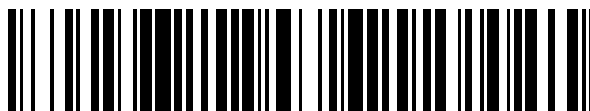


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 380 686**

51 Int. Cl.:
C07D 241/24 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
A01N 43/60 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 96 Número de solicitud europea: **06835193 .1**
96 Fecha de presentación: **21.12.2006**
97 Número de publicación de la solicitud: **1963286**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **03.09.2008**

54 Título: **Derivados de piracinocarboxamida y agentes para el control de enfermedades de plantas que contienen los mismos**

30 Prioridad:
22.12.2005 JP 2005370863
24.02.2006 JP 2006049068
10.10.2006 JP 2006276601

73 Titular/es:
NIHON NOHYAKU CO., LTD.
2-5, NIHONBASHI 1-CHOME, CHUO-KU
TOKYO 103-8236, JP

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
17.05.2012

72 Inventor/es:
ODA, Masatsugu;
FURUYA, Takashi;
HASEBE, Motohiro y
KUROKI, Nobutaka

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
17.05.2012

74 Agente/Representante:
Carpintero López, Mario

ES 2 380 686 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).

DESCRIPCION

Derivados de piracinocarboxamida y agentes para el control de enfermedades de plantas que contienen los mismos

Campo técnico

5 La presente invención se refiere a derivados de piracinocarboxamida o sus sales, y a agentes para el control de enfermedades de plantas para usos agrícolas y hortícolas que contienen dicho compuesto como un ingrediente activo.

Antecedentes de la técnica

10 Ciertos derivados de piracinocarboxamida son hasta ahora conocidos por mostrar actividad para el control de plagas (por ejemplo, referencia en la Gaceta Oficial del Documento JP-A Hei 2-175 y la Patente WO 05/115994). Igualmente, se ha encontrado que algunos compuestos bifenilo son eficaces para el control de hongos destructores o perjudiciales (por ejemplo, referencia en la Gaceta Oficial de la Patente Japonesa No. 3202079). Los presentes compuestos representan una selección de entre las Patentes WO 04/058723 o la WO 04/054982.

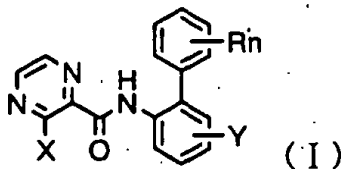
Divulgación de la invenciónEl problema que la invención está destinada a resolver

15 No obstante, siguen sin resolverse diversos problemas, tal como puede reflejarse por los problemas que se están encontrado, puesto que los compuestos descritos en la Gaceta Oficial del Documento JP-A Hei 2-175, no muestran ninguna actividad útil prácticamente contra la enfermedad de la botritis y del oidio pulverulento, y los compuestos mencionados en el Folleto de la Patente WO 05/115994 muestran actividad acaricida, pero actividad bactericida o fungicida disminuida, en tanto que los descritos en la Gaceta Oficial de la Patente Japonesa No.3202079 no solamente muestran actividad reducida contra el oidio pulverulento, sino que además omiten deducir ninguna actividad útil prácticamente contra las enfermedades causadas por los hongos de la clase Basidiomicetos, tales como la roya de la hoja de una planta de trigo y el agostamiento de la vaina de una planta de arroz. Tal como se ha esbozado anteriormente, los compuestos que pertenecen a la técnica anterior no se ha encontrado que sean siempre satisfactorios como un agente para el control de enfermedades de plantas para usos agrícolas y hortícolas en términos de la eficacia y amplitud del espectro del control de plagas. En los últimos años, se ha centrado de manera intensificada la atención sobre las presiones recientemente crecientes de los efectos nocivos, perjudiciales, para el medio ambiente de la tierra, y en el campo de agentes para el control de enfermedades de plantas o, igualmente, de formulaciones para usos agrícolas y hortícolas, lo cual ha dado como resultado demandas actualmente intensificadas de compuestos que posean un espectro para el control de plagas ampliado a proporciones de aplicación reducidas.

Medios para resolver los problemas

20 Los autores de la presente invención, con una visión específica para resolver los problemas anteriormente descritos, han llevado a cabo estudios de investigación intensivos de manera repetida y, como resultado de ellos, han encontrado que un derivado de piracinocarboxamida representado por la fórmula general (I) y sus sales de acuerdo con la presente invención, cuando se elabora dentro de un agente para el control de enfermedades de plantas para usos agrícolas y hortícolas, no solamente produce efectos para el control de plagas mejorados, sino que además muestra el espectro fungicida extremadamente ampliado, culminando, de esta forma, la consumación de la presente invención. Fundamentalmente, la presente invención se refiere a:

1) Un derivado de piracinocarboxamida, o sus sales, representado por la fórmula general (I):



40 [en la que X es un átomo de halógeno o un grupo alquilo(C₁-C₃) el cual puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno; Y es un átomo de hidrógeno o de halógeno, o un grupo alquilo(C₁-C₃) o alcoxi(C₁-C₃); R es un átomo de hidrógeno o de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo(C₁-C₆) el cual puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alqueno(C₂-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquino(C₂-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno o grupo hidroxilo, un grupo alcoxi(C₁-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alqueno(C₂-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquino(C₂-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquilo(C₁-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquilsulfinilo(C₁-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquilsulfonilo(C₁-C₆) el cual que

- 5 puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alcóxicarbonilo(C₁-C₆) o grupo alcóxiimino(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₃), un grupo trialquilsililo(C₁-C₁₀) en el cual los grupos alquilo(C₁-C₁₀) pueden ser el mismo o diferentes, un grupo fenilo el cual puede estar substituido con un substituyente(s) Z (en el que Z es tal como se define más adelante), un grupo fenoxi el cual puede estar substituido con un substituyente(s) Z (en el que Z es tal como se define más adelante), un grupo piridiloxi el cual puede estar substituido con un substituyente(s) Z (en el que Z es tal como se define más adelante), o un grupo pirimidiloxi el cual puede estar substituido con un substituyente(s) Z (en el que Z es tal como se define más adelante); n es un número entero de 1 a 5; cuando n es un número entero de 2 a 5, R puede ser el mismo o diferente y los dos Rs adyacentes pueden tomarse conjuntamente para representar un grupo alquilenilo(C₃-C₅) el cual puede estar substituido con un substituyente(s) Z (en el que Z es tal como se define más adelante), grupo alquilenoxi(C₂-C₄) el cual puede estar substituido con un substituyente(s) Z (en el que Z es tal como se define más adelante), grupo alquileniloxi(C₂-C₄) el cual puede estar substituido con un substituyente(s) Z (en el que Z es tal como se define más adelante), o un grupo alquilendioxo(C₁-C₃) el cual puede estar substituido con un substituyente(s) Z (en el que Z es tal como se define más adelante); Z es un átomo de hidrógeno o halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo(C₁-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alqueni(C₂-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquini(C₂-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alcóxi(C₁-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alqueni(C₂-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquini(C₂-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquiltio(C₁-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquilsulfino(C₁-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquilsulfonilo(C₁-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, o un grupo alcóxicarbonilo(C₁-C₆), alcóxiimino(C₁-C₃)alquilo(C₁-C₃) o carbamoilo, y cuando están presentes un número plural de Zs, las Zs pueden ser la misma o diferente].
- 25 2) El derivado de piracino-carboxamida o sus sales tal como se ha descrito anteriormente bajo el apartado 1), en el que X es un átomo de cloro, bromo o yodo, o un grupo metilo, fluorometilo, difluorometilo o trifluorometilo.
- 30 3) El derivado de piracino-carboxamida o sus sales tal como se ha descrito anteriormente bajo el apartado 1) o 2), en el que R es un átomo de hidrógeno o halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo(C₁-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alqueni(C₂-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquini(C₂-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alcóxi(C₁-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alqueni(C₂-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquini(C₂-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquiltio(C₁-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquilsulfino(C₁-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquilsulfonilo(C₁-C₆) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno, o un grupo alcóxicarbonilo(C₁-C₆); cuando n es un número entero de 2 a 5, R puede ser el mismo o diferente, o los dos Rs adyacentes están tomados conjuntamente para representar un grupo alquilenilo(C₃-C₅) o alquilenoxi(C₂-C₄), o un grupo alquileniloxi(C₁-C₃) el cual puede estar substituido con un átomo(s) de halógeno.
- 40 4) Los derivados de piracino-carboxamida o sus sales tal como se ha descrito anteriormente bajo uno cualquiera de los apartados 1) a 3), en el que Y es un átomo de hidrógeno.
- 45 5) Un agente para el control de enfermedades de plantas para usos agrícolas y hortícolas, caracterizada porque dicho agente para el control de enfermedades de plantas contiene como un ingrediente activo el derivado de piracino-carboxamida o sus sales tal como se ha descrito anteriormente bajo uno cualquiera de los apartados 1) a 4).
- 50 6) Un procedimiento para el control de una enfermedad de una planta, caracterizada porque dicho procedimiento comprende el tratamiento de una planta o suelo objetivo con una cantidad eficaz del derivado de piracino-carboxamida o sus sales tal como se ha descrito anteriormente bajo uno cualquiera de los apartados 1) a 4).

Efecto de la invención

La presente invención proporciona los compuestos, los cuales poseen característica de acción mejorada, que comparada con los compuestos que pertenecen a la técnica anterior, y especialmente como un agente para el control de enfermedades de plantas para usos agrícolas y hortícolas, desarrollan un espectro de control de plagas ampliado a proporciones de aplicación reducidas.

Mejor modo de llevar a cabo la invención

Con referencia a las definiciones presentadas para la fórmula general (I) que representa los derivados de piracino-carboxamida de la presente invención, el "átomo de halógeno" incluye, por ejemplo, un átomo de flúor, cloro, bromo

o yodo; el "grupo alquilo(C₁-C₆) el cual puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno" está ejemplificado por grupos alquilo de cadena recta o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, tales como metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, n-pentilo, neopentilo, n-hexilo, etc., y por grupos alquilo de cadena recta o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono que están sustituidos con no menos de un átomo de halógeno, el cual puede ser el mismo o diferente, tales como grupos fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, perfluoroetilo, perfluoroisopropilo, clorometilo, bromometilo, 1-bromoetilo, 2,3-dibromopropilo, etc.; el "alqueno(C₂-C₄)" incluye, por ejemplo, grupos alqueno de cadena recta o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, tales como grupos vinilo, alilo, isopropenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 1-metil-2-propenilo, 2-metil-1-propenilo, pentenilo, 1-hexenilo, etc.; el "grupo alquino(C₂-C₆)" está ejemplificado por grupos alquino de cadena recta o ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, tales como grupos etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 3-metil-1-propinilo, 2-metil-3-propinilo, pentinilo, 1-hexinilo, etc.; y el grupo alcoxi(C₁-C₆) incluye, por ejemplo, grupos alcoxi de cadena recta o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, tales como grupos metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, sec-butoxi, t-butoxi, n-pentiloxi, isopentiloxi, neopentiloxi, n-hexiloxi, etc.; el "grupo alqueno(C₂-C₆)" está ejemplificado por grupos alqueno de cadena recta o ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, tales como grupos propeniloxi, buteniloxi, penteniloxi, etc.; el término "grupo alquinox(C₂-C₆)" incluye, por ejemplo, grupos alquinox de cadena recta o ramificada de 2 a 6 átomos de carbono, tales como grupos propiniloxi, butiniloxi, pentiniloxi, etc.; el "grupo alquiltio(C₁-C₆)" incluye, por ejemplo, grupos alquiltio de cadena recta o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, tales como grupos metiltio, etiltio, n-propiltio, isopropiltio, n-butiltio, sec-butiltio, t-butiltio, n-pentiltio, isopentiltio, n-hexiltio, etc.; el "grupo alquilsulfino(C₁-C₆)" incluye, por ejemplo, grupos alquilsulfino de cadena recta o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, tales como grupos metilsulfino, etilsulfino, n-propilsulfino, isopropilsulfino, n-butilsulfino, sec-butilsulfino, t-butilsulfino, n-pentilsulfino, isopentilsulfino, n-hexilsulfino, etc.; el "grupo alquilsulfonilo(C₁-C₆)" incluye, por ejemplo, grupos alquilsulfonilo de cadena recta o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, tales como grupos metilsulfonilo, etilsulfonilo, n-propilsulfonilo, isopropilsulfonilo, n-butilsulfonilo, sec-butilsulfonilo, t-butilsulfonilo, n-pentilsulfonilo, isopentilsulfonilo, n-hexilsulfonilo, etc.; el "grupo alcoxycarbonilo(C₁-C₆)" incluye, por ejemplo, grupos alcoxycarbonilo de cadena recta o ramificada de 1 a 6 átomos de carbono, tales como grupos metoxycarbonilo, etoxycarbonilo, n-propoxycarbonilo, isopropoxycarbonilo, n-butoxycarbonilo, t-butoxycarbonilo, etc.; el "grupo alcoximinino(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₃)" incluye, por ejemplo, grupos alcoximinino(C₁-C₆)alquilo(C₁-C₃) de cadena recta o ramificada, tales como grupos metoximinometilo, etoximinometilo, n-propoximinometilo, isopropoximinometilo, etc.; el "grupo alquilsililo(C₁-C₁₀)" incluye, por ejemplo, grupos alquilsililo de cadena recta o ramificada de 1 a 10 átomos de carbono, tales como grupos trimetilsililo, trietilsililo, etc., el "grupo alquilsililo(C₁-C₁₀)" tiene tres grupos (C₁-C₁₀) los cuales pueden ser el mismo o diferentes; el "grupo alqueno(C₃-C₅)" está ejemplificado por grupos alqueno de cadena recta o ramificada de 3 a 5 átomos de carbono, tales como grupos propileno, butileno, pentametileno, etc.; el "grupo alqueno(C₂-C₄)" incluye, por ejemplo, por grupos alqueno de cadena recta o ramificada de 2 a 4 átomos de carbono, tales como grupos etileno, propileno, butileno, etc.; el "grupo alquendiox(C₁-C₃)" está ejemplificado por grupos alquendiox de cadena recta o ramificada de 1 a 3 átomos de carbono, tales como grupos metilendiox, etilendiox, propilendiox, etc.

Los grupos alqueno(C₂-C₆), grupos alquino(C₂-C₆), grupos alcoxi(C₁-C₆), alqueno(C₂-C₆), grupos alquinox(C₂-C₆), grupos alquiltio(C₁-C₆), grupos alquilsulfino(C₁-C₆), grupos alquilsulfonilo(C₁-C₆) o grupos alquendiox(C₁-C₃) anteriormente mencionados, pueden estar sustituidos con uno o no más de dos átomos de halógeno en cualquiera de las posiciones sustituibles. En el caso de sustitución con no menos de dos átomos de halógeno, dichos átomos de halógeno pueden ser el mismo o diferentes.

Las sales de los derivados de piracincocarboxamida de acuerdo con la presente invención tal como están representados por la fórmula general (I), pueden ejemplificarse por sales de ácidos inorgánicos, tales como clorhidratos, sulfatos, nitratos, fosfatos, etc., sales de ácidos orgánicos, tales como acetatos, fumaratos, maleatos, oxalatos, metanosulfonatos, bencenosulfonatos, p-toluenosulfonatos, etc., y sales formadas con iones inorgánicos u orgánicos, tales como ion potasio, ion sodio, ion calcio, trimetilamonio, etc.

En los compuestos de acuerdo con la presente invención tal como están representados por la fórmula general (I), X es preferiblemente un átomo de cloro, bromo o yodo, o un grupo metilo, fluorometilo, difluorometilo o trifluorometilo, y más preferiblemente un grupo trifluorometilo.

Y es preferiblemente un átomo de hidrógeno o halógeno, o un grupo metilo, y más preferiblemente un átomo de hidrógeno.

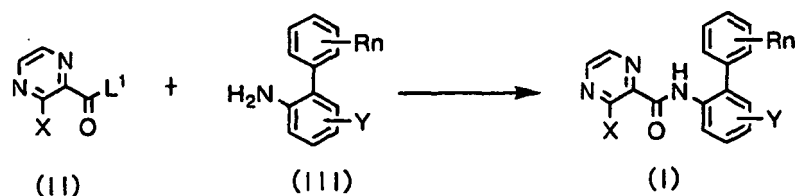
R es preferiblemente un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, tal como átomos de cloro, bromo y yodo, etc., un grupo ciano, un grupo alquilo(C₁-C₆) el cual puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alqueno(C₂-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquino(C₂-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alcoxi(C₁-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alqueno(C₂-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquinox(C₂-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquiltio(C₁-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquilsulfino(C₁-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquilsulfonilo(C₁-C₆) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, o un grupo alcoxycarbonilo(C₁-C₆), o cuando n no es menor de 2, R puede ser el mismo o diferente y los dos Rs adyacentes están tomados conjuntamente para representar un grupo alqueno(C₃-C₅) o grupo alqueno(C₂-C₄) o un grupo alquendiox(C₁-C₃) el cual puede estar sustituido con

un átomo(s) de halógeno. R es más preferiblemente un átomo de halógeno, tal como átomos de cloro, bromo y yodo, etc., un grupo ciano, un grupo alquilo(C₁-C₄) el cual puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alqueno(C₂-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquino(C₂-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alcoxi(C₁-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo un grupo alquenoiloxi(C₂-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquinoiloxi(C₂-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquiltio(C₁-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquilsulfino(C₁-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, o un grupo alquilsulfonilo(C₁-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, o cuando n no es menor de 2, R puede ser el mismo o diferente y los dos Rs adyacentes están tomados conjuntamente para representar grupos alquilendioxi(C₁-C₃) el cual puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno.

n es preferiblemente un número entero de 1 a 3.

Los compuestos de la presente invención pueden producirse, por ejemplo, de acuerdo con los Procedimientos de Producción 1 y 2 descritos más adelante, pero se da por entendido que esto no plantea restricción sobre estos procedimientos de producción.

Procedimiento de Producción 1:

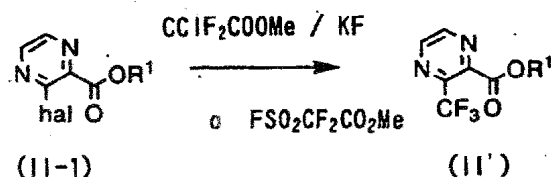


(en el que X, Y, R y n son tal como se han definido anteriormente, y L¹ es un grupo de cesión, tal como un átomo de cloro o bromo, grupos alcoxi, etc.).

Un derivado de ácido piracino-carboxílico representado por la fórmula general (II) puede hacerse reaccionar con un derivado 2-aminofenilo representado por la fórmula general (III), en un disolvente inerte en la presencia de una base, para producir un derivado de piracino-carboxamida de la presente invención tal como se representa por la fórmula general (I). En la presente reacción, la temperatura de reacción está normalmente dentro del intervalo de aproximadamente -20°C a 120°C, en tanto que el tiempo de reacción está generalmente dentro del intervalo de aproximadamente 0,2 a 24 horas. Un derivado aminobifenilo representado por la fórmula general (III) normalmente se usa en proporciones de aproximadamente 0,2 a 5 moles por mol de derivado de ácido piracino-carboxílico representado por la fórmula general (II).

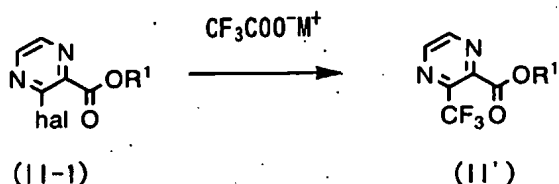
Como la base, puede mencionarse, por ejemplo, bases inorgánicas, tales como hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato sódico, bicarbonato potásico, etc., sales del ácido acético, tales como acetato sódico, acetato potásico, etc., alcóxidos de metal alcalino, tales como t-butóxido potásico, metóxido sódico, etóxido sódico, etc., aminas terciarias, tales como trietilamina, diisopropiletilamina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno, etc., compuestos aromáticos que contienen nitrógeno, tales como piridina, dimetilaminopiridina, etc., y similares. La base se usa generalmente en proporciones de aproximadamente 0,5 a 10 moles por mol de derivado de ácido piracino-carboxílico representado por la fórmula general (I). El disolvente inerte que puede usarse puede ser cualquier disolvente inerte, salvo que ellos impidan o inhiban marcadamente la presente reacción, y dichos disolventes pueden ejemplificarse por alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol, 2-propanol, etc., éteres de cadena recta o cíclicos, tales como éter dietílico, tetrahydrofurano, dioxano, etc., hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, tolueno, xileno, etc., hidrocarburos halogenados, tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, etc., hidrocarburos aromáticos halogenados, tales como clorobenceno, diclorobenceno, etc., nitrilos, tales como acetonitrilo, etc., ésteres, tales como acetato de etilo, etc., disolvente polares, tales como, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetil sulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, agua, ácido acético, etc., y similares. Estos disolventes inertes pueden usarse de manera individual o como una mezcla de no más de dos de los mismos.

Los derivados de ácido piracino-carboxílico representados por la fórmula general (II) que son usables en la presente reacción, son compuestos conocidos, y el derivado de ácido piracino-carboxílico de la fórmula general (II') en la que X es, por ejemplo, un grupo trifluorometilo, puede producirse, por ejemplo, mediante el procedimiento tal como se representa en los Procedimientos de Preparación de Referencia 1 a 8 descritos más adelante.

Procedimiento de Preparación de Referencia 1:

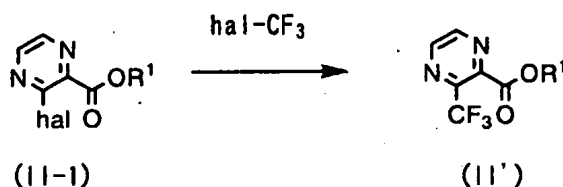
(en el que hal es un átomo de halógeno; R¹ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo(C₁-C₆); Me es un grupo metilo).

- 5 De acuerdo con un procedimiento similar a los descritos en las referencias de la literatura conocidos (por ejemplo, la referencia al Folleto de la WO 05/115994 y *J. Heterocycl. Chem.*, vol. 34, pág. 551, (1997)), un derivado de ácido piracino-carboxílico halogenado representado por la fórmula (II-1) puede hacerse reaccionar con clorodifluoroacetato de metilo en la presencia de fluoruro potásico, para producir un derivado de ácido trifluorometilpiracino-carboxílico representado por la fórmula general (II').

10 Procedimiento de Preparación de Referencia 2:

(en el que hal y R¹ son tal como se han definido anteriormente; M es un átomo de metal alcalino o NHR¹₃ (en el que R¹ es tal como se ha definido anteriormente).

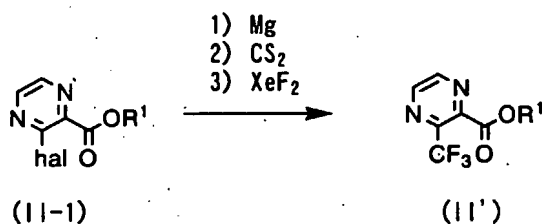
- 15 De acuerdo con un procedimiento similar a los descritos en las referencias de la literatura conocidos (por ejemplo, la referencia a *J. Chem. Soc. Perkin Trans I*, pág. 921, (1988), *Chem. Lett.*, vol. 12, pág. 1719, (1981) y la Gaceta Oficial de la Patente de EE.UU. No. 4814480), un derivado de ácido piracino-carboxílico halogenado representado por la fórmula (II-1) puede hacerse reaccionar con una sal de ácido trifluoroacético, para producir un derivado de ácido trifluorometilpiracino-carboxílico representado por la fórmula general (II').

Procedimiento de Preparación de Referencia 3:

20

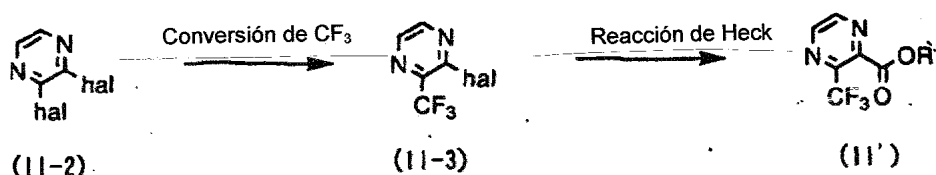
(en el que hal y R¹ son tal como se han definido anteriormente).

- 25 De acuerdo con un procedimiento similar a los descritos en las referencias de la literatura conocidos (por ejemplo, la referencia a *J. Med. Chem.*, vol. 27, (No. 3), pág. 255, (1984), *J. Chem. Soc. Chem. Commun.*, vol. 1, pág. 53, (1992) y *J. Chem. Soc. Chem. Commun.*, pág. 638, (1988), un derivado de ácido piracino-carboxílico halogenado representado por la fórmula (II-1) puede hacerse reaccionar con un trifluorometilo halogenado, para producir un derivado de ácido trifluorometilpiracino-carboxílico representado por la fórmula general (II').

Procedimiento de Preparación de Referencia 4:

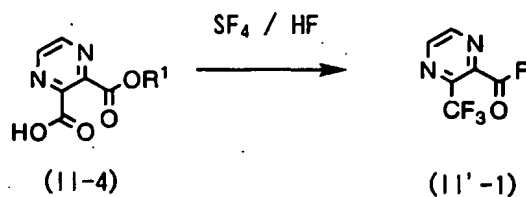
(en el que hal y R¹ son tal como se han definido anteriormente).

5 De acuerdo con un procedimiento similar a los descritos en las referencias de la literatura conocidos (por ejemplo, la referencia a Tetrahedron Letters, vol. 31, (No. 23), pág. 3357, (1990)), un derivado de ácido piracinocarboxílico halogenado representado por la fórmula (II-1) se hace reaccionar con magnesio para convertirse en un reactivo de Grignard, y el dicho reactivo de Grignard puede hacerse reaccionar con disulfuro de carbono, seguido de reacción con fluoruro de xenón, para producir un derivado de ácido trifluorometilpiracinocarboxílico representado por la fórmula general (II').

10 Procedimiento de Preparación de Referencia 5:

(en el que hal y R¹ son tal como se han definido anteriormente).

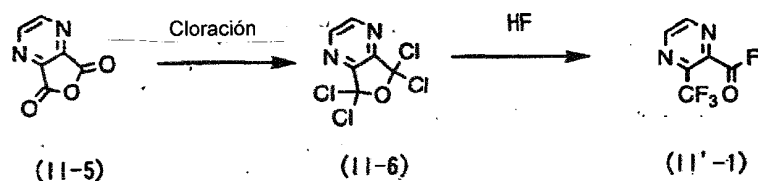
15 De acuerdo con los procedimientos tal como describen en los Procedimientos de Preparación de Referencia 1 a 4, piracinas 2,3-dihalogenadas representadas por la fórmula general (II-2) pueden someterse a sustitución de uno cualquiera de sus átomos de halógeno con un grupo trifluorometilo, para proporcionar trifluorometilpiracinas representadas por la fórmula (II-3), seguido por la conversión del átomo de halógeno restante a un ácido carboxílico o su éster mediante la reacción de Heck (por ejemplo, la referencia a la Gacetas Oficiales de los Documentos JP-A Nos. Sho 64-000047, Hei 8-157421 y Hei 9-151156), para producir derivados de ácido trifluorometilpiracinocarboxílico representados por la fórmula general (II').

20 Procedimiento de Preparación de Referencia 6:

(en el que hal y R¹ son tal como se han definido anteriormente).

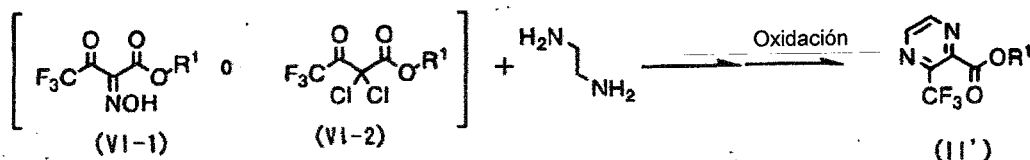
25 De acuerdo con un procedimiento similar a los descritos en las referencias de literatura conocida (por ejemplo, la referencia a las Gacetas Oficiales de los Documentos JP-A Nos. Sho 55-59136 y Sho 55-59136), derivados de ácido 2,3-piracinodicarboxílico representados por la fórmula general (II-4), pueden fluorarse para producir derivados de ácido trifluorometilpiracinocarboxílico representados por la fórmula general (II'-1).

Procedimiento de Preparación de Referencia 7:



De acuerdo con un procedimiento similar a los descritos en las referencias de literatura conocida (por ejemplo, la referencia a la Gaceta Oficial del Documento JP-A No. Hei 8-81456), el anhídrido del ácido 2,3-piracindicarboxílico representado por la fórmula general (II-5), puede clorarse para proporcionar su derivado clorado representado por la fórmula general (II-6), seguido por reacción con fluoruro de hidrógeno mediante un procedimiento similar a los descritos en las referencias de literatura conocidas (por ejemplo, referencia a Chemical Abstracts, (AN: 1963: 475140), un extracto en inglés del Zhurnal Obschei Khimii), para producir un derivado de ácido trifluorometilpiracinoicarboxílico representado por la fórmula general (II'-1).

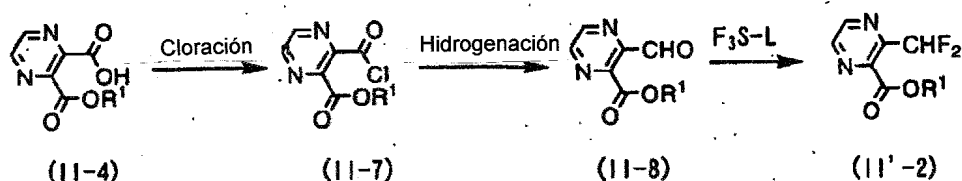
10 Procedimiento de Preparación de Referencia 8:



De acuerdo con un procedimiento similar a los descritos en las referencias de literatura conocida (por ejemplo, la referencia a J. Org. Chem., vol. 45, pág. 161, (1980); J. Org. Chem., vol. 45, pág. 163, (1980) e Indian J. Org. Chem. Sect. B., vol. 23, pág. 850, (1984)), ésteres ceto representados por la fórmula general (VI-1) o (VI-2), pueden hacerse reaccionar con etilendiamina para permitir la ciclación, seguido por oxidación para producir derivados de ácido trifluorometilpiracinoicarboxílico representados por la fórmula general (II').

El derivado de ácido piracindicarboxílico de (II'-2), en el que X es, por ejemplo, un grupo difluorometilo, puede producirse, por ejemplo, de acuerdo con el procedimiento tal como se describe en el Procedimiento de Preparación de Referencia 9 a continuación, etc.

20 Procedimiento de Preparación de Referencia 9:

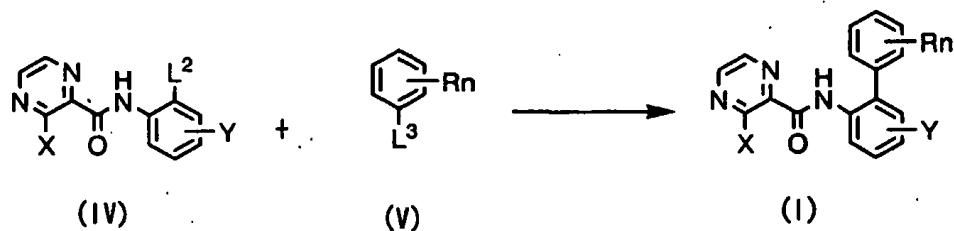


(en el que R¹ es tal como se ha definido anteriormente; L es -N(CH₃)₂, -N(C₂H₅)₂, -N(CH₂CH₂OCH₃)₂, o -N(CH₂CH₂)₂O).

De acuerdo con un procedimiento similar a los descritos en las referencias de literatura conocida (por ejemplo, la referencia a la Gaceta Oficial de la traducción japonesa de Solicitud PCT No. 2004-528297), derivados de ácido 2,3-piracindicarboxílico representados por la fórmula general (II-4), pueden convertirse en sus derivados aldehído representados por la fórmula general (II-8) mediante sus haluros de ácido representados por la fórmula general (II-7), seguido por fluoración de sus grupos formilo con agentes de fluoración conocidos (por ejemplo, referencia a J. Chem. Org., vol. 64, pág. 7048, (1999)), para producir derivados de ácido difluorometilpiracinoicarboxílico representados por la fórmula general (II'-2).

Derivados 2-aminobifenilo representados por la fórmula general (III) pueden producirse mediante procedimientos tales como los descritos en Tetrahedron Letters, vol. 28, pág. 5093, (1987) y Tetrahedron Letters, vol. 90, pág. 5436, (1988), etc., o procedimientos similares a ellos.

Procedimiento de Producción 2:



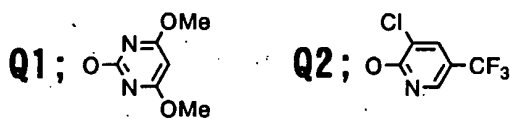
(en el que X, Y, R y n son tal como se han definido anteriormente; L² es un grupo de cesión, tal como átomos de cloro, bromo y yodo, un grupo trifluorometanosulfonylo, etc.; L³ es un grupo B(OH)₂, B(OR²)₂, (en el que R² puede ser el mismo o diferente, y representa un grupo alquilo(C₁-C₁₀), o dos R²s pueden combinarse en sus terminales para formar un grupo -CH₂CH₂- o -C(CH₃)₂C(CH₃)₂-) o un grupo Sn(R³)₃ (en el que R³ puede ser el mismo o diferente y representa un grupo alquilo(C₁-C₁₀)).

Un derivado piracino-carboxamida representado por la fórmula general (IV) y un compuesto representado por la fórmula general (V) pueden hacerse reaccionar con un disolvente inerte en la presencia de un catalizador y una base, para producir un derivado de piracino-carboxamida de la presente invención tal como se representa por la fórmula general (I). Esta reacción normalmente se lleva a cabo a una temperatura de reacción dentro del intervalo de aproximadamente 20°C a 150°C para un tiempo de reacción dentro del intervalo de 1 hora a 24 horas. Un compuesto representado por la fórmula general (V) normalmente se usa en proporciones de aproximadamente 0,8 a 5 moles por mol de un derivado de ácido piracino-carboxílico representado por la fórmula general (IV).

El catalizador incluye, por ejemplo, catalizadores de paladio, tales como acetato de paladio(II), tetraquis-(trifenilfosfina)paladio(0), complejo de [1,1'-bis(difenilfosfina)-ferroceno]dicloroplatino(II)-cloruro de metileno, dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II), etc. El catalizador se usa en proporciones dentro del intervalo de aproximadamente 0,001 a 0,1 mol por mol de un compuesto representado por la fórmula general (V). La base incluye, por ejemplo, bases inorgánicas, tales como hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, carbonato de cesio, bicarbonato sódico, etc., y sales del ácido acético, tales como acetato sódico, acetato potásico, etc. La base se usa normalmente en proporciones dentro del intervalo de aproximadamente 0,5 a 10 moles por mol de derivado de ácido piracino-carboxílico representado por la fórmula general (IV).

Esta reacción puede llevarse a cabo en la presencia de un catalizador de transferencia de fase (el cual incluye, por ejemplo, sales de amonio cuaternario, tales como bromuro de tetrabutilamonio, bromuro de benciltrimetilamonio, etc.), según sea el caso. En el caso del compuesto representado por la fórmula general (V) en la que L³ es Sn(R³)₃, además, la reacción puede realizarse, por ejemplo, en la presencia de óxido de cobre(II), óxido de plata(II), etc., con el fin de llevar a cabo la reacción de manera eficaz. El disolvente inerte que puede usarse puede ser cualquier disolvente inerte, salvo que ellos impidan o inhiban marcadamente esta reacción, y pueden ejemplificarse por alcoholes, tales como metanol, etanol, propanol, butanol, 2-propanol, etc., éteres de cadena recta o cíclicos, tales como éter dietílico, tetrahidrofurano, dioxano, etc., hidrocarburos aromáticos, tales como benceno, tolueno, xileno, etc., hidrocarburos halogenados, tales como cloruro de metileno, cloroformo, tetracloruro de carbono, etc., nitrilos, tales como acetonitrilo, etc., ésteres, tales como acetato de etilo, etc., disolventes orgánicos polares, tales como, N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, dimetil sulfóxido, 1,3-dimetil-2-imidazolinona, agua, ácido acético, etc., y similares. Estos disolventes inertes pueden usarse de manera individual o como una mezcla de no más de dos de los mismos. Una vez completada la reacción, el compuesto objetivo puede aislarse a partir de la mezcla de reacción que contiene el compuesto objetivo mediante los procedimientos convencionalmente usados, y la purificación, puede efectuarse mediante recristalización, cromatografía de columna, etc., según sea el caso, para producir el compuesto objetivo. En algunos casos, los compuestos a producir pueden existir en isómeros que muestran diferentes puntos de fusión, tal como es el caso de polimorfismo del cristal, y cualquiera de dichos isómeros se encuentra incluido en la presente invención.

En las Tablas 1 a 5 se presentan ejemplos representativos de los derivados de piracino-carboxamida de la presente invención representados mediante la fórmula general (I), los cuales se han obtenido de la manera anteriormente descrita, pero la presente invención se entiende que no está limitada a ellos. En estas Tablas, las propiedades físicas típicas están expresadas como un punto de fusión (°C). La Tabla 6 tabula los datos de RMN ¹H para los compuestos descritos como "Amorfos", y en las Tablas 1 a 5, los compuestos que muestran dos puntos de fusión diferentes indicados están destinados a implicar la existencia del polimorfismo del cristal que consiste en al menos dos formas de cristal. En las Tablas 1 a 5 mostradas a continuación, "Me" indica un grupo metilo, "Et" un grupo etilo, "Pr" un grupo propilo, "Bu" un grupo butilo, "Ph" un grupo fenilo, "n-" normal, "i-" iso, y "t-" terciario, respectivamente. Y Q1 y Q2 representan las fórmulas estructurales ilustradas a continuación, respectivamente.



La fórmula general (I):

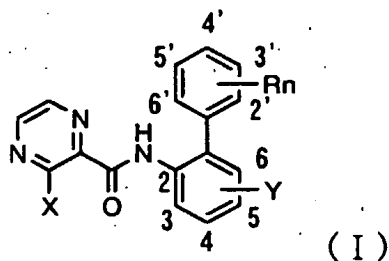


Tabla 1: (X=Cl)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
1-1	H	2'-F	
1-2	H	3'-F	
1-3	H	3'-Cl	121-122
1-4	H	3'-CF ₃	115-117
1-5	H	4'-F	107,6-109
1-6	H	4'-Cl	130-133
1-7	H	4'-Br	148-149
1-8	H	4'-Me	111-113
1-9	H	4'-Et	
1-10	H	4'-t-Bu	115,5-116,5
1-11	H	4'-CF ₃	154,7-155,6
1-12	H	4'-OMe	
1-13	H	4'-OCHF ₂	
1-14	H	4'-OCF ₃	89-94
1-15	H	4'-SMe	116,6-117,5
1-16	H	4'-SO ₂ Me	
1-17	H	4'-CN	201-204
1-18	H	4'-C(Me)=NOMe	124-125
1-19	H	4'-C(Me)=NOPr-n	
1-20	H	4'-C(Me)=NOPr-i	
1-21	H	3',4'-F ₂	141,7-142,9
1-22	H	3',4'-Cl ₂	153,7-155
1-23	H	3'-F-4'-Cl	

Tabla 1 (Cont.)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
1-24	H	3'-Cl-4'-F	
1-25	H	3'-Me-4'-F	
1-26	H	3'-Me-4'-Cl	
1-27	H	3'-Cl-4'-Me	
1-28	H	3'-Cl-4'-CF ₃	Amorfo
1-29	H	3'-CF ₃ -4'-Cl	
1-30	H	3'-OCH ₂ O-4'	
1-31	H	3'-OCF ₂ O-4'	Amorfo
1-32	H	3'-OCF ₂ CF ₂ O-4'	
1-33	H	3',5'-F ₂	199-200
1-34	H	3',5'-Cl ₂	167-168
1-35	H	3',5'-(CF ₃) ₂	152-153
1-36	H	2'-F-4'-Cl	147-151
1-37	H	3'-Cl-4'-CO ₂ Et	83-86
1-38	H	2'-Me-4'-OCF ₃	94,5-95,5
1-39	H	2',4'-F ₂	103,5-105
1-40	H	2',4'-Cl ₂	157-158
1-41	H	2',5'-F ₂	
1-42	H	2',3'-F ₂	
1-43	H	4'-Ph(4''-Br)	
1-44	H	4'-OPh	100-106
1-45	H	4'-OPh(4''-Cl)	
1-46	H	4'-Q1	137-143
1-47	H	4'-Q2	79-80
1-48	H	3-Q2	
1-49	5-Me	4'-Cl	
1-50	4-F	4'-Cl	
1-51	H	2'-Me-4'-Cl	
1-52	H	2'-Me-4'-F	
1-53	H	2'-Me-4'-Cl ₂	
1-54	H	2'-Me-3',4'-F ₂	
1-55	H	2'-F-4',5'-Cl ₂	
1-56	H	2',4',5'-F ₃	
1-57	H	2',5'-F ₂ -4'-Cl	

Tabla 1 (cont.)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
1-58	H	3',5'-Cl ₂ -4'-Me	
1-59	H	3',5'-F ₂ -4'-Me	

Tabla 2: (X=Me)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
2-1	H	2'-F	
2-2	H	3'-F	
2-3	H	3'-Cl	
2-4	H	3'-CF ₃	
2-5	H	4'-F	163,6-165
2-6	H	4'-Cl	146-147
2-7	H	4'-Br	125-126
2-8	H	4'-Me	127-128
2-9	H	4'-Et	
2-10	H	4'-t-Bu	
2-11	H	4'-CF ₃	143,9-144,3
2-12	H	4'-OMe	Amorfo
2-13	H	4'-OCHF ₂	
2-14	H	4'-OCF ₃	120-121
2-15	H	4'-SMe	
2-16	H	4'-SO ₂ Me	
2-17	H	4'-CN	
2-18	H	4'-C(Me)=NOMe	
2-19	H	4'-C(Me)=NOPr-n	
2-20	H	4'-C(Me)=NOPr-i	
2-21	H	3',4'-F ₂	173—174
2-22	H	3',4'-Cl ₂	178,4-179
2-23	H	3'-F-4'-Cl	
2-24	H	3'-Cl-4'-F	
2-25	H	3'-Me-4'-F	
2-26	H	3'-Me-4'-Cl	
2-27	H	3'-Cl-4'-Me	
2-28	H	3'-Cl-4'-CF ₃	
2-29	H	3'-CF ₃ -4'-Cl	

Tabla 2 (Cont.)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
2-30	H	3'-OCH ₂ O-4'	
2-31	H	3'-OCF ₂ O-4'	
2-32	H	3'-OCF ₂ CF ₂ O-4'	
2-33	H	3',5'-F ₂	
2-34	H	3'.5'-Cl ₂	
2-35	H	3',5'-(CF ₃) ₂	
2-36	H	2'-F-4'-Cl	107-108
2-37	H	3'-Cl-4'-CO ₂ Et	138-139
2-38	H	2'-Me-4'-OCF ₃	53-55
2-39	H	2',4'-F ₂	
2-40	H	2',4'-Cl ₂	93-96
2-41	H	2',5'-F ₂	
2-42	H	2',3'-F ₂	
2-43	H	4'-Ph(4''-Br)	
2-44	H	4'-OPh	
2-45	H	4'-OPh(4''-Cl)	
2-46	H	4'-Q1	
2-47	H	4'-Q2	
2-48	H	3-Q2	
2-49	5-F	4'-Cl	
2-50	4-F	4'-Cl	
2-51	H	2'-Me-4'-Cl	
2-52	H	2'-Me-4'-F	
2-53	H	2'-Me-4'-Cl ₂	
2-54	H	2'-Me-3',4'-F ₂	
2-55	H	2'-F-4',5'-Cl ₂	
2-56	H	2',4',5'-F ₃	
2-57	H	2',5'-F ₂ -4'-Cl	
2-58	H	3',5'-Cl ₂ -4'-Me	
2-59	H	3',5'-F ₂ -4'-Me	

Tabla 3: (X=CF₃)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
3-1	H	2'-F	
3-2	H	3'-F	
3-3	H	3'-Cl	110,5-111,5
3-4	H	3'-CF ₃	120-121,5
3-5	H	4'-F	133-134
3-6	H	4'-Cl	144-145
3-7	H	4'-Br	156-157
3-8	H	4'-Me	110-111
3-9	H	4'-Et	
3-10	H	4'-t-Bu	127,8-129,1
3-11	H	4'-CF ₃	147-148
3-12	H	4'-OMe	
3-13	H	4'-OCHF ₂	
3-14	H	4'-OCF ₃	138-140
3-15	H	4'-SMe	121,5-122,5
3-16	H	4'-SO ₂ Me	
3-17	H	4'-CN	
3-18	H	4'-C(Me)=NOMe	132.133
3-19	H	4'-C(Me)=NOPr-n	
3-20	H	4'-C(Me)=NOPr-i	
3-21	H	3',4'-F ₂	116-117
3-22	H	3',4'-Cl ₂	115,5-112,1 131-132 (Polimorfismo del cristal)
3-23	H	3'-F-4'-Cl	127-128
3-24	H	3'-Cl-4'-F	128-129
3-25	H	3'-Me-4'-F	94-95
3-26	H	3'-Me-4'-Cl	140-141
3-27	H	3'-Cl-4'-Me	104-105
3-28	H	3'-Cl-4'-CF ₃	126-130
3-29	H	3'-CF ₃ -4'-Cl	144-147
3-30	H	3'-OCH ₂ O-4'	
3-31	H	3'-OCF ₂ O-4'	122-123

Tabla 3 (Cont.)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
3-32	H	3'-OCF ₂ CF ₂ O-4'	
3-33	H	3',5'-F ₂	119-120
3-34	H	3'.5'-Cl ₂	117-118
3-35	H	3',5'-(CF ₃) ₂	147-148
3-36	H	2'-F-4'-Cl	137-138
3-37	H	3'-Cl-4'-CO ₂ Et	83,5-84,5
3-38	H	2'-Me-4'-OCF ₃	76-77
3-39	H	2',4'-F ₂	117-118
2340	H	2',4'-Cl ₂	135,5-136,5
3-41	H	2',5'-F ₂	88-89
3-42	H	2',3'-F ₂	Amorfo
3-43	H	4'-Ph(4''-Br)	160-163
3-44	H	4'-OPh	152-153
3-45	H	4'-OPh(4''-Cl)	
3-46	H	4'-Q1	167-168
3-47	H	4'-Q2	143-144
3-48	H	3-Q2	
3-49	5-Cl	4'-Cl	
3-50	4-F	4'-Cl	
3-51	H	2'-Me-4'-Cl	112
3-52	H	2'-Me-4'-F	116
3-53	H	2'-Me-4'-Cl ₂	
3-54	H	2'-Me-3',4'-F ₂	
3-55	H	2'-F-4',5'-Cl ₂	
3-56	H	2',4',5'-F ₃	
3-57	H	2',5'-F ₂ -4'-Cl	
3-58	H	3',5'-Cl ₂ -4'-Me	
3-59	H	3',5'-F ₂ -4'-Me	
3-60	H	2'-Me-5'-F	
3-61	H	3'-F-4-Me	92-93
3-62	H	2'-Me-5'-F	
3-63	H	3'-F-4'-CHF ₂	111
3-64	H	3'-CHF ₂ -4-F	130-131
3-65	H	3'-Cl-4'-CHF ₂	128

Tabla 3 (Cont.)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
3-66	H	3'-F-4'-CF ₃	
3-67	H	2'-CHF ₂ -4'-F	
3-68	HI	2'-CHF ₂ -4'-Cl	
3-69	H	3'-F-4'-OCF ₃	103-104
3-70	H	3'-F-4'-OCHF ₂	95-100
3-71	H	3'-Cl-4'-OCHF ₂	Amorfo
3-72	H	3'-OCHF ₂ -4'-Cl	
3-73	H	3'-OCHF ₂ -4'-F	
3-74	H	3',5'-(Me) ₂ -4'-Cl	122,5-123,5
3-75	H	3',5'-(Me) ₂ -4'-F	Amorfo
3-76	H	3',5'-F ₂ -4'-Cl	128,5-129,5
3-77	H	3',4',5'-F ₃	145
3-78	H	3',5'-F ₂ -4'-OCHF ₂	
3-79	H	3',5'-F ₂ -4'-CO ₂ Et	
3-80	H	3'-Cl-4'-OCHF ₂ -5'-F	
3-81	H	3'-F-4'-OC(CO ₂ Et)=CH-5'	
3-82	H	3'-F-4'-OCH=CH-5'	
3-83	HI	4'-C≡CC(Me) ₃	
3-84	H	4'-C≡CC(Me) ₂ OH	
3-85	H	3'-F-4'-C≡CC(Me) ₃	
3-86	4-F	3',4'-Cl ₂	
3-87	4-F	3',4'-F ₂	
3-88	4-F	3'-F-4'-Cl	
3-89	4-f	4'-C(Me)=NOMe	

Tabla 4: (X=CHF₂)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
4-1	H	2'-F	
4-2	H	3'-F	
4-3	H	3'-Cl	
4-4	H	3'-CF ₃	
4-5	H	4'-F	
4-6	H	4'-Cl	Amorfo
4-7	H	4'-Br	

Tabla 4 (Cont.)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
4-8	H	4'-Me	
4-9	H	4'-Et	
4-10	H	4'-t-Bu	
4-11	H	4'-CF ₃	
4-12	H	4'-OMe	
4-13	H	4'-OCHF ₂	
4-14	H	4'-OCF ₃	
4-15	H	4'-SMe	
4-16	H	4'-SO ₂ Me	
4-17	H	4'-CN	
4-18	H	4'-C(Me)=NOMe	
4-19	H	4'-C(Me)=NOPr-n	
4-20	H	4'-C(Me)=NOPr-i	
4-21	H	3',4'-F ₂	Amorfo
4-22	H	3',4'-Cl ₂	Amorfo
4-23	H	3'-F-4'-Cl	
4-24	H	3'-Cl-4'-F	
4-25	H	3'-Me-4'-F	
4-26	H	3'-Me-4'-Cl	
4-27	H	3'-Cl-4'-Me	
4-28	H	3'-Cl-4'-CF ₃	
4-29	H	3'-CF ₃ -4'-Cl	
4-30	H	3'-OCH ₂ O-4'	
4-31	H	3'-OCF ₂ O-4'	
4-32	H	3'-OCF ₂ CF ₂ O-4'	
4-33	H	3',5'-F ₂	
4-34	H	3',5'-Cl ₂	
4-35	H	3',5'-(CF ₃) ₂	
4-36	H	2'-F-4'-Cl	
4-37	H	3'-Cl-4'-CO ₂ Et	
4-38	H	2'-Me-4'-OCF ₃	
4-39	H	2',4'-F ₂	
4-40	H	2',4'-Cl ₂	
4-41	H	2',5'-F ₂	

Tabla 4 (Cont.)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
4-42	H	2',3'-F ₂	
4-43	H	4'-Ph(4''-Br)	
4-44	H	4'-OPh	
4-45	H	4'-OPh(4''-Cl)	
4-46	H	4'-Q1	
4-47	H	4'-Q2	
4-48	H	3-Q2	
4-49	5-Cl	4'-Cl	
4-50	4-F	4'-Cl	
4-51	H	2'-Me-4'-Cl	
4-52	H	2'-Me-4'-F	
4-53	H	2'-Me-4'-Cl ₂	
4-54	H	2'-Me-3',4'-F ₂	
4-55	H	2'-F-4',5'-Cl ₂	
4-56	H	2',4',5'-F ₃	
4-57	H	2',5'-F ₂ -4'-Cl	
4-58	H	3',5'-Cl ₂ -4'-Me	
4-59	H	3',5'-F ₂ -4'-Me	

Tabla 5: (X=CH₂F)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
5-1	H	2'-F	
5-2	H	3'-F	
5-3	H	3'-Cl	
5-4	H	3'-CF ₃	
5-5	H	4'-F	
5-6	H	4'-Cl	
5-7	H	4'-Br	
5-8	H	4'-Me	
5-9	H	4'-Et	
5-10	H	4'-t-Bu	
5-11	H	4'-CF ₃	
5-12	H	4'-OMe	
5-13	H	4'-OCHF ₂	

Tabla 5 (Cont.)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
5-14	H	4'-OCF ₃	
5-15	H	4'-SMe	
5-16	H	4'-SO ₂ Me	
5-17	H	4'-CN	
5-18	H	4'-C(Me)=NOMe	
5-19	H	4'-C(Me)=NOPr-n	
5-20	H	4'-C(Me)=NOPr-i	
5-21	H	3',4'-F ₂	
5-22	H	3',4'-Cl ₂	
5-23	H	3'-F-4'-Cl	
5-24	H	3'-Cl-4'-F	
5-25	H	3'-Me-4'-F	
5-26	H	3'-Me-4'-Cl	
5-27	H	3'-Cl-4'-Me	
5-28	H	3'-Cl-4'-CF ₃	
5-29	H	3'-CF ₃ -4'-Cl	
5-30	H	3'-OCH ₂ O-4'	
5-31	H	3'-OCF ₂ O-4'	
5-32	H	3'-OCF ₂ CF ₂ O-4'	
5-33	H	3',5'-F ₂	
5-34	H	3',5'-Cl ₂	
5-35	H	3',5'-(CF ₃) ₂	
5-36	H	2'-F-4'-Cl	
5-37	H	3'-Cl-4'-CO ₂ Et	
5-38	H	2'-Me-4'-OCF ₃	
5-39	H	2',4'-F ₂	
5-40	H	2',4'-Cl ₂	
5-41	H	2',5'-F ₂	
5-42	H	2',3'-F ₂	
5-43	H	4'-Ph(4''-Br)	
5-44	H	4'-OPh	
5-45	H	4'-OPh(4''-Cl)	
5-46	H	4'-Q1	
5-47	H	4'-Q2	

Tabla 5 (Cont.)

Compuesto Nos.	Y	Rn	Propiedades físicas típicas
5-48	H	3-Q2	
5-49	5-Cl	4'-Cl	
5-50	4-F	4'-Cl	
5-51	H	2'-Me-4'-Cl	
5-52	H	2'-Me-4'-F	
5-53	H	2'-Me-4'-Cl ₂	
5-54	H	2'-Me-3',4'-F ₂	
5-55	H	2'-F-4',5'-Cl ₂	
5-56	H	2',4',5'-F ₃	
5-57	H	2',5'-F ₂ -4'-Cl	
5-58	H	3',5'-Cl ₂ -4'-Me	
5-59	H	3',5'-F ₂ -4'-Me	

Tabla 6:

Compuesto Nos.	RMN ¹ H (CDCl ₃ /TMS, δ valor ppm)
1-31	7,15-7,30 (m, 5H), 7,40-7,60 (m, 2H), 8,35 (d, 1H), 8,60 (d, 1H), 9,70 (s ancho, 1H)
3-42	7,10-7,20 (m, 2H), 7,25-7,40 (m, 3H), 7,52 (t, 1H), 8,45 (d, 1H), 8,60 (d, 1H), 8,80 (d, 1H), 9,48 (s ancho, 1H)
3-71	6,64 (t, 1H), 7,26-7,40 (m, 4H), 7,48 (t, 1H), 7,60 (d, 1H), 8,53 (d, 1H), 8,62 (d, 1H), 8,82 (d, 1H), 9,60 (ancho, 1H)

- 5 Los derivados de piracinocarboxamida de la presente invención tal como están representados por la fórmula general [I] o sus sales, poseen el efecto de control contra las enfermedades de las plantas. Consecuentemente, los derivados de piracinocarboxamida de la presente invención tal como están representados por la fórmula general [I] o sus sales, pueden encontrar aplicación especialmente como un agente para el control de enfermedades de plantas para usos agrícolas y hortícolas. En base a esto, la presente invención proporciona igualmente un procedimiento para el control de una enfermedad de una planta que comprende el tratamiento de plantas (especialmente plantas para usos agrícolas y hortícolas) con los derivados de piracinocarboxamida anteriormente mencionados representados por la fórmula general [I] o sus sales. Y el "tratamiento", que ha de efectuarse con los derivados de piracinocarboxamida anteriormente descritos de la presente invención tal como se representan por la fórmula general [I] o sus sales, incluye la pulverización o esparcido de las sustancias químicas anteriormente descritas sobre la planta objetivo, así como la pulverización o mojado de los mismos sobre el suelo en el cual crece la planta objetivo, y similares.

El agente para el control de enfermedades de plantas para usos agrícolas y hortícolas, el cual contiene un derivado de piracinocarboxamida de la presente invención, tal como se representa por la fórmula general [I] o sus sales, es particularmente adecuado para el control de enfermedades de plantas de arroz, árboles frutales, verduras y diversos cultivos, así como flores y plantas ornamentales.

- 20 Las enfermedades objetivo, contra las cuales el agente de control de enfermedades de plantas de la presente invención es para usar, incluyen, por ejemplo, enfermedades causadas por hongos o mohos, enfermedades causadas por bacterias, enfermedades causadas por virus, y similares. Las enfermedades causadas por mohos están ejemplificadas por las enfermedades causadas por la familia de los *Fungi Imperfecti* (por ejemplo, enfermedades causadas por el género *Botrytis*, el género *Helminthosporium*, el género *Fusarium*, el género *Septoria*, el género *Cercospora*, el género *Pseudocercospora*, el género *Rhynhospodium*, el género *Pyricularia*, el género *Alternaria*, y similares), las enfermedades causadas por la familia de los *Basidiomycetes* (por ejemplo, las enfermedades causadas por el género *Hemilelia*, el género *Rhizoctonia*, el género *Ustilago*, el género *Typhula*, el género *Puccinia*, y similares), las en-

5 fermedades causadas por la familia de los *Ascomycetes* (por ejemplo, las enfermedades causadas por el género *Venturia*, el género *Podosphaera*, el género *Leptosphaeria*, el género *Blumeria*, el género *Erysia*, el género *Microdochium*, el género *Sclerotinia*, el género *Gaeumannomyces*, el género *Monilinia*, el género *Unsinula*, y similares), las enfermedades causadas por diversas familias de hongos (por ejemplo, las enfermedades causadas por el género *Ascochiata*, el género *Phoma*, el género *Pythium*, el género *Corticium*, el género *Pyrenophora*, y similares. Las enfermedades causadas por bacterias incluyen, por ejemplo, las enfermedades causadas por el género *Pseudomonas*, el género *Xanthomonas*, el género *Erwinia*, y similares, y las enfermedades causadas por virus incluyen, por ejemplo, las enfermedades causadas por el virus del mosaico del tabaco, etc.

10 Como los ejemplos particulares o específicos de las enfermedades causadas por hongos, puede mencionarse el tizón de la planta del arroz (causada por la *Prycularia oryzae*), añublo de la vaina de la planta del arroz (causada por la *Rhizoctonia solani*), rayado de la planta del arroz (causado por la *Cochlobolus miyabeanus*), añublo de la semilla de la planta del arroz (causada por el *Rhizopus chinensis*, *Pythium graminicola*, *Fusarium graminicola*, *Fusarium roseum*, *Mucro sp.*, *Phoma sp.*, *Tricoderma sp.*), enfermedad "bakanae" de la planta del arroz (causada por la *Gibberella fujikoroï*), oidio pulverulento de plantas de cebada y trigo (causado por *Blumeria graminis*), oidio pulverulento de la planta del pepino, etc. (causado por la *Sphaerotheca fuliginea*), oidio pulverulento de la planta de la berenjena, etc. (causado por la *Erysiphe cichoracoarum*) y los oidios pulverulentos de diversas plantas huéspedes, cercosporiosis de plantas de cebada y trigo (causado por la *Pseudocercospora herpotrichoides*), royas blancas de la planta del trigo, etc. (causadas por la *Urocystis tritici*), añublo de las nieves de las plantas de cebada y trigo, etc. (causado por *Microdochium nivalis*, *Pythium iwayamai*, *Typhla ishikariensis*, *Thiplotrypa incamata*, *Sclerotinia borealis*), roñas de las plantas de cebada y trigo, etc. (causadas por *Fusarium graminearum*, *Fusarium avenaceum*, *Fusarium culmorum*, *Microdochium nivalis*), royas de las plantas de cebada y trigo, etc. (causadas por *Puccinia recondite*, *Puccinia striiformis*, *Puccinia graminis*), podredumbres de los pies de las plantas de cebada y trigo, etc. (causadas por *Gaeumannomyces graminis*), roya de las plantas de avena, etc. (causada por *Puccinia coronata*), y royas de diversas plantas, botritis de las plantas del pepino y fresa, etc. (causada por *Botrytis cinerea*), canchros de las plantas de tomate y col, etc. (causado por *Sclerotinia sclerotinorum*), agostamiento tardío de plantas de patatas y tomates (causado por la *Phytophthora infestans*) y diversas plantas, royas de diversas plantas, tales como oidio veloso de la planta del pepino (causado por *Pseudoperonospora cubensis*), oidio veloso de cepas de vino, etc., roña del manzano (causado por *Venturia inaequalis*), manchas de las hojas del manzano (causadas por *Alternaria mali*), manchas negras del peral Japonés (causadas por *Alternaria kikuchiana*), canchros de los árboles frutales cítricos (causados por *Diaporthe citri*), roña de los árboles frutales cítricos (causada por *Elsinoe fawcetti*), manchas pardas de las hojas de la planta de la remolacha (causada por *Cercospora beticola*), manchas pardas de las hojas de la planta del cacahuete (causada por *Cercospora arachidicola*), mancha de la hoja de la planta del cacahuete (causada por *Cercospora personata*), manchas de las hojas caídas de la planta del trigo (causada por *Septoria tritici*), mancha gluma de la planta del trigo (causada por *Leptosphaeria nodorum*), podredumbre de la planta de la cebada (causada por *Pyrenophora teres*), rayado de la hoja de la planta de la cebada (causado por *Pyrenophora graminea*), quemadura de la planta de la cebada (causada por *Rhynchosporium secalis*), carbón desnudo de la planta del trigo (causado por *Ustilago nuda*), caries de la planta del trigo (causada por *Tilletia caries*), rodal pardo de hierba de césped o prados (causado por *Rhizoctonia solani*), mancha del tamaño del dólar de hierba de césped (causada por *Sclerotinia homeocarpa*), y similares.

40 Como los ejemplos particulares o específicos de las enfermedades causadas por bacterias, pueden mencionarse las enfermedades causadas por el género *Pseudomonas*, tal como manchas bacterianas de la planta del pepino (causadas por *Pseudomonas syringae* pv. *Lachrymans*), bronceado bacteriano de la planta del tomate (causado por *Ralstonia solanacearum*) y podredumbre bacteriana de la planta del arroz (causada por *Burkholderia glumae*), las enfermedades causadas por el género *Xanthomonas*, tales como roña negra de la planta de la col (causada por *Xanthomonas campestris*), tizón bacteriano de la hoja de plantas de arroz (causada por *Xanthomonas oryzae*) y gangrenado de los árboles frutales cítricos (causado por *Xanthomonas citri*), las enfermedades causadas por el género *Erwinia*, tal como la podredumbre blanda bacteriana de la planta de la col (causada por *Erwinia carotovora*), y similares.

50 Los ejemplos de enfermedades particulares o específicas de las enfermedades causadas por virus incluyen el mosaico del tabaco (causado por el *Tobacco mosaic virus*), y similares.

Las plantas a las cuales el agente para el control de enfermedades de plantas de la presente invención es aplicable no está particularmente limitado, e incluye, por ejemplo, plantas de cereales (por ejemplo, plantas de arroz, cebada, trigo, centeno, avena, maíz, sorgo, etc.), plantas de vainas (por ejemplo, plantas de soja, judía roja pequeña, haba, guisante, cacahuete, etc.), árboles frutales y frutos (por ejemplo, manzanos, frutales cítricos, perales, parras, melocotoneros, albaricoquero japonés o ciruelo, cerezo, nogal, almendro, platanero, fresa, etc., y sus frutos), verduras y hortalizas (por ejemplo, plantas de coles, tomates, espinacas, brócoli, lechuga, cebolla, cebolleta, pimiento, etc.), vegetales y hortalizas de raíz (por ejemplo, plantas de zanahorias, patata, boniato, rábano japonés, loto de la India Oriental, remolacha, etc.), cultivos industriales o cultivos para transformación industrial (por ejemplo, plantas o árboles de algodón, cáñamo, moral para papel, *mitsumata*, colza, remolacha, lúpulo, caña de azúcar, remolacha azucarera, aceituna, caucho o goma, café, tabaco, té, etc.), vegetales y hortalizas cucurbitáceas (por ejemplo, plantas de calabaza, pepino, sandía, melón, etc.), gramíneas para forraje (por ejemplo, hierba para horticoltura, sorgo, fleo de los prados, trébol, alfalfa, etc.), hierba para césped o prado (por ejemplo, hierba *korai*, hierba *agrostis*, etc.), cose-

chas para fragancias (por ejemplo, plantas de lavanda, romero, tomillo, perejil, pimienta, jengibre, etc.), flores (por ejemplo, crisantemo, rosa, orquídea, etc.), y similares.

Igualmente, el agente para el control de enfermedades de plantas de la presente invención puede encontrar aplicación práctica en IPM (abreviatura de "Control de plagas integrado"). El IPM incluye, por ejemplo, la introducción de cultivos, genéticamente modificados (por ejemplo, cultivo resistente a enfermedades que ha sido transfectado con el gen que codifica una proteína insecticida, cultivo resistente a herbicidas, cultivo resistente a plagas que ha sido transfectado con el gen que codifica una sustancia capaz de inducir resistencia a la enfermedad, cultivo para mejorar el sabor, plantas que producen cultivos de mayor duración de conservación, cultivo de rendimiento mejorado, etc.), uso de formulaciones de feromonas, tales como feromonas de insectos (por ejemplo, agentes que perturban la comunicación entre polillas), uso práctico de insectos enemigos naturales, etc., uso práctico de productos agroquímicos con base química, y similares. El agente para el control de enfermedades de plantas de la presente invención puede encontrar uso práctico, eficaz, como los productos agroquímicos mencionados.

En casos en los que el compuesto de la presente invención se usa como un ingrediente activo para agentes de control de enfermedades de plantas, este puede usarse como tal sin la adición de otros ingredientes, pero preferiblemente, se usa después de ser transformado normalmente dentro de una forma de formulación agroquímica para uso de acuerdo con el procedimiento convencional de transformación de formulaciones agroquímicas.

Fundamentalmente, un derivado de piracincocarboxamida representado por la fórmula general (I) o sus sales, puede usarse después de incorporarse dentro de un vehículo inerte adecuado como tal o conjuntamente con adyuvantes en proporciones adecuadas, según sea el caso, seguido de disolución, separación, suspensión, mezclado, impregnación, adsorción o adhesión con el fin de transformarlo dentro de una forma de formulación agroquímica adecuada, tal como suspensión, emulsión, solución, polvo humectable, gránulo dispersable en agua, gránulo, polvo, comprimido, formulación en envase, y similares.

El vehículo inerte que puede usarse en la presente invención puede ser o bien uno sólido o uno líquido. El material que puede ser capaz de servir para un fin útil como un vehículo sólido incluye, por ejemplo, harina de soja, harina de cereal, harina de madera, harina de corteza de árbol, polvo de serrín, harina de caña de tabaco, harina de cáscara de nuez, salvado de trigo, polvo de celulosa, residuo después de la extracción de extractos de plantas, polímeros sintéticos tales como polímeros sintéticos molidos, polvos minerales inorgánicos, tales como arcillas (por ejemplo, caolín, bentonita, arcilla ácida, etc.), talcos (por ejemplo, talco, pirofillita, etc.), sílices (por ejemplo, tierra de diatomeas, arena de sílice, mica, carbón blanco (sílice conteniendo agua finamente pulverizada, o ácidos silícicos sintéticos finamente dispersados, también denominados como ácido silícico conteniendo agua, en algunos casos constituida fundamentalmente de silicato cálcico), carbón activado, polvo de azufre, pómez, tierra de diatomeas quemada, ladrillos molidos, cenizas volantes, arena, carbonato cálcico, fosfato cálcico, etc., vehículos de plásticos, tales como polietileno, polipropileno, cloruro de polivinilo, etc., fertilizantes químicos, tales como sulfato amónico, fosfato amónico, nitrato amónico, urea, cloruro amónico, etc., compost, y similares. Estos pueden usarse de manera separada o como una mezcla de no menos de dos de los mismos.

El material, que puede actuar como un vehículo líquido, incluye los que poseen la capacidad disolvente y, además, está seleccionado entre materiales que eventualmente serían capaces de dispersar los ingredientes activos mediante la ayuda de adyuvantes, aunque carezcan de capacidad disolvente; sus representantes pueden ejemplificarse mediante los vehículos anteriormente mencionados, los cuales se usan de manera separada o como una mezcla de no menos de dos de los mismos, y pueden mencionarse, por ejemplo, agua, alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, isopropanol, butanol, etileno glicol, etc.), cetonas (por ejemplo, acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona, diisobutil cetona, ciclohexanona, etc.), éteres (por ejemplo, éter etílico, dioxano, cellosolve, éter dipropílico, tetrahidrofurano, etc.), hidrocarburos alifáticos (por ejemplo, queroseno, aceite mineral, etc.), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno, nafta disolvente, alquilnaftaleno, etc.), hidrocarburos halogenados (por ejemplo, dicloroetano, clorformo, tetracloruro de carbono, bencenos clorados, etc.), ésteres (por ejemplo, acetato de etilo, ftalato de diisopropilo, ftalato de dibutilo, ftalato de dioctilo, etc.), amidas (por ejemplo, dimetilformamida, dietilformamida, dimetilacetamida, etc.), nitrilos (por ejemplo, acetonitrilo, etc.), dimetil sulfóxido, y similares.

Como el adyuvante, pueden mencionarse, por ejemplo, los tensioactivos ejemplificados más adelante, estabilizadores de dispersión, adyuvantes pegajosos y/o aglomerantes, mejoradores de la fluidez, agentes desfloculantes, agentes antiespumantes, conservantes, y similares, y estos pueden usarse adecuadamente de acuerdo con el objeto deseado. Los adyuvantes pueden usarse de manera separada y, en ciertos casos, pueden usarse en combinación con menos de dos de los mismos, aunque en algunos casos no se necesita usar ninguno de los mismos.

El tensioactivo puede usarse, por ejemplo, para los fines de emulsificación, dispersión, solubilización y/o humectación de los ingredientes activos, y puede ejemplificarse mediante éteres de polioxietileno alquileo, éteres de polioxietileno polialalquilarilo, ésteres de ácidos grasos superiores de polioxietileno, ésteres de ácidos de resina de polioxietileno, monolaurato de polioxietileno sorbitano, monooleato de polioxietileno sorbitano, alquilarilsulfonatos, condensados de naftalenosulfonato, lignosulfonatos, ésteres de ácido sulfúrico de alcoholes superiores, y similares.

El estabilizador de dispersión y el adyuvante pegajoso y/o aglomerante pueden usarse con el fin de estabilización de la dispersión de los ingredientes activos e igualmente como un adyuvante pegajoso y/o aglomerante para la forma-

ción de partículas. Y como tal estabilizador de la dispersión y adyuvante pegajoso y/o aglomerante, pueden mencionarse, por ejemplo, caseína, gelatina, almidón, metilcelulosa, carboximetilcelulosa, goma arábiga, alcoholes de polivinilo, aceite de raíz de pino aceite de salvado de arroz, bentonita, ligninosulfonatos, y similares.

5 El mejorador de la fluidez puede usarse para mejorar la fluidez de formas agroquímicas sólidas. Como el mejorador de la fluidez, puede mencionarse, por ejemplo, cera, sales de ácido esteárico, fosfatos de alquilo, y similares. El agente desfloculante puede usarse como una agente de dispersante-desfloculante para formas de formulación suspendidas. Y como el agente desfloculante, puede mencionarse, por ejemplo, condensados de naftalenosulfonato, sales de ácidos fosfórico condensadas, y similares.

El agente antiespumante incluye, por ejemplo, aceites de silicona, y similares.

10 El conservante incluye, por ejemplo, 1,2-benzoisotiazolin-3-on, p-cloro-meta-xilenol, p-oxibenzoato de butilo, y similares.

15 Además, los agentes para el control de enfermedades de plantas para usos agrícolas y hortícolas pueden incorporarse, según sea el caso, con esparcidores funcionales. agentes reforzantes de la actividad, tales como inhibidores de la ruptura metabólica, por ejemplo, butóxido de piperonilo, etc., agentes anticongelantes, tal como propileno glicol, etc., antioxidantes, tal como BHT (dibutilhidroxitolueno), etc., absorbedores de UV, aditivos diversos, y similares.

20 La proporción de formulación del compuesto ingrediente activo, la cual puede incrementarse o disminuirse, según sea necesario, puede seleccionarse de manera adecuada para uso a partir del intervalo de aproximadamente 0,01 hasta 90 partes en masa contra 100 partes en masa del agente para el control de enfermedades de plantas para usos agrícolas y hortícolas, y de manera apropiada dentro del intervalo de aproximadamente 0,01 hasta 50% en masa en los casos en los que el compuesto ingrediente activo se transforme, por ejemplo, dentro de un concentrado emulsificable, polvo humectable, polvo o gránulo.

El agente para el control de enfermedades de plantas para usos agrícolas y hortícolas de acuerdo con la presente invención, puede usarse como tal, o en formas tales que sea adecuadamente diluido o suspendido con agua, etc., con el fin de controlar diversas enfermedades.

25 El agente para el control de enfermedades de plantas para usos agrícolas y hortícolas de acuerdo con la presente invención, se usa en cantidades o proporciones tal que pueden seleccionarse de manera apropiada de acuerdo con el objetivo a partir del intervalo de aproximadamente 0,001 g a 10 kg por área del área de la superficie de la explotación, aunque puede variar dependiendo de una diversidad de factores diferentes, tales como el objetivo, la enfermedad objetivo, condiciones de crecimiento de la planta de cultivo, tendencia de aparición o incidencia de la enfermedad, tiempo atmosférico, condiciones ambientes, forma de formulación, y el procedimiento, lugar o tiempo de aplicación, y similares.

30 El agente para el control de enfermedades de plantas para usos agrícolas y hortícolas de acuerdo con la presente invención, además con una visión específica hacia la ampliación o alargamiento de las plagas de enfermedades objetivo a controlar y el tiempo de control óptimo o con el fin de la reducción de las proporciones de aplicación, según sea el caso, puede usarse como una mezcla con otros pesticidas para usos agrícolas y hortícolas, tales como fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, productos agroquímicos biológicos, y similares, y puede igualmente usarse como una mezcla con herbicidas, reguladores del crecimiento de plantas, fertilizantes, y similares, dependiendo de las condiciones de aplicación.

35 Los otros fungicidas para usos agrícolas y hortícolas a usar para dichos fines pueden ejemplificarse mediante azufre, cal de azufre, sulfato de cobre básico, iprobenfos, edifenfos, tolclofos-methyl, thiram, policarbamato, zineb, manzeb, mancozeb, prpineb, tiofanato, tiofanato-metilo, benomyl, acetato de iminocadina, iminocadina-albesilato, mepronil, flutolanil, pencycuron, furametpyr, thifluzamid, metalaxil, oxadixil, carpropamid, dichlofluanid, fultsulfamida, chlorot-halonil, cresoxim-methyl, fenoxanil, hymexazol, euclomezol, fluoroimida, procymidona, vinclozolin, iprodiona, triadimefon, bitertanol, triflumizol, ipconazol, furconazol, propiconazol, difenoconazol, myclobutanil, tetraconazol, hexaconazol, tebuconazol, tiadinil, imibenconazol, prochloraz, pefurazoato, cyproconazol, isoprothiolano, fenarimol, pyrimetanil, mepanipyrim, pyrefenox, fluazinam, trifolina, diclomezina, azoxystrobin, tiadiacina, captan, probenazol, acibenzolar-S-methyl, fthalide, tricyclazole, pyroquilon, quinometionato, ácido oxolínico, dithianon, kasugamicina, validamicina, polyoxin, blastocidina o estreptomycin, y similares.

40 Los insecticidas, acaricidas, y nematocidas para usos agrícolas y hortícolas a usar para el mismo fin incluyen, por ejemplo, ethion, trichlorfon, methamidphos, acephate, dichlorvos, mevinphos, monocrotophos, malathion, dimetoato, formotion, mecarbam, vamidothion, thiometon, disulfoton, oxydeprofos, naled, methylparathion, fenitrothion, cyanophos, propaphos, fenthion, prothiofos, profenopos, isofenphos, temephos, fentoato, dimethylvinphos, chlorfenvinphos, tetrachlorvinphos, phoxim, isoxathion, pyraclofos, methidathion, clorpyrifos, chlorpyrifos-methyl, pyridafenthion, diazinon, pirimiphos-methyl, phosalone, phosmet, dioxabenzofos, quinalfos, terbufos, ethoprophos, cadusafos, mesulfenfos DPS (NK-0795), phosphocarb, fenamiphos, isoamidofos, fosthiazato, isazofos, enaprofos, fenthion, fosthietano, dichlofenthion, thionazin, sulfopros, fensulfthion, diamidafos, piretrina, allethrin, prallethrin, resmethrin, permethrin, tefluthrin, bifenthrin, fenpropathrin, cypermethrin, alpha-cypermethrin, cyhalothrin, rhamda-cyhalotrin, delta-methrin, acrinathrin, fenvalerato, esfenvalerato, cycloprothrin, etofenprox, halfenprox, silafluofen, flucythrinate, fluva-

linato, methomyl, oxamyl, thiocarb, aldicarb, alanicarb, cartap, metholcarb, xylicarb, propuxol, fenoxycarb, fenocarb, ethiocarb, fenothiocarb, bifenazato, BPMC /2-sec-butilfenil-N-metilcarbamato), carbaryl, pirimicarb, carbofuran, carbosulfan, furathiocarb, benfuracarb, aldoxycarb, diafenthiuron, diflubenzuron, teflubenzuron, hexaflumuron, novaluron, lufenuron, flufenoxuron, chlorfluaazuron, óxido de fenbutatin, hidróxido de triciclohexiltin, oleato sódico, oleato potásico, methoprene, hydropene, binapacryl, amitraz, dicofol, kelthane, clorobencilato, fenisobromolato, tetradifon, bensultap, benzomato, tebufenozide, methoxyfenozide, pyradalil, metaflumizone, flubendiamide, chromafenozide, propargita, acequinocyl, endosulfan, diofenolan, chlorphenapyr, fenpyroximate, tolfenpyrad, fipronil, tebufenpyrad, triazamato, ethoxazol, hexthiazox, sulfato de nicotina, nitenpyram, acetamiprid, thiacloprid, imidacloprid, thiamet-hoxam, clothianidin, dinotefuran, fluazinam, pyriproxyfen, hydramethylnon, pirimidifen, pyridaben, cyromazine, TPIC (isocianurato de tripropilo), pyremetrozine, clofentezine, buprofezin, thiocyclam, fenazaquin, quinometionato, indoxa-carb, polynactin complex, milbemectin, abamectin, benzoato de emamectin, spinosad, BT (*Bacillus thuringiensis*), azadilactin, rotenone, almidón hidroxipropilo, clorhidrato de levamisol, metam-sodium, tartrato de morantel, dazomet, triclamide, Bastoria o *Monacrosporium phymatopagum*, etc.

De manera similar, los herbicidas incluyen, por ejemplo, glifosato, sulfosato, glufosinato, bialaphos, butamifos, es-procarb, prosulfocarb, benthocarb, pyributicarb, asulam, linuron, daimuron, isouron, bensulfuron-methyl, cyclosulfamuron, cinosulfuron, pyrazosulfuron-ethyl, azimusulfuron, imazosulfuron, thenylchlor, alachlor, pretichlor, clomeprop, etanbenzanid, mefenacet, pendimethalin, bifenox, aciflufen, lactofen, cyhalofop-butyl, loxynil, bromobutide, alloxidim, sethoxydim, napropamide, indanofan, pirazolato, benzofenap, pyraflifen-ethyl, imzapyr, sulfentrazone, cafenstrole, pentoxazone, oxadiazon, paraquat, diquat, pyrimobac, simazine, atrazine, dimethametryn, triaziflam, benfuserato, fluthiacet-methyl, quizalofop-ethyl, bentazona o peróxido de calcio, etc.

Los descritos a continuación, son ejemplos para ilustrar la presente invención más particularmente, pero la presente invención no debe entenderse que está destinada a limitarse a ellos, salvo que se extiendan más allá del objeto de la presente invención.

Ejemplo 1:

Producción de N-(4'-trifluorometoxibifenil-2-il)-3-metilpiracino-2-carboxamida (Compuesto No. 2-14)

Se agregó una solución de carbonato sódico (0,31 g; 1,5 mmol) en 5 ml de agua a una solución de N-(2-bromofenil)-3-metilpiracino-2-carboxamida (0,4 g; 1,4 mol) y ácido 4-trifluorometoxifenil bórico (0,31 g; 1,5 mmol) en 10 ml de tolueno, seguido de la adición de tetraquis(trifenilfosfino)paladio(0) (0,1 g; 0,09 mmol). Después de calentamiento bajo condiciones de reflujo durante 6 horas bajo atmósfera de argón, la mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y se mezcló con acetato de etilo y agua, seguido de separación. La capa orgánica se lavó con agua y salmuera saturada sucesivamente, se secó sobre sulfato sódico anhidro, y se concentró en vacío. El residuo se purificó mediante cromatografía de columna de gel de sílice, proporcionando el compuesto sujeto (0,35 g).

Rendimiento: 68%.

Propiedades físicas típicas: punto de fusión de 120 a 121°C.

Ejemplo 2:

Producción de N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-trifluorometilpiracino-2-carboxamida (Compuesto No. 3-6)

Se agregó trietilamina (0,32 g; 1,5 mmol) a una solución de 4'-clorobifenil-2-ilamina (0,3 g; 1,5 mmol) y cloruro del ácido 3-trifluorometilpiracino-2-carboxílico (0,32 g; 1,5 mmol) en THF (10 ml), seguido de agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. Se agregó agua a la mezcla de reacción para suspender la reacción, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa de acetato de etilo se secó sobre sulfato sódico anhidro y se concentró en vacío, y el residuo se purificó mediante cromatografía de columna de gel de sílice, proporcionando el compuesto sujeto (0,47 g).

Rendimiento: 85%.

Propiedades físicas típicas: punto de fusión de 144 a 145°C.

Lo descrito a continuación, son las formulaciones agroquímicas representativas y ejemplos de ensayos, pero la presente invención se entiende que no está limitada a los mismos.

El término "parte" agregado indica "parte en masa".

Formulación agroquímica del Ejemplo 1:

	El Compuesto de la presente invención:	10 partes
50	Xileno:	70 partes
	N-metilpirrolidona:	10 partes

Una mezcla de polioxietileno nonilfenil éter
y alquibencenosulfonato cálcico 10 partes

Los ingredientes anteriormente descritos se mezclaron uniformemente y se disolvieron para obtener un concentrado emulsificable.

5 Formulación agroquímica del Ejemplo 2:

El Compuesto de la presente invención: 3 partes
Polvo de arcilla: 82 partes
Polvo de tierra de diatomeas: 15 partes

10 Los ingredientes anteriormente descritos se mezclaron uniformemente y se trituraron finamente para obtener un polvo.

Formulación agroquímica del Ejemplo 3:

El Compuesto de la presente invención: 5 partes
Una mezcla en polvo de bentonita y arcilla: 90 partes
Ligninosulfonato cálcico: 5 partes

15 Los ingredientes anteriormente descritos se mezclaron uniformemente y después de adición de agua, la mezcla se amasó, se granuló y se secó para obtener un gránulo.

Formulación agroquímica del Ejemplo 4:

El Compuesto de la presente invención: 20 partes
Caolín y ácido silícico finamente
20 dispersado, sintético: 75 partes
Una mezcla de polioxietileno nonilfenil éter
y alquibencenosulfonato cálcico 5 partes

Los ingredientes anteriormente descritos se mezclaron uniformemente y se trituraron finamente para obtener un polvo humectable.

25 A continuación, se describen los ejemplos de ensayos para demostrar que los compuestos de la presente invención son útiles como un agente para el control de enfermedades de plantas. Se aprovecha la ocasión para indicar que, en estos ejemplos, los compuestos de la presente invención están expresados como el Compuesto Número listado en las Tablas 1 a 5, al tiempo que, tal como se muestra a continuación, se usaron tres compuestos como un compuesto de referencia para llevar a cabo la misma evaluación.

30 Compuesto de Referencia A: 3-metil-N-(2-metilindan-4-il)-piracino-2-carboxamida (el compuesto está expresado como Compuesto No. 13 descrito en la Gaceta Oficial del Documento JP-A Hei 2-175).

35 Compuesto de Referencia B: N-{3-isobutil-4-[1-metoxi-2,2,2-trifluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil}- 3-trifluorometilpiracino-2-carboxamida (el compuesto está expresado como Compuesto No. 1-14 descrito en el Folleto de la WO 05/115994). Compuesto de Referencia C: 2-cloro-N-(4'-clorobifenil-2-il)nicotinamida (el compuesto está expresado como Compuesto No. 3-16 descrito en la Gaceta Oficial de la Patente Japonesa No. 3202079).

Ejemplo de Ensayo 1:

Ensayo sobre el efecto de control contra la roña del manzano

40 Una plántula de un manzano (la variedad: Ohrin) desarrollada en un tiesto, se sometió a aplicación foliar con una emulsión diluida del concentrado emulsificable del compuesto de la presente invención, preparado de acuerdo con la Formulación Agroquímica del Ejemplo 1, cuya emulsión diluida se produjo diluyendo el concentrado con agua hasta el volumen determinado específicamente. Al día siguiente después de la aplicación, la plántula se inoculó mediante pulverización con una suspensión de esporas del hongo causal de la roña del manzano (*Ventura inequalis*) tal como se obtuvo mediante cultivo sobre el medio PSA (que consiste en 1000 ml de una solución obtenida mediante la decocción de 20 g de sacarosa, 15 g de agar y 200 g patata; ajustado a pH 7) y se mantuvo a 20°C bajo condiciones

húmedas. Catorce días después de la inoculación, se determinó el valor de protección (%) contra hongos de acuerdo con la ecuación (1), y el efecto de control se evaluó de acuerdo con el criterio de juicio descrito más adelante.

Ecuación (1):

$$\text{Valor de protección (\%)} = A/B \times 100 \quad (1)$$

5 en la que:

A; [(Relación del área de la superficie de la hoja manchada afectada en la sección no tratada con respecto al área total de la superficie de la hoja) - (Relación del área de la superficie de la hoja manchada afectada en la sección tratada con respecto al área total de la superficie de la hoja)]

10 B; (Relación del área de la superficie de la hoja manchada afectada en la sección no tratada con respecto al área total de la superficie de la hoja)

Criterios de juicio:

0: Menos del 9% en el valor de protección

1: 10 a 19% en el valor de protección

2: 20 a 29% en el valor de protección

15 3: 30 a 39% en el valor de protección

4: 40 a 49% en el valor de protección

5: 50 a 59% en el valor de protección

6: 60 a 69% en el valor de protección

7: 70 a 79% en el valor de protección

20 8: 80 a 89% en el valor de protección

9: 90 a 99% en el valor de protección

10: 100% en el valor de protección

25 Los resultados del ensayo anteriormente descrito demuestran que los compuestos de la presente invención pueden producir un excelente efecto de control a la concentración de ingrediente activo de 50 ppm y a la proporción de aplicación de 50 ml; entre otros, los Compuestos Nos. 1-5, 1-7, 1-14, 1-15, 1-18, 1-21, 1-22, 1-28, 1-31, 1-34, 1-36, 1-37, 1-39, 1-44, 1-47, 2-6, 2-11, 2-36, 2-37, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-14, 3-15, 3-18, 3-21, 3-22, 3-23, 3-24, 3-25, 3-26, 3-27, 3-28, 3-33, 3-34, 3-36, 3-37, 3-39, 3-40, 3-43, 3-44, 3-47, 3-51, 3-52, 3-61, 3-63, 3-64, 3-65, 3-69, 3-70, 3-71, 3-74, 3-75, 3-76 y 3-77 mostraron el efecto potenciado tan alto como 10, evaluado de acuerdo con los criterios de juicio, en tanto que los Compuestos de Control A y B, que mostraron un no efecto tan despreciable como 0 evaluado de acuerdo con los criterios de juicio, fueron incapaces de desarrollar algún efecto de control; y que de los compuestos de la presente invención, los Compuestos Nos. 1-21, 1-47, 3-3, 3-4, 3-6, 3-11, 3-14, 3-18, 3-21, 3-22, 3-23, 3-24, 3-25, 3-26, 3-27, 3-28, 3-33, 3-34, 3-36, 3-37, 3-39, 3-44, 3-47, 3-61, 3-63, 3-64, 3-65, 3-69, 3-70, 3-71, 3-74, 3-75, 3-76 y 3-77 a la concentración de ingrediente activo de 10 ppm y la proporción de aplicación química de 50 ml, mostraron el efecto potenciado tan alto como 10, evaluado de acuerdo con los criterios de juicio.

35 **Ejemplo de Ensayo 2:**

Ensayo sobre el efecto de control contra la botritis de la planta del pepino

Una planta de pepino de una hoja de edad (cultivar: *Soyou*) desarrollada como una plántula en un tiesto de 9 cm de diámetro, se sometió a aplicación foliar con una emulsión diluida del concentrado emulsificable del compuesto de la presente invención, preparado de acuerdo con la Formulación Agroquímica del Ejemplo 1, cuya emulsión diluida se produjo diluyendo el concentrado con agua hasta el volumen determinado específicamente. Al día siguiente después de la aplicación, el cotiledón de la planta de pepino se inoculó mediante un disco de papel de 6 mm de diámetro impregnado con una suspensión de esporas del hongo causal del botritis de la planta del pepino (*Botrytis cinerea*) tal como se obtuvo mediante cultivo sobre el medio PSA y se mantuvo a 20°C bajo condiciones húmedas. Siete días después de la inoculación, se determinó el valor de protección (%) contra hongos de acuerdo con la ecuación (2), y el efecto de control se evaluó de acuerdo con el criterio de juicio tal como se ha establecido en el Ejemplo de Ensayo 1.

Ecuación (2):

$$\text{Valor de protección (\%)} = X/Y \times 100 \quad (2)$$

en la que:

X; [(Diámetro de la mancha afectada en la sección no tratada) - (Diámetro de la mancha afectada en la sección tratada)]

B; (Diámetro de la mancha afectada en la sección no tratada)

Los resultados del ensayo anteriormente descrito demuestran que los compuestos de la presente invención produjeron el excelente efecto de control a la concentración de ingrediente activo de 200 ppm y a la proporción de aplicación de 50 ml; y que los Compuestos Nos. 1-3, 1-5, 1-6, 1-8, 1-11, 1-14, 1-15, 1-17, 1-18, 1-21, 1-22, 1-28, 1-31, 1-33, 1-36, 1-38, 1-39, 1-40, 1-47, 2-6, 2-21, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-11, 3-14, 3-15, 3-18, 3-21, 3-22, 3-23, 3-24, 3-25, 26, 3-27, 3-28, 3-31, 3-33, 3-34, 3-36, 3-37, 3-39, 3-40, 3-41, 3-42, 3-43, 3-51, 3-52, 3-61, 3-63, 3-64, 3-65, 3-69, 3-70, 3-71, 3-74, 3-75, 3-76, 3-77 y 4-6, entre otros, mostraron efecto potenciado tal alto como 10, evaluado de acuerdo con los criterios de juicio, en tanto que los Compuestos de Control A y B, que mostraron un no efecto tan despreciable como 0 evaluado de acuerdo con los criterios de juicio, fueron incapaces de desarrollar algún efecto de control.

Ejemplo de Ensayo 3:

Ensayo sobre el efecto de control contra el oidio pulverulento de la planta de cebada

Una planta de cebada de una hoja de edad (el cultivar: *Kantch No. 6*) desarrollada como una plántula en un tiesto de 6 cm de diámetro, se sometió a aplicación foliar con una emulsión diluida del concentrado emulsificable del compuesto de la presente invención, preparado de acuerdo con la Formulación Agroquímica del Ejemplo 1, cuya emulsión diluida se produjo diluyendo el concentrado con agua hasta el volumen determinado específicamente. Al día siguiente después de la aplicación, la planta de cebada se inoculó mediante rociado con esporas tal como se obtuvieron a partir de plantas de cebada afectadas con el hongo causal del oidio pulverulento (*Blumeria graminis f. sp. hordei*) y se mantuvo a 20°C bajo condiciones húmedas. Siete días después de la inoculación, se evaluó el efecto de control de acuerdo con el criterio de juicio tal como se ha establecido en el Ejemplo de Ensayo 1.

Los resultados del ensayo anteriormente descrito revelan que los compuestos de la presente invención produjeron el excelente efecto de control a la concentración de ingrediente activo de 200 ppm y a la proporción de aplicación de 50 ml; que los Compuestos Nos. 1-4, 1-5, 1-6, 1-11, 1-14, 1-21, 1-22, 1-31, 1-33, 1-36, 1-37, 1-38, 1-39, 1-47, 2-12, 2-14, 2-21, 2-22, 2-36, 2-38, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-10, 3-11, 3-14, 3-15, 3-18, 3-21, 3-22, 3-23, 3-24, 3-25, 3-26, 3-27, 3-28, 3-29, 3-31, 3-33, 3-34, 3-36, 3-37, 3-38, 3-39, 3-40, 3-41, 3-42, 3-43, 3-47, 3-51, 3-52, 3-61, 3-63, 3-64, 3-65, 3-69, 3-70, 3-71, 3-74, 3-75, 3-76, 3-77, 4-6, 4-21 y 4-22, entre otros, mostraron el efecto potenciado tal alto como 10, evaluado de acuerdo con los criterios de juicio, en tanto que los Compuestos de Control A y B, que mostraron una no actividad tan despreciable como 0 evaluada de acuerdo con los criterios de juicio, fueron incapaces de producir algún efecto de control y el Compuesto de Control C provocó el efecto menguado tan bajo como 4, evaluado de acuerdo con los criterios de juicio, y que de los compuestos de la presente invención, cuando se aplicaron a la concentración de ingrediente activo de 50 ppm y a la proporción de aplicación química de 50 ml, los Compuestos Nos. 1-23, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-10, 3-11, 3-14, 3-18, 3-21, 3-22, 3-23, 3-24, 3-25, 3-26, 3-27, 3-28, 3-29, 3-31, 3-33, 3-34, 3-36, 3-37, 3-39, 3-40, 3-41, 3-42, 3-43, 3-47, 3-61, 3-63, 3-64, 3-65, 3-69, 3-70, 3-71, 3-74, 3-75, 3-76, 3-77, 4-6, 4-21 y 4-22, entre otros, mostraron el efecto potenciado tal alto como 10, evaluado de acuerdo con los criterios de juicio, en tanto que el Compuesto de Control C, que mostró un no efecto tan despreciable como 0 evaluado de acuerdo con los criterios de juicio, fue incapaz de producir algún efecto de control.

Ejemplo de Ensayo 4:

Ensayo sobre el efecto de control contra la roya de la hoja parda de la planta de trigo

Una planta de trigo de una hoja de edad (el cultivar: *Hokushin*) desarrollada como una plántula en un tiesto de 6 cm de diámetro, se sometió a aplicación foliar con una emulsión diluida del concentrado emulsificable del compuesto de la presente invención, preparado de acuerdo con la Formulación Agroquímica del Ejemplo 1, cuya emulsión diluida se produjo diluyendo el concentrado con agua hasta el volumen determinado específicamente. Al día siguiente después de la aplicación, la planta de trigo se inoculó mediante pulverización de una suspensión de esporas tal como se obtuvieron a partir de plantas de trigo afectadas con el hongo causal de la roya de la hoja parda (*Puccinia recondita*) y se mantuvo a 20°C bajo condiciones húmedas. Siete días después de la inoculación, se evaluó el efecto de control de acuerdo con el criterio de juicio tal como se ha establecido en el Ejemplo de Ensayo 1.

Los resultados del ensayo anteriormente descrito demuestran que los compuestos de la presente invención produjeron el excelente efecto de control a la concentración de ingrediente activo de 200 ppm y a la proporción de aplicación de 50 ml; y que los Compuestos Nos. 1-4, 1-5, 1-14, 1-15, 1-37, 1-38, 1-39, 1-44, 2-14, 2-21, 2-22, 2-36, 2-38, 3-3, 3-4, 3-5, 3-6, 3-7, 3-8, 3-10, 3-11, 3-14, 3-15, 3-18, 3-21, 3-22, 3-23, 3-24, 3-25, 3-26, 3-27, 3-28, 3-29, 3-31, 3-

33, 3-34, 3-35, 3-36, 3-37, 3-38, 3-39, 3-40, 3-41, 3-42, 3-43, 3-44, 3-47, 3-51, 3-52, 3-61, 3-63, 3-64, 3-65, 3-69, 3-70, 3-71, 3-74, 3-75, 3-76, 3-77, 4-6, 4-21 y 4-22, entre otros, mostraron el efecto potenciado tan alto como 10, evaluado de acuerdo con los criterios de juicio, en tanto que el Compuesto de Control B, que mostró un no efecto tan despreciable como 0 evaluado de acuerdo con los criterios de juicio, fue incapaz de desarrollar algún efecto de control y que los Compuestos de Control A y C, que mostraron ambos el efecto tan bajo como 6, evaluado de acuerdo con los criterios de juicio, y produjeron el efecto de control deteriorado; y que de los compuestos de la presente invención, cuando se aplicaron a la concentración de ingrediente activo de 50 ppm y a la proporción de aplicación química de 50 ml, los Compuestos Nos. 1-23, 3-3, 3-4, 3-6, 3-11, 3-18, 3-21, 3-22, 3-23, 3-24, 3-25, 3-26, 3-27, 3-28, 3-29, 3-31, 3-33, 3-34, 3-35, 3-37, 3-38, 3-40, 3-41, 3-42, 3-43, 3-47, 3-61, 3-63, 3-64, 3-65, 3-69, 3-70, 3-71, 3-74, 3-75, 3-76, 3-77, 4-6, 4-21 y 4-22, entre otros, mostraron el efecto potenciado tan alto como 10, evaluado de acuerdo con los criterios de juicio, en tanto que los Compuestos de Control A y C, que mostraron un no efecto tan despreciable como 0 evaluado de acuerdo con los criterios de juicio, fueron incapaces de mostrar algún efecto de control.

Aplicabilidad Industrial

Los compuestos de la presente invención pueden causar cargas reducidas de efectos nocivos, perjudiciales, al medio ambiente de la tierra, al tiempo que muestran un espectro de control ampliado contra las enfermedades de las plantas para usos agrícolas y hortícolas a proporciones de aplicación química menores y, consecuentemente, encuentran aplicación útil como un agente para el control de enfermedades de las plantas con el efecto de control excelente.

6. Un procedimiento para el control de una enfermedad de las plantas, **caracterizado porque** dicho procedimiento comprende el tratamiento de una planta o un suelo objetivo con una cantidad eficaz del derivado de piracinocarboxamida o sus sales de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4.

- 5 7. El derivado de piracinocarboxamida o sus sales de acuerdo con la reivindicación 1, en el que X es un grupo trifluorometilo; Y es un átomo de hidrógeno; R es un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo(C₁-C₄) el cual puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alqueno(C₂-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquino(C₂-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alcoxi(C₁-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alqueno(C₂-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquinox(C₂-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquiltio(C₁-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, un grupo alquilsulfnilo(C₁-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, o un grupo alquilsulfonilo(C₁-C₄) el cual que puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno, o cuando n no es menor de 2, R puede ser el mismo o diferente y los dos Rs adyacentes se toman conjuntamente para representar un grupo alquilenodiox(C₁-C₃) el cual puede estar sustituido con un átomo(s) de halógeno.
- 10