puede purificarse además por un procedimiento, tal como cromatografía, recristalización y similares.

40

(Proceso B)

El compuesto de la presente invención puede prepararse haciendo reacción un compuesto representado por la fórmula (XIII) y un compuesto representado por la fórmula (III) usando carbonildiimidazol.

45



[en las que R¹, R², R³ y Q son como se han definido anteriormente.]

5 Normalmente, la reacción se realiza en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se usa en la reacción incluyen nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo y similares, éteres, tales como éter dietílico, t-butil metil éter, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano y similares, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, xileno y similares, amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida y similares, y mezclas de los mismos.

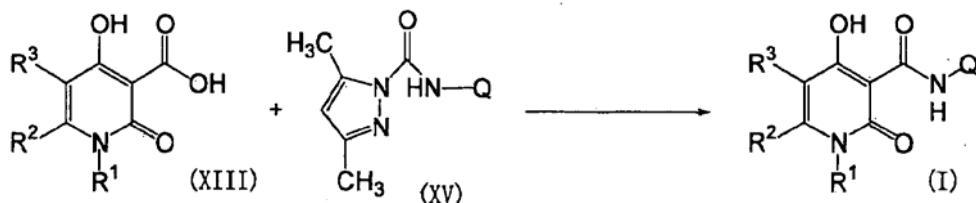
10 En la reacción, el compuesto representado por la fórmula (III) se usa normalmente en una proporción de 0,1 a 5 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XIII). Normalmente, se usa carbonildiimidazol en una proporción de 0,1 a 5 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XIII).

15 Una temperatura de reacción en la reacción está normalmente en un intervalo de -10 a 150 °C, y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

20 Después de que se complete la reacción, el compuesto de la presente invención representado por la fórmula (I) puede aislarse realizando un procedimiento de post-tratamiento, tal como recoger el sólido resultante por filtración, lavar el sólido con un disolvente orgánico, secarlo y así sucesivamente. El compuesto de la presente invención aislado representado por la fórmula (I) puede purificarse además por un procedimiento, tal como cromatografía, recristalización y similares.

(Proceso C)

25 El compuesto de la presente invención puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XIII) y un compuesto representado por la fórmula (XV) en presencia de un triflato de metales alcalinotérreos, tales como triflato de magnesio, triflato cálcico y similares.



30 [en las que R¹, R², R³ y Q son como se han definido anteriormente.]

35 Normalmente, la reacción se realiza en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se usa en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, xileno y similares.

En la reacción, el compuesto representado por la fórmula (XV) se usa normalmente en una proporción de 1 mol por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XIII), y el triflato de metal alcalinotérreo se usa normalmente en una proporción de 0,01 a 0,1 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XIII).

40 Una temperatura de reacción en la reacción está normalmente en un intervalo de 100 a 150 °C y el tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

45 Después de que se completa la reacción, el compuesto representado por la fórmula (I) puede aislarse realizando un procedimiento post-tratamiento, tal como enfriando la mezclado de reacción y recogiendo el sólido resultante por filtración, lavando el sólido con un disolvente orgánico, secándolo y así sucesivamente. El compuesto aislado representado por la fórmula (I) pueden purificarse además por un procedimiento, tal como cromatografía,

recristalización y similares.

El compuesto representado por la fórmula (XV) puede prepararse a partir de un compuesto representado por la fórmula (XVI):

5

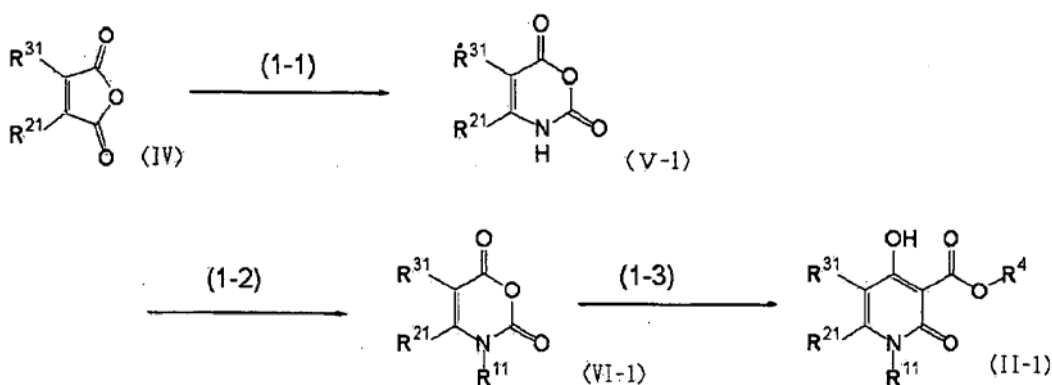
OCN-Q (XVI)

y 3,5-dimetilimidazol.

10 A continuación, se explicará un proceso para preparar un intermedio para preparar el compuesto de la presente invención como Proceso de Referencia.

(Proceso de Referencia 1)

15 Un compuesto representado por la fórmula (II-1) entre los compuestos representados por la fórmula (II) puede prepararse a partir de un compuesto representado por la fórmula (IV) de acuerdo con el siguiente esquema.



20 [en la que Q es como se ha definido anteriormente, R¹¹ representa un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilquilo C2-C5, R²¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, R³¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R⁴ representa un grupo alquilo C1-C10]

25 Etapa (1-1)

Un compuesto representado por la fórmula (V-1) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (IV) con un compuesto de azida (por ejemplo, azida sódica y trimetilsilil azida) y haciendo reaccionar adicionalmente el producto resultante con un compuesto de alcohol (por ejemplo, metanol y etanol).

30 La reacción se realiza normalmente en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se usa en la reacción incluyen hidrocarburos halogenados, tales como cloroformo, tetracloruro de carbono y similares, hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, xileno y similares, amidas de ácidos, tales como *N,N*-dimetilformamida y similares y mezclas de los mismos.

35 En la reacción, el compuesto de azida se usa normalmente en una proporción de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (IV), y el compuesto de alcohol se usa normalmente en una proporción de 1 mol por 1 mol del compuesto de azida.

40 Cuando el compuesto (IV) se hace reaccionar con el compuesto de azida, una temperatura de reacción está normalmente en un intervalo de -20 a 100 °C, y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas. Cuando el producto resultante se hace reaccionar con el compuesto de alcohol, una temperatura de la reacción está normalmente en el intervalo de -20 a 10 °C, y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

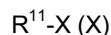
45 Después de que se completara la reacción, el compuesto representado por la fórmula (V-1) puede aislarse realizando un procedimiento post-tratamiento, tal como en forma de un sólido producido en la mezcla de reacción

que se recoge por filtración, lavando el sólido con un disolvente orgánico, secándolo y así sucesivamente. El compuesto aislado representado por la fórmula (V-1) puede purificarse adicionalmente por un procedimiento, tal como cromatografía, recristalización y similares.

- 5 Como alternativa, el compuesto representado por la fórmula (V-1) también puede prepararse por un método que se muestra en Tetrahedron Letters N.º 4, pp. 243-246, 1976.

Etapa (1-2)

- 10 Un compuesto representado por la fórmula (VI-1) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (V-1) con un compuesto representado por la fórmula (X):



- 15 [en la que R^{11} es como se ha definido anteriormente y X representa un grupo saliente, tal como un átomo de halógeno (por ejemplo, átomo de cloro, átomo de bromo y átomo de yodo), un grupo sulfoniloxi (por ejemplo, grupo metanosulfoniloxi, grupo metoxisulfoniloxi y grupo p-toluenosulfoniloxi) y similares] en presencia de una base.

- 20 La reacción se realiza normalmente en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se usa en la reacción incluyen cetonas, tales como acetona, etil metil cetona y similares, hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, xileno y similares, amias ácidas, tales como *N,N*-dimetilformamida y similares, éteres, tales como tetrahidrofurano, 1,4-dioxano y similares, nitrilos, tales como acetonitrilo y similares, y una mezcla de los mismos.

- 25 Los ejemplos del compuesto representado por la fórmula (X) que se usa en la reacción incluyen yoduro de metilo, bromuro de metilo, sulfato de dimetilo, yoduro de etilo, yoduro de propilo y clorometil etil éter.

- Los ejemplos de la base usada en la reacción incluyen carbonatos, tales como carbonato potásico, carbonato de cesio y similares, e hidruros de metales alcalinos, tales como hidruro sódico, hidruro potásico y similares.

- 30 En la reacción, el compuesto representado por la fórmula (X) se usa normalmente en una proporción de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (VI-1), y la base se usa normalmente en una proporción de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (VI-1).

- 35 Una temperatura de reacción en la reacción está en un intervalo de -20 a 150 °C, y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

- Después de que se completa la reacción, el compuesto representado por la fórmula (VI-1) puede aislarse realizando el siguiente procedimiento de post-tratamiento.

- 40 La mezcla de reacción se enfría a temperatura ambiente y se filtra, el filtrado se concentra a presión reducida, y el sólido resultante se lava con un disolvente orgánico y se seca;

- se añade agua a la mezcla de reacción, ésta se extrae con un disolvente orgánico y la capa orgánica se concentra.

- 45 El compuesto aislado representado por la fórmula (VI-1) también puede purificarse además por un procedimiento, tal como cromatografía, recristalización y similares.

Etapa (1-3)

- 50 Un compuesto representado por la fórmula (11-1) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (VI-1) con malonato de dialquilo representado por la fórmula: $CH_2(COOR^4)_2$

- (en la que R^4 es como se ha definido anteriormente)

- 55 en presencia de una base.

- La reacción se realiza normalmente en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se usa en la reacción incluyen éteres, tales como tetrahidrofurano, 1,4-dioxano y similares, hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno,

- 60

xileno y similares, amidas ácidas, tales como *N,N*-dimetilformamida y similares, y una mezcla de los mismas.

Los ejemplos del malonato representado por la fórmula $\text{CH}_2(\text{COOR}^4)_2$ usado en la reacción incluyen malonato de dimetilo y malonato de dietilo.

5

Los ejemplos de la base que se incluye en la reacción incluyen:

alcóxidos metálicos representados por la fórmula:

10



(en la que R^9 es como se ha definido anteriormente) e

hidruros de metales alcalinos, tales como hidruro sódico, hidruro potásico y similares.

15

En la reacción, normalmente se usa malonato de dialquilo en una proporción de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (VI-1), y la base se usa normalmente en una proporción de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (VI-1).

20

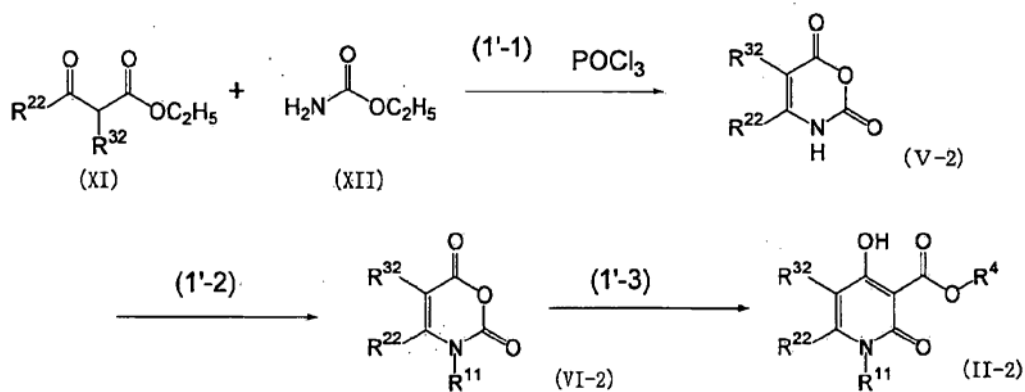
Una temperatura de reacción en la reacción está normalmente en el intervalo de -10 a 150 °C, y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

25

Después de que se completa la reacción, el compuesto representado por la fórmula (11-1) puede aislarse realizando un procedimiento post-tratamiento, tal como enfriando la mezcla de reacción a temperatura ambiente, añadiendo agua ácida, tal como ácido clorhídrico diluido y similares a la mezcla de reacción para hacer ácida la capa acuosa, extrayendo esto con un disolvente orgánico, secando y concentrando la capa orgánica y así sucesivamente. El compuesto aislado representado por la fórmula (11-1) también puede purificarse adicionalmente por un procedimiento, tal como cromatografía, recristalización y similares.

30

Además, puede prepararse un compuesto representado por la fórmula (II-2) entre el compuesto representado por la fórmula (II), por ejemplo, de acuerdo con el siguiente esquema:



35 [en el que, Q, R^{11} y R^4 son como se han definido anteriormente, R^{22} representa un grupo alquilo C1-C3, R^{32} representa un átomo de halógeno y R^4 representa un grupo alquilo C1-C10.]

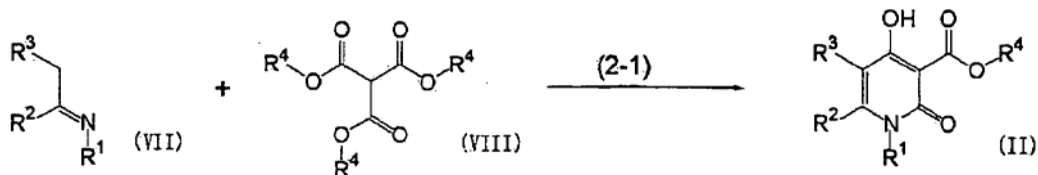
Etapa (1'-1)

40 Un compuesto representado por la fórmula (V-2) puede prepararse de acuerdo con el método descrito en Tetrahedron Letters N° 4, pág. 243-246, 1976.

La etapa A (1'-2) y una etapa (1'-3) se realizan como en la etapa (1-2) y la etapa (1-3).

45 (Proceso de referencia 2)

El compuesto representado por la fórmula (II) también puede prepararse de acuerdo con el siguiente esquema:



[en la que R¹, R², R³, R⁴ y Q son como se han definido anteriormente.]

5

Etapa (2-1)

El compuesto representado por la fórmula (II) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (VII) con un compuesto representado por la fórmula (VIII).

10

La reacción puede realizarse normalmente en ausencia de un disolvente. Como alternativa, la reacción puede realizarse en presencia de un disolvente mientras que un compuesto de alcohol producido junto con una reacción se retira por destilación azeotrópica y similares. Los ejemplos del disolvente que se usa en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, xileno y similares, amidas ácidas, tales como *N,N*-dimetilformamida y similares, y una mezcla de los mismos.

15

En la reacción, el compuesto representado por la fórmula (VIII) se usa normalmente en una proporción de 1 a 50 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (VII).

20

Una temperatura de reacción en la reacción está normalmente en el intervalo de 100 a 250 °C, y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

25

Después de que se completa la reacción, puede aislarse el compuesto representado por la fórmula (II), por ejemplo, realizando el siguiente procedimiento post-tratamiento.

La mezcla de reacción se enfría a temperatura ambiente, el sólido resultante se filtra, y el sólido se lava con un disolvente orgánico y se seca;

30

después de que la mezcla de reacción se enfría a temperatura ambiente, se añade agua a la mezcla de reacción, ésta se extrae con un disolvente orgánico, y la capa orgánica se concentra.

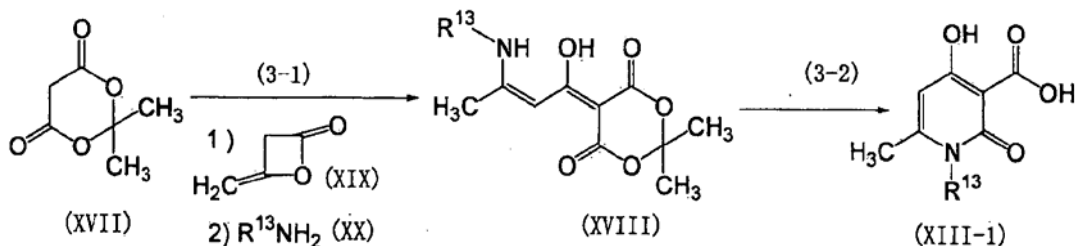
El compuesto aislado representado por la fórmula (II) también puede purificarse adicionalmente por un procedimiento, tal como cromatografía, recristalización y similares.

35

(Proceso de Referencia 3)

Entre el compuesto representado por la fórmula (XIII), un compuesto representado por la fórmula (XIII-1) puede prepararse a partir de un compuesto representado por la fórmula (XVII) de acuerdo con el siguiente esquema:

40



[en el que R¹³ representa un grupo alquilo C1-C3.]

45

(Etapa 3-1)

Un compuesto representado por la fórmula (XVIII) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XVII) con diceteno representado por la fórmula (XIX) en presencia de amina terciaria o piridinas (primera etapa) y haciendo reaccionar el producto resultante con un compuesto representado por la fórmula (XX) (segunda etapa).

5 Cada reacción se realiza normalmente en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se usa en la reacción incluyen nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo y similares, éteres, tales como éter dietílico, *t*-butil metil éter, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano y similares, hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, xileno y similares y una mezcla de los mismos.

10 En la reacción en la primera etapa, se usa normalmente diceteno representado por la fórmula (XIX) en una proporción de 1 mol por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XVII).

15 En la reacción en la primera etapa, los ejemplos de la amina terciaria que se usa incluyen trietilamina y tri-*n*-propilamina; los ejemplos de piridina incluyen piridina y 4-dimetilaminopiridina. En la reacción en la primera etapa, se usa amina terciaria o piridinas normalmente en una proporción de 1 mol por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XVII).

20 Una temperatura de reacción en la primera etapa está normalmente en un intervalo de 0 a 40 °C, y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

La mezcla de reacción obtenida por la reacción en la primera etapa se usa normalmente como tal en la reacción en la segunda etapa.

25 La reacción en la segunda etapa se realiza normalmente mezclando la mezcla de reacción obtenida en la primera etapa y un compuesto representado por la fórmula (XX).

30 En la reacción en la segunda etapa, el compuesto representado por la fórmula (XX) se usa normalmente en una proporción de 2 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XVII).

Una temperatura de reacción en la reacción en la segunda etapa se usa normalmente en un intervalo de 0 a 40 °C, y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

35 Después de que se completa la reacción en la segunda etapa, el compuesto representado por la fórmula (XVIII) puede aislarse realizando un procedimiento post-tratamiento, tal como añadiendo ácido (por ejemplo, ácido clorhídrico diluido, ácido sulfúrico diluido) a la mezcla de reacción, recogiendo el cristal resultante por filtración, secándolo y así sucesivamente. El compuesto aislado representado por la fórmula (XVIII) también puede purificarse adicionalmente por un procedimiento, tal como cromatografía, recristalización y similares.

40 (Etapa 3-2)

Un compuesto representado por la fórmula (XI11-1) puede prepararse manteniendo un compuesto representado por la fórmula (XVIII) de 40 a 120 °C de 0,1 a 24 horas.

45 El procedimiento se realiza normalmente en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente que se usa en el procedimiento incluyen nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo y similares, éteres, tales como *t*-butil metil éter, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano y similares, hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, xileno y similares, y una mezcla de los mismos.

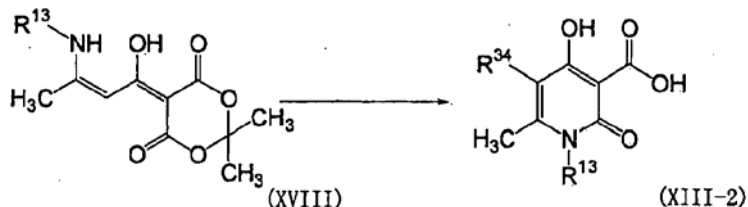
50 Después de que se confirma la desaparición del compuesto representado por la fórmula (XVIII) por un medio de análisis, tal como cromatografía de capa fina y similares, el compuesto representado por la fórmula (XIII-1) puede aislarse realizando un procedimiento post-tratamiento, tal como adición de la mezcla resultante a agua, extracción con un disolvente orgánico, concentración de una capa orgánica y similares. El compuesto aislado representado por la fórmula (XIII-1) también puede purificarse adicionalmente por un procedimiento, tal como cromatografía, recristalización y similares.

55 (Proceso de Referencia 4)

60

Entre el compuesto representado por la fórmula (XIII), un compuesto representado por la fórmula (XIII-2) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XVIII) con un agente de halogenación de -10 a 30 °C (primera etapa) y manteniendo el producto resultante de 40 a 120 °C de 0,1 a 24 horas (segunda etapa):

5



[en la que R³⁴ representa un átomo de halógeno, y R¹³ es como se ha definido anteriormente.]

10 La reacción en la primera etapa se realiza normalmente en presencia de un disolvente. los ejemplos del disolvente usado en la reacción en la reacción incluyen nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo y similares; éteres tales como éter dietílico, *t*-butil metil éter, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano y similares, hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno y bromobenceno, y similares, hidrocarburos aromáticos, tales como tolueno, xileno y similares, y una mezcla de los mismo.

15 Los ejemplos del agente de halogenación usado en la reacción en la primera etapa incluyen sales de *N*-fruropiridinio, tales como bis(tetrafluoroborato) de *N,N'*-difluoro-2,2'-bipiridinio y similares, y *N*-halogenosuccinimidas, tales como *N*-clorosuccinimida, *N*-bromosuccinimida, *N*-yodosuccinimida y similares.

20 En la reacción, el agente de halogenación se usa normalmente en una proporción de 0,5 a 2 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XVIII).

Una temperatura reacción en la primera etapa se usa normalmente en un intervalo de -10 a 30 °C, y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 5 horas.

25 La mezcla de reacción obtenida en la reacción en la primera etapa puede usarse normalmente como tal en un procedimiento de la segunda etapa.

30 El procedimiento en la segunda etapa se realiza normalmente manteniendo la mezcla de reacción obtenida en la primera etapa de 40 a 120 °C.

35 Posteriormente, el compuesto representado por la fórmula (XIII-2) puede aislarse realizando un procedimiento post-tratamiento, tal como adición de la mezcla de reacción a agua, extracción con un disolvente orgánico, concentración de la capa orgánica y similares. El compuesto aislado representado por la fórmula (XIII-2) también puede purificarse adicionalmente por un procedimiento, tal como cromatografía, recristalización y similares.

40 Un compuesto representado por la fórmula (III) puede adquirirse en el mercado o prepararse de acuerdo con el método descrito en, por ejemplo, Indian Journal of Chemistry, Section B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry (1998), 37B(1), pág. 84, Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (2002), 12(16), págs. 2221-2224, JP-B N° 52-009736, Journal of Organic Chemistry (1994), 59(24), págs. 7299-7305, Phosphorus, Sulfur and Silicon and the Related Elements (2002), 177 (11), págs. 2651-2659, Bioorganic & Medicinal Chemistry (2001), 9(12), 3231-3241, Chemische Berichte (1960), 93, págs. 2190-2097, "The Chemistry of Heterocyclic Compounds" (John Wiley & Sons, Inc.) y así sucesivamente.

45 Un compuesto representado por la fórmula (IV), un compuesto representado por la fórmula (VII), Un compuesto representado por la fórmula (VIII), un compuesto representado por la fórmula (X) y malonato de dialquilo pueden adquirirse en el mercado o prepararse de acuerdo con los métodos conocidos.

50 Los ejemplos de una fitopatología que este compuesto puede controlar incluyen las siguientes enfermedades:

Pyricularia oryzae y *Cochliobolus miyabeanus* y *Rhizoctonia solani* del arroz;

Erysiphe graminis, *Gibberella zeae*, *Fusarium graminearum*, *Fusarium culmorum*, *F. avenaceum*, *Microdochium nivale*, *Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. haberiana*, *P. hordei*, *Typhula sp.*, *Micronectriella nivalis*, *Ustilago tritici*, *U. nuda*, *Tilletia caries*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Rhynchosporium secalis*, *Septoria tritici*, *Leptosphaeria nodorum* y *Gaeumanomyces graminis*, del trigo y la cebada;

- 5 *Diaporthe citri*, *Elsinoe fawcetti*, *Penicillium cervantesii* y *P. italicum* de cítricos;
- Sclerotinia mali*, *Valsa mali*, *Podosphaera leucotricha*, *Alternaria mali* y *Venturia inaequalis* de la manzana;
- 10 *Venturia nashicola*, *V. pirina*, *Alternaria kikuchiana* y *Gymnosporangium haraeaeum* de la pera;
- Sclerotinia cinerea*, *Cladosporium carpophilum* y *Phomopsis sp.* del melocotón; *Elsinoe ampelina*, *Glomerella cingulata*, *Uncinula necator*, *Phakopsora ampelopsidis*, *Guarnardia bidwellii* y *Plasmopara viticola*, de la uva;
- 15 *Gloeosporium kaki*, *Cercospora kaki* y *Mycosphaerella nawae* del caqui japonés;
- Colletotrichum lagenarium*, *Sphaerotheca fuliginea*, *Mycosphaerella melonis*, *Fusarium oxysporum*, *Pseudoperonospora cubensis*, *Phytophthora sp* y *Pythium sp.* de la calabaza;
- 20 *Alternaria solani*, *Cladosporium fulvum* y *Phytophthora infestans* del tomate;
- Phomopsis vexans* y *Erysiphe cichoracearum*, de berenjena; *Alternaria japonica* y *Cercospora brassicae* de hortalizas crucíferas;
- 25 *Puccinia allii* del puerro *Cercospora kikuchii*, *Elsinoe glycines*, *Diaporthe phaseolorum var sojae* y *Phakospora pachrhizii* de la semilla de soja; *Colletotrichum lindemthianum* de la judía arriñonada; *Cercospora personata* y *Cercospora arachidicola* del cacahuete; *Erysiphe pisi* del guisante; *Alternaria solani* y *Phytophthora infestans* de la patata; *Sphaerotheca humuli* de la fresa; *Exobasidium reticulatum* y *Elsinoe leucospila* del té; *Alternaria longipes*, *Erysiphe cichoracearum*, *Colletotrichum tabacum*, *Peronospora tabacina* y *Phytophthora nicotianae* del tabaco; *Cercospora beticola* de la remolacha azucarera; *Diplocarpon rosae* y *Sphaerotheca pannosa* de la rosa; *Septoria chrysanthemi-indici* y *Puccinia horiana* del crisantemo; *Botrytis cinerea* y *Sclerotinia sclerotiorum* de diversos cultivos; *Sclerotinia homeocarpaa* y *Rhizoctonia solani* del césped.
- 30

El agente de control fitopatológico de la presente invención puede ser el presente compuesto en sí mismo, pero normalmente, el agente contiene el presente compuesto y un vehículo inerte tal como un vehículo sólido, un vehículo líquido y similar, y se formula en preparaciones mezclando posteriormente un tensioactivo y otros adyuvante para preparaciones. Los ejemplos de dichas preparaciones incluyen concentrados emulsionables, polvos humectables, gránulos dispersables en agua, preparaciones en emulsiones, preparaciones fluidas, polvos finos y gránulos. Estas preparaciones contienen el presente compuesto como un ingrediente activo normalmente del 0,1 al 90% en cuanto a proporción en peso.

35

40

Los ejemplos del vehículo sólido usados después de la formulación de las preparaciones incluyen polvos y partículas finos de minerales tales como arcilla de caolín, arcilla de atapulgita, bentonita, montmorillonita, arcilla ácida, pirofilita, talco, tierra diatomea, calcita y similares, compuestos orgánicos naturales tales como polvos de mazorca de maíz, harina de cáscara de nuez y similares, compuestos orgánicos sintéticos tales como urea y similares, sales tales como carbonato cálcico, sulfato de amonio y similares, sustancias inorgánicas sintéticas tales como óxido de silicio hidratado sintético y similares y los ejemplos del vehículo líquido incluyen hidrocarburos aromáticos tales como xileno, alquilbenzeno, metilnaftaleno y similares, alcoholes tales como 2-propanol, etilenglicol, propilenglicol, etilenglicol-monometil éter y similares, cetonas tales como acetona, ciclohexanona, isoforona y similares, aceites vegetales tales como aceite de semilla de soja, aceite de semilla de algodón y similares, hidrocarburos alifáticos, ésteres, dimetil sulfóxido, acetónitrilo y agua.

45

50

Los ejemplos del tensioactivo incluyen tensioactivos aniónicos tales como sal del éster de alquilsulfato, sal alquilarilsulfonato, sal dialquilsulfossucinato, sal éster fosfato de polioxietilen alquil aril éter, sal sulfonato de lignina, policondensado formaldehído naftaleno sulfonato y similares y tensioactivos no iónicos tales como polioxietilen alquil aril éter, copolímero de bloques de polioxietilen alquil polioxipropileno, éster de ácidos grasos de sorbitán y similares.

55

Los ejemplos de otros adyuvantes para preparaciones incluyen polímeros hidrosolubles tales como alcohol polivinílico, polivinilpirrolidona y similares, polisacáridos tales como goma arábiga, ácido algínico y una sal de los mismos, CMC (carboximetilcelulosa), goma xantano y similares, sustancias inorgánicas tales como silicato de

60

aluminio magnesio, sol de alúmina y similares, conservantes, agentes colorantes y estabilizantes tales como PAP (fosfato de isopropilo ácido), BHT y similares.

5 El agente de control fitopatológico de la presente invención se usa, por ejemplo, para proteger una planta contra una fitopatología tratando el follaje de la planta o usa tratando el suelo contra una fitopatología para proteger a una planta que crece en un suelo. Cuando el agente de control fitopatológico de la presente invención se usa mediante el tratamiento del follaje de una planta, o cuando el agente se usa mediante el tratamiento de un suelo, la cantidad del tratamiento varía dependiendo del tipo de cultivo en el que se va a controlar la planta, del tipo enfermedad a controlar, del nivel de infestación de la enfermedad a controlar, de la forma de preparación, de la duración del tratamiento, del clima y similares y la cantidad en términos del presente compuesto por 10000 m² es normalmente de 1 a 5000 g, preferiblemente de 5 a 1000 g.

15 En el caso de concentrados emulsionables, polvos humectables, preparaciones fluidas y similares, normalmente se trata una planta diluyendo el agente con agua, seguido de pulverización. Una concentración del presente compuesto está normalmente en el intervalo de 0,0001 al 3% en peso, preferiblemente en un intervalo del 0,0005 al 1% en peso. En el caso de polvos finos, gránulos y similares, la planta se trata con el agente sin dilución.

20 Como alternativa, el agente de control fitopatológico de la presente invención puede usarse por un método de tratamiento tal como desinfección de semillas. Los ejemplos del procedimiento de desinfección de semillas incluyen un método de inmersión de una semilla de la planta en un agente de control fitopatológico de la presente invención que se ha preparado de manera que se ajusta una concentración del presente compuesto de 1 a 1000 ppm, un método de pulverización o de aplicación del agente de control fitopatológico de la presente invención que tiene una concentración del presente compuesto de 1 a 1000 ppm en las semillas de la planta y un método de recubrimiento de las semillas de la planta con el agente de control fitopatológico de la presente invención que se ha formulado en polvos.

30 El método de control fitopatológico de la presente invención se realiza normalmente tratando una planta que se espera que desarrolle una enfermedad o un suelo en el que crece la planta y/o tratando una planta que se confirma que ha desarrollado una enfermedad o un suelo en el que crece la planta, con una cantidad eficaz del agente de control fitopatológico de la presente invención.

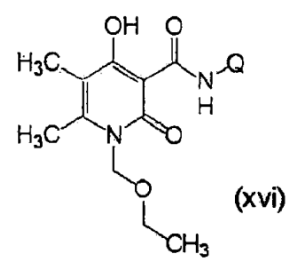
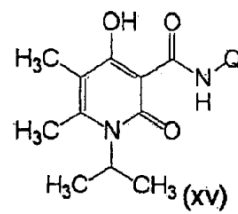
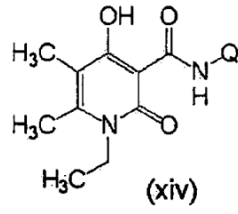
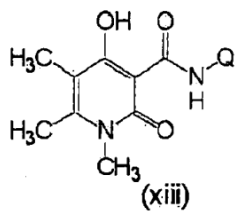
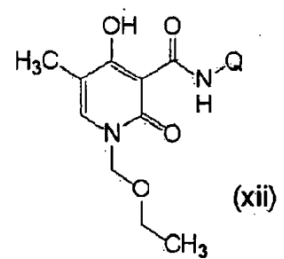
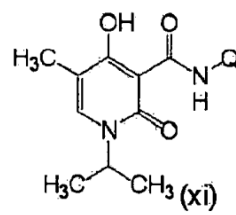
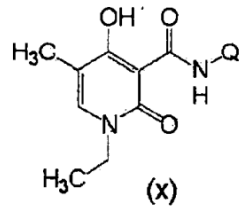
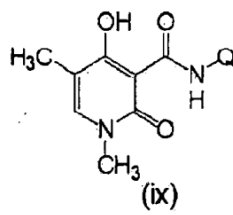
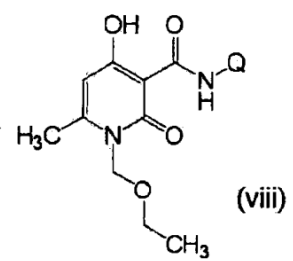
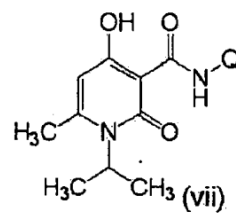
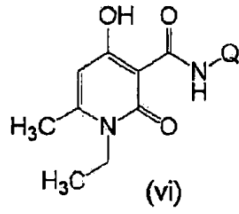
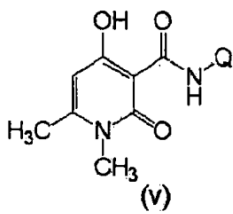
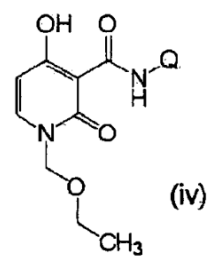
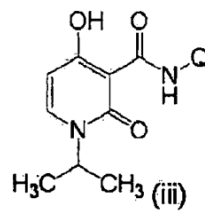
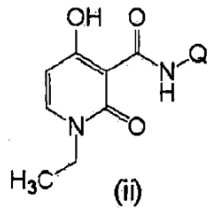
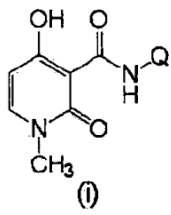
35 El agente de control fitopatológico de la presente invención normalmente se usa como un agente de control fitopatológico para horticultura, es decir, un agente de control fitopatológico para controlar una fitopatología en un campo arado, arrozal, huerto, plantación de té, prado, césped y así sucesivamente.

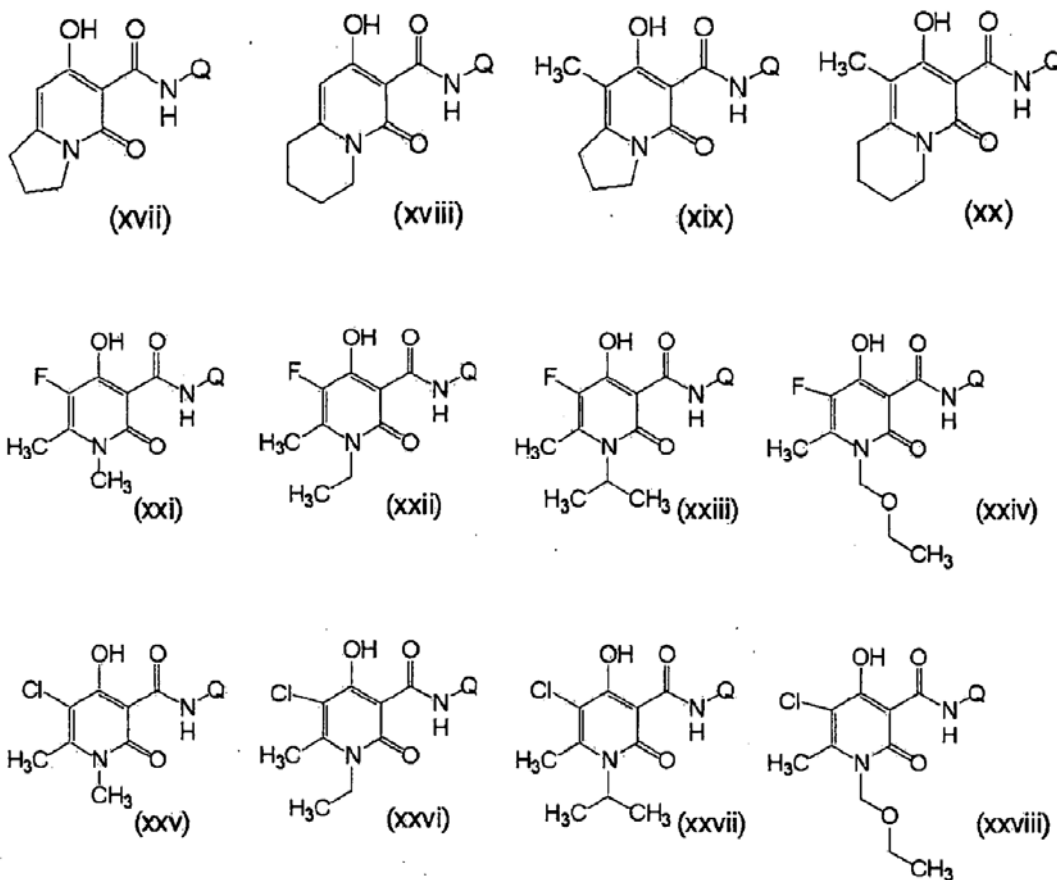
El agente de control fitopatológico de la presente invención puede usarse (mezclado o combinado) junto con otros fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, herbicidas, agentes de control del crecimiento de plantas y/o fertilizantes.

40 Los ejemplos de un ingrediente activo de dichos otros fungicidas incluyen clorotalonil, fluazinam, diclofluanid, fosetil-Al, derivados imidocíclicos (captano, captafol, folpet, etc.), derivados de ditiocarbamato (maneb, mancozeb, tiram, ziram, zineb, propineb, etc.), derivados de cobre inorgánico u orgánico (sulfato de cobre básico, oxicloruro de cobre, hidróxido de cobre, oxina-cobre, etc.), derivados de acilalanina (metalaxil, furalaxil, ofurace, ciprofuram, benalaxil, oxadixil, etc.), compuestos de estrobilurina (kresoxim-metilo, azoxistrobina, trifloxistrobina, picoxistrobina, piraclostrobin, dimoxistrobina, fluoxastrobina, metominostrobin, etc.), derivados de anilino pirimidina (ciprodinil, pirimetanil, mepanipirim, etc.), derivados de fenilpirrol (fenpiclonil, fludioxonil, etc.), derivados de imida (procimidona, iprodiona, vincrozolin, etc.), derivados de benzimidazol (carbendazim, benomil, tiabendazol, tiofanato-metilo, etc.), derivados de amina (fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin, espiroxamina, etc.), derivados de azol (propiconazol, triadimenol, procloraz, penconazol, tebuconazol, flusilazol, diniconazol, bromuconazol, epoxiconazol, difenoconazol, ciproconazol, metconazol, triflumizol, tetraconazol, miclobutanil, fenbuconazol, hexaconazol, fluquinconazol, triticonazol, bitertanol, imazadil, flutriafol, etc.), cimoxanil, dimetomorf, famoxadona, fenamidona, iprovalicarb, bentiavalicarb, ciazofamid, picobenzamid, mandipropamida, zoxamida, etaboxam, boscalid, piribencarb, fluopicolida, fenhexamida, quinoxifen, proquinazid, dietofencarb, acibenzolar-S-metil, guazatina y fentiopirad.

55 Los ejemplos de la presente invención incluyen los siguientes compuestos.

Compuestos de carboxamida representados por la siguientes fórmulas (i) a (xxviii):

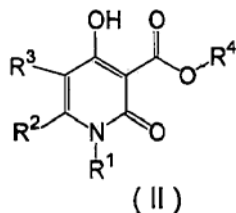




En las fórmulas (i) a (xxviii), Q es cualquiera de los siguientes grupos:

- 5 un grupo 2-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-metil-2-piridilo, un grupo 5-metil-2-piridilo, un grupo 5-trifluorometil-2-piridilo, un grupo 5-metoxi-2-piridilo, un grupo 5-ciano-2-piridilo, un grupo 5-nitro-2-piridilo, un grupo 6-cloro-3-piridilo, un grupo 6-trifluorometil-3-piridilo, un grupo 6-metoxi-3-piridilo, un grupo 5-metoxi-3-piridilo, un grupo 6-ciano-3-piridilo, un grupo 6-nitro-3-piridilo, un grupo quinolin-2-ilo, un grupo quinolin-3-ilo, un grupos isoquinolin-3-ilo.

10 Los ejemplos de aspectos del intermedio para el compuesto de la presente invención incluyen los siguientes compuestos:



15 Un compuesto en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilquilo C2-C5, R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R³ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3 en la fórmula (II).

20 Un compuesto en el que R¹ y R² están unidos entre sí en un extremo para ser un grupo alquilenos C3-C4 y R³ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3 en la fórmula (II).

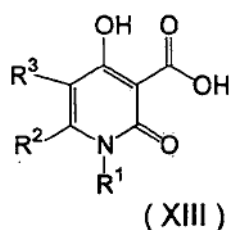
Un compuesto en el que R^1 es un grupo alquilo C1-C3, R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, y R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 en la fórmula (II)-.

5 Un compuesto en el que R^1 es un grupo alquilo C1-C3, R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R^3 es un átomo de halógeno en la fórmula (II).

Un compuesto en el que R^1 es un grupo alquilo C1-C3, R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R^3 es un átomo de flúor en la fórmula (II).

10 Un compuesto en el que R^1 es un grupo alquilo C1-C3, R^2 es un grupo alquilo C1-C3 y R^3 es un átomo de flúor en la fórmula (II).

15 Un compuesto en el que R^1 es un grupo alquilo C1-C3, R^2 es un grupo metilo y R^3 es un átomo de flúor en la fórmula (II).



20 Un compuesto en el que R^1 es un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilquilo C2-C5, R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R^3 es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3 en la fórmula (XIII).

Un compuesto en el que R^1 y R^2 están unidos entre sí en un extremo para ser un grupo alquilenos C3-C4 y R^3 es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3 en la fórmula (XIII).

25 Un compuesto en el que R^1 es un grupo alquilo C1-C3, R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 en la fórmula (XIII).

30 Un compuesto en el que R^1 es un grupo alquilo C1-C3, R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R^3 es un átomo de halógeno en la fórmula (XIII).

Un compuesto en el que R^1 es un grupo alquilo C1-C3, R^2 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R^3 es un átomo de flúor en la fórmula (XIII).

35 Un compuesto en el que R^1 es un grupo alquilo C1-C3, R^2 es un grupo alquilo C1-C3 y R^3 es un átomo de flúor en la fórmula (XIII).

Un compuesto en el que R^1 es un grupo alquilo C1-C3, R^2 es un grupo metilo y R^3 es un átomo de halógeno en la fórmula (XIII).

40 Un compuesto en el que R^1 es un grupo alquilo C1-C3, R^2 es un grupo metilo y R^3 es un átomo de flúor en la fórmula (XIII).

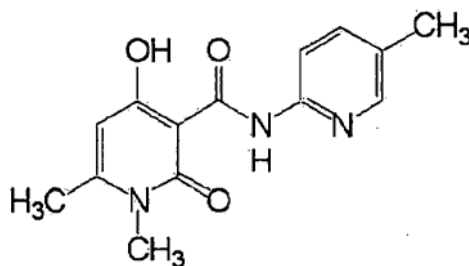
Ejemplos

45 La presente invención se explicará con mayor detalle mediante Ejemplos de Preparación, Ejemplos de Formulación y Ejemplos de Ensayo, pero la presente invención no se limita a estos Ejemplos.

50 En primer lugar, se describirán Ejemplos de Preparación del compuesto de la presente invención y Ejemplos de Preparación de Referencia para preparar intermedios del compuesto de la presente invención.

Ejemplo de Preparación 1.

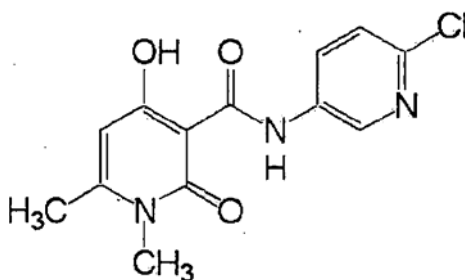
Se añadieron 214 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 101 mg de 2-amino-5-metilpiridina a 2,5 ml de bromobenceno y la mezcla se agitó durante 6,5 horas en condiciones de calentamiento a reflujo. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se añadieron t-butil metil éter y n-hexano a la mezcla. El sólido resultante se recogió por filtración, se lavó con t-butil metil éter y n-hexano, y se secó para obtener *N*-(5-metil-2-piridil)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado como compuesto de la presente invención 1) representado por la fórmula:



^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,30 (3H, s), 2,37 (3H, s), 3,52 (3H, s), 5,95 (1 H, s), 7,51 (1H, dd, $J = 9$ Hz, 2 Hz), 8,06 (1 H, d, $J = 9$ Hz), 8,19 (1 H, d, $J = 2$ Hz), 12,72 (1 H, s), 15,08 (1 H, s).

Ejemplos de Preparación 2

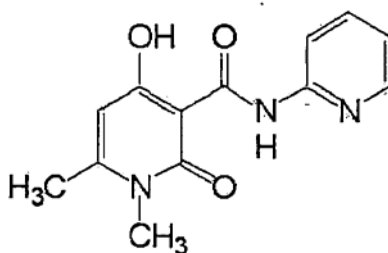
Usando 3-amino-6-cloropiridina en lugar de 2-amino-5-metilpiridina y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo *N*-(6-cloro-3-piridil)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado como compuesto de la presente invención 2) representado por la fórmula:



^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,41 (3H, s), 3,53 (3H, s), 6,02 (1 H, s), 7,31 (1H, d, $J = 9$ Hz), 8,19 (1 H, dd, $J = 9$ Hz, 3 Hz), 8,57 (1H, d, $J = 3$ Hz), 12,60 (1H, s), 14,78 (1H, s).

Ejemplo de Preparación 3

Usando 2-aminopiridina en lugar de 2-amino-5-metilpiridina y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo *N*-(2-piridil)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado como compuesto de la presente invención 3) representado por la fórmula:

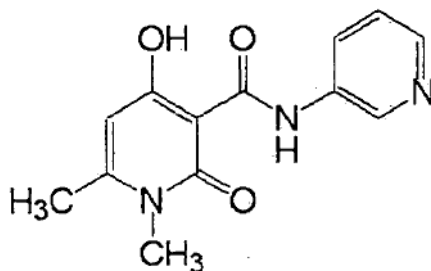


^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,31 (3H, s), 3,45 (3H, s), 5,89 (1 H, s), 6,94-7,00 (1 H, m), 7,60-7,65 (1 H, m), 8,10(1 H, d, J = 9 Hz), 8,37 (1 H, d, J = 4 Hz), 12,81 (1H, s), 14,82 (1 H, s).

5 Ejemplo de Preparación 4

Usando 3-aminopiridina en lugar de 2-amino-5-metilpiridina y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo *N*-(3-piridil)-1,5-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado Compuesto de la Presente Invención⁴) representado por la fórmula:

10



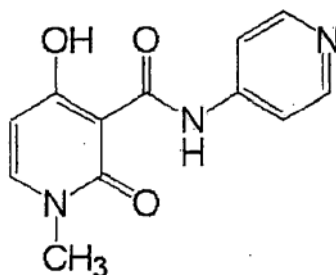
^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,41 (3H, s), 3,53 (3H, s), 6,02 (1 H, s), 7,29 (1 H, dd, J = 8 Hz, 5 Hz), 8,19(1 H, d, J = 8 Hz), 8,37 (1 H, d, J = 5 Hz), 8,78 (1 H, s), 12,51 (1H, s), 14,96 (1 H, s).

15

Ejemplo de Preparación 5

Usando 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo en lugar de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo, usando 4-aminopiridina en lugar de 2-amino-5-metilpiridina y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo *N*-(4-piridil)-1-metil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado como compuesto de la presente invención 5) representado por la fórmula:

20

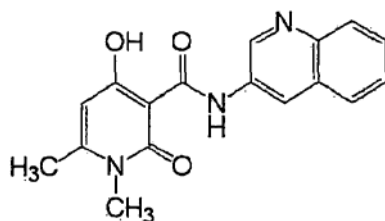


25

^1H RMN (CD_3SOCD_3 , TMS) δ (ppm): 3,56 (3H, s), 6,45 (1H, d, J = 8 Hz), 7,62 (2H, d, J = 5 Hz), 7,97 (1H; d, J = 8 Hz), 8,49 (2H, d, J = 5 Hz), 12,86 (1H, s).

30 Ejemplo de Preparación 6

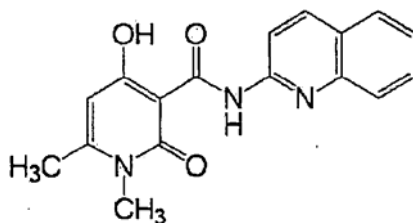
Usando 3-aminoquinolina en lugar de 2-amino-5-metilpiridina y de acuerdo con la misma manera que la del Preparación 1, se obtuvo *N*-(quinolin-3-il)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado como compuesto de la presente invención 6) representado por la fórmula siguiente:



5 ^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,38 (3H, s), 3,53 (3H, s), 6,01 (1H, s), 7,54 (1 H, dd, $J = 8$ Hz, 7 Hz), 7,64 (1 H, dd, $J = 8$ Hz, 7 Hz), 7,82 (1 H, d, $J = 8$ Hz), 8,06 (1 H, d, $J = 8$ Hz), 8,81 (1H, d, $J = 2$ Hz), 8,93 (1 H, d, $J = 2$ Hz), 12,77(1 H, s), 14,53(1 H, s).

Ejemplo de Preparación 7

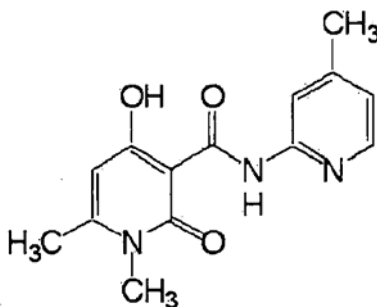
10 Usando 2-aminoquinolina en lugar de 2-amino-5-metilpiridina y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo *N*-(quinolin-2-il)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado como compuesto de la presente invención 7) representado por la fórmula:



15 ^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm) 2,40 (3H, s) 3,55 (3H, s) 5,99 (1H, s), 7,34 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 8 Hz), 7,66 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 9 Hz), 7,77 (1H, d, $J = 8$ Hz), 7,95 (1H, d, $J = 9$ Hz), 8,17 (1H, d, $J = 9$ Hz), 8,40 (1H, d, $J = 9$ Hz), 13,02 (1H, s), 15,00 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 8

20 Usando 2-amino-4-metilpiridina en lugar de 2-amino-5-metilpiridina y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo *N*-(4-metil-2-piridil)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado como compuesto de la presente invención 8) representado por la fórmula:

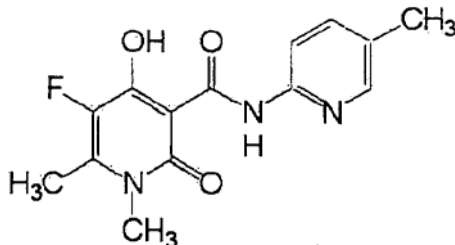


25 ^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,38 (6H, s), 3,58 (3H, s), 5,96 (1H, s), 6,88 (1H, d, $J = 5$ Hz), 8,01 (1H, s), 8,22 (1H, d, $J = 5$ Hz), 12,76 (1H, s), 15,02 (1H, s).

Ejemplo de Preparación 9

Usando 1,6-dimetil-5-fluoro-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo en lugar de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-

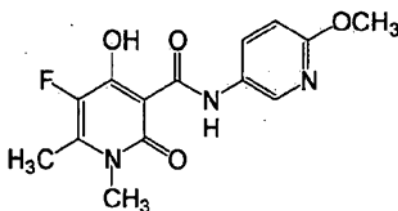
oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo *N*-(5-metil-2-piridil)-5-fluoro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado como compuesto de la presente invención 9) representado por la fórmula siguiente:



5 ^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,31 (3H, s), 2,42 (3H, d, $J = 3$ Hz), 3,54 (3H, s), 7,53 (1H, dd, $J = 8$ Hz, 2 Hz), 8,05 (1H, d, $J = 8$ Hz), 8,20 (1H, m), 12,71 (1H, s), 15,75 (1H, s)

10 Ejemplo de Preparación 10

Usando 1,6-dimetil-5-fluoro-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo en lugar de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo, usando 5-amino-2-metoxipiridina en lugar de 2-amino-5-metilpiridina y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo 1,6-dimetil-5-fluoro-4-hidroxi-2-oxo-*N*-(6-metoxi-3-piridil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado como Compuesto de la Presente Invención 10) representado por la fórmula:

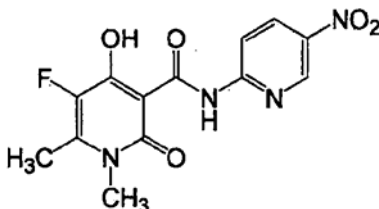


20 ^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm) 2,42 (3H, s), 3,53 (3H, s), 3,94 (3H, s), 6,75 (1H, d, $J = 8$ Hz), 7,97 (1H, d, $J = 8$ Hz), 8,35 (1H, s), 12,23 (1H, s), 15,86 (1H, s).

Ejemplo de Preparación 11

25 Usando 1,6-dimetil-5-fluoro-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo en lugar de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo, usando 2-amino-5-nitropiridina en lugar de 2-amino-5-metilpiridina y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo 1,6-dimetil-5-fluoro-4-hidroxi-2-oxo-*N*-(5-nitro-2-piridil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado como Compuesto de la Presente Invención 11) representado por la fórmula:

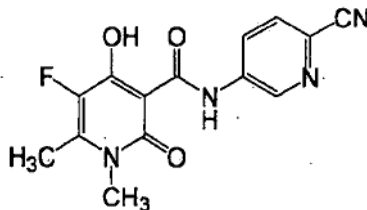
30



^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,45 (3H, s), 3,57 (3H, s), 8,42 (1H, d, $J = 8$ Hz), 8,51 (1H, d, $J = 8$ Hz), 9,22 (1H, s), 13,32 (1H, s), 14,92 (1H, s).

Ejemplo de Preparación 12

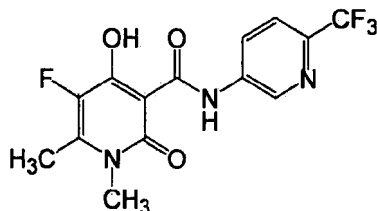
5 Se disolvieron 500 mg de ácido 5-fluoro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico en 5 ml de acetonitrilo y se le añadieron 403 mg de carbonildiimidazol. La mezcla se agitó durante 1 hora en condiciones de agitación a reflujo, se añadieron 297 mg de 5-amino-2-cianopiridina y la mezcla se agitó adicionalmente durante 1 hora en condiciones de agitación a reflujo. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y los cristales resultantes se recogieron por filtración para obtener 460 mg de 1,6-dimetil-5-fluoro-4-hidroxi-2-oxo-N-(6-ciano-3-piridil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado como compuesto de la presente invención 12) representado por la fórmula:



15 ^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,46 (3H, s), 3,56 (3H, s), 7,71 (1H, d, J = 8 Hz), 8,42 (1H, d, J = 8 Hz), 8,82 (1H, s), 12,95 (1H, s), 14,99 (1H, s).

Ejemplos de Preparación 13

20 Usando 1,6-dimetil-5-fluoro-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo en lugar de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo, usando 5-amino-2-trifluorometilpiridina en lugar de 2-amino-5-metilpiridina y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo 1,6-dimetil-5-fluoro-4-hidroxi-2-oxo-N-(6-trifluorometil-2-piridil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado como Compuesto de la Presente Invención 13) representado por la fórmula:



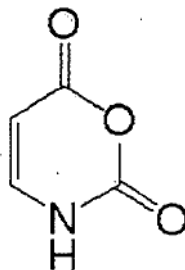
25 ^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,46 (3H, s), 3,56 (3H, s), 7,70 (1H, d, J = 8 Hz), 8,43 (1H, d, J = 8 Hz), 8,84 (1H, s), 12,83 (1H, s), 15,20 (1H, s)

30 Después, se describirán Ejemplos de Preparación de Referencia para preparar intermedios del Compuesto de la Presente.

Ejemplo de Preparación de Referencia 1

35 A temperatura ambiente, se añadieron 7,9 ml de trimetilsililazida a una mezcla de 5,0 g de anhídrido maléico y 20 ml de benceno. La mezcla se agitó a 50-60 °C durante 3 horas. Después de enfriar la mezcla de reacción a temperatura ambiente, se añadieron 4,5 ml de etanol, seguido de agitación durante 3 horas más. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con éter dietílico para obtener 300 mg de 2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona representado por la fórmula:

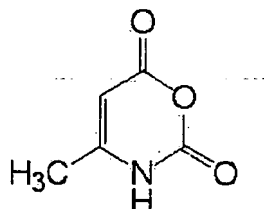
40



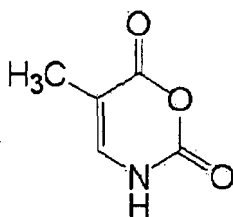
^1H RMN (CD_3SOCD_3 , TMS) δ (ppm): 5,62 (1H, d, J = 8 Hz), 7,66 (1H, d, J = 8 Hz), 11,55 (1H, s)

5 Ejemplo de Preparación Referencia 2

A temperatura ambiente, se añadieron 50,0 g de trimetilsililazida a una mezcla de 44,8 g de anhídrido citracónico y 60 ml de cloroformo. La mezcla se agitó a 50-60 °C durante 5 horas. Después de enfriar la mezcla de reacción con hielo, se añadieron 25,0 g de etanol, seguido de agitación durante 30 minutos más. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mixto de cloroformo y etanol para obtener 4-metil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona en bruto representado por la fórmula:



Además, la solución de lavado se concentró a presión reducida. Se añadió t-butil metil éter al residuo, seguido de filtración. El sólido resultante se lavó con t-butil metil éter. El filtrado y la solución de lavado se combinaron y se concentraron a presión reducida para obtener 5-metil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-di-ona en bruto representada por la fórmula:



4-Metil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona

^1H RMN (CD_3SOCD_3 , TMS) δ (ppm): 2,06 (3H, s), 5,50 (1 H, s), 11,47 (1H, s a)

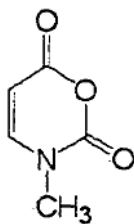
5-Metil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona

^1H RMN (CD_3SOCD_3 , TMS) δ (ppm): 1,78 (3H, s), 7,48 (1H, s), 11,47 (1H, s a)

30 Ejemplo de Preparación Referencia 3

A temperatura ambiente, se añadieron secuencialmente 1,50 g de 2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona, 2,19 g de carbonato potásico y 3,77 g de yoduro de metilo a 30 ml de acetona y la mezcla se agitó durante 10 horas en condiciones de agitación a reflujo. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se filtró. El filtrado se

concentró a presión reducida y el sólido resultante se secó para obtener 1,46 g de 3-metil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:

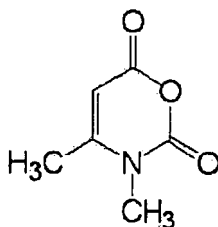


5

^1H RMN (CD_3SOCD_3 , TMS) δ (ppm): 3,26 (3H, s), 5,68 (1H, d, $J = 8$ Hz), 7,82 (1H, d, $J = 8$ Hz)

Ejemplo de Preparación Referencia 4

- 10 Usando 4-metil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona en bruto en lugar de 2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación Referencia 3, se obtuvo 3,4-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona en bruto representada por la fórmula:

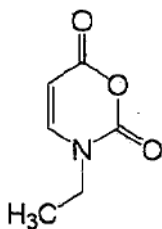


15

^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,27 (3H, d), 3,41 (3H, s), 5,49 (1H, d)

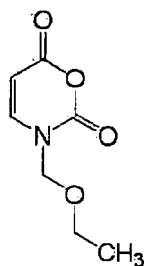
Ejemplo de Preparación Referencia 5

- 20 Usando bromuro de etilo en lugar de yoduro de metilo y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación Referencia 3, se obtuvo 3-etil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:



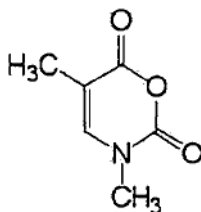
- 25 Ejemplo de Preparación Referencia 6

Usando clorometil etil éter en lugar de yoduro de metilo y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación Referencia 3, se obtuvo 3-etoximetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:



Ejemplo de Preparación Referencia 7

- 5 Usando 5-metil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona en bruto en lugar de 2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación Referencia 3, se obtuvo 3,5-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona en bruto representada por la fórmula:

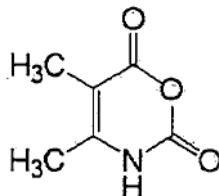


10

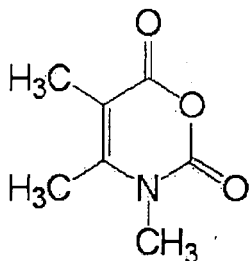
^1H RMN(CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,94 (3H, d), 3,37 (3H, s) 6,99 (1 H, como c)

Ejemplo de Preparación Referencia 8

- 15 Usando 4,5-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:



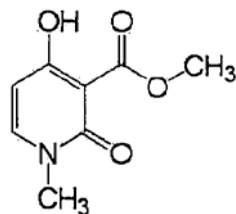
- 20 en lugar de 2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación Referencia 3, se obtuvo 3,4,5-trimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:



- 25 ^1H RMN(CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,97 (3H, s), 2,26 (3H, s), 3,42 (3H, s)

Ejemplo de Preparación Referencia 9

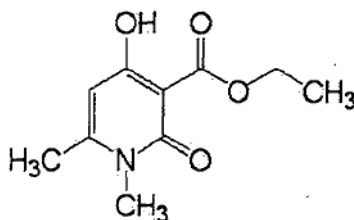
En refrigeración con hielo, se añadieron 568 mg de hidruro sódico (60%) a una mezcla de 181 mg de malonato de dimetilo y 70 ml de *N,N*-dimetilformamida, y la mezcla se agitó durante 20 minutos. Después, la mezcla se calentó a 80 °C, se añadieron 1,50 g de 3-metil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona a la mezcla, seguido de agitación adicional a 120 °C durante 7 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida, se añadió ácido clorhídrico a 2 mol/l al residuo y la mezcla se agitó a 60 °C durante 15 minutos. La mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa saturada de cloruro sódico, se secó con sulfato sódico, se filtró y se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: acetato de etilo) para obtener 100 mg de 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo representado por la fórmula:



¹H RMN (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 3,44 (3H, s), 3,97 (3H, s), 5,97 (1H, d, J = 8 Hz), 7,37 (1H, d, J = 8 Hz), 13,21 (1H, s)

Ejemplo de Preparación Referencia 10

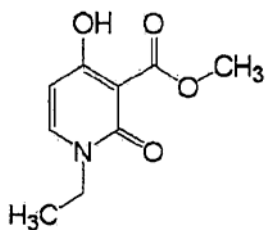
A temperatura ambiente, se añadió 1 ml de una solución de 0,71 g de malonato de dietilo en tetrahidrofurano a una mezcla de 0,19 g de hidruro sódico y 4 ml de tetrahidrofurano, y la mezcla se agitó durante 20 minutos. A temperatura ambiente, se añadieron a la mezcla 3 ml de una solución de 0,59 g de 3,4-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona en tetrahidrofurano, seguido de agitación durante 2 horas en condiciones de agitación a reflujo. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Al residuo se le añadieron 10 ml de agua y 12 ml de 2 mol/l de ácido clorhídrico, seguido de la extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se secó con sulfato de magnesio, después se filtró y se concentró para obtener 0,57 g de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo representado por la fórmula:



¹H RMN (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,44 (3H, t, J = 7 Hz), 2,34 (3H, s), 3,45 (3H, s), 4,93 (2H, c, J = 7 Hz), 5,86 (1H, s), 13,26 (1H, s)

Ejemplo de Preparación Referencia 11

Usando 3-etil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona en lugar de 3,4-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona y usando malonato de dimetilo en lugar de malonato de dietilo y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación Referencia 10, se obtuvo 1-etil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo representado por la fórmula:



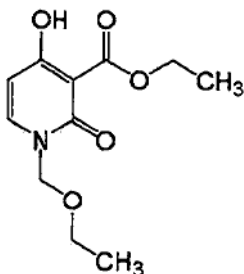
¹H RMN (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,33 (3H, t, J = 7 Hz), 3,94 (2H, c, J = 7 Hz), 3,98 (3H, s), 5,98 (1 H, d, J = 8 Hz), 7,37 (1H, d, J=8 Hz), 13,25 (1 H, s)

5

Ejemplo de Preparación Referencia 12

Usando 3-etoximetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona en lugar de 3,4-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación Referencia 10, se obtuvo 1-etoximetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo representado por la fórmula:

10



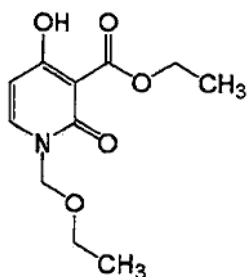
¹H RMN (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,20 (3H, t, J = 7 Hz), 1,44 (3H, t, J = 7 Hz), 3,60 (2H, c, J = 7 Hz), 4,45 (2H, c, J = 7 Hz), 5,30 (2H, s), 6,03 (1 H, d, J = 8 Hz), 7,50 (1 H, d, J = 8 Hz), 13,55 (1 H, s)

15

Ejemplo de Preparación Referencia 13

Usando 3,5-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona en lugar de 3,4-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación Referencia 10, se obtuvo 1,5-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo representado por la fórmula:

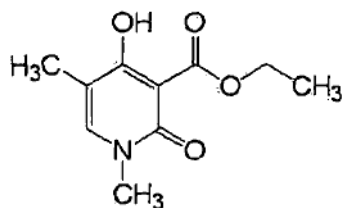
20



25 Ejemplo de Preparación Referencia 14

Usando 3,4,5-trimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona en lugar de 3,4-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona, usando malonato de dimetilo en lugar de malonato de dietilo y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación Referencia 10, se obtuvo 4-hidroxi-2-oxo-1,5,6-trimetil-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo representado por la fórmula:

30

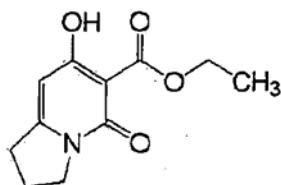


^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,05 (3H, s), 2,36 (3H, s), 3,51 (3H, s), 3,96(3H, s), 13,83(1 H, s)

5 Ejemplo de Preparación Referencia 15

Una mezcla de 10, 1 ml de 2-metil-1-pirrolina y 2,27 ml de metanotricarboxilato de trietilo se agitó a 200 °C durante 20 horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice para obtener 400 mg de éster carboxílico representado por la fórmula:

10



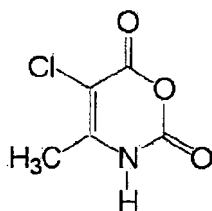
^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,43 (3H, t, J = 7 Hz), 2,14 (2H, m), 3,06 (2H, t, J = 7 Hz), 4,08 (2H, t, J = 7 Hz), 4,41 (2H, c, J = 7 Hz), 5,90(1 H, s), 13,35(1 H, s)

15

Ejemplo de Preparación Referencia 16

Después de que se añadieran 16,5 g de 2-cloroacetoacetato de etilo y 8,91 g de carbamato de etilo a 83,9 g de oxiclورو de fósforo, éste se agitó a 90 °C durante 5 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se añadieron tolueno y agua al residuo, seguido de la separación de las capas. La capa orgánica se extrajo cuatro veces con agua. La capa acuosa se recogió y se extrajo cuatro veces con acetato de etilo. La capa orgánica se recogió, se lavó con agua, se secó con sulfato de magnesio, se filtró y se concentró. El sólido resultante se lavó con una mezcla de t-butil metil éter y n-hexano y se secó para obtener 5-cloro-4-metil-2H-1,3-oxazina-2,6 (3H)-diona representada por la fórmula:

25

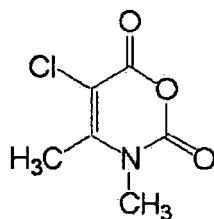


^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,34(3H, s)

30 Ejemplo de Preparación Referencia 17

A temperatura ambiente, se añadieron secuencialmente 2,11 g de 5-cloro-4-metil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona, 2,07 g de carbonato potásico y 1,3 ml de yoduro de metilo a 40 ml de acetona, después la mezcla se agitó durante 3 horas en condiciones de agitación a reflujo. A la mezcla de reacción se le añadieron 0,5 ml de yoduro de metilo y la mezcla se agitó adicionalmente durante 2 horas en condiciones de agitación a reflujo. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El sólido resultante se secó para obtener 1,74 g de 5-cloro-3,4-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:

35

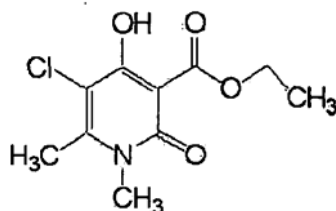


^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,48 (3H, s), 3,48 (3H, s)

5 Ejemplo de Preparación Referencia 18

10 A 0,43 g de hidruro sódico (60%) se les añadieron 35 ml de tetrahidrofurano, se añadieron adicionalmente 2,5 ml de una solución de 1,76 g de malonato de dietilo en tetrahidrofurano en refrigeración con hielo y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. A la mezcla se le añadieron 1,74 g de 5-cloro-3,4-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona, y ésta se agitó durante 3,5 horas en condiciones de agitación a reflujo. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Al residuo, se le añadieron secuencialmente 20 ml de agua y 15 ml de 1 mol/l de ácido clorhídrico, seguido de la extracción con 85 ml de cloroformo dos veces. La capa orgánica se secó con sulfato de magnesio, se filtró y se concentró. El residuo se lavó con n-hexano para obtener 1,52 g de 5-cloro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo representado por la fórmula:

15

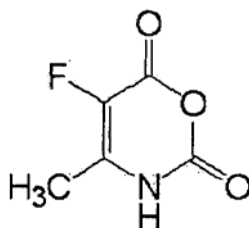


^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,45 (3H-1, t, J = 7 Hz), 2,57 (3H, s), 3,54 (3H, s), 4,46 (2H, c, J = 7 Hz), 14,10 (1H, s).

20

Ejemplo de Preparación Referencia 19

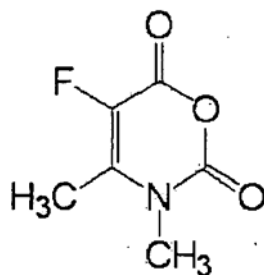
25 Usando 2-fluoroacetoacetato de etilo en lugar de 2-cloroacetoacetato de etilo y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación Referencia 16, se obtuvo 5-fluoro-4-metil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:



30

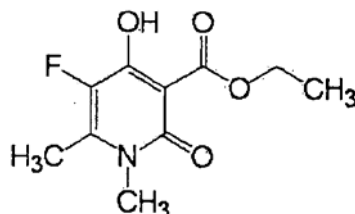
Ejemplo de Preparación Referencia 20

Usando 5-fluoro-4-metil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona en lugar de 5-cloro-4-metil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación Referencia 17, se obtuvo 5-fluoro-3,4-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:



Ejemplo de Preparación Referencia 21

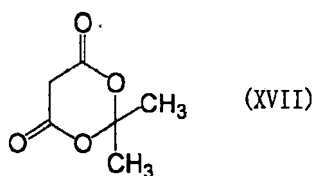
- 5 Usando 5-fluoro-3,4-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona en lugar de 5-cloro-3,4-dimetil-2H-1,3-oxazina-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera que la del Ejemplo de Preparación Referencia 18, se obtuvo 5-fluoro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo representado por la fórmula:



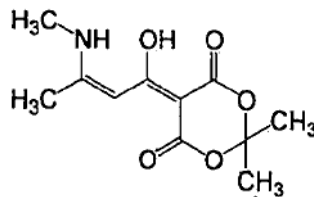
- 10 ^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,45 (3H, d, $J = 7$ Hz), 2,38 (3H, s), 3,46 (3H, s), 4,46 (2H, c, $J = 7$ Hz), 13,67 (1 H, s), 13,64 (1H,s)

Ejemplo de Preparación Referencia 22

- 15 Se disolvieron 14,4 g de un compuesto representado por la fórmula (XVII):



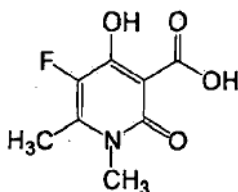
- 20 y 6,8 g de diceteno en 150 ml de acetonitrilo y se añadieron 1,01 g de trietilamina a temperatura ambiente. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después, se añadieron 15,5 g de una solución de metilamina al 40% en metanol a la mezcla, después ésta se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Posteriormente, la mezcla de reacción se enfrió con hielo y se añadieron 30 ml de ácido clorhídrico concentrado. El cristal resultante se recogió por filtración y se secó para obtener 17,6 g de 2,2-dimetil-5-(1-hidroxi-3-metilamino-2-butenilideno)-1,3-dioxano-4,6-diona representada por la fórmula:
- 25



^1H RMN(CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 1,70 (6H, s), 2,16 (3H, s), 3,09 (3H, d, J = 4 Hz), 6,45 (1H, s), 8,82 (1H, a)

Ejemplo de Preparación Referencia 23

- 5 Se suspendió 1,0 g de 2,2-dimetil-5-(1-hidroxi-3-metilamino-2-butenilideno)-1,3-dioxano-4,6-diona en 20 ml de acetonitrilo, se le añadieron 806 mg de bis(tetrafluoroborato) de *N,N'*-difluoro-2,2'-bipiridinio, y ésta se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora y a 50 °C durante 30 minutos. La mezcla de reacción se añadió a 100 ml de agua enfriada con hielo y se extrajo con 100 ml de cloroformo dos veces. La capa orgánica se secó con sulfato de magnesio anhidro, se concentró y el residuo se sometió a cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente: acetato de etilo) para obtener 480 mg de ácido 5-fluoro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico representado por la fórmula:



- 15 ^1H RMN (CDCl_3 , TMS) δ (ppm): 2,47 (3H, s), 3,58 (3H, s), 13,89 (1H, a), 15,46 (1H, a)

Después, se mostrarán los Ejemplos de Formulación. Parte representa parte en peso.

Ejemplo de Referencia 1

- 20 Cincuenta partes de cada uno de los compuestos de la presente invención 1 a 13, 3 partes de ligninsulfonato cálcico, 2 partes de laurilsulfato sódico y 45 partes de óxido de silicio hidroso sintético se muelen y se mezclan bien para obtener polvo humectable de cada uno.

25 Ejemplo de Referencia 2

- Veinte partes de cada uno de los compuestos de la presente invención 1 a 13 y 1,5 partes de triolato de sorbitán se mezclan con 28,5 partes de una solución acuosa que contiene 2 partes de alcohol polivinílico y por último se dividió mediante un método de trituración en húmedo, se añaden 40 partes de una solución acuosa que contiene 0,05 partes de goma de xantano y 0,1 partes de silicato de magnesio y aluminio, se añaden 10 partes de propilenglicol y esto se agita y se mezcla para obtener una preparación fluida de cada uno.

Ejemplo de Referencia 3

- 35 Dos partes de cada uno de los compuestos de la presente invención 1 a 13, 88 partes de arcilla de kaolín y 10 partes de talco se trituran y se mezclan bien para obtener un polvo de cada uno.

Ejemplo de Referencia 4

- 40 Cinco partes de cada uno de los compuesto de la presente invención 1 a 13, 14 partes de fenil éter de estiril polioxietileno, 6 partes de dodecibencenosulfonato cálcico y 75 partes de xileno se mezclan bien para obtener un concentrado emulsionable de cada uno.

Ejemplo de Referencia 5

- 45 Dos partes de cada uno de los compuestos de la presente invención 1 a 13, 1 parte de óxido de silicio hidroso sintético, 2 partes de ligninsulfonato cálcico, 30 partes de bentonita y 65 partes de arcilla de Kaolín se trituran y se mezclan bien, se añade agua y la mezcla se amasa bien, se granula y se seca para obtener gránulos de cada uno.

50 Ejemplo de Referencia 6

Diez partes de cada uno de los compuestos 1 a 13, 35 partes de carbono blanco que contienen 50 partes de sal amonio de alquil éter sulfato de polioxietileno y 55 partes de agua se mezclan y por último se dividen mediante un

método de trituración en húmedo para obtener una preparación fluida de cada uno.

Por lo tanto, los Ejemplos de Ensayo demuestran que los Compuestos de la Presente Invención son útiles como fungicidas agrícolas y hortícolas. El Compuesto de la Presente Invención se indica mediante un número de compuesto.

Ejemplo de Ensayo 1: Ensayo del efecto controlador del moho gris del pepino (efecto preventivo)

Se llenó una maceta de plástico con arena arcillosa y se cultivó pepino (nombre de variedad de planta: Sagamihanpaku) que creció durante 10 días en un invernadero. Cada preparación de pasta líquida de los presentes compuestos 1, 2, 3, 9, 11 y 12, que se habían obtenido de acuerdo con el Ejemplo de Preparación 6, se diluyó con agua hasta una concentración predeterminada (500 ppm) para preparar una solución pulverizable. Cada solución pulverizable se pulverizó sobre el follaje de manera que la solución se adhiriese suficientemente a las hojas de pepino. Después de la pulverización, el pepino se secó al aire hasta un grado en el que la solución pulverizable de las hojas se secó y sobre las hojas del pepino se puso un medio de PDA que contenía una espora de moho gris del pepino (*Botrytis cinerea*). Después de la inoculación, el pepino se colocó a 12°C con elevada humedad durante 5 días y se investigó el efecto controlador.

Como resultado, un área de lesión en una planta tratada con los presentes compuestos 1, 2, 3, 9, 11 y 12 era del 10% o menor de un área de una lesión en una planta no tratada.

Ejemplo de Ensayo 2: Ensayo del efecto controlador de la costra del trigo (*Fusarium culmorum*) (efecto preventivo)

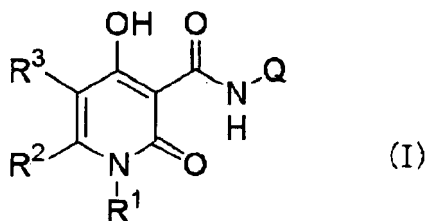
Se llenó una maceta de plástico con arena arcillosa y se cultivó trigo (nombre de variedad de planta: *Shirogane komugi*) que creció durante 8 días en un invernadero. Cada preparación de pasta líquida del presente compuesto 4, que se había obtenido de acuerdo con el Ejemplo de Preparación 6, se diluyó con agua hasta una concentración predeterminada (500 ppm) para preparar una solución pulverizable. Cada solución pulverizable se pulverizó sobre el follaje de manera que la solución se adhiriese suficientemente a las hojas de trigo anteriores. Después de la pulverización, el trigo se secó al aire hasta un grado en el que la solución pulverizadora sobre las hojas se secó y después se inoculó por pulverización una suspensión de esporas de la costra del trigo (*Fusarium culmorum*) (que contenía aproximadamente 2.000.000 de esporas por 1 ml de la suspensión) (a una proporción de aproximadamente 2 ml por una planta). Después de la inoculación, el trigo se puso a 23°C con una elevada humedad durante 4 días, y después se puso en un invernadero a 23°C durante 3 días. Después de esto, se investigó el efecto controlador.

Como resultado, un área de una lesión en una planta tratada con el presente compuesto 4 era del 10% o menor de un área de una lesión en una planta no tratada.

Mediante el uso del presente compuesto puede controlarse una fitopatología.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I)



5

[en la que Q representa un grupo heterocíclico aromático de 6 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente condensado con un anillo benceno, uno de los átomos constituyentes del grupo heterocíclico es un átomo de nitrógeno y el grupo heterocíclico puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro;

10

R¹ representa un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilquilo C2-C5, R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, o R¹ y R² se unen entre sí para representar un grupo alquileno C3-C4; y R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3.]

15

2. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, en el que Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo quinolin-2-ilo, un grupo quinolin-3-ilo o un grupo isoquinolin-3-ilo, y el grupo heterocíclico puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro.

20

3. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, en el que Q es un grupo piridilo y el grupo piridilo puede estar sustituido con al menos un grupo seleccionado entre el grupo que consiste en un grupo alquilo C1-C3, un grupo haloalquilo C1-C3, un grupo alcoxi C1-C3, un átomo de halógeno, un grupo ciano y un grupo nitro.

25

4. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.

30

5. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, en el que R³ es un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno.

6. Un agente de control fitopatológico que comprende, como un ingrediente activo, el compuesto de carboxamida como se define en la reivindicación 1 y un vehículo inerte.

35

7. Un procedimiento de control de una fitopatología, que comprende una etapa de tratar una planta o un suelo, en el que crece la planta, con una cantidad eficaz del compuesto de carboxamida como se define en la reivindicación 1.

8. El uso del compuesto de carboxamida, como se define en la reivindicación 1, para el control de una fitopatología.