



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 362 500**

51 Int. Cl.:
C07D 403/06 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 471/04 (2006.01)
A01N 43/653 (2006.01)
A01N 43/84 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **98950362 .8**
96 Fecha de presentación : **23.10.1998**
97 Número de publicación de la solicitud: **1031571**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **30.08.2000**

54 Título: **Compuestos de sulfamilo y bactericida agrícola u hortícola.**

30 Prioridad: **24.10.1997 JP 9-292399**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
06.07.2011

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
06.07.2011

73 Titular/es: **NISSAN CHEMICAL INDUSTRIES, Ltd.**
7-1, Kanda-Nishiki-cho, 3-chome
Chiyoda-ku, Tokyo 101-0054, JP

72 Inventor/es: **Takeyama, Toshiaki;**
Hamada, Toshimasa;
Takahashi, Hiroaki;
Watanabe, Junichi;
Yamagishi, Kazuhiro;
Nishioka, Masanori y
Suzuki, Hiroyuki

74 Agente: **Elzaburu Márquez, Alberto**

ES 2 362 500 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

Compuestos de sulfamoilo y bactericida agrícola u hortícola.

5 **CAMPO TÉCNICO**

La presente invención se refiere a nuevos compuestos de sulfamoilo y a compuestos agroquímicos (insecticidas, fungicidas, herbicidas, agentes para regular el crecimiento de las plantas y semejantes), particularmente fungicidas agrícolas y hortícolas.

10

ANTECEDENTES DE LA INVENCION

Los documentos JP-A-3-170464, JP-A-6-32785, JP-A-7-2803 y JP-A-7-215971 describen que ciertos compuestos de sulfamoilo tienen actividades bactericidas.

15

Incluso los compuestos descritos en las primeras publicaciones antes descritas tienen una potencia y una efectividad residual insatisfactorias y por lo tanto se desean desarrollar fungicidas agrícolas y hortícolas más útiles.

20

Los documentos WO 94/01419 A, EP 0603415 A1, JP 07002803 A, JP 06032785 A y JP 07215971 A describen como fungicidas agrícolas y hortícolas derivados de triazol que portan un sustituyente sulfamoilo y un sustituyente fenilo, naftilo o piridinilo unidos al anillo de triazol mediante un grupo sulfonilo.

25

Los documentos JP 63255269 y EP 0284277 A1 describen derivados de triazol con actividad fungicida que portan un sustituyente sulfóxido en el átomo 1 del anillo y un sustituyente seleccionado de un grupo ciano, un grupo tioamida y un grupo azometino en el átomo 5 del anillo.

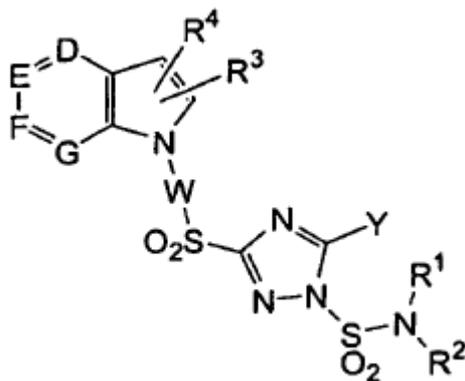
30

DESCRIPCIÓN DE LA INVENCION

Bajo las circunstancias, los presentes inventores han realizado una investigación extensiva con vistas a desarrollar un fungicida excelente y, como resultado, han encontrado que nuevos compuestos de sulfamoilo tiene una notable actividad controladora como fungicidas agrícolas y hortícolas, consiguiendo así la presente invención.

35

Esto es, la presente invención se refiere a un compuesto (1) de sulfamoilo de la siguiente fórmula



35

en la que:

40

R¹ y R² son Me,

Y es H,

W es un enlace químico,

45

D, E, F y G son CR⁷, CR⁸, CR⁹ y CR¹⁰,

R³ es H, alquilo de C₁₋₈, halógeno, haloalquilo de C₁₋₈ o CN,

50

R⁴ es H, alquilo de C₁₋₈, halógeno, o alcoxi de C₁₋₆-carbonilo, haloalquilo de C₁₋₈ o CN, en el que

cuando R³ es H, entonces R⁴ es halógeno o alcoxi de C₁₋₆-carbonilo,

cuando R³ es alquilo de C₁₋₈, entonces R⁴ es H, alquilo de C₁₋₈, halógeno o alcoxi de C₁₋₆-carbonilo,

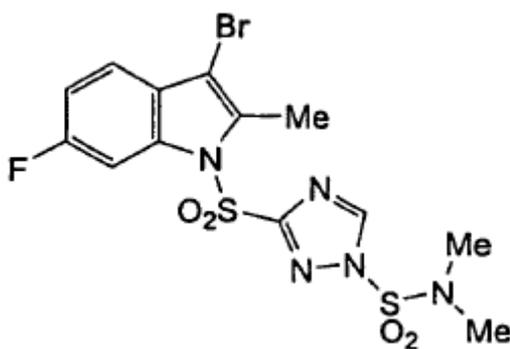
5 cuando R³ es halógeno, entonces R⁴ es halógeno,

cuando R³ es haloalquilo de C₁₋₈, entonces R⁴ es H, alquilo de C₁₋₈ o halógeno,

10 cuando R³ es CN, entonces R⁴ es H o alquilo de C₁₋₈, y

uno de R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ es F, Cl, Br, Me, Et, MeO, NO₂, CN, CF₃ o CO₂Me, mientras los otros de R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son H.

En una realización preferida, la invención se refiere a un compuesto de sulfamoilo que tiene la siguiente fórmula:



15

En otro aspecto, la presente invención se refiere a un compuesto agroquímico que contiene como ingrediente activo al menos un compuesto de sulfamoilo como se describió anteriormente y un vehículo adecuado.

20 Preferiblemente, dicho compuesto agroquímico es un fungicida agrícola y hortícola.

Las definiciones de los sustituyentes R³, R⁴, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ tienen los siguientes significados.

25 Ejemplos de alquilo de C₁₋₈ son metilo, etilo, n- o i-propilo, n- o i-butilo y n-pentilo.

Ejemplos de haloalquilo de C₁₋₈ son clorometilo, diclorometilo, diclorofluorometilo y trifluorometilo.

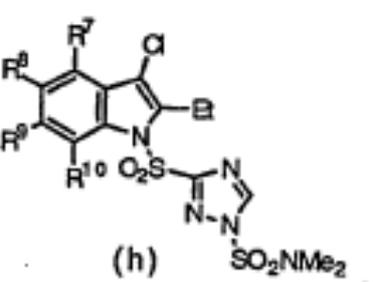
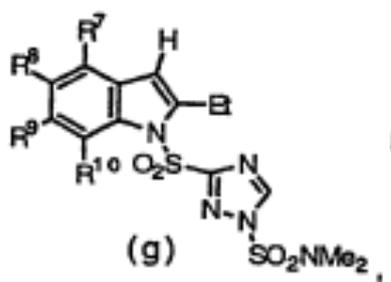
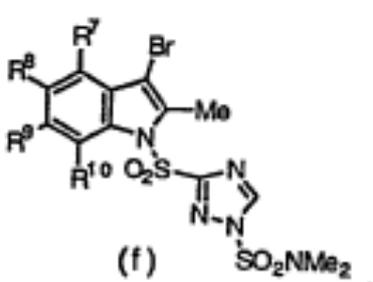
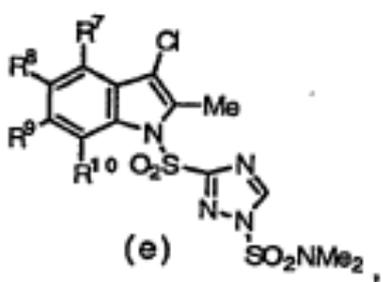
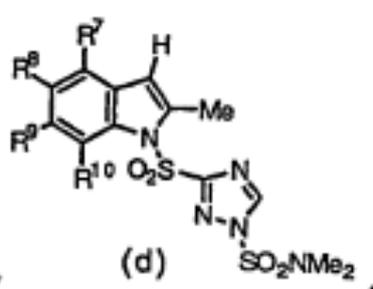
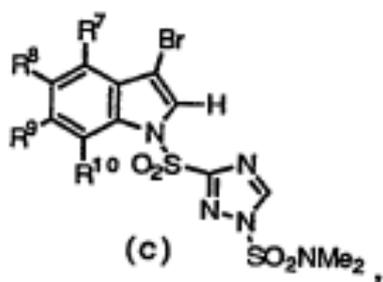
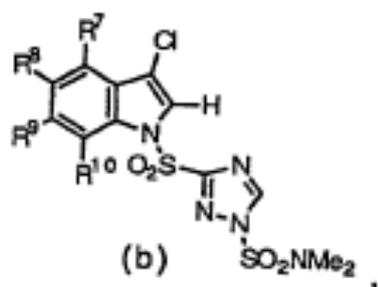
Ejemplo de alcoxi de C₁₋₆-carbonilo es metoxycarbonilo.

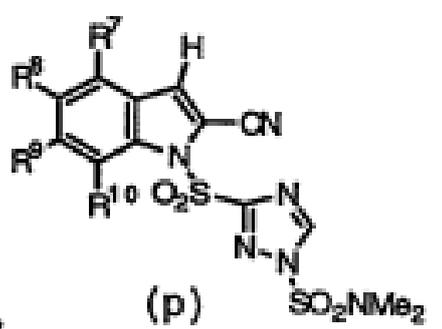
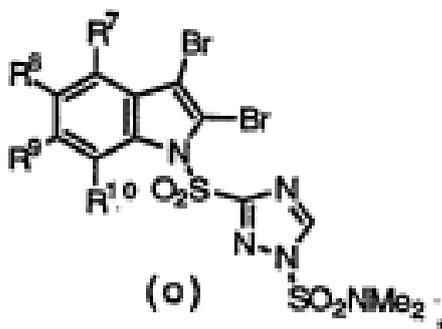
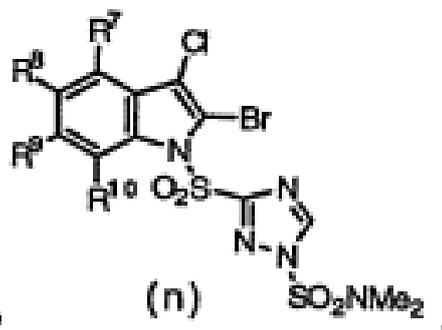
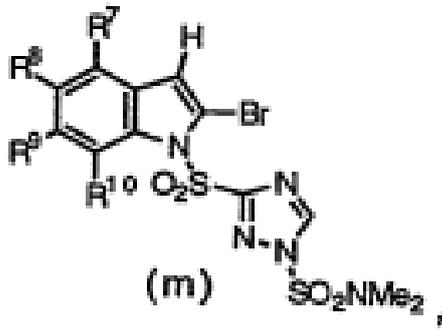
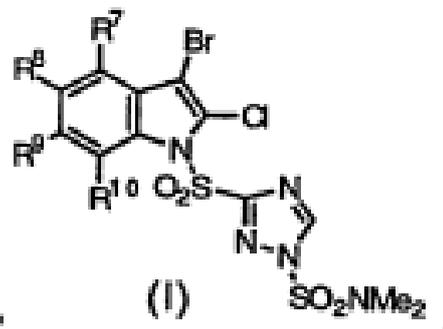
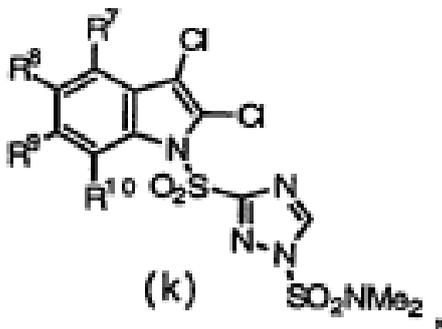
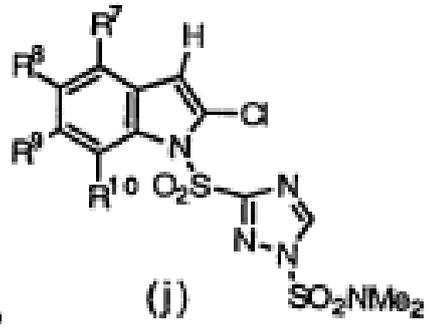
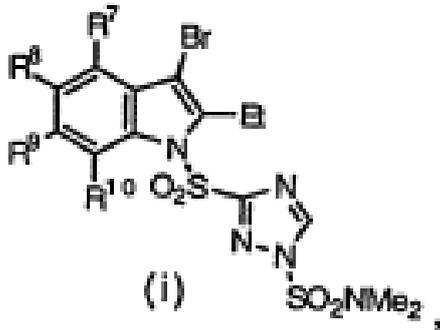
30 Ejemplos de halógeno son F, Cl, Br y I.

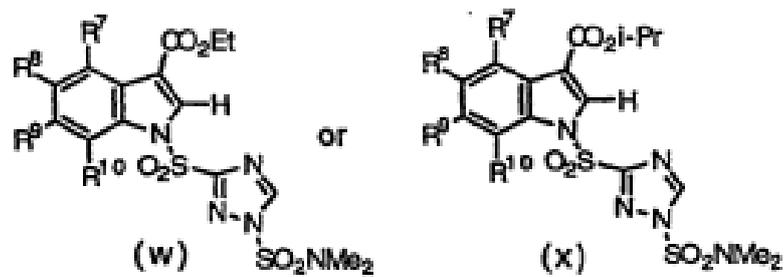
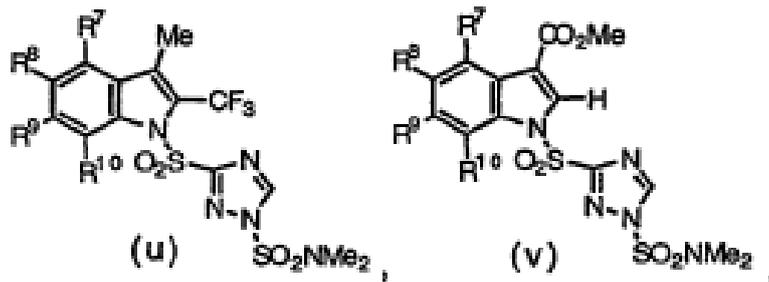
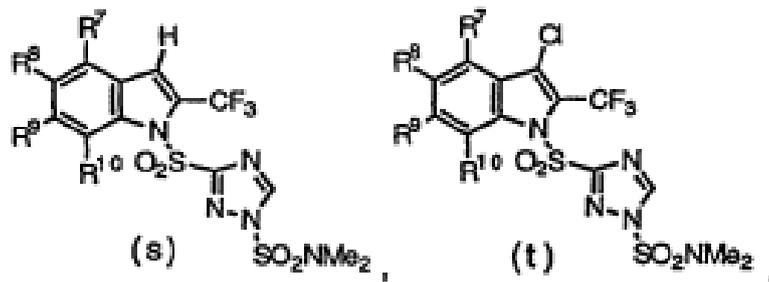
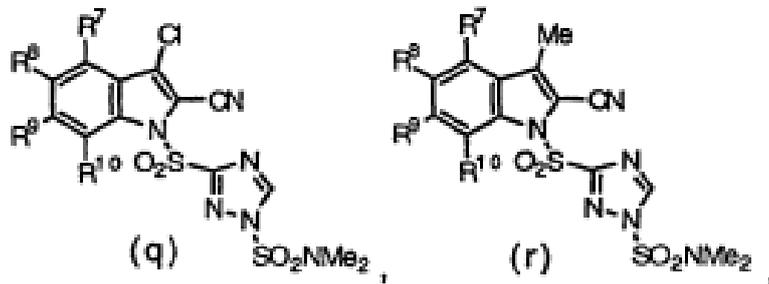
A continuación, los compuestos de la invención se muestran en las tablas siguientes. Sin embargo, no debe interpretarse que la presente invención esté limitada a los mismos.

35 En las tablas, Me denota metilo, Et denota etilo, Pr denota propilo, Bu denota butilo, n- denota normal, i- denota iso, s- denota secundario, t- denota terciario, Ph denota fenilo, Bn denota bencilo y Ac denota acetilo.

Tabla 2







Compuesto No.	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰
2-1	F	H	H	H
2-2	H	F	H	H
2-3	H	H	F	H
2-4	H	H	H	F
2-5	Cl	H	H	H
2-6	H	Cl	H	H
2-7	H	H	Cl	H
2-8	H	H	H	Cl

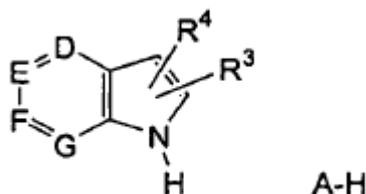
Tabla 2 (continúa)				
Compuesto No.	R¹	R²	R³	R¹⁰
2-9	Br	H	H	H
2-10	H	Br	H	H
2-11	H	H	Br	H
2-12	H	H	H	Br
2-13	I	H	H	H
2-14	H	I	H	H
2-15	H	H	I	H
2-16	H	H	H	I
2-17	Me	H	H	H
2-18	H	Me	H	H
2-19	H	H	Me	H
2-20	H	H	H	Me
2-21	Et	H	H	H
2-22	H	Et	H	H
2-23	H	H	Et	H
2-24	H	H	H	Et
2-25	MeO	H	H	H
2-26	H	MeO	H	H
2-27	H	H	MeO	H
2-28	H	H	H	MeO
2-29	NO ₂	H	H	H
2-30	H	NO ₂	H	H
2-31	H	H	NO ₂	H
2-32	H	H	H	NO ₂
2-33	CN	H	H	H
2-34	H	CN	H	H
2-35	H	H	CN	H
2-36	H	H	H	CN
2-37	CF ₃	H	H	H
2-38	H	CF ₃	H	H
2-39	H	H	CF ₃	H
2-40	H	H	H	CF ₃
2-41	CO ₂ Me	H	H	H
2-42	H	CO ₂ Me	H	H
2-43	H	H	CO ₂ Me	H
2-44	H	H	H	CO ₂ Me

A continuación se explicarán los métodos para preparar el compuesto de la invención. Sin embargo, no debe interpretarse que la presente invención se limite a los mismos.

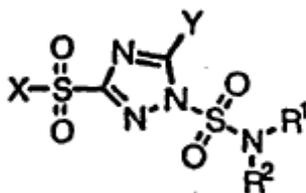
5

(Método de preparación 1)

El compuesto (1) de la invención puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula A-H



con un compuesto de fórmula 3

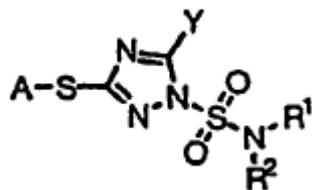


en la que R^1 , R^2 e Y tienen los mismos significados que se definieron anteriormente, y X es un halógeno.

5

(Método de preparación 3)

El compuesto de la invención puede prepararse oxidando con un agente oxidante un compuesto de la fórmula (6)



10 en la que R^1 , R^2 , A e Y tienen los mismos significados que se definieron anteriormente.

En el método de preparación 1, puede sintetizarse un derivado de sulfamoilo (1) haciendo reaccionar A-H con un halosulfoniltriazol (3) en presencia de una base.

15 El disolvente puede ser cualquier disolvente en tanto y cuanto sea inerte en la reacción. Por ejemplo, pueden emplearse éteres tales como dioxano, dimetoxietano y tetrahydrofurano, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y clorobenceno, hidrocarburos halogenados tales como dicloroetano y cloroformo, cetonas tales como acetona, metil etil cetona y metil isobutil cetona, nitrilos tales como acetonitrilo, aminas terciarias tales como piridina, trietilamina y tributilamina, amidas tales como N,N-dimetilformamida, compuestos de azufre tales como dimetilsulfóxido y sulfolano, nitrocompuestos tales como nitroetano y nitrobenzono, ésteres tales como acetato de metilo, o mezclas de los mismos. La reacción puede realizarse a una temperatura de reacción de -78°C hasta el punto de ebullición del disolvente.

20 Como base pueden emplearse, por ejemplo, bases orgánicas tales como piridina, 4-dimetilaminopiridina, trietilamina, dietilisopropilamina y N,N-dietilanilina, bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrógeno-carbonato de sodio e hidrógeno-carbonato de potasio, hidruros metálicos tales como hidruro de sodio, alcóxidos metálicos tales como metóxido de sodio y t-butóxido de potasio, compuestos derivados de amidas orgánicas y metales tales como diisopropilamida de litio, compuestos organometálicos tales como n-butil-litio, y semejantes.

30 En el método de preparación 1, puede sintetizarse un derivado de sulfamoilo (1) oxidando (6) con un agente oxidante. El disolvente puede ser cualquier disolvente en tanto y cuanto sea inerte en la reacción. Por ejemplo, pueden emplearse éteres tales como dioxano, dimetoxietano y tetrahydrofurano, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y clorobenceno, hidrocarburos halogenados tales como dicloroetano y cloroformo, cetonas tales como acetona, metil etil cetona y metil isobutil cetona, nitrilos tales como acetonitrilo, amidas tales como N,N-dimetilformamida, ésteres tales como acetato de etilo, ácidos carboxílicos tales como ácido acético, agua, o mezclas de los mismos. La reacción puede realizarse a una temperatura de reacción de -78°C hasta el punto de ebullición del disolvente.

35 Como agentes oxidantes pueden emplearse, por ejemplo, peróxidos tales como peróxido de hidrógeno, ácido peracético, ácido 3-cloro-perbenzoico, percarbonato de sodio, y semejantes.

40

Los compuestos de partida del método, compuestos A-H, (3), (4) y (6) pueden sintetizarse fácilmente mediante métodos conocidos (véase Dai Auki Kagaku vol. 14, 299-514 para el compuesto A-H, documentos JP-A-5-43557 y/o JP-A-7-

215971 para el compuesto (3), Chem. Pharm. Bull. 41(7) 1226-1231 (1993) para el compuesto (4), y documento JP-A-9-143181 para el compuesto (6)) o métodos análogos a los mismos.

5 Como enfermedades de las plantas que son diana para su control mediante el compuesto de la invención, pueden mencionarse: añublo del arroz (*Pyricularia oryzae*), mancha marrón (*Cochliobolus miyabeanus*), añublo de la vaina (*Rhizoctonia solani*); cebada y trigo: oídio (*Erysiphe graminis* f. sp. *hordei*, f. sp. *tritici*), mancha listada (*Pyrenophora graminea*), helmintosporiosis (*Pyrenophora teres*), tizón (*Gibberella zeae*), roya (*Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. Hordei*), tizón de invierno (*Tipula* sp., *Micronectriella nivais*), carbón volador (*Ustilago tritici*, *U. Nuda*), mancha ocular (*Pseudocercospora herpotrichoides*), escaldadura de la cebada (*Rhynchosporium secalis*), septoriosis (*Septoria tritici*), tizón de la gluma (*Leptosphaeria nodorum*); cítricos: melanosis (*Diaporthe citri*), sarna de los cítricos (*Elsinoe fawcetti*), moho verde y moho azul (*Penicillium digitalum*, *P. italicum*); manzana: tizón de la flor (*Sclerotinia mali*), cancro (*Valsa mali*), oídio (*Podosphaera leucotricha*), mancha foliar por alternaria (*Alternaria mali*), sarna del manzano (*Venturia inaequalis*); pera: sarna del peral (*Venturia nashicola*), mancha negra (*Alternaria kikuchiana*), roya (*Gymnosporangium haracanum*); melocotón: podredumbre parda (*Sclerotinia cinerea*), sarna del melocotonero (*Cladosporium carpophilum*), podredumbre por *Phomopsis* (*Phomopsis* sp.), vid: mildiu (*Plasmopara viticola*), antracnosis (*Elsinoe ampelina*), podredumbre (*Glomerella cingulata*), oídio (*Uncinula necator*), roya (*Phakopsora ampelopsidis*); caqui: antracnosis (*Gloeosporium kaki*), mancha foliar angular y circular (*Cercospora Kaki*, *Mycosphaerella nawae*); melones: mildiu (*Pseudoperenospora cubensis*), antracnosis (*Colletotrichum lagenarium*), oídio (*Sphaerotheca fuliginea*), tizón gomoso del tallo (*Mycosphaerella melonis*); tomate: tizón tardío (*Phytophthora infestans*), tizón temprano (*Alternaria solani*), moho foliar (*Cladosporium fulvum*); berenjena: mancha marrón (*Phomopsis vexans*), oídio (*Erysiphe cichoracearum*); colza: podredumbre negra (*Alternaria japonica*), podredumbre blanca (*Cercospora brassicae*); cebolla: roya (*Puccinia alli*); soja: mancha púrpura de la semilla (*Cercospora kikuchii*), sarna (*Elsinoe glycines*), mancha negra (*Diaporthe phaseololum*); frijol: antracnosis (*Colletotrichum lindemuthianum*); cacahuate: mancha foliar (*Mycosphaerella personatum*), mancha foliar marrón (*Cercospora arachidicola*); guisante: oídio (*Erysiphe pisi*); patata: tizón tardío (*Alternaria solani*); fresa: oídio (*Sphaerotheca humuli*); planta del te: tizón de red de ampollas (*Exobasidium reticulatum*), sarna blanca (*Elsinoe leucospila*); tabaco: mancha marrón (*Alternaria lingipes*), oídio (*Erysiphe cichoracearum*), antracnosis (*Colletotrichum tabacum*); remolacha: viruela de la hoja (*Cercospora beticola*); rosa: mancha negra (*Diplocarpon rosae*), mildiu (*Sphaerotheca pannosa*); crisantemo: mancha foliar (*Septoria chrysanthemiindici*), roya (*Puccinia horiana*); cultivos diversos: moho gris (*Botrytis cinerea*); cultivos diversos: podredumbre por sclerotinia (*Sclerotinia sclerotiorum*), y semejantes.

En el uso de los compuestos de la invención como fungicidas agrícolas y hortícolas, en general se mezclan con un vehículo adecuado, por ejemplo, vehículos sólidos tales como arcilla, talco, bentonita y tierra de diatomeas, o vehículos líquidos tales como agua, alcoholes (metanol, etanol, etc.), hidrocarburos aromáticos (benceno, tolueno, metilnaftaleno, etc.), hidrocarburos clorados, éteres, cetonas, ésteres (acetato de etilo, etc.), amidas de ácidos (dimetilformamida, etc.), o semejantes a aplicar. Si se desea, pueden añadirse agentes emulsionantes, dispersantes, agentes de suspensión, agentes penetrantes, agentes de extensión, estabilizantes, y semejantes, para que los compuestos puedan someterse a aplicación práctica en cualquier forma de formulación tal como una formulación líquida, un concentrado emulsionable, un polvo humectable, una formulación en polvo, gránulos o un polvo fluible.

El compuesto de la invención puede mezclarse o usarse en combinación con varios compuestos activos tales como fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas e insecticidas u otros compuestos biológicamente activos. Los nombres comunes de estos compuestos activos se listarán a continuación concretamente. Sin embargo, no debe interpretarse que la invención se limite a los mismos.

Compuestos fungicidamente activos: acibenzolar, ampropifós, anulazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo, benodanilo, benomilo, benzamacrilo, binapacrilo, bifenilo, bitertanol, betoxazina, mezcla de burdeos, blasticidina-S, bromoconazol, bupirimato, butiobato, polisulfuro de calcio, captafol, captano, oxiclورو de cobre, carpropamid, carbendazim, carboxin, quinometionato, clorobentiazona, clorfenazol, cloroneb, clortalonil, clozolinato, cifraneb, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinil, ciprofuram, debacarb, diclorofeno, diclobutrazol, diclofluanid, diclormedina, diclorano, dietofencarb, diclomictet, difenoconazol, diflumetorim, dimetirimol, dimetomorfo, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, difenilamina, dipiritiona, ditalimfos, ditianona, dodemorfo, domina, drazoxolona, edifenfós, epoxiconazol, etaconazol, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenarimol, febuconazol, fenfuramo, fenpiclonilo, fenpropidin, fenpropimorfo, fentin, ferbam, ferimzona, fluazizam, fludioxonil, fluoroimida, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetil-aluminio, fuberidazol, furalaxil, fenamidona, fenhexamid, guazatina, hexaclorobenceno, hexaconazol, himexazol, imazalil, imibenconazol, iminocadina, ipconazol, iprobenfós, iprodiona, isoprotilano, iprovalicarb, kasugamicina, kresoxim-metilo, mancozeb, maneb, mepanipirim, mepronilo, metalaxil, metconazol, metiram, metominoestrobina, miclobutanilo, nabam, níquel bis(dimetilditiocarbamato), nitroal-isopropilo, nuarimol, octilina, ofurace, oxadixil, oxicarboxin, oxpoconazol fumarato, perfurzoato, penconazol, pencicurón, ftalida, piperalin, polioxinas, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb hidrocloreuro, propiconazol, propineb, pirazofós, pirifenox, pirimetanilo, piroquilón, quinoxifeno, quintoceno, azufre, espiroxamina, tebuconazol, tecnazeno, tetraconazol, tiabendazol, tifulzamid, tiofanato-metilo, tiram, tolclófós-metilo, tolilfluanid, triadimefon, toriadimenol, triazoxida, triciclazol, tridemorfo, triflumizol, triforina, triticonazol, validamicina, vinclozolina, zineb, ziram.

Compuestos bactericidamente activos: estreptomycin, oxitetraciclina, ácido oxolínico.

Compuestos nematocidamente activos: aldoxicarb, fostiazato, fostietano, oxamilo, fenamifós.

5 Compuestos acaricidamente activos: amitraz, bromopropilato, quinometionato, clorobencilato, clofentezina, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquin, óxido de fenbutatin, fenpropatrin, fenproximato, halfenprox, hexitiazox, milbemectina, propargite, piridaben, pirimidifeno, tebufenpirad.

10 Compuestos insecticidamente activos: abamectin, acefato, acetamipirid, azinfós-metilo, bendiocarb, benfuracarb, bensultap, bifentrina, buprofezin, butocarboxim, carbaril, carbofurano, carbosulfano, cartap, clorfenapir, clorpirifós, clorfenvinfós, clorfluazurón, clotianidina, cloromafenoazida, clorpirifós-metilo, ciflutrina, beta-ciflutrina, cipermetrina, ciromazina, cihalotrina, landa-cihalotrina, deltametrina, diafentiurón, diazinón, diacloveno, diflubenzurón, dimetilvinfós, diofenolano, disulfotón, dimetoato, EPN, esfenvalerato, etiofencarb, etioprol, etofenprox, etrimfós, fenitrotión, fenobucarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronilo, flucitrinato, flufenoxurón, flufenprox, tao-fluvalinato, fonofós, formetanato, formotión, furatiocarb, halofenocida, hexaflumurón, hidrametilnón, imidacloprid, isofenfós, indoxacarb, isoprocab, isoxatión, lufenurón, malatión, metaldehído, metahamidofós, metidatión, metacrifós, metalcarb, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoxifenoazida, monocrotofós, muscalure, nitenpiram, ometoato, oxidemetón-metilo, oxamilo, paratión, paratión—metilo, permetrina, fentoato, foxim, forato, fosalona, fosmet, fosfamidón, pirimicarb, pirimifós-metilo, profenofós, pimetozina, piraclófós, piriproxifeno, rotenona, sulprofós, silafluofeno, espinosad, sulfotep, tebufenocida, teflubenzurón, teflutrina, terbufós, tetraclorovinifós, tiodicarb, tiametoxam, tiofanox, tiometón, tolfenpirad, tralometrina, troclorfón, triazurón, triflumurón, vamidotión.

20 Cuando los compuestos de la invención se usan como fungicidas agrícolas y hortícolas pueden aplicarse mediante aplicación a las hojas, tratamiento del suelo, desinfección de las semillas y métodos semejantes. También son efectivos en los métodos generales usualmente utilizados por los expertos en la técnica.

25 Además, si es necesario, pueden mezclarse con otros herbicidas y diversos insecticidas, fungicidas, reguladores del crecimiento de las plantas, agentes sinérgicos y semejantes en la formulación o pulverizarse y usarse juntos. La tasa de aplicación del compuesto de la invención varía en función del campo de aplicación, del período de aplicación, del método de aplicación, de la enfermedad diana, del cultivo cultivado y factores semejantes, pero en general es conveniente aplicar aproximadamente 0,005-50 kg del ingrediente activo por hectárea.

30 A continuación, se muestran como sigue ejemplos de formulaciones de fungicidas que contienen el compuesto de la invención como ingrediente activo. Sin embargo, no debe interpretarse que la presente invención está limitada a los mismos. En los siguientes ejemplos de formulaciones todas las "partes" quieren decir "partes en peso".

35 Formulación ejemplo 1. Concentrado emulsionable

Compuesto de la invención	20 partes
Metilnaftaleno	55 partes
Ciclohexanona	20 partes
Sorpol 2680 (mezcla de tensioactivo no iónico y tensioactivo aniónico: Toho Kagaku Kogyo K.K., nombre comercial)	5 partes

40 Los componentes anteriores se mezclan uniformemente para hacer una emulsión. En el uso la emulsión se diluye entre 50 y 20.000 veces para aplicar 0,005-50 kg de ingrediente activo por hectárea.

Formulación ejemplo 2. Polvo humectable

Compuesto de la invención	25 partes
Zeeklite PEP (mezcla de caolinita y celisita: Zeeklite Industry K.K. Ltd.)	66 partes
Sorpol 5039 (tensioactivo aniónico: Toho Kagaku Kogyo K.K., nombre comercial)	4 partes
Carplex nº 80 (carbón blanco: Shionogi Seiyaku K.K., nombre comercial)	3 partes
Ligninsulfonato de calcio	2 partes

45 Los componentes anteriores se mezclan y muelen uniformemente para hacer un polvo humectable. En el uso el polvo humectable se diluye entre 50 y 20.000 veces para pulverizar 0,005 a 50 kg de ingrediente activo por hectárea.

Formulación ejemplo 3. Formulación en polvo

Compuesto de la invención	3 partes
Carplex nº 80 (carbón blanco: Shionogi Seiyaku K.K., nombre comercial)	0,5 partes
Arcilla	95 partes
Fosfato de diisopropilo	1,5 partes

Los componentes anteriores se mezclan y muelen uniformemente para hacer una formulación en polvo. En el uso la formulación en polvo se aplica con 0,005 a 50 kg de ingrediente activo por hectárea.

Formulación ejemplo 4. Gránulos

Compuesto de la invención	5 partes
Bentonita	30 partes
Talco	64 partes
Ligninsulfonato de calcio	1 parte

5

Los componentes anteriores se mezclan y muelen uniformemente, se agitan para mezclarlos con adición de una pequeña cantidad de agua, se granulan mediante un granulador por extrusión y se secan para fabricar un gránulo. En el uso, el gránulo se aplica con 0,005 a 50 kg de ingrediente activo por hectárea.

10 Formulación ejemplo 5. Polvo fuible

Compuesto de la invención	25 partes
Solpol 3353 (tensioactivo no iónico: Toho Kagaku Kogyo K.K., nombre comercial)	5 partes
Lunox 1000C (tensioactivo aniónico: Toho Kagaku Kogyo K.K., nombre comercial)	0,5 partes
Goma de xantano (polímero natural)	0,2 partes
Benzoato de sodio	0,4 partes
Propilenglicol	10 partes
Agua	58,9 partes

15

Los componentes anteriores, excepto el ingrediente activo (el compuesto de la invención) se disuelven uniformemente y luego se añade sobre los mismos el compuesto de la invención, se agita bien y seguidamente se muele en agua en un molino de arena para obtener un polvo fuible. En el uso el polvo fuible se diluye entre 50 y 20.000 veces para aplicar 0,005 - 50 kg del ingrediente activo por hectárea.

A continuación, en la tabla 12 se muestran las propiedades físicas de los compuestos de fórmula (1) preparados según estos métodos.

20

Tabla 12

Compuesto nº	Propiedad (p.f. °C)
2-2(b)	160-161
2-2(n)	184-186
2-2(o)	180-181,5
2-3(b)	140,5-142
2-3(n)	151,5-152,5
2-3(o)	161,5-163
2-4(b)	176-180
2-5(b)	174-176
2-6(d)	141-143
2-6(e)	168-169
2-6(n)	173-175
2-7(b)	142-145
2-7(n)	143-144
2-8(b)	177-179
2-8(x)	123-124

2-10(b)	142-145
2-10(n)	163-164,5
2-10(v)	138-141
2-11(e)	149-150,5
2-14(b)	150,5-153
2-17(b)	181-183
2-18(b)	134-136
2-19(b)	136-138
2-20(b)	148-149
2-24(b)	81-83
2-30(b)	174-176
2-34(b)	181-183
2-39(e)	126-128
2-44(b)	162-163

La utilidad del compuesto de la invención se explicará concretamente mediante los siguientes ejemplos de ensayo. Sin embargo, no debe interpretarse que la presente invención esté limitada a los mismos.

5

Ejemplo de ensayo 1: Ensayo sobre el efecto controlador del mildiu en pepinos

10

A pepino (especie: Salami Hanjiro) hecho crecer en una maceta que tenía un diámetro de 7 cm se le aplicó con una pistola de pulverización en la etapa 1,5 de la hoja 20 mL por maceta de una disolución de un agente que se preparó diluyendo el concentrado emulsionable del compuesto de la invención con agua hasta 500 ppm.

15

Un día después de la aplicación se pulverizó para inocular una suspensión de esporas del patógeno del mildiu del pepino (*Pseudoperonospora cubensis*) (2×10^5 /mL). El pepino inoculado se colocó en una caja de inoculación a una temperatura de 25°C y una humedad de 95% o más durante un día y una noche. Seguidamente, el pepino se colocó en un invernadero y se determinó la relación de área manchada por la enfermedad formada después de 7 días desde la inoculación a las hojas para calcular el índice de control según la siguiente ecuación:

20

Índice de control = $[1 - (\text{proporción de área manchada por la enfermedad en la parte tratada} / \text{proporción de área manchada por la enfermedad en la parte no tratada})] \times 100$

Como resultado, los siguientes compuestos mostraron un índice de control de 100.

25

Compuesto de la invención nº: 2-2(b), 2-2(n), 2-2(o), 2-3 (b), 2-3(n), 2-3(o), 2-4(b), 2-5(b), 2-6(d), 2-6(e), 2-6(n), 2-7(b), 2-7(n), 2-8(b), 2-8(x), 2-10(b), 2-10(n), 2-10(v), 2-11(e), 2-14(b), 2-17(a), 2-17(b), 2-18(b), 2-19(b), 2-20(b), 2-24(b), 2-34(b), 2-39(e), 2-4(b).

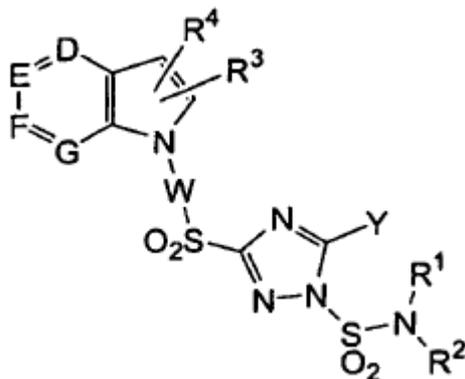
APLICABILIDAD INDUSTRIAL

30

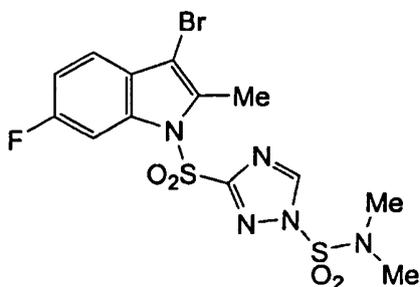
Estos compuestos son nuevos, exhiben un excelente efecto fungicida agrícola y hortícola y no tienen ninguna fitotoxicidad sobre los cultivos útiles de modo que son útiles como fungicidas agrícolas y hortícolas.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de sulfamoilo de fórmula general:



- 5 en la que:
 R¹ y R² son Me,
 Y es H,
 10 W es un enlace químico,
 D, E, F y G son CR⁷, CR⁸, CR⁹ y CR¹⁰,
 15 R³ es H, alquilo de C₁₋₈, halógeno, haloalquilo de C₁₋₈ o CN,
 R⁴ es H, alquilo de C₁₋₈, halógeno, o alcoxi de C₁₋₆-carbonilo, en el que
 cuando R³ es H, entonces R⁴ es halógeno o alcoxi de C₁₋₆-carbonilo,
 20 cuando R³ es alquilo de C₁₋₈, entonces R⁴ es H, alquilo de C₁₋₈, halógeno o alcoxi de C₁₋₆-carbonilo,
 cuando R³ es halógeno, entonces R⁴ es halógeno,
 cuando R³ es haloalquilo de C₁₋₈, entonces R⁴ es H, alquilo de C₁₋₈ o halógeno,
 cuando R³ es CN, entonces R⁴ es H o alquilo de C₁₋₈, y
 25 uno de R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ es F, Cl, Br, Me, Et, MeO, NO₂, CN, CF₃ o CO₂Me, mientras los otros de R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son H.
2. Un compuesto de sulfamoilo según la reivindicación 1, el cual tiene la siguiente fórmula



- 30 3. Un compuesto agroquímico, que contiene como ingrediente activo al menos un compuesto de sulfamoilo según la reivindicación 1 ó 2 y un vehículo adecuado.
4. Un compuesto agroquímico según la reivindicación 3, en la cual el compuesto agroquímico es un fungicida agrícola y hortícola.