(19) OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

(11) Número de publicación: **2 410 879**

(51) Int. Cl.:

| | |
|---|---|
| ***C07D 207/34*** | (2006.01) |
| ***C07D 333/28*** | (2006.01) |
| ***C07D 231/12*** | (2006.01) |
| ***C07D 231/10*** | (2006.01) |
| ***C07D 277/20*** | (2006.01) |
| ***C07D 333/38*** | (2006.01) |
| ***C07D 307/54*** | (2006.01) |
| ***C07D 307/56*** | (2006.01) |
| ***A01N 43/00*** | (2006.01) |

(12) TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA T3

(96) Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **04.10.2006** **E 06806950 (9)**

(97) Fecha y número de publicación de la concesión europea: **03.04.2013** **EP 1937637**

(54) Título: **Nuevos derivados de N-alquil-heterociclilcarboxamida**

(30) Prioridad:

**05.10.2005 EP 05356179**

(45) Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
**03.07.2013**

(73) Titular/es:

**BAYER CROPSCIENCE AG (100.0%)**
**ALFRED-NOBEL-STRASSE 50**
**40789 MONHEIM, DE**

(72) Inventor/es:

**MANSFIELD, DARREN;**
**COQUERON, PIERRE-YVES;**
**RIECK, HEIKO;**
**DESBORDES, PHILIPPE;**
**VILLIER, ALAIN;**
**GROSJEAN-COURNOYER, MARIE-CLAIRE y**
**GENIX, PIERRE**

(74) Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**ES 2 410 879 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

Nuevos derivados de N-alquil-heterociclilcarboxamida

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

La solicitud de patente internacional WO 96/38419 da a conocer derivados de pirazolcarboxamida cuya fórmula general abarca los compuestos de acuerdo con la presente invención y su uso como fungicidas. Sin embargo, en esa solicitud de patente no se consideran compuestos de acuerdo con la presenta invención.

La solicitud de patente internacional WO 96/29871 da a conocer derivados de tiadiazolcarboxamida cuya fórmula general abarca los compuestos de acuerdo con la presente invención y su uso como fungicidas, Sin embargo, en esa solicitud de patente no se consideran compuestos de acuerdo con la presenta invención.

La solicitud de patente británica GB 1387652 da a conocer derivados de furancarboxamida cuya fórmula general abarca los compuestos de acuerdo con la presente invención y su uso como fungicidas, Sin embargo, en esa solicitud de patente no se consideran compuestos de acuerdo con la presenta invención.

La solicitud de patente japonesa JP 9176124 da a conocer derivados de pirazolincarboxamida cuya fórmula general abarca los compuestos de acuerdo con la presente invención y su uso como fungicidas, Sin embargo, en esa solicitud de patente no se consideran compuestos de acuerdo con la presenta invención.

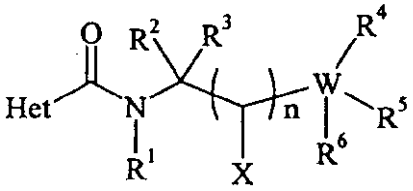
La solicitud de patente US U.S. 5.240.951 da a conocer derivados de isotiazolcarboxamida cuya fórmula general abarca los compuestos de acuerdo con la presente invención y su uso como fungicidas, Sin embargo, en esa solicitud de patente no se consideran compuestos de acuerdo con la presenta invención.

Siempre es de gran interés en el campo de los compuestos agroquímicos usar compuestos plaguicidas más activos que los ya conocidos por los expertos en la técnica con los que se pueden usar menos cantidad de compuesto mientras que se consigue una eficacia equivalente.

Además, la provisión de nuevos compuestos plaguicidas de una mayor eficacia reduce el riesgo de que aparezcan nuevas cepas de los hongos a tratar.

Los inventores han encontrado ahora una nueva familia de compuestos que presentan una actividad fungicida intensificada respecto a la familia general conocida de tales compuestos.

Consecuentemente, la presente invención se refiere a un derivado de N-alquilheterociclilcarboxamida de fórmula general (I)




(I)

en la que :

- Het representa 4-pirazol, estando Het unido por un átomo de carbono y estando sustituido como mínimo en la posición orto;

- n es 2, 3 o 4;

- $R^1$ se selecciona de manera que sea un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo $C_{1-6}$ o un grupo cicloalquilo $C_{3-7}$;

- $R^2$ se selecciona para que sea un grupo alquilo $C_{1-6}$;

- $R^3$ se selecciona de manera que sea un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo $C_{1-6}$;

- cada X se selecciona, independientemente de los otros, de manera que sea un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo $C_{1-6}$;

- W representa un átomo de carbono o un átomo de silicio;

- $R^4$, $R^5$ y $R^6$ se seleccionan independientemente entre sí, de manera que sean un átomo de hidrógeno, un átomo

de halógeno o un grupo alquilo $C_{1-6}$, siendo como mínimo dos de los sustituyentes $R^4$, $R^5$ y $R^6$ diferentes de un átomo de hidrógeno;

o dos de los sustituyentes $R^4$, $R^5$ y $R^6$ pueden formar juntos un ciclo no aromático de 3, 4, 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo alquilo $C_{1-6}$;

así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metalóidicos e isómeros ópticamente activos con la excepción de:

- N-(1,5-dimetilhexil)-1-[4-[[(1,5-dimetilhexil)amino]sulfonil]fenil]-4-[[4-[(1,5-dimetilhexil)amino]sulfonil]fenil]azo]-5-hidroxi-1H-pirazol-3-carboxamida;

- 5-(4-clorofenil)-1-(2,4-diclorofenil)-N-(1,4-dimetilpentil)-4-metil-1H-pirazol-3-carboxamida y

- 5-(4-clorofenil)-1-(2,4-diclorofenil)-N-(1,5-dimetilhexil)-4-metil-1H-pirazol-3-carboxamida.

En el contexto de la presente invención:

- halógeno significa flúor, bromo, cloro o yodo;

- carboxi significa –C(=O)OH; carbonilo significa –C(=O), carbamoilo significa –C(=O)$NH_2$; N-hidroxicarbamoílo significa –C(=O)NHOH;

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

En el contexto de la presente invención se ha de entender también que, en caso de radicales amino disustituido y carbamoílo disustitudo, los dos sustituyentes pueden formar junto con el átomo de hidrógeno que los soporta un anillo heterocíclico saturado que contiene de 3 a 7 átomos.

Cualquiera de los compuestos de la presente invención puede existir en una o varias formas ópticas o quirales dependiendo del número de centros asimétricos del compuesto. La invención se refiere así igualmente a todos los isómeros y a sus mezclas racémicas o escalémicas (el término “escalémico” denota una mezcla de enantiómeros en diferentes proporciones) y a las mezclas de todos los posibles estereoisómeros, en todas proporciones. Los diastereoisómeros y/o los isómeros ópticos se pueden separar de acuerdo con los procedimientos que son conocidos per se por los expertos en la técnica de cualificación ordinaria.

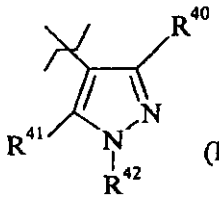
Cualquiera de los compuestos de la presente invención puede existir en una o varias formas de isómeros geométricos dependiendo del número de dobles enlaces en el compuesto. La invención se refiere así igualmente a todos los isómeros geométricos y a todas las mezclas posibles, en todas proporciones. Los isómeros geométricos se pueden separar de acuerdo con procedimientos generales, que son conocidos per se por los expertos en la técnica de cualificación ordinaria.

De acuerdo con la presente invención, “Het” del compuesto de fórmula general (I) es:

- en cuanto a los sustituyentes del resto “Het”, cada sustituyente se selecciona, independientemente de los otros, de manera que sea un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo ciano, un grupo alquilamino $C_{1-4}$, un grupo di-(alquil $C_{1-4}$)amino, un alquilo $C_{1-4}$, un halogenoalquilo $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un grupo nitro, un alcoxi $C_{1-4}$, un alquiltio $C_{1-4}$, un alquilsulfonilo $C_{1-4}$, un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo $C_{1-4}$, o un piridilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo $C_{1-4}$, un di(alquil $C_{1-4}$)aminosulfonilo, un grupo alquilcarbonilo $C_{1-4}$, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo $C_{1-4}$, o benzoílo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo $C_{1-4}$, un grupo carbamoílo o un alquilcarbonilamino $C_{1-8}$, un alquenilo $C_{2-6}$, un cicloalquilo $C_{3-6}$, un alquiltio $C_{1-4}$-alquilo $C_{1-4}$, un halogenoalquiltio $C_{1-4}$-alquilo $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi $C_{1-4}$-alquilo $C_{1-4}$ o un halogenoalcoxi $C_{1-4}$-alquilo $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

- en cuanto al sustituyente en la posición 2 del resto “Het”, el sustituyente en posición orto del resto “Het” se selecciona de manera que sea un átomo de halógeno, un alquilo $C_{1-4}$, un halogenoalquilo $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o un alquiloxi $C_{1-4}$:

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



(Het-13)

en la que

- $R^{40}$ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo $C_{1-4}$, un halogenoalquilo $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo $C_{3-6}$, un alcoxi $C_{1-4}$, un halogenoalcoxi $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiltio $C_{1-4}$, un halogenoalquiltio $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un aminocarbonilo o un aminocarbonil alquilo $C_{1-4}$;

- $R^{41}$ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo $C_{1-4}$, un alcoxi $C_{1-4}$, un halogenoalcoxi $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o un alquiltio $C_{1-4}$; y

- $R^{42}$ puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo $C_{1-4}$, un halogenoalquilo $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo $C_{1-4}$, un alquenilo $C_{2-6}$, un cicloalquilo $C_{3-6}$, un alquiltio $C_{1-4}$-alquilo $C_{1-4}$, un halogenoalquiltio $C_{1-4}$ alquilo $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi-$C_{1-4}$-alquilo $C_{1-4}$, un halogenoalcoxi $C_{1-4}$-alquilo $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno, un alquilo $C_{1-4}$, un alcoxialquilo $C_{1-4}$ o un grupo nitro;

a condición de que $R^{40}$ y $R^{41}$no sean, ambos, un átomo de hidrógeno.

De acuerdo con la presente invención, el átomo de nitrógeno del resto carboxamida del compuesto de fórmula (I) está sustituido por $R^1$, siendo $R^1$ un átomo de hidrógeno o un cicloalquilo $C_{3-7}$. Preferiblemente, el cicloalquilo $C_{3-7}$ es ciclopropilo.

De acuerdo con la presente invención, el primer átomo de carbono de la cadena alquilo del compuesto de fórmula (I) está sustituido con $R^2$, siendo $R^2$ lo definido antes. Preferiblemente, la presente invención se refiere también a derivados de N-alquil-heterociclilcarboxamida de fórmula general (I) en los que $R^2$ se puede seleccionar que sea alquilo $C_{1-3}$. Más preferiblemente, $R^2$ es un grupo metilo.

De acuerdo con la presente invención, la cadena alquilo del compuesto de fórmula (I) comprende además n átomos de carbono, cada uno de los cuales está sustituido con $R^3$, siendo $R^3$ lo definido antes. Preferiblemente, la presente invención se refiere también a derivados de fórmula (I) en los que las diferentes características se pueden seleccionar solas o en combinación de manera que sean:

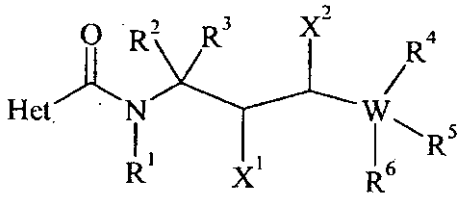
- en cuanto a n, n sea 3, y

- en cuanto a $R^3$, que $R^3$ sea un grupo metilo.

De acuerdo con la presente invención, el último átomo de carbono de la cadena alquilo del compuesto de fórmula (I) está sustituido con $R^4$, $R^5$ y $R^6$, siendo $R^4$, $R^5$ y $R^6$ lo definido antes. Preferiblemente, la presente invención se refiere también a derivados de N-alquil-heterociclilcarboxamida de fórmula general (I) en los que $R^4$, $R^5$ y $R^6$ se pueden seleccionar independientemente entre sí, de forma que sean un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

De acuerdo con la presente invención, la cadena alquilo del compuesto de fórmula (I) contiene de 2 a 4 átomos de carbono, cada uno de los cuales está sustituido con un sustituyente X que puede ser el mismo o diferente. Preferiblemente, la presente invención se refiere a un derivado de N-alquil-heterociclilcarboxamida de fórmula general (I) en el que X se selecciona de manera que sea un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

Preferiblemente, la presente invención se refiere también a derivados de N-alquil-heterociclilcarboxamida de fórmula general (I-a)



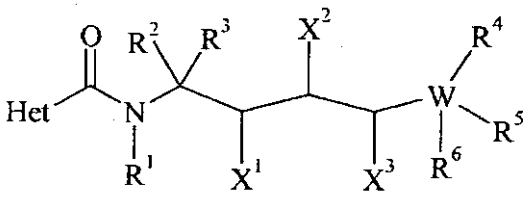
(I-a)

en la que

- Het, $R^1$, $R^2$, $R^3$, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son lo definido antes, y

- $X^1$ y $X^2$ se seleccionan, independientemente entre sí, de manera que sean un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

Preferiblemente, la presente invención se refiere también a derivados de N-alquil-heterociclilcarboxamida de fórmula general (I-b)



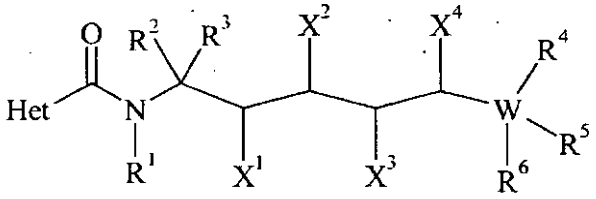
(I-b)

en la que

- Het, $R^1$, $R^2$, $R^3$, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son lo definido antes, y

- $X^1$, $X^2$ y $X^3$ se seleccionan, independientemente entre sí, de manera que sean un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

Preferiblemente, la presente invención se refiere también a derivados de N-alquil-heterociclilcarboxamida de fórmula general (I-c)



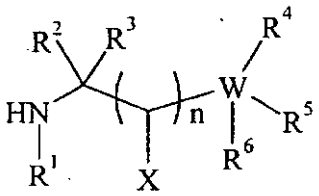
(I-c)

en la que

- Het, $R^1$, $R^2$, $R^3$, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son lo definido antes, y

- $X^1$, $X^2$, $X^3$ y $X^4$ se seleccionan, independientemente entre sí, de manera que sean un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

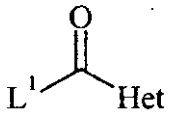
La presente invención también se refiere a un procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). Así, de acuerdo con otro aspecto de la presente invención, se proporciona un procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula general (I) definida antes, que comprende hacer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



(II)

en la que

$R^1$, $R^2$, $R^3$, X, n, W, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son los definido antes; con un derivado de ácido carboxílico de la fórmula general (III)

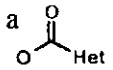


(III)

en la que

- Het es lo definido antes, y

- $L^1$ es un grupo saliente seleccionado entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, $-OR^{54}$, $-OCOR^{54}$, siendo $R^{54}$ un alquilo $C_{1-6}$, un haloalquilo $C_{1-6}$, un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula



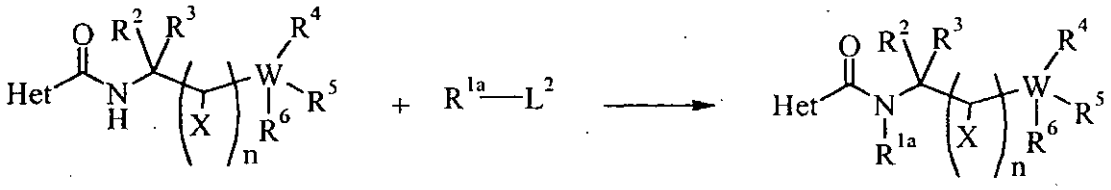
;

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

El procedimiento de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de un catalizador. Se puede seleccionar un catalizador adecuado tal como 4-dimetil-aminopiridina, 1-hidroxi-benzotiazol o dimetilformamida.

En el caso en que $L^1$ es un grupo hidroxi, el procedimiento de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de un agente de condensación. Se puede seleccionar un agente de condensación adecuado entre formadores de haluro de ácido tales como fosgeno, tribromuro fosforoso, tricloruro fosforoso, pentacloruro fosforoso, óxido de tricloruro fosforoso o cloruro de tionilo; formadores de anhídridos tales como cloroformiato de etilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de isobutilo o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas tales como N,N'-diciclohexilcarbodiinida (DCC) u otros agentes de condensación corrientes tales como pentóxido fosforoso, ácido polifosfórico, N,N'-carbonildiimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDC), trifenilfosfina/tetraclorometano, cloruro de 4-(4,6-dimetoxi[1.3.5]triazin-2-il)-4-metilmorfolinio hidratado o hexafluorofosfato de bromo-tripilrrodinofosfonio.

Cuando $R^1$ es un átomo de hidrógeno, el procedimiento antes mencionado para la preparación de compuestos de fórmula general (I), opcionalmente se puede completar con otra etapa de acuerdo con el siguiente esquema de reacción:



(Ib) (VIII) (Ia)

en el que:

- $R^2$, $R^3$, X, n, W, $R^4$, $R^5$, $R^6$ y Het son lo definido antes,

-$L^2$ es un grupo saliente seleccionado de manera que sea un átomo de halógeno, un 4-metil-fenilsulfoniloxi o un metilsulfoniloxi: y

- $R^{1a}$ es un grupo alquilo $C_{1-6}$ o cicloalquilo $C_{3-7}$,

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Ib) con un compuesto de fórmula general (VIII) para obtener un compuesto de fórmula general (Ia).

Dependiendo de la definición de $R^1$, $R^2$, $R^3$, X, n, $R^4$, $R^5$ y $R^6$, los derivados amina de fórmula general (II) se pueden preparar por diferentes procedimientos. Un ejemplo (A) de tal procedimiento puede ser, cuando:

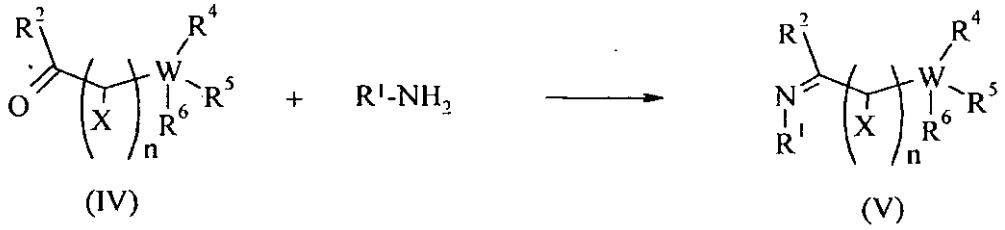
- $R^1$, $R^2$, X, n, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son lo definido antes , y

- $R^3$ es un átomo de hidrógeno,

el derivado amina de fórmula general (II) se puede preparar de acuerdo con un procedimiento que comprende:

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

Esquema A-1



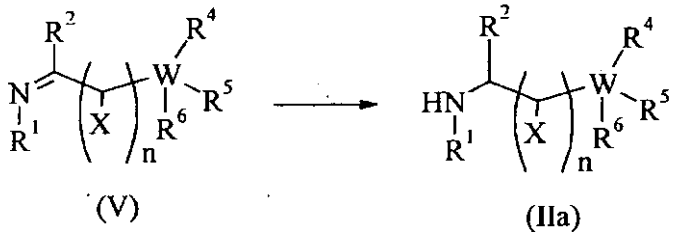

en la que

$R^1$, $R^2$, X, n, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son lo definido antes,

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (IV) con una amina de fórmula general $R^1$-$NH_2$ para que resulte un derivado imina de fórmula general (V);

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

Esquema A-2




en la que $R^1$, $R^2$, X, n, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son lo definido antes,

que comprende la reducción de un derivado imina de fórmula general (V) por hidrogenación o por un dador de hidruro, en el mismo o diferente recipiente, para que resulte un derivado amina de fórmula general (IIa) o una de sus sales.

Otro ejemplo (B) de tal procedimiento puede ser: cuando

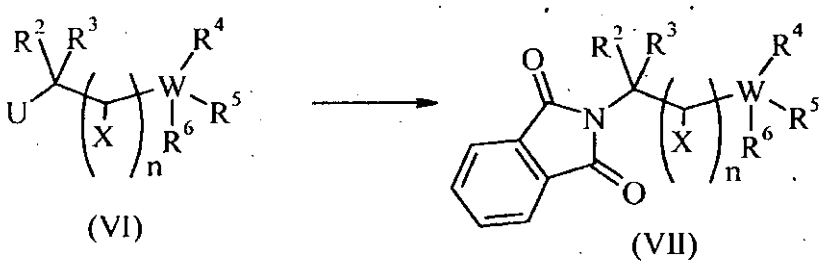
- $R^2$, $R^3$, X, n, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son lo definido antes, y

- $R^1$ es un átomo de hidrógeno

el derivado amina de fórmula general (II) se puede preparar de acuerdo con un procedimiento que comprende:

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

Esquema B-1



(VI) (VII)

en la que

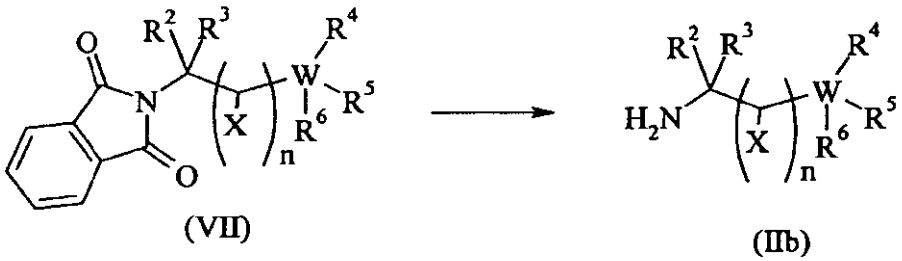
- $R^2$, $R^3$, X, n, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son lo definido antes, y

- U es un grupo saliente seleccionado de manera que sea un átomo de halógeno, un alquilsulfonato $C_{1-6}$ o un haloalquilsulfonato $C_{1-6}$;

que comprende la sustitución nucleófila de un compuesto de fórmula general (VI) por una sal de ftalimida produciendo un compuesto de fórmula general (VII):

- una segunda etapa de acuerdo con el esquema de reacción B-2

Esquema B-2



(VII) (IIb)

en la que $R^2$, $R^3$, X, n, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son lo definido antes,

que comprende la desprotección de un compuesto de fórmula general (VII) haciéndolo reaccionar con hidrato de hidrazina o una sal de hidrazina para que resulte un derivado amina de fórmula general (IIb) o una de sus sales.

La presente invención se refiere también a una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un material activo de fórmula general (I). Así, de acuerdo con la presente invención se proporciona una composición fungicida que comprende, como un ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula general (I), definida antes, en un soporte, vehículo o carga agrícolamente aceptable.

En la presente memoria, el término ·"soporte" significa un material orgánico o inorgánico, natural o sintético, con el que se combina el material activo haciendo que se aplique más fácilmente, notablemente a partes de la planta. El soporte generalmente es inerte y debe ser agrícolamente aceptable. El soporte puede ser sólido o líquido. Entre los ejemplos de soportes adecuados figuran arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, agua, alcoholes, en particular butanol, disolventes orgánicos, aceites minerales y vegetales y derivados de los mismos. También se pueden usar mezclas de tales soportes.

La composición puede comprender también componentes adicionales. En particular, la composición puede comprender además un tensioactivo. El tensioactivo puede ser un emulsivo, un agente dispersivo o un agente humectante de tipo iónico o no iónico, o una mezcla de tales tensioactivos. Se pueden mencionar, por ejemplo, de sales de poli(ácido acrílico), sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (en particular alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (en particular tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polietoxilados, ésteres de ácido graso de polioles y derivados de los compuestos anteriores que contienen funciones sulfato, sulfonato y fosfato. Generalmente es esencial la presencia de cómo mínimo un tensioactivo cuando el material activo y/o el soporte inerte son insolubles en agua y cuando el agente vector para la aplicación es agua. Preferiblemente, el contenido de tensioactivo puede estar comprendido entre 5% y 40% en peso de la composición.

Opcionalmente, también se pueden incluir componentes adicionales, por ejemplo coloides protectores, adhesivos, espesativos, agentes tixotrópicos, agentes de penetración, estabilizadores, agentes secuestrantes. Más en general,

los materiales activos se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido que se acopla a las técnicas de formulación usuales.

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

Las composiciones de acuerdo con la presente invención se pueden usar en diversas formas tales como con dispensador de aerosoles, suspensión en cápsula, concentrado de nebulización frío, polvo convertible en muy fino, concentrado emulsionable, emulsión de aceite en agua, emulsión de agua en aceite, gránulos encapsulados, gránulos finos, concentrado deslizable para tratamiento de semillas, gas (a presión), producto que genera un gas, gránulos, concentrado de nebulización en caliente, macrogránulos, microgránulos, polvo dispersable en aceite, concentrado deslizable mezclable con aceite, líquido miscible con aceite, pasta, cilindros para plantas, polvo para tratamiento de semilla en seco, semilla revestida con un plaguicida, concentrado soluble, polvo soluble, solución para tratamiento de semillas, concentrado en suspensión (concentrado deslizable), líquido de volumen ultrabajo (ulv), suspensión de volumen ultrabajo (ulv), gránulos o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento de suspensiones, gránulos o comprimidos solubles en agua, polvo soluble en agua para tratamiento de semillas y polvo que se moja.

Entre estas composiciones figuran no sólo las que están ya dispuestas para aplicar a la planta o la semilla a tratar mediante un dispositivo tal como un atomizador o pulverizador, sino también composiciones concentradas comerciales que deben ser diluidas antes de aplicarlas a la cosecha.

Los compuestos de la invención también se pueden mezclar con uno o varios insecticidas, fungicidas, batericidas, acaricidas atrayentes o feromonas u otros compuestos de actividad biológica. Las mezclas así obtenidas tienen un espectro de actividad ampliado. Las mezclas con otros fungicidas son particularmente ventajosas. Los ejemplos de compuestos funguicidas adecuados para mezclas se pueden seleccionar de la lista siguiente:

(1) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de ácido nucleico, como benalaxil, benalaxil-M, bupiramato, chiralaxil, clozilacón, dimetirimol, etirimol, furalaxil, himexazol, metalaxil-M, ofurace, oxadicil, ácido oxolínico;

(2) un compuesto capaz de inhibir la mitosis y división celular como benomil, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicuron, tiabenzodazol tiofanato de metilo, zoxamida;

(3) un compuesto capaz de inhibir la respiración, por ejemplo

inhibidor de CI, como diflumetorim;

inhibidor de respiración de CII como boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronil, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida;

inhibidor de respiración de CIII como azoxistrobin, ciazofamid, dimoxistrobin, enestrobin, famoxadona, fenanildona, fluoxastrobin, cresoxim-metilo, metominoestrabin, orisatrobin, piraclostrobin, picoxistrobin, trifloxistrobin;

(4) un compuesto capaz de actuar como desacoplador, como dinocap, fluazinam;

(5) un compuesto capaz de inhibir la producción de ATP, como acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de efentina, siltiofam;

(6) un compuesto capaz de inhibir AA y la síntesis de proteína como andoprim, blasticidin-S, ciprodinil, kasugamicina, hidrocloruro de kasugamicina hidratado, mepanipirim, pirametanil;

(7) un compuesto capaz de inhibir la transducción de señal como fenpiclonil, fludioxonil, quinoxifen;

(8) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de lípidos y membrana como clozolinato, ipodriona, procimidona, vindozolin, pirazofos, edinfos, iprobenfos (IBP), isoprotiolano, tolclofos-metilo, bifenilo, yodocarb, propamocarb, hidrocloruro de propamocarb.

(9) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de ergosterol, como fenhexamida, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, metconazol, miclobutanil, paclobutrazol, penconazol, propioconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon, triadimenol, tritioconazol, uniconazol, voriconazol, imazalil, sulfato de imazalil, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triflorina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol, aldimorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenprodin, espiroxamine, naftifina, pirilibuticarb, terbinafine;

(10) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de pared celular como bentiavalcarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas, polioxorim, validamicin A;

(11) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de melanina, como carbopramid, diclocimet, fenoxanil, ftalida, piroquilón, triciclazol;

(12) un compuesto capaz de inducir la defensa de un hospedador, como acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinil;

(13) un compuesto capaz de tener una acción multisitio, como captafol, captano, clorotalonil, preparados de cobre tales como hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, oxina-cobre y mezcla de Bordeauz, diclorofluanid, ditianon, dodina (base libre), ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, aslbesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, mancopper, mancozeb, maneb, metiram, metiram zinc, propineb, azufre y preparados de azufre incluidos polisulfuros de calcio, tiram, tolifluanid, zineb, ziram;

(14) un compuesto seleccionado de la lista siguiente: amibrondole, bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvone, quinometionato, cloropicrina, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanil, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofen, dicloran, dibenzoquat, difenzoquat metilsulfato, difenilamina, etaboxam, ferimzona, flunietover, flusulfamida, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, fluopicolida, fluoroimida, hexaclorobenceno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, octilinona, oxamocarb, oxifentina, pentaclorofenol y sales, 2-fenil-fenol y sales, ácido fosforoso y sus sales, piperalina, propanosina-sodio, proquionazid, pirrolnitrina, quintozeno, tecloftalam, tecnazeno, triazoxide, triclamida, zarilamida y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, 3,4,5-tricloro-2,6-piridinadicarbonitrilo, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxofenil)imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoximetilen)-benzoacetato de metilo, 4-cloro-alfa-propiniloxi-N-[2-[3-metoxi-4-(2-propiniloxi)fenil]etil]-bencenoacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxi-fenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]-triazolo[1.5-a]pirimidina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6(2,4,6-tritrifluorofenil)[1,2,4]triazolo-[1,5-a]pirimidin-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotin-amida, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzo-piranon-4-ona, N-{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino] [6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-fenilacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxi-benzamida, 2-[[[[1-[3(1-fluoro-2-feniletil)oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]-alfa-(metoxiimino)-N-metil-alfaE-benceno-acetamida, N-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 2-(2-{[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi}fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carbotioico.

La composición de acuerdo con la invención que comprende una mezcla de un compuesto de fórmula (I) con un compuesto bactericida puede ser también particularmente ventajosa. Se pueden seleccionar ejemplos de compuestos bactericidas adecuados para mezclar entre la siguiente lista: bronopol, diclorofen, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilinona, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomicina, tecloftalam, sulfato de cobre y otros preparados de cobre.

Las composiciones fungicidas de la presente invención se pueden usar para control curativo o preventivo de los hongos fitopatógenos de cultivos. Así, de acuerdo con otro aspecto de la presente invención, se proporciona un procedimiento para controlar curativa o preventivamente los hongos fitopatógenos de cultivos que se caracteriza porque una composición fungicida, según se ha definido aquí antes, se aplica a la siembra, la planta y/o la fruta de la planta, o al suelo en el que crece la planta o en el que se desea que crezca.

La composición usada frente a hongos patógenos de cosechas comprende una cantidad eficaz y no fitotóxica de un material activo de fórmula (I).

La expresión "cantidad eficaz y no fitotóxica" significa una cantidad de composición de acuerdo con la invención que es suficiente para controlar o destruir los hongos presentes o de probable aparición en los cultivos, y que no conlleva síntoma apreciable alguno de fitotoxicidad para los mencionados cultivod. Tal cantidad puede variar dentro de un amplio intervalo dependiendo del hongo a controlar, el tipo de cultivo, las condiciones climáticas y los compuestos incluidos en la composición fungicida de acuerdo con la invención.

Esta cantidad se puede determinar por ensayos de campo sistemáticos, de los que son capaces los expertos en la técnica.

El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la presente invención es útil para tratar material de propagación tal como tubérculos y rizomas, pero también semillas, plantas jóvenes, plantones y plantas o brotes de plantas. El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la presente invención también puede ser útil para tratar partes enterradas de la planta tales como troncos, tallos o pedúnculos, hojas, flores y frutos de la planta concernida.

Entre las plantas que se pueden proteger por el procedimiento de acuerdo con la presente invención se pueden mencionar algodón; lino; viña; o cosechas de vegetales tales como *Rosaceae sp.*(por ejemplo, fruta de semilla tal

como manzanas y peras, pero también albaricoques, almendras y melocotones), *Ribesioidae sp.*, *Juglandaceae sp.*, *Betulaceae sp.*, *Anacardiaceae sp.*, *Fagaceae sp.*, *Moraceae sp.*, *Olaceae sp.*, *Actidaceae sp.*, *Lauraceae sp.*, *Musaceae sp.*, (por ejemplo árboles plataneros y plantinas), *Rubiceae sp.*, *Theaceae sp.*, *Sterculiceae sp.*, *Rutaceae sp.*,(por ejemplo limones, naranjas y pomelo), *Solanaceae sp.*, (por ejemplo tomates), *Liliceae sp.*, *Asteraceae sp.* (por ejemplo lechugas), *Umbelliferae sp.*, *Cruciferae sp.*, *Chenopodiceae sp.*, *Cucurbitaceae sp.*, *Papilionaceae sp.*, (por ejemplo guisantes), *Rosaceae sp.* (por ejemplo fresas); cosechas grandes tales como *Gramínea sp.* (grama o cereales tales como trigo, arroz, cebada y triticale), *Asteraceae sp.* (por ejemplo, girasol), *Cruciferae sp.* (por ejemplo colza), *Fabacae sp*. (por ejemplo cacahuetes), *Papilionaceae sp.* (por ejemplo soja), *Solanaceae sp.* (por ejemplo patatas), *Chenopodiaceae sp.* (por ejemplo remolacha); cultivos horticolas y de bosque y homólogos genéticamente modificados de estos cultivos.

Entre las enfermedades de plantas o cultivos que se pueden controlar por el procedimiento de acuerdo con la presente invención se pueden mencionar:

Enfermedades de mohos pulvurulentos:

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

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

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

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

Enfermedades de royas tales como

enfermedades de Gynmosporangium causadas, por ejemplo, por *Gymnosporangium sabinae*,

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

enfermedades de Phakopsora causadas, por ejemplo, por *Phakopsora pachyrhizi* o *Phakopsora meibomiae*;

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

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

Enfermedades de Oomycete tales como.

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

enfermedades de Peronospora causadas, por ejemplo, por *Peronospora pisi* o *P. brassicae*;

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

enfermedades de Plasmopara causadas, por ejemplo, por *Plasmopara vitícola*;

enfermedades de Pseudoperonospora causadas, por ejemplo, por *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*;

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

Enfermedades de manchas de hojas y añublo de hoja tales como:

enfermedades de Alternaria causadas, por ejemplo, por *Alternaria solaris*;

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

enfermedades de Cladiosporum causadas, por ejemplo, por *Cladosporium cucumerium*;

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

enfermedades de Colletotrichuin causadas, por ejemplo, por *Colletotrichum lindemuthanium*;

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

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

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

enfermedades de Glososporium causadas, por ejemplo, por *Glososporium laeticolor*;

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

enfermedades de Guignardia causadas, por ejemplo, por *Guignardia bidwelli*;

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

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

enfermedadas de Mycosphaerella causadas, por ejemplo, por *Mycosphaerella graminicola; Mycosphaerella arachidicola; Mycosphaerella fijiensis*;

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

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

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

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

enfermedades de Septoria causadas, por ejemplo, por *Septoria apii* o *Septoria lycopercisi*;

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

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

Enfermedades de la raíz y el tallo tales como:

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

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

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

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

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

enfermedades de Thielaviopsis causadas, por ejemplo, por *Thielaviopsis basicola*; enfermedades de la espiga y el panículo tales como

enfermedades de Alternaria causadas, por ejemplo, por *Alternaria spp*;

enfermedades de Aspergilus, causadas, por ejemplo, por *Aspergilus flavus*;

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

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

enfermedades de Fusarium causadas, por ejemplo, por *Tusarium Culmorum*;

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

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

Enfermedades de suciedad y hediondez tales como:

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

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

enfermedades de Urocystis causadas, por ejemplo, por *Urocystis oculta*;

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

Enfermedades de la raíz de fruta y mohos tales como;

enfermedades de Aspergillus causadas, por ejemplo, por *Aspergillus flavius*;

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

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

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

enfermedades de Vericilium causadas, por ejemplo, por *Verticilium alboatrum*;

Enfermedades del deterioro del cultivo y partes del suelo, mohos, marchitamiento, podredumbre y muerte imprevista de la planta:

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

enfermedades de Phytophthora causadas, por ejemplo, por *Phytophthora catorum*;

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

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

enfermedades de Sclerotium causadas, por ejemplo, por *Sclerotium rolfsil*;

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

Enfermedades de tricomoniasis, deformaciones y degeneración tales como:

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

Enfermedades de royas tales como:

Enfermedades de Moilinia causadas, por ejemplo, por *Monilinia laxa*;

Enfermedades de ampollas en las hojas o rizos en las hojas tales como;

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

Enfermedades de deterioro de plantas arbóreas tales como:

enfermedad yesca causada, por ejemplo, por *Phaemoniella clamydospora*;

Enfermedades de flores y semillas tales como:

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

Enfermedades de tubérculos tales como:

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

La composición fungicida de acuerdo con la presente invención puede usarse también contra enfermedades de hongos que pueden crecer en la madera o dentro de ésta. El término “madera” significa todas las especies de madera y todos los tipos de trabajo de esta madera destinada a la construcción, por ejemplo, madera resistente, madera de alta densidad, láminas de madera y contrachapado. El procedimiento para tratar la madera de acuerdo con la presente invención puede consistir en ponerla en contacto con uno o varios compuestos de la presente invención, o una composición de acuerdo con la invención; esto incluye, por ejemplo, la aplicación directa, la pulverización, la inmersión, la inyección o cualquier otro medio adecuado.

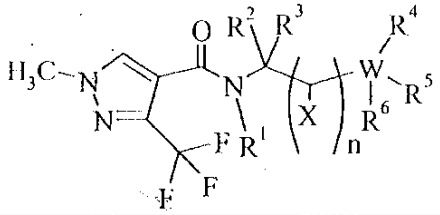
La dosis de material activo usualmente aplicada en el tratamiento de acuerdo con la presente invención generalmente es, ventajosamente, de entre 10 y 800 g/ha, preferiblemente entre 50 y 300 g/ha para aplicaciones de tratamiento foliar. La dosis de sustancia activa general y ventajosamente es de entre 2 y 200 g por 100 kg de cultivo, preferiblemente de entre 3 y 150 g por 100 kg de cultivo en el tratamiento de semilla. Se entiende claramente que las dosis indicadas se dan como ejemplos ilustrativos de la invención. Una persona experta en la técnica conocerá cómo adaptar las dosis de la memoria a la naturaleza de la cosecha a tratar.

La composición fungicida de acuerdo con la presente invención se puede usar también en el tratamiento de organismos modificados genéticamente con los compuestos de la invención o las composiciones agroquímicas de acuerdo con la invención. Son plantas genéticamente modificadas, plantas en cuyo genoma se ha integrado establemente un gen heterólogo que codifica una proteína de interés. La expresión “gen heterólogo que codifica una proteína de interés” significa esencialmente genes que confieren a la planta transformada nuevas propiedades agronómicas, o genes para mejorar la calidad agronómica de la planta transformada.

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

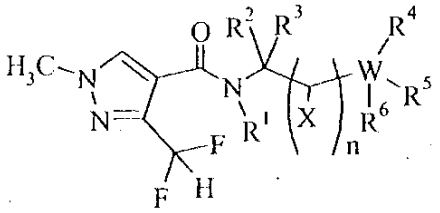
Se ilustran ahora los aspectos de la presente invención con referencia a las siguientes tablas de compuestos y ejemplos. Las siguientes Tablas A a V ilustran de manera no limitativa ejemplos de compuestos fungicidas de acuerdo con la presente invención. En los Ejemplos siguientes, M+1 (o M-1) significa el pico iónico molecular, más o menos 1 a.m.u. (unidades de masa atómica) respectivamente, observado en espectroscopia de masas.

Tabla 4



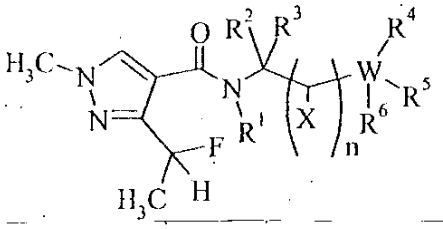
| Compuesto | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | n | $X^1$ | $X^2$ | $X^3$ | W | $R^4$ | $R^5$ | $R^6$ | [M+1] |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 4-1 | H | Me | H | 2 | H | H | - | C | H | Me | Me | 292 |
| 4-2 | H | Me | H | 3 | H | H | H | C | H | H | Me | 292 |
| 4-3 | H | Me | H | 3 | H | H | H | Si | Me | Me | Me | 336 |
| 4-4 | H | Me | H | 3 | H | Me | H | C | Me | Me | Me | 334 |
| 4-5 | H | Me | H | 3 | H | Me | H | Si | Me | Me | Me | 350 |
| 4-6 | H | Me | H | 3 | Me | Me | H | Si | Me | Me | Me | 364 |
| 4-7 | H | Me | Me | 3 | H | H | H | C | H | Me | Me | 320 |
| 4-8 | ciclopropilo | Me | H | 3 | H | Me | H | Si | Me | Me | Me | 390 |
| 4-9 | H | (R)-Me | H | 3 | H | (R)-Me | H | C | Me | Me | Me | 334 |
| 4-10 | H | (R)-Me | H | 3 | H | (S)-Me | H | C | Me | Me | Me | 334 |
| 4-11 | H | (S)-Me | H | 3 | H | (S)-Me | H | C | Me | Me | Me | 334 |
| 4-12 | H | (S)-Me | H | 3 | H | (R)-Me | H | C | Me | Me | Me | 334 |

Tabla 5



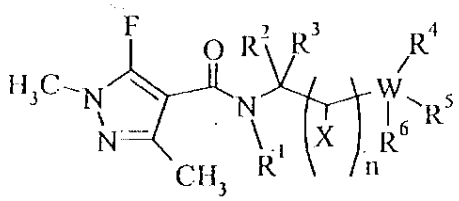
| Compuesto | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | n | $X^1$ | $X^2$ | $X^3$ | W | $R^4$ | $R^5$ | $R^6$ | [M+1] |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 5-1 | H | Me | H | 2 | H | H | - | C | H | Me | Me | 274 |
| 5-2 | H | Me | H | 3 | H | H | H | C | H | H | Me | 274 |
| 5-3 | H | Me | H | 3 | H | Me | H | C | Me | Me | Me | 316 |
| 5-4 | H | Me | H | 3 | H | Me | H | Si | Me | Me | Me | 332 |
| 5-5 | H | Me | H | 3 | Me | Me | H | Si | Me | Me | Me | 346 |
| 5-6 | H | Me | Me | 3 | H | H | H | C | H | Me | Me | 302 |
| 5-7 | ciclopropilo | Me | H | 3 | H | Me | H | Si | Me | Me | Me | 372 |

Tabla 6



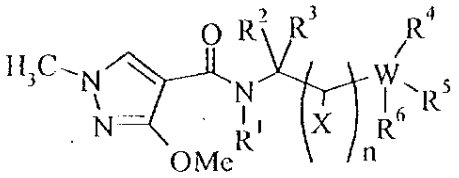
| Compuesto | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | n | $X^1$ | $X^2$ | $X^3$ | W | $R^4$ | $R^5$ | $R^6$ | [M+1] |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 6-1 | H | Me | H | 3 | Me | Me | H | Si | Me | Me | Me | 340 |

Tabla 7



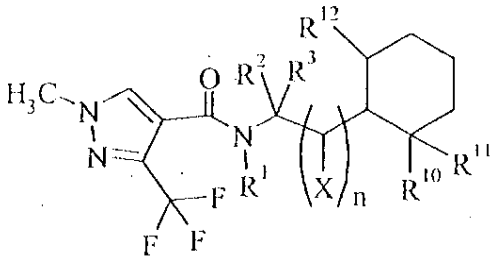
| Compuesto | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | n | $X^1$ | $X^2$ | $X^3$ | W | $R^4$ | $R^5$ | $R^6$ | [M+1] |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 7-1 | H | Me | H | 2 | H | H | - | C | H | Me | Me | 256 |
| 7-2 | H | Me | H | 3 | H | Me | H | C | Me | Me | Me | 298 |
| 7-3 | H | Me | H | 3 | H | Me | H | Si | Me | Me | Me | 314 |
| 7-4 | H | Me | H | 3 | Me | Me | H | Si | Me | Me | Me | 328 |
| 7-5 | H | Me | Me | 3 | H | H | H | C | H | Me | Me | 284 |
| 7-6 | ciclopropilo | Me | H | 3 | H | Me | H | Si | Me | Me | Me | 354 |

Tabla 8



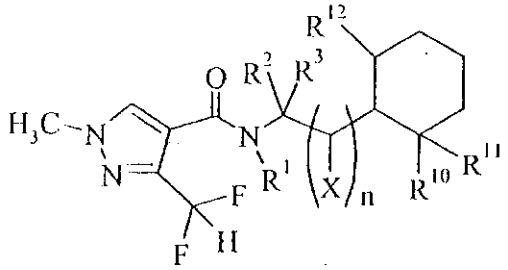
| Compuesto | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | n | $X^1$ | $X^2$ | $X^3$ | W | $R^4$ | $R^5$ | $R^6$ | [M+1] |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 8-1 | H | Me | H | 3 | H | Me | H | C | Me | Me | Me | 296 |
| 8-2 | H | Me | H | 3 | H | Me | H | Si | Me | Me | Me | 312 |
| 8-3 | H | Me | H | 3 | Me | Me | H | Si | Me | Me | Me | 326 |
| 8-4 | ciclopropilo | Me | H | 3 | H | Me | H | Si | Me | Me | Me | 352 |

Tabla 21



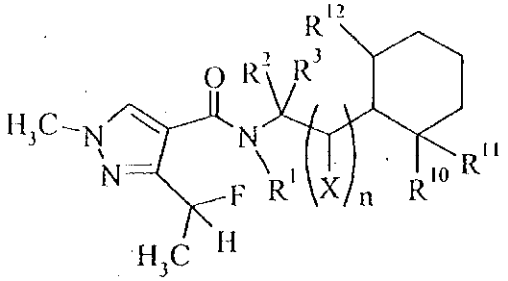
| Compuesto | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | n | $X^1$ | $X^2$ | $R^{10}$ | $R^{11}$ | $R^{12}$ | [M+1] |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 21-1 | H | Me | H | 1 | H | - | H | H | H | 318 |
| 21-2 | H | Me | H | 2 | H | H | H | H | H | 332 |
| 21-3 | H | Me | H | 2 | H | H | Me | Me | Me | 388 |

Tabla 22



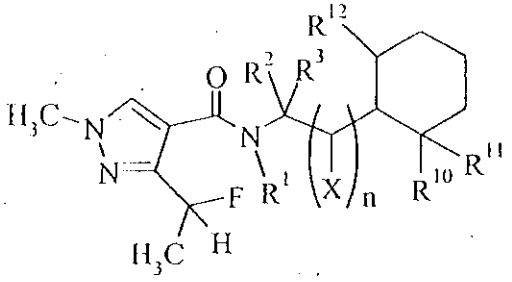
| Compuesto | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | n | $X^1$ | $X^2$ | $R^{10}$ | $R^{11}$ | $R^{12}$ | [M+1] |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 22-1 | H | Me | H | 1 | H | - | H | H | H | 300 |
| 22-2 | H | Me | H | 2 | H | H | H | H | H | 314 |
| 22-3 | H | Me | H | 2 | H | H | Me | Me | Me | 370 |

Tabla 23



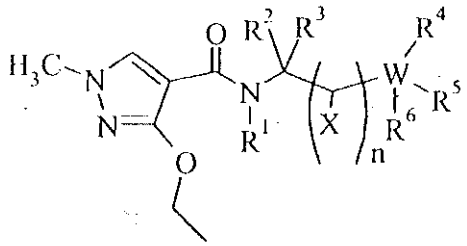
| Compuesto | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | n | $X^1$ | $X^2$ | $R^{10}$ | $R^{11}$ | $R^{12}$ | [M+1] |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 23-1 | H | Me | H | 1 | H | - | H | H | H | 296 |

Tabla 24



| Compuesto | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | n | $X^1$ | $X^2$ | $R^{10}$ | $R^{11}$ | $R^{12}$ | [M+1] |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 24-1 | H | Me | H | 1 | H | | H | H | H | 282 |
| 24-2 | H | Me | H | 2 | H | H | Me | Me | Me | 352 |

Tabla 34



| Compuesto | $R^1$ | $R^2$ | $R^3$ | n | $X^1$ | $X^2$ | $X^3$ | W | $R^4$ | $R^5$ | $R^6$ | [M+1] |
|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
| 34-1 | H | Me | H | 3 | Me | Me | H | Si | Me | Me | Me | 340 |
| 34-2 | H | Me | H | 3 | H | Me | H | Si | Me | Me | Me | 326 |

**Ejemplos de procedimientos para la preparación del compuesto de fórmula general (I)**

**Ejemplo 1**: Preparación de N-[1,3-dimetil-4-(trimetilsilil)butil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (Compuesto 7-3)

Preparación de 4-metil-5-(trimetilsilil)pentan-2-ona

Una solución de 8,00 g de pent-3-en-2-ona en 50 ml de dietil éter se vertió a gotas a una solución de 73,5 ml de cloro[(trimetilsilil)metil]magnesio (1,0 M en dietil éter) y 955 mg de CuBr a –5ºC bajo argón. La mezcla se agitó durante 1 hora a temperatura ambiente. Un desarrollo acuoso seguido de cromatografía en gel de sílice dio 5,20 g (43%) de un aceite incoloro.
[M+1]=173.

Preparación de hidrocloruro de 4-metil-5-(trimetilsilil)pentan-2-amina

Se agitó durante 4 horas a temperatura ambiente una solución de 7,4 g de 4-metil-5-(trimetilsilil)pentan-2-ona, 29,8 g de acetato amónico y 5 g de tamiz molecular de 3Å en 500 ml de metanol. Se añadieron 4,86 g de cianoborohidruro sódico. La reacción se completó durante la noche a temperatura ambiente. Se evaporó la mezcla de reacción en bruto. Tras extracción con dietil éter, tratamiento acuoso básico y evaporación se obtuvieron 2,20 g (26%) de un sólido incoloro.
[M-HCl+1]=174.

Preparación de N-[1,3-dimetil-4-(trimetilsilil)butil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida

Se añadieron 91,6 mg de cloruro de 5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carbonilo a una solución de 173 mg de 4-metil-5-(trimetilsilil)pentan-2-amina y 71,7 mg de carbonato potásico en 3 ml de cloruro de metileno. La mezcla de reacción se agitó durante 2 horas a temperatura ambiente. Tras desarrollo acuoso, extracción con acetato de etilo y cromatografía en gel de sílice se obtuvieron 115 mg (67%) de un aceite incoloro.
[M+1]=314.

**Ejemplo 2**: Preparación de N-(3-ciclohexil-1-metilpropil)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (Compuesto 22-2)

Preparación de metanosulfonato de 3-ciclohexil-1-metilpropilo

Una solución de 3,35 g demetanosulfonato de 3-ciclohexil-1-metilpropilo en 100 ml de cloruro de metileno se añadió a una solución de 4,38 g de 4-ciclohexilbutan-2-ol en 200 ml de cloruro de metileno. La mezcla de reacción se agitó durante la noche. El desarrollo acuoso dio7,06 g (96%) de un aceite incoloro.

Preparación de 2-(3-ciclohexil-1-metilpropil)-1H-isoindol-1,3(2H)-diona

Una solución de 7,00 g de metanosulfonato de 3-ciclohexil-1-metilpropilo en 20 ml de DMF se añadió a una solución de 5,14 g de ftalimida y 7,43 g de carbonato potásico en 50 ml de DMF a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se agitó a 80ºC durante la noche. El desarrollo acuoso seguido de filtración en gel de sílice dio 4,95 g (58%) de un aceite incoloro.
[M+1]=286

Preparación de 4-ciclohexilbutan-2-amina

Una solución de 4,60 g de 2-(3-ciclohexil-1-metilpropil)-1H-isoindol-1,3(2H)-diona y 7,26 g de hidrato de hidrazina en 60 ml de etanol se calentó a 70ºC. El precipitado blanco se separó por filtración después de enfriar a temperatura ambiente. La mezcla se lavó con agua y se evaporó, obteniéndose 920 mg (37%) de un aceite incoloro.

Preparación de N-(3-ciclohexil-1-metilpropil)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida

Una solución de 489 mg de PS DCC [N-ciclohexilcarbodiimida, N'-metilpoliestireno], 90,7 mg de ácido 3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico, 69,6 mg de 1-hidroxibenzotriazol (HOBT) en 3,2 ml de acetonitrilo se calentó durante 5 min a 100ºC en horno de microondas. Después de enfriar la mezcla de reacción se añadieron 200 mg de Amberlist A21 y la mezcla se calentó nuevamente a 100ºC en horno de microondas. Se filtró la mezcla de reacción fría, se lavó la resina con cloruro de metileno. La cromatografía en gel de sílice dio 89 mg (52%) de un aceite de color castaño.
[M+1]=314.

**Ejemplos de actividad biológica del compuesto de fórmula general (I)**

**Ejemplo A**: Ensayo in vivo con *Alternaria brassicae* (Mancha en hojas de crucíferas)

El ingrediente activo ensayado se prepara por homogeneización en DMSO (5% del volumen final), acetona (10% del volumen final y tween 80, 10% (5 μl/mg de ingrediente activo).

Se tratan en la etapa de cotiledón por pulverización con la suspensión acuosa descrita antes, plantas de rábano (variedad Pernot) en copas de inicio, sembrado en un sustrato 50/50 de suelo de turba/puzolana y crecido a 18-20ºC.

Las plantas, usadas como control, se tratan con solución acuosa que no contiene el material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan proyectando sobre ellas la suspensión acuosa de esporas de *Alternaria brassicae* (40.000 esporas por $cm^3$). Las esporas se recolectan de cultivos de 12 a 13 días.

Las plantas de rábano contaminadas es incuban durante 6-7 días a aproximadamente 18ºC en atmósfera húmeda.

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

En estas condiciones se observa una protección buena (como mínimo 70%) o total a una dosis de 500 ppm con los compuestos siguientes: 4-3, 4-4, 4-5, 4-6, 5-4, 5-5, 5-7, 6-1, 7-1, 7-3, 7-4, 7-6, 21-1, 22-2, 22-3, 23-1, 24-1, 24-2.

En estas condiciones, la 4-dicloro-N-octilisotiazol-5-carboxamida, descrita en la patente U.S. 5.240.951 (véase el compuesto 23) no mostró actividad alguna contra *Alternaria brassicae.*

**Ejemplo B**: Ensayo in vivo con *Botrytis cinerea* (moho gris de pepino)

El ingrediente activo ensayado se prepara por homogeneización en DMSO (5% del volumen final), acetona (10% del volumen final) y tween 80, 10% (5 μl/mg de ingrediente activo).

Plantas de pepino (variedad Marketer) en copas de inicio, sembradas en sustrato 50/50 de suelo de turba/puzolana y crecidas a 18-20ºC se tratan en la etapa de cotiledón Z11 por pulverización de la suspensión acuosa descrita antes. Las plantas, usadas como control, se tratan con una solución acuosa que no contiene el material activo.

Después de 24 horas las plantas se contaminan depositando gotas de una suspensión acuosa de esporas de *Botrytis cinerea* (150.000 esporas por ml) sobre la superficie de arriba de las hojas. Las esporas se recogen de cultivo de 15 días y se ponen en suspensión en una solución nutriente compuesta por:

20 g/l de gelatina

50 g/l de azúcar de caña

2 g/l de $NH_4NO_3$

1 g/l de $KH_2PO_4$

Las plantas de pepino contaminadas se dejan durante 5/7 días en una sala climática a 15-11ºC (día/noche) y 80% de humedad relativa.

La evaluación se realiza 5/7 días después de la contaminación, comparativamente con las plantas de control. En estas condiciones se observa una protección buena (como mínimo 70%) o total:

a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 4-3. 4-4. 4-5, 4-7, 4-11, 5-4, 5-5, 5-6, 5-7, 7-1, 7-2, 7-5, 7-6, 21-1, 21-2, 22-2, 24-1.

En estas condiciones, la N-isopropil-4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-carboxamida divulgada en la solicitud de patente internacional WO 96/29871 (véase compuesto 1-89), la N-s-butil-2,5-dimetil-3-furamida divulgada en la solicitud de patente británica GB 1387652 (véase compuesto 3) y la 4-dicloro-N-octilisodiazol-5-carboxamida divulgada en la

patente US 5.240.951 (véase compuesto 23) no presentaron actividad alguna contra *Botrytis cinerae.*

**Ejemplo C**: Ensayo in vivo en manchas netas en cebada con *Pyrenophora teres*

El ingrediente activo ensayado se preparó por homogeneización en DMSO (5% del volumen final), acetona (10% del volumen final) y tween 80 10% (5 μl/mg de ingrediente activo).

Plantas de cebada (variedad Express) en copas de inicio, sembradas en sustrato 50/50 de suelo de turba-puzolana y crecidas a 12ºC se tratan en la etapa de 1-hoja (altura de 10 cm) por pulverización de la suspensión acuosa descrita antes. Las plantas usadas como controles se tratan con una solución acuosa que no contenía el material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan por proyección sobre ellas de una suspensión acuosa de esporas de *Pyrenophora teres* (12.000 por ml). Las esporas se recogen de un cultivo de 12 días. Las plantas de cebada contaminadas se incuban durante 24 horas a aproximadamente 20ºC y humedad relativa de 100%, y luego durante 12 días a una humedad relativa de 80%.

La evaluación es realiza 12 días después de la contaminación comparativamente con las plantas de control. En estas condiciones, se observa una protección buena (como mínimo 70%) o total:

a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 4-5, 4-6, 4-8, 4-12, 5-4, 5-5, 5-7, 7-1, 7-2, 7-3, 7-4, 7-6, 8-4, 21-2, 21-3, 22-2, 22-3, 24-1, 24-2 y

a una dosis de 500 g/ha con los siguientes compuestos: 4-3, 4-4, 21-1, 22-1.

En estas condiciones, la N-s-butil-2,5-dimetil-3-furamida descrita en la solicitud de patente británica GB 1387652 (véase compuesto 3) no presentó actividad alguna frente a *Pyrenophora teres.*

**Ejemplo D**: Ensayo in vivo con *Sphaerotheca fuliginea (*moho pulvurulento)

El ingrediente activo ensayado se preparó por homogeneización en DMSO 5% del volumen final), acetona (10% del volumen final) y tween 80 10% (5 μl/mg de ingrediente activo).

Plantas de pepinillo (variedad Vert petit de Paris) en copas de inicio sembradas en sustrato de suelo de turba-puzolana y crecidas a 20ºC/23ºC se tratan en la etapa de cotiledón Z11 por pulverización con la suspensión acuosa descrita antes. Las plantas, usadas como control, se tratan con solución acuosa que no contiene el material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan proyectando sobre ellas la suspensión acuosa de esporas de *Sphaerotheca fuliginea* (100.000 esporas por ml). Las esporas se recolectan de plantas contaminadas. Las plantas de pepinillo contaminadas se incuban a aproximadamente 20ºC-25ºC y humedad relativa de 60/70%.

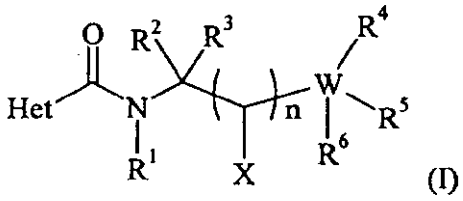
La evaluación (% de eficacia) se realiza 21 días después de la contaminación, comparativamente con las plantas de control. En estas condiciones se observa una protección buena (como mínimo 70%) o total:

a una dosis de 500 ppm con los compuestos siguientes: 4-3, 4-4, 4-5, 4-6, 4-8, 4-11, 4-12, 5-4, 5-5, 5-6, 5.7, 7-2, 7-3, 7-4, 7-5, 7-6, 8-4, 21-1, 21-2, 21-3, 22-1, 22-2, 22-3, 24-2.

En estas condiciones, la N-isopropil-4-metil-1,2,3-tiadiazol-5-carboxamida divulgada en la solicitud de patente internacional WO 96/29871 (véase compuesto 1-89) y N-s-butil-2,5-dimetil-3-furamida divulgada en la solicitud de patente británica GB 1387652 (véase compuesto 3) no presentaron actividad alguna frente a *Sphaerotheca fuliginea.*

**REIVINDICACIONES**

1. Un compuesto de fórmula general (I)



(I)

en la que :

- Het representa 4-pirazol, estando Het unido por un átomo de carbono y estando sustituido como mínimo en la posición orto;

- n es 2, 3 o 4;

- $R^1$ se selecciona de manera que sea un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo $C_{1-6}$ o un grupo cicloalquilo $C_{3-7}$;

- $R^2$ se selecciona para que sea un grupo alquilo $C_{1-6}$;

- $R^3$ se selecciona de manera que sea un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo $C_{1-6}$;

- cada X se selecciona, independientemente de los otros, de manera que sea un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo $C_{1-6}$;

- W representa un átomo de carbono o un átomo de silicio;

- $R^4$, $R^5$ y $R^6$ se seleccionan, independientemente entre sí, de manera que sean un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo $C_{1-6}$, siendo como mínimo dos de los sustituyentes $R^4$, $R^5$ y $R^6$ diferentes de un átomo de hidrógeno;

o dos de los sustituyentes $R^4$, $R^5$ y $R^6$ pueden formar juntos un ciclo no aromático de 3, 4, 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con un grupo alquilo $C_{1-6}$;

así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metalóidicos e isómeros ópticamente activos con la excepción de:

- N-(1,5-dimetilhexil)-1-[4-[[(1,5-dimetilhexil)amino]sulfonil]fenil]-4-[[4-[(1,5-dimetilhexil)amino]sulfonil]fenil]azo]-5-hidroxi-1H-pirazol-3-carboxamida;

- 5-amino-N-(1,5-dimetlhexil)-3-piridin-3-ilisoxazol-4-carboxamida;

- 5-(4-clorofenil)-1-(2,4-diclorofenil)-N-(1,4-dimetilpentil)-4-metil-1H-pirazol-3-carboxamida y

- 5-(4-clorofenil)-1-(2,4-diclorofenil)-N-(1,5-dimetilhexil)-4-metil-1H-pirazol-3-carboxamida.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque cada sustituyente de Het se selecciona, independientemente de los otros, de manera que sea un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo ciano, un grupo alquilamino $C_{1-4}$, un grupo di-(alquil $C_{1-4}$)amino, un alquilo $C_{1-4}$, un halogenoalquilo $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un grupo nitro, un alcoxi $C_{1-4}$, un alquiltio $C_{1-4}$, un alquilsulfonilo $C_{1-4}$, un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo $C_{1-4}$, o un piridilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo $C_{1-4}$, un di(alquil $C_{1-4}$)aminosulfonilo, un grupo alquilcarbonilo $C_{1-4}$, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo $C_{1-4}$, o un benzoílo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo $C_{1-4}$, un grupo carbamoílo o un alquilcarbonilamino $C_{1-4}$, un alquenilo $C_{2-6}$, un cicloalquilo $C_{3-6}$, un alquiltio $C_{1-4}$-alquilo $C_{1-4}$, un halogenoalquiltio $C_{1-4}$-alquilo $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi $C_{1-4}$-alquilo $C_{1-4}$ o un halogenoalcoxi $C_{1-4}$-alquilo $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

3. Un compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, caracterizado porque Het está sustuido en la posición orto con un sustituyente seleccionado entre un átomo de halógeno, un alquilo $C_{1-4}$, un halogenoalquilo $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi $C_{1-4}$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o un grupo alquiloxi $C_{1-4}$:

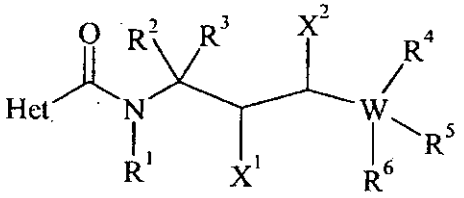
4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado porque $R^2$ se selecciona que sea metilo.

5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque n es 3.

6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque $R^4$, $R^5$ y $R^6$ se seleccionan, independientemente entre sí, de manera que sean un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

7. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado porque cada sustituyente X, que puede ser igual o diferente, se selecciona de manera que sea un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

8. Un compuesto de fórmula general (I-a)

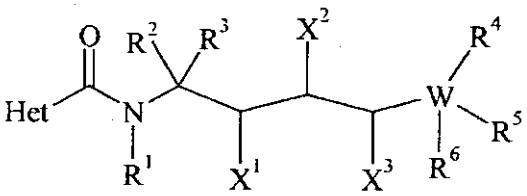


(I-a)

en la que

- Het, $R^1$, $R^2$, $R^3$, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son lo definido antes en la reivindicación 1, y
- $X^1$ y $X^2$ se seleccionan, independientemente entre sí, de manera que sean un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

9. Un compuesto de fórmula general (I-b)

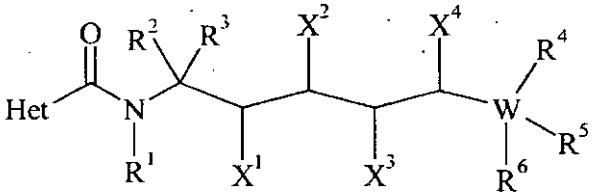


(I-b)

en la que

- Het, $R^1$, $R^2$, $R^3$, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son lo definido en la reivindicación 1, y
- $X^1$, $X^2$ y $X^3$ se seleccionan, independientemente entre sí, de manera que sean un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

10. Un compuesto de fórmula general (I-c)

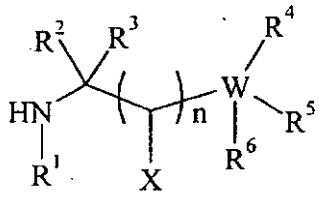


(I-c)

en la que

- Het, $R^1$, $R^2$, $R^3$, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son lo definido en la reivindicación 1, y
- $X^1$, $X^2$, $X^3$ y $X^4$ se seleccionan, independientemente entre sí, de manera que sean un átomo de hidrógeno o un grupo metilo.

11. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula general (I) según se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, que comprende hacer reaccionar un derivado alquilamina de fórmula general (II) o una de sus sales

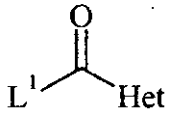


(II)

en la que

$R^1$, $R^2$, $R^3$, X, n, W, $R^4$, $R^5$ y $R^6$ son los definido en la reivindicación 1,

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

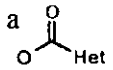


(III)

en la que

- Het es lo definido en la reivindicación 1, y

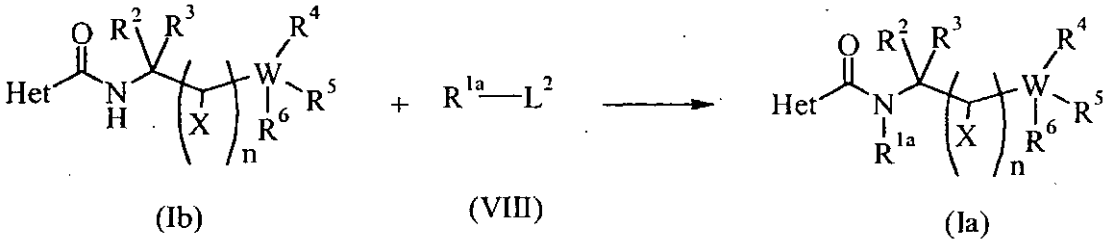
- $L^1$ es un grupo saliente seleccionado entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, $-OR^{54}$, $-OCOR^{54}$, siendo $R^{14}$ un alquilo $C_{1-6}$, un haloalquilo $C_{1-6}$, un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula



;

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

12. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 11, caracterizado porque $R^1$ es un átomo de hidrógeno y porque el procedimiento se completa con otra etapa adicional de acuerdo con el siguiente esquema de reacción:



(Ib) (VIII) (Ia)

en el que:

- $R^2$, $R^3$, X, n, W, $R^4$, $R^5$, $R^6$ y Het son lo definido en la reivindicación ,

-$L^2$ es un grupo saliente seleccionado de manera que sea un átomo de halógeno, un 4-metil-fenilsulfoniloxi o un metilsulfoniloxi: y

- $R^{1a}$ es un grupo alquilo $C_{1-6}$ o cicloalquilo $C_{3-7}$,

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Ib) con un compuesto de fórmula general (VIII) para obtener un compuesto de fórmula general (Ia).

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

14. Un procedimiento para combatir preventiva o curativamente los hongos fitopatógenos de cultivos, caracterizado porque se aplica una cantidad eficaz y no fitotóxica de una composición de acuerdo con la reivindicación 15 a las semillas de plantas, o a las hojas de las plantas, o a los frutos de las plantas o al suelo en el que crecen las plantas o en el que se desea que crezcan.