

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 475 495**

51 Int. Cl.:

**A01N 43/56** (2006.01)

**C07D 231/16** (2006.01)

**C07D 231/14** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **22.01.2005 E 05701132 (2)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **07.05.2014 EP 1771069**

54 Título: **Derivados de N-(2-(hidroximetil)fenil)-1H-pirazol-4-carboxamida y compuestos relacionados como principios activos microbicidas para usar en fitoprotección y protección de materiales**

30 Prioridad:

**06.02.2004 DE 102004005787**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

**10.07.2014**

73 Titular/es:

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

72 Inventor/es:

**DUNKEL, RALF;  
ELBE, HANS-LUDWIG;  
HARTMANN, BENOIT;  
GREUL, JÖRG, NICO;  
HERRMANN, STEFAN;  
WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE;  
DAHMEN, PETER y  
KUCK, KARL-HEINZ**

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**ES 2 475 495 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

Derivados de N-(2-(hidroximetil)fenil)-1H-pirazol-4-carboxamida y compuestos relacionados como principios activos microbicidas para usar en fitoprotección y protección de materiales

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

Se sabe ya que numerosas carboxamidas poseen propiedades fungicidas (véanse, por ejemplo, los documentos WO 03/010149, WO 02/059086, EP-A 0 824 099, EP-A 0 737 682, EP-A 0 591 699, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099, DE-A 24 09 011, DE-A 20 06 472, JP-A 2001-302605, JP-A 10-251240, JP-A 8-176112, JP-A 8-92223 y JP-A 53-72823 ). De este modo se han conocido ya numerosas alquilcarboxamidas que no están sustituidas en la porción de alquilo, tales como, por ejemplo N-alil-N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida por el documento WO 02/059086 , N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-carboxamida por el documento EP-A 0 824 099 y 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[2-(1,3,3-trimetilbutil)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida por el documento WO 03/010149. Estas sustancias tienen una actividad buena, pero, en algunos casos, por ejemplo, en cantidades de aplicación reducidas, dejan que desear.

15 El documento WO-A-2003/010149 divulga carboxamidas cuyo anillo de fenilo M está sustituido con un grupo hidroxialquilo. El documento WO-A-2003/010149, sin embargo, no divulga ninguna carboxamida en la que el anillo de fenilo M esté sustituido con L1-Q-L2-R, siendo R distinto de hidrógeno, de modo que la sustitución con un grupo hidroxialquilo está excluida.

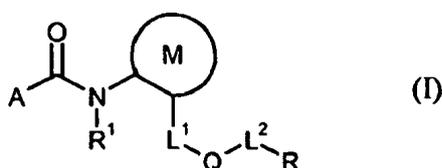
20 Dixon y col. "Kinetics and mechanism of the addition of water and ring-opening of 2-methyl- and 2-aryl-4H-3, 1-benzoxazines to 2-aminobenzyl esters in the acidic pH range; change in rate limiting step with buffer concentration and evidence for a tetrahedral carbonyl addition intermediate", J. Chem. Soc. Perkin Trans. 2, Volumen 8, 1997, páginas 1503 – 1510 divulga resultados de experimentos cinéticos de reacciones intramoleculares en derivados de bencilo sustituidos con grupos reactivos en la posición 2 en compuestos aromáticos. Sin embargo, no se divulgan ni carboxamidas según la invención ni su uso como fungicidas.

25 Raiford y col., "Behavior of mixed O-acyl-N-acyl derivatives in which the reacting groups are not on adjacent carbon atoms", J. Am. Chem. Soc., Volumen 48, 1926, página 487, divulga resultados de investigación de la migración de acilo en derivados de acetil-benzoílo. Sin embargo, no se divulgan ni las carboxamidas según la invención ni su uso como fungicidas.

30 La base de datos Beilstein del 29 de junio de 1989 (XP002323927), la base de datos Beilstein del 5 de febrero de 1990 (XP002323928) y la base de datos Beilstein del 25 de julio de 2003 (XP002323929) divulgan también carboxamidas. Sin embargo, no se divulgan las carboxamidas según la invención en las que el anillo de fenilo M esté sustituido con L1-Q-L2-R, siendo R distinto de hidrógeno.

35 Belekón y col., "Synthesis of amino acids via asymmetric phase transfer catalyzed alkylation of achiral nickel(II) complexes of glycine derived Schiff bases", J. Am. Chem. Soc., Volumen 125, N° 42, 2003, páginas 12860 - 12871, divulga la síntesis de carboxamidas como producto intermedio para la preparación de complejos de Ni(II). Sin embargo, no se divulgan carboxamidas según la invención.

Se han hallado ahora nuevas carboxamidas de la fórmula (I)



en la que

40 R<sup>1</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfínilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfínilo, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; formilo, formil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>; halogeno-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halogeno-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> con, respectivamente, 1 a 13 átomos de flúor, cloro y/o bromo; (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo; (halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, (halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-

C<sub>6</sub>)carbonilo, (halogeno-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (halogenocicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; o -C(=O)C(=O)R<sup>2</sup>, -CONR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> o -CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>,

5 R<sup>2</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> representan, independientemente uno de otro, respectivamente, hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

10 R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup>, además, conjuntamente con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclo con 5 a 8 átomos de anillo saturado, dado el caso sustituido una o más veces, de forma igual o distinta, con halógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes de la serie de oxígeno, azufre o NR<sup>7</sup>,

R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

15 R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup>, además, conjuntamente con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclo con 5 a 8 átomos de anillo saturado, dado el caso sustituido una o más veces, de forma igual o distinta, con halógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes de la serie de oxígeno, azufre o NR<sup>7</sup>,

R<sup>7</sup> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

20 M representa un anillo de fenilo, respectivamente sustituido una vez con R<sup>8</sup>,

R<sup>8</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, metilo, iso-propilo, metiltio o trifluorometilo,

R<sup>8</sup> además, representa metoxi,

R<sup>8-A</sup> representa hidrógeno, metilo, metiltio o trifluorometilo,

L<sup>1</sup> representa alquileo (alcanodiilo)C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>,

25 Q representa O, S, SO, SO<sub>2</sub> o NR<sup>9</sup>,

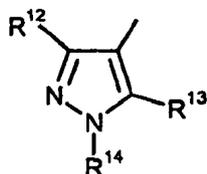
L<sup>2</sup> representa un enlace directo, SiR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> o CO,

R representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>,

30 R<sup>9</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>,

R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup> independientemente uno de otro, representan hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

A representa el resto de la fórmula (A1)



(A1)

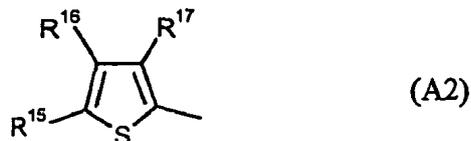
35 en la que

R<sup>12</sup> representa hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno, aminocarbonilo o aminocarbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

R<sup>13</sup> representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio,

40 R<sup>14</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, hidroxil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno, o fenilo, o

A representa el resto de la fórmula (A2)

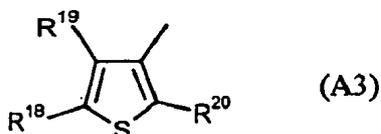


en la que

5  $R^{15}$  y  $R^{16}$ , independientemente uno de otro, representan hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

$R^{17}$  representa halógeno, ciano o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno,

A representa el resto de la fórmula (A3)



10 en la que

$R^{18}$  y  $R^{19}$ , independientemente uno de otro, representan hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

$R^{20}$  representa hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa el resto de la fórmula (A4)

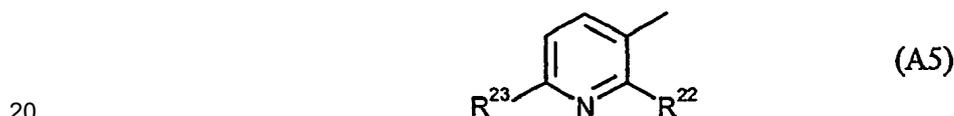


15

en la que

$R^{21}$  representa halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogeno-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno,

A representa el resto de la fórmula (A5)



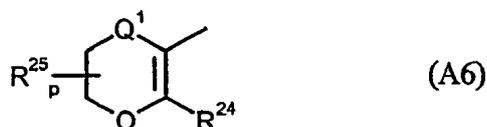
20

en la que

$R^{22}$  representa halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno,

25  $R^{23}$  representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinilo o alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, o

A representa el resto de la fórmula (A6)



en la que

30  $R^{24}$  representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

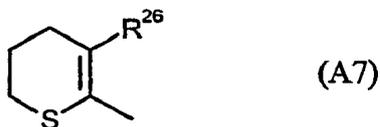
R<sup>25</sup> representa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

Q<sup>1</sup> representa S (azufre), SO, SO<sub>2</sub> o CH<sub>2</sub>,

p representa 0, 1 o 2, representando R<sup>25</sup> restos idénticos o diferentes cuando p representa 2, o

A representa el resto de la fórmula (A7)

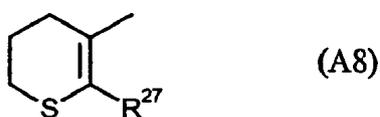
5



en la que

R<sup>26</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

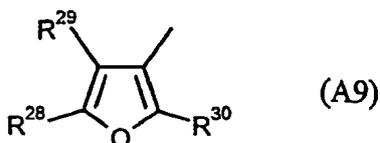
A representa el resto de la fórmula (A8)



10 en la que

R<sup>27</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

A representa el resto de la fórmula (A9)

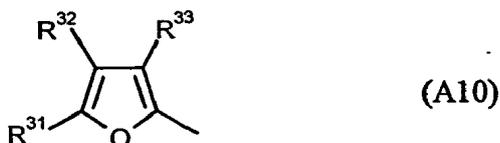


en la que

15 R<sup>28</sup> y R<sup>29</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, halógeno, amino, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

R<sup>30</sup> representa hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa el resto de la fórmula (A10)



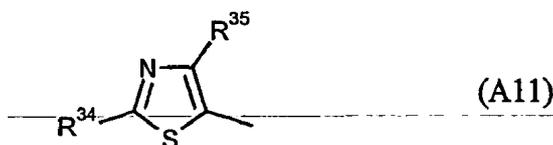
20 en la que

R<sup>31</sup> y R<sup>32</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, halógeno, amino, nitro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

R<sup>33</sup> representa hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa el resto de la fórmula (A11)

25

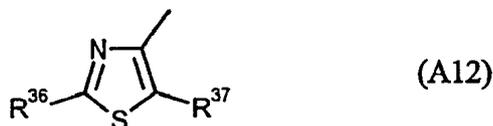


en la que

R<sup>34</sup> representa hidrógeno, halógeno, amino, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino, di-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)amino, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

R<sup>35</sup> representa halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa el resto de la fórmula (A12)

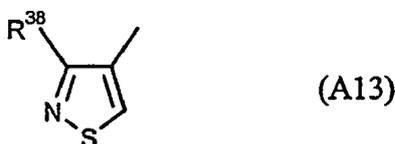


en la que

R<sup>36</sup> representa hidrógeno, halógeno, amino, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino, di-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)amino, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

R<sup>37</sup> representa halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno, o

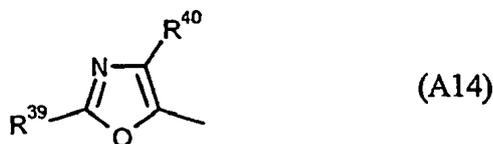
10 A representa el resto de la fórmula (A13)



en la que

R<sup>38</sup> representa halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa el resto de la fórmula (A14)

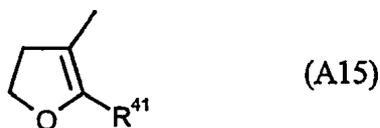


en la que

R<sup>39</sup> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

R<sup>40</sup> representa halógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o

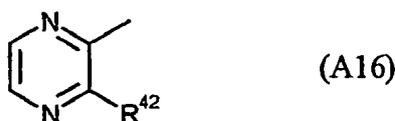
A representa el resto de la fórmula (A15)



en la que

R<sup>41</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

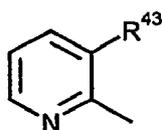
A representa el resto de la fórmula (A16)



en la que

R<sup>42</sup> representa hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa el resto de la fórmula (A17)

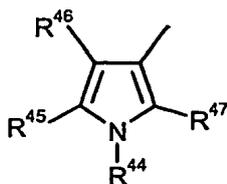


(A17)

en la que

R<sup>43</sup> representa halógeno, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno, o

5 A representa el resto de la fórmula (A18)



(A18)

en la que

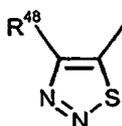
10 R<sup>44</sup> representa hidrógeno, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, hidroxil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)aminosulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-carbonilo o fenilsulfonilo o benzoílo respectivamente, dado el caso, sustituidos,

R<sup>45</sup> representa hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

R<sup>46</sup> representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

R<sup>47</sup> representa hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno, o

A representa el resto de la fórmula (A19)



(A19)

15

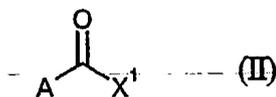
en la que

R<sup>48</sup> representa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

no representando R alcoxi cuando L<sup>2</sup> representa un enlace directo.

Además, se ha hallado que se obtienen carboxamidas de la fórmula (I)

20 (a) haciendo reaccionar derivados de ácido carboxílico de la fórmula (II)

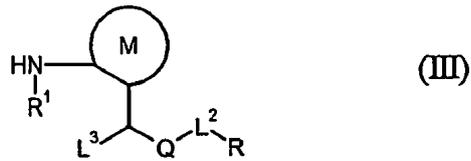


en la que

A tiene los significados indicados anteriormente y

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

25 con derivados de anilina de la fórmula (III)



en la que

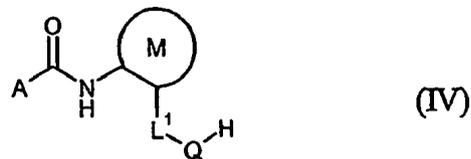
$R^1$ , M, Q,  $L^2$  y R tienen los significados indicados anteriormente,

$L^3$  representa hidrógeno o alquilo  $C_1-C_4$ ,

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

o

(b) haciendo reaccionar carboxamidas de la fórmula (IV)



- 10 en la que M,  $L^1$ , Q y A tienen los significados indicados anteriormente, con un compuesto de la fórmula (V)



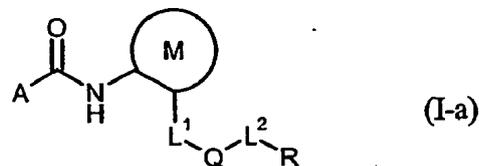
en la que

$L^2$  y R tienen los significados indicados anteriormente,

Y representa halógeno, triflato (trifluorometilsulfonilo), mesilato (metilsulfonilo) o tosilato (4-metilfenilsulfonilo),

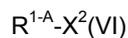
- 15 en presencia de una base y en presencia de un diluyente, o

(c) haciendo reaccionar carboxamidas de la fórmula (I-a)



en la que M,  $L^1$ , Q,  $L^2$ , R y A tienen los significados indicados anteriormente, con halogenuros de la fórmula (VI)

20



en la que

$X^2$  representa cloro, bromo o yodo,

5 R<sup>1-A</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinilo, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; formilo, formil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>; halogeno-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halogeno-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> con, respectivamente, 1 a 13 átomos de flúor, cloro y/o bromo; (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo; (halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, (halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, (halogeno-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (halogenocicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; o -C(=O)C(=O)R<sup>2</sup>, -CONR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> o -CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, teniendo R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> los significados indicados anteriormente,

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

Finalmente, se ha hallado que las nuevas carboxamidas de la fórmula (I) poseen propiedades microbicidas muy buenas y se pueden usar para combatir microorganismos no deseados tanto en fitoprotección como también en protección de materiales.

15 Los compuestos según la invención pueden estar presentes, dado el caso, en forma de mezclas de diferentes formas isómeras posibles, especialmente de estereoisómeros, tales como, por ejemplo, isómeros E y Z, treo y eritro, así como isómeros ópticos, pero también, dado el caso, de tautómeros. Se reivindican tanto los isómeros E como también los Z, y también los treo y eritro, así como los isómeros ópticos, mezclas discrecionales de estos isómeros, así como las formas tautómeras posibles.

20 Las carboxamidas según la invención se definen, en general, mediante la fórmula (I). A continuación se indican definiciones de restos preferentes de las fórmulas mencionadas anteriormente y que se mencionan más adelante. Estas definiciones tienen validez para los productos finales de la fórmula (I) y, del mismo modo, para todos los productos intermedios.

25 R<sup>1</sup> representa preferentemente hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinilo, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; formilo, formil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>; halogeno-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halogeno-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> con, respectivamente, 1 a 13 átomos de flúor, cloro y/o bromo; (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo; (halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (halogeno-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, (halogenocicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; o -C(=O)C(=O)R<sup>2</sup>, -CONR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> o -CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>,

30 R<sup>1</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o tercbutilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o iso-propilsulfinilo, n-, iso-, sec- o terc-butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o iso-propilsulfonilo, n-, iso-, sec- o terc-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, trifluorometilo, triclorometilo, trifluoroetil, difluorometilito, difluoroclorometilito, trifluorometilito, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometoximetilo; formilo, -CH<sub>2</sub>-CHO, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CHO, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CCl<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CCl<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, iso-propilcarbonilo, terc-butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, terc-butoxicarbonilo, ciclopropilcarbonilo; trifluorometilcarbonilo, trifluorometoxicarbonilo; o -C(=O)C(=O)R<sup>2</sup>, -CONR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> o -CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>.

45 R<sup>1</sup> representa de modo muy particularmente preferente hidrógeno, metilo, metoximetilo, formilo, -CH<sub>2</sub>-CHO, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CHO, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)CHO, -C(=O)C(=O)CH<sub>3</sub>, -C(=O)C(=O)CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, -C(=O)CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -C(=O)CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>.

50 R<sup>2</sup> representa preferentemente hidrógeno alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

R<sup>2</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, terc-butilo, metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, terc-butoxi, metoximetilo, ciclopropilo; trifluorometilo, trifluorometoxi.

55 R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> representan, independientemente uno de otro, preferentemente hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, cicloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>; halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo.

R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> además, conjuntamente con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclo con 5 o 6 átomos de anillo saturado, dado el caso sustituido de una a cuatro veces, de forma igual o distinta, con halógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes de la serie de oxígeno, azufre o NR<sup>7</sup>.

- 5 R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> representan, independientemente uno de otro, de modo particularmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluorometilo, triclorometilo, trifluoroetilo, trifluorometoximetilo.

- 10 R<sup>3</sup> y R<sup>4</sup> además, forman conjuntamente con el átomo de nitrógeno al que están unidos, de modo particularmente preferente un heterociclo saturado de la serie morfolina, tiomorfolina o piperazina, dado el caso sustituido de una a cuatro veces, de modo igual o diferente, con flúor, cloro, bromo o metilo, pudiendo estar la piperazina sustituida en el segundo átomo de nitrógeno con R<sup>7</sup>.

R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> independientemente uno de otro, representan preferentemente hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo.

- 15 R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> además, conjuntamente con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman preferentemente un heterociclo con 5 o 6 átomos de anillo saturado, dado el caso sustituido una o más veces, de forma igual o distinta, con halógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes de la serie de oxígeno, azufre o NR<sup>7</sup>.

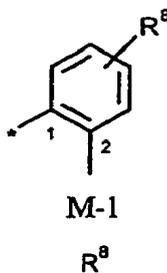
- 20 R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> representan, independientemente uno de otro, de modo particularmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluorometilo, triclorometilo, trifluoroetilo, trifluorometoximetilo.

R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> además, forman conjuntamente con el átomo de nitrógeno al que están unidos, de modo particularmente preferente un heterociclo saturado de la serie morfolina, tiomorfolina o piperazina, dado el caso sustituido de una a cuatro veces, de modo igual o diferente, con flúor, cloro, bromo o metilo, pudiendo estar la piperazina sustituida en el segundo átomo de nitrógeno con R<sup>7</sup>.

- 25 R<sup>7</sup> representa preferentemente hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

R<sup>7</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo.

M representa preferentemente



estando unido el enlace marcado con "\*" con la amida.

- 30 R<sup>8</sup> representa preferentemente hidrógeno.

R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-1, además, preferentemente flúor, estando el flúor de modo particularmente preferente en la posición 4, 5 o 6, de modo muy particularmente preferente en la posición 4 o 6, especialmente en la posición 4 R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-1, además, preferentemente cloro, estando el cloro de modo particularmente preferente en la posición 4 o 6.

- 35 R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-1, además, preferentemente metilo, estando el metilo de modo particularmente preferente en la posición 3 y, además, de modo particularmente preferente en la posición 4.

R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-1, además, preferentemente metoxi, estando el metoxi de modo particularmente preferente en la posición 4.

- 40 R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-1, además, preferentemente trifluorometilo, estando el trifluorometilo de modo particularmente preferente en la posición 4 o 6.

R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-2, M-3, M-4 o M-5, además, preferentemente flúor, estando el flúor de modo particularmente preferente en la posición 6 (M-2, M-3) o en la posición 3 (M-4, M-5).

- R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-2, M-3, M-4 o M-5, además, preferentemente cloro, estando el cloro de modo particularmente preferente en la posición 6 (M-2, M-3) o en la posición 3 (M-4, M-5).
- R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-2, M-3, M-4 o M-5, además, preferentemente metilo, estando el metilo de modo particularmente preferente en la posición 4 (M-2,) o en la posición 3 (M-3, M-4, M-5).
- 5 R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-6, además, preferentemente metilo, estando el metilo de modo particularmente preferente en la posición 3.
- R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-6, además, preferentemente trifluorometilo, estando el trifluorometilo de modo particularmente preferente en la posición 3.
- 10 R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-7, M-8 o M-9, además, preferentemente cloro, estando el cloro de modo particularmente preferente en la posición 5 (M-7, M-8) o en la posición 3 (M-9).
- R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-7, M-8 o M-9, además, preferentemente metilo, estando el metilo de modo particularmente preferente en la posición 5 (M-7, M-8) o en la posición 3 (M-9).
- R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-12, además, preferentemente metilo, estando el metilo de modo particularmente preferente en la posición 4.
- 15 R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-12, además, preferentemente trifluorometilo, estando el trifluorometilo de modo particularmente preferente en la posición 4.
- R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-13, además, preferentemente metilo, estando el metilo de modo particularmente preferente en la posición 3.
- 20 R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-13, además, preferentemente trifluorometilo, estando el trifluorometilo de modo particularmente preferente en la posición 3.
- R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-14, además, preferentemente metilo, estando el metilo de modo particularmente preferente en la posición 3.
- R<sup>8</sup> representa en el caso de que M represente M-14, además, preferentemente trifluorometilo, estando el trifluorometilo de modo particularmente preferente en la posición 3.
- 25 R<sup>8-A</sup> representa preferentemente hidrógeno.
- R<sup>8-A</sup> representa, además, preferentemente metilo.
- R<sup>8-A</sup> representa, además, preferentemente trifluorometilo.
- L<sup>1</sup> representa preferentemente alquileo (alcanodiilo) C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (alcanodiilo).
- L<sup>1</sup> representa de modo particularmente preferente -CH<sub>2</sub>-, -CH(CH<sub>3</sub>)- o -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-.
- 30 L<sup>1</sup> representa también de modo particularmente preferente -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-.
- Q representa preferentemente O.
- Q representa también preferentemente S.
- Q representa también preferentemente SO.
- Q representa también preferentemente SO<sub>2</sub>.
- 35 Q representa también preferentemente NR<sup>9</sup>, de modo particularmente preferente NH.
- L<sup>2</sup> representa preferentemente un enlace directo.
- L<sup>2</sup> representa también preferentemente SiR<sup>10</sup>R<sup>11</sup>.
- L<sup>2</sup> representa también preferentemente CO.
- 40 R representa preferentemente alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, R representa también preferentemente halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.
- R representa de modo particularmente preferente metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, sec-, iso- o terc-butilo, metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, n-, sec-, iso- o terc-butoxi, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, metiltiometilo, etiltio-metilo, metiltioetilo, etiltioetilo o ciclopropilo.

- R representa además de modo particularmente preferente 1-metilbutilo, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro o bromo, ciclopentilo o ciclohexilo.
- R representa de modo muy particularmente preferente metilo, etilo, n- o iso-propilo, iso- o terc-butilo, metoxi, iso-propoxi, iso- o terc-butoxi, metoximetilo o metiltiométilo.
- 5 R representa además de modo muy particularmente preferente sec-butilo, 1-metilbutilo, diclorometilo, ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo.
- R representa de modo especialmente preferente metilo, etilo, n- o iso-propilo, iso- o terc-butilo, metoxi, iso-propoxi, iso- o terc-butoxi.
- R representa además de modo especialmente preferente sec-butilo o 1-metilbutilo.
- 10 R<sup>9</sup> representa preferentemente hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>.
- R<sup>9</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, metiltio-métilo, etiltiométilo, metiltioetilo, etiltioetilo o ciclopropilo.
- 15 R<sup>9</sup> representa de modo muy particularmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, iso- o terc-butilo, metoximetilo o metiltiométilo.
- R<sup>9</sup> representa de modo especialmente preferente hidrógeno o metilo.
- R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup> representan, independientemente uno de otro, preferentemente alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> o alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>.
- 20 R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup> representan, independientemente uno de otro, de modo particularmente preferente metilo, etilo, metoxi, etoxi, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, metiltiométilo, etiltiométilo, metiltioetilo o etiltioetilo.
- R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup> representan, de modo muy particularmente preferente metilo, metoxi, metoximetilo o metiltiométilo.
- R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup> representan de modo especialmente preferente, respectivamente, metilo.
- A representa preferentemente uno de los restos A1, A2, A3, A4, A5, A6, A9, A10, A11, A12, A17 o A18.
- A representa de modo particularmente preferente uno de los restos A1, A2, A4, A5, A6, A9, A11, A16, A17, A18.
- 25 A representa de modo muy particularmente preferente el resto A1.
- A representa además de modo muy particularmente preferente el resto A2.
- A representa además de modo muy particularmente preferente el resto A4.
- A representa además de modo muy particularmente preferente el resto A5.
- A representa además de modo muy particularmente preferente el resto A6.
- 30 A representa además de modo muy particularmente preferente el resto A9.
- A representa además de modo muy particularmente preferente el resto A11.
- A representa además de modo muy particularmente preferente el resto A16.
- A representa además de modo muy particularmente preferente el resto A18.
- 35 R<sup>12</sup> representa preferentemente hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, iso-propilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, ciclopropilo, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo, trifluorometiltio, difluorometiltio, aminocarbonilo, aminocarbonilmétilo o aminocarboniletilo.
- R<sup>12</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, iso-propilo, monofluorometilo, monofluoroetilo, difluorometilo, trifluorometilo, difluoroclorometilo, triclorometilo, diclorometilo, ciclopropilo, metoxi, etoxi, trifluorometoxi, triclorometoxi, metiltio, etiltio, trifluorometiltio o difluorometiltio.
- 40 R<sup>12</sup> representa de modo muy particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, iso-propilo, monofluorometilo, monofluoroetilo, difluorometilo, trifluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>12</sup> representa de modo especialmente preferente metilo, difluorometilo, trifluorometilo o 1-fluoroetilo.
- R<sup>13</sup> representa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio o etiltio.

- R<sup>13</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo o metilo.
- R<sup>13</sup> representa de modo muy particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro o metilo.
- R<sup>14</sup> representa preferentemente hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo, hidroximetilo, hidroxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo o fenilo.
- 5 R<sup>14</sup> representa de modo particularmente preferente, hidrógeno, metilo, etilo, iso-propilo, trifluorometilo, difluorometilo, hidroximetilo, hidroxietilo o fenilo.
- R<sup>14</sup> representa de modo muy particularmente preferente hidrógeno, metilo, trifluorometilo o fenilo.
- R<sup>14</sup> representa de modo especialmente preferente metilo.
- 10 R<sup>15</sup> y R<sup>16</sup> representan, independientemente uno de otro, preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>15</sup> y R<sup>16</sup> representan, independientemente uno de otro, de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>15</sup> y R<sup>16</sup> representan, independientemente uno de otro, de modo muy particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo o triclorometilo.
- 15 R<sup>15</sup> y R<sup>16</sup> representan de modo especialmente preferente, respectivamente, hidrógeno.
- R<sup>17</sup> representa preferentemente flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>1</sub> o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>17</sup> representa de modo particularmente preferente flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, trifluorometilo, trifluorometoxi, difluorometoxi, difluoroclorometoxi o triclorometoxi.
- 20 R<sup>17</sup> representa de modo muy particularmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, trifluorometilo o trifluorometoxi.
- R<sup>17</sup> representa de modo especialmente preferente metilo.
- R<sup>18</sup> y R<sup>19</sup> representan, independientemente uno de otro, preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- 25 R<sup>18</sup> y R<sup>19</sup> representan, independientemente uno de otro, de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>18</sup> y R<sup>19</sup> representan, independientemente uno de otro, de modo muy particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluorometilo, trifluorometilo o triclorometilo.
- R<sup>18</sup> y R<sup>19</sup> representan de modo especialmente preferente, respectivamente, hidrógeno.
- 30 R<sup>20</sup> representa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>20</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo o trifluorometilo.
- R<sup>20</sup> representa de modo muy particularmente preferente metilo.
- 35 R<sup>21</sup> representa preferentemente flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-tio con, respectivamente, 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>21</sup> representa de modo particularmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, difluorometilo, trifluorometilo, difluoroclorometilo, triclorometilo, trifluorometoxi, difluorometoxi, difluoroclorometoxi, triclorometoxi, trifluorometiltio, difluorometiltio, difluoroclorometiltio o triclorometiltio.
- 40 R<sup>21</sup> representa de modo muy particularmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, difluorometilo, trifluorometilo o triclorometilo.
- R<sup>21</sup> representa de modo especialmente preferente yodo, metilo, difluorometilo o trifluorometilo.
- R<sup>22</sup> representa preferentemente flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- 45

- R<sup>22</sup> representa de modo particularmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo, triclorometilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, trifluorometoxi, difluorometoxi, difluoroclorometoxi o triclorometoxi.
- 5 R<sup>22</sup> representa de modo muy particularmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- R<sup>23</sup> representa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-sulfinilo o alquil C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-sulfonilo.
- 10 R<sup>23</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo, triclorometilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, trifluorometoxi, difluorometoxi, difluoroclorometoxi, triclorometoxi, metilsulfinilo o metilsulfonilo.
- R<sup>23</sup> representa de modo muy particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, triclorometilo, metilsulfinilo o metilsulfonilo.
- 15 R<sup>23</sup> representa de modo especialmente preferente hidrógeno.
- R<sup>24</sup> representa preferentemente metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>24</sup> representa de modo particularmente preferente metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>25</sup> representa preferentemente metilo o etilo.
- 20 R<sup>25</sup> representa de modo particularmente preferente metilo.
- Q<sup>1</sup> representa preferentemente S (azufre), SO<sub>2</sub> o CH<sub>2</sub>.
- Q<sup>1</sup> representa de modo particularmente preferente S (azufre) o CH<sub>2</sub>.
- Q<sup>1</sup> representa de modo muy particularmente preferente S (azufre).
- p representa preferentemente 0 o 1.
- 25 p representa de modo particularmente preferente 0.
- R<sup>26</sup> representa preferentemente metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>26</sup> representa de modo particularmente preferente metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>26</sup> representa de modo muy particularmente preferente metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- 30 R<sup>27</sup> representa preferentemente metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>27</sup> representa de modo particularmente preferente metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>27</sup> representa de modo muy particularmente preferente metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- R<sup>28</sup> y R<sup>29</sup> representan, independientemente uno de otro, preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- 35 R<sup>28</sup> y R<sup>29</sup> representan, independientemente uno de otro, de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>28</sup> y R<sup>29</sup> representan, independientemente uno de otro, de modo muy particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- 40 R<sup>28</sup> y R<sup>29</sup> representan de modo especialmente preferente, respectivamente, hidrógeno.
- R<sup>30</sup> representa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>30</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.

- R<sup>30</sup> representa de modo muy particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- R<sup>30</sup> representa de modo especialmente preferente metilo.
- 5 R<sup>31</sup> y R<sup>32</sup> representan, independientemente uno de otro, preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, nitro, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>31</sup> y R<sup>32</sup> representan, independientemente uno de otro, de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>31</sup> y R<sup>32</sup> representan, independientemente uno de otro, de modo muy particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- 10 R<sup>31</sup> y R<sup>32</sup> representan de modo especialmente preferente, respectivamente, hidrógeno.
- R<sup>33</sup> representa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>33</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluoroclorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- 15 R<sup>33</sup> representa de modo muy particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- R<sup>33</sup> representa de modo especialmente preferente metilo.
- R<sup>34</sup> representa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)amino, ciano, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- 20 R<sup>34</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>34</sup> representa de modo muy particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, difluorometilo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- R<sup>34</sup> representa de modo especialmente preferente amino, metilamino, dimetilamino, metilo o trifluorometilo.
- 25 R<sup>35</sup> representa preferentemente flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>35</sup> representa de modo particularmente preferente flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- 30 R<sup>35</sup> representa de modo muy particularmente preferente flúor, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- R<sup>35</sup> representa de modo especialmente preferente metilo, trifluorometilo o difluorometilo.
- R<sup>36</sup> representa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)amino, ciano, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- 35 R<sup>36</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>36</sup> representa de modo muy particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, difluorometilo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- R<sup>36</sup> representa de modo especialmente preferente amino, metilamino, dimetilamino, metilo o trifluorometilo.
- 40 R<sup>37</sup> representa preferentemente flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>37</sup> representa de modo particularmente preferente flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>37</sup> representa de modo muy particularmente preferente flúor, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- 45 R<sup>37</sup> representa de modo especialmente preferente metilo, trifluorometilo o difluorometilo.

- R<sup>38</sup> representa preferentemente flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>38</sup> representa de modo particularmente preferente flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluoroclorometilo o tricloroetilo.
- 5 R<sup>38</sup> representa de modo muy particularmente preferente flúor, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- R<sup>39</sup> representa preferentemente hidrógeno, metilo o etilo.
- R<sup>39</sup> representa de modo particularmente preferente metilo.
- R<sup>40</sup> representa preferentemente flúor, cloro, bromo, metilo o etilo.
- 10 R<sup>40</sup> representa de modo particularmente preferente flúor, cloro o metilo.
- R<sup>41</sup> representa preferentemente metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>41</sup> representa de modo particularmente preferente metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>41</sup> representa de modo muy particularmente preferente metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- 15 R<sup>41</sup> representa de modo especialmente preferente metilo o trifluorometilo.
- R<sup>42</sup> representa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>42</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo o trifluorometilo.
- R<sup>43</sup> representa preferentemente flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- 20 R<sup>43</sup> representa de modo particularmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- R<sup>43</sup> representa de modo muy particularmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- 25 R<sup>44</sup> representa preferentemente hidrógeno, metilo, etilo, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, hidroximetilo, hidroxietilo, metilsulfonilo o dimetilaminosulfonilo.
- R<sup>44</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, trifluorometilo, metoximetilo, etoximetilo, hidroximetilo o hidroxietilo.
- 30 R<sup>44</sup> representa de modo muy particularmente preferente metilo o metoximetilo.
- R<sup>45</sup> representa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>45</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.
- 35 R<sup>45</sup> representa de modo muy particularmente preferente hidrógeno o metilo.
- R<sup>46</sup> representa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>46</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo.
- 40 R<sup>46</sup> representa de modo muy particularmente preferente hidrógeno, metilo, difluorometilo o trifluorometilo.
- R<sup>47</sup> representa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo.
- R<sup>47</sup> representa de modo particularmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo o trifluorometilo.
- R<sup>47</sup> representa de modo muy particularmente preferente hidrógeno.

R<sup>48</sup> representa preferentemente metilo, etilo, n-propilo o iso-propilo.

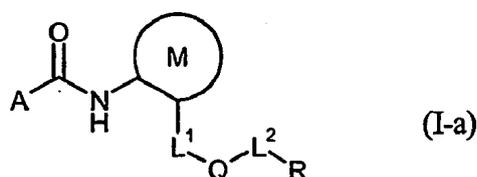
R<sup>48</sup> representa de modo particularmente preferente metilo o etilo.

Son preferentes los compuestos de la fórmula (I) en la que todos los restos tienen respectivamente los significados preferentes indicados anteriormente.

- 5 Son particularmente preferentes los compuestos de la fórmula (I) en la que todos los restos tienen respectivamente los significados particularmente preferentes indicados anteriormente.

Preferentemente y respectivamente como cantidad parcial de los compuestos de la fórmula (I) mencionados anteriormente se entiende los grupos siguientes de carboxamidas nuevas:

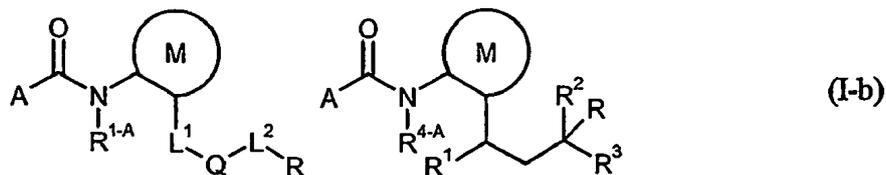
Grupo 1: Carboxamidas de la fórmula (I-a)



10

en la que M, L<sup>1</sup>, Q, L<sup>2</sup>, R y A tienen los significados indicados anteriormente.

Grupo 2: Carboxamidas de la fórmula (I-b)



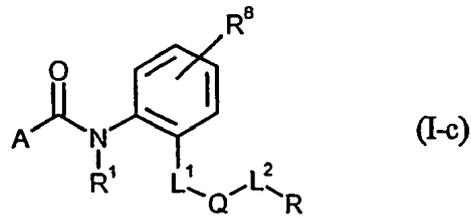
en la que R<sup>1-A</sup>, M, L<sup>1</sup>, Q, L<sup>2</sup>, R y A tienen los significados indicados anteriormente.

- 15 R<sup>1-A</sup> representa preferentemente alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinilo, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; formilo, formil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>; halogeno-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halogeno-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> con, respectivamente, 1 a 13 átomos de flúor, cloro y/o bromo; (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo; (halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (halogeno-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonilo, (halogenocicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; o -C(=O)C(=O)R<sup>2</sup>, -CONR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> o -CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>.

- 25 R<sup>1-A</sup> representa de modo particularmente preferente metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o iso-propilsulfinilo, n-, iso-, sec- o terc-butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o iso-propilsulfonilo, n-, iso-, sec- o terc-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, trifluorometilo, triclorometilo, trifluoroetilo, difluorometilitio, difluoroclorometilitio, trifluorometilitio, trifluorometilsulfinilo, trifluorometilsulfonilo, trifluorometoximetilo; formilo, -CH<sub>2</sub>-CHO, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CHO, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CCl<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CCl<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, iso-propilcarbonilo, terc-butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, terc-butoxicarbonilo, ciclopropilcarbonilo; trifluorometilcarbonilo, trifluorometoxicarbonilo; o -C(=O)C(=O)R<sup>2</sup>, -CONR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> o -CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>.

- 35 R<sup>1-A</sup> representa de modo muy particularmente preferente metilo, metoximetilo, formilo, -CH<sub>2</sub>-CHO, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CHO, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, -C(=O)CHO, -C(=O)C(=O)CH<sub>3</sub>, -C(=O)C(=O)CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>, -C(=O)CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, -C(=O)CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>.

Grupo 3: Carboxamidas de la fórmula (I-c)



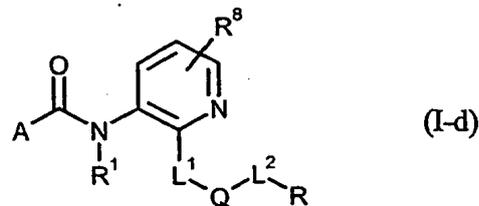
en la que R<sup>1</sup>, R<sup>8</sup>, L<sup>1</sup>, Q, L<sup>2</sup>, R y A tienen los significados indicados anteriormente.

Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-c) en la que R<sup>1</sup> representa hidrógeno.

5 Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-c) en la que R<sup>8</sup> representa hidrógeno.

Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-c) en la que R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup> representan respectivamente hidrógeno.

Grupo 4: Carboxamidas de la fórmula (I-d)



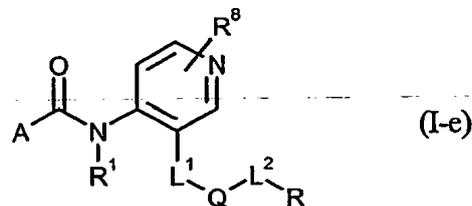
en la que R<sup>1</sup>, R<sup>8</sup>, L<sup>1</sup>, Q, L<sup>2</sup>, R y A tienen los significados indicados anteriormente.

10 Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-d) en la que R<sup>1</sup> representa hidrógeno.

Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-d) en la que R<sup>8</sup> representa hidrógeno.

Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-d) en la que R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup> representan respectivamente hidrógeno.

Grupo 5: Carboxamidas de la fórmula (I-e)



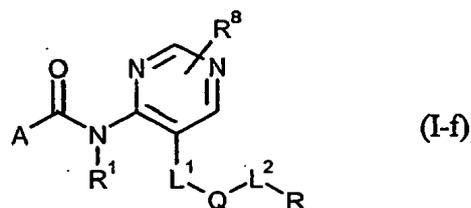
15 en la que R<sup>1</sup>, R<sup>8</sup>, L<sup>1</sup>, Q, L<sup>2</sup>, R y A tienen los significados indicados anteriormente.

Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-e) en la que R<sup>1</sup> representa hidrógeno.

Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-e) en la que R<sup>8</sup> representa hidrógeno.

Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-e) en la que R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup> representan respectivamente hidrógeno.

Grupo 6: Carboxamidas de la fórmula (I-f)



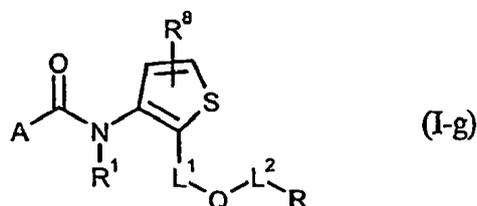
en la que R<sup>1</sup>, R<sup>8</sup>, L<sup>1</sup>, Q, L<sup>2</sup>, R y A tienen los significados indicados anteriormente.

Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-f) en la que R<sup>1</sup> representa hidrógeno.

Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-f) en la que R<sup>8</sup> representa hidrógeno.

- 5 Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-f) en la que R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup> representan respectivamente hidrógeno.

Grupo 7: Carboxamidas de la fórmula (I-g)



en la que R<sup>1</sup>, R<sup>8</sup>, L<sup>1</sup>, Q, L<sup>2</sup>, R y A tienen los significados indicados anteriormente.

Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-g) en la que R<sup>1</sup> representa hidrógeno.

- 10 Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-g) en la que R<sup>8</sup> representa hidrógeno.

Son preferentes carboxamidas de la fórmula (I-g) en la que R<sup>1</sup> y R<sup>8</sup> representan respectivamente hidrógeno.

Son destacados los compuestos de la fórmula (I) (y también los grupos 1 a 7) en la que R<sup>1</sup> representa hidrógeno.

Son destacados los compuestos de la fórmula (I) (y también los grupos 1 a 7) en la que R<sup>1</sup> representa formilo.

- 15 También son destacados los compuestos de la fórmula (I) (y también los grupos 1 a 7) en la que R<sup>1</sup> representa -C(=O)C(=O)R<sup>2</sup>, teniendo R<sup>2</sup> los significados indicados anteriormente.

Los restos de hidrocarburo saturados o insaturados tales como alquilo o alquenilo pueden ser, también en compuestos con heteroátomos, como por ejemplo en alcoxi, siempre que sea posible, respectivamente, de cadena lineal o ramificados. También pueden ser los restos hidrocarburo enlazados doblemente tales como alquilenos (alcanodiilo), siempre que sea posible, de cadena lineal o ramificados.

- 20 Los restos dado el caso sustituidos pueden estar sustituidos una o varias veces, pudiendo ser los sustituyentes en sustituciones múltiples iguales o distintos. De este modo, la definición dialquilamino incluye también un grupo amino sustituido con alquilo de forma asimétrica, tal como, por ejemplo, metil-etilamino.

Los restos sustituidos con halógeno, tales como, por ejemplo, halogenoalquilo, están halogenados una o más veces. En el caso de halogenación múltiple, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes. A este respecto,

- 25 halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo, en particular flúor, cloro y bromo.

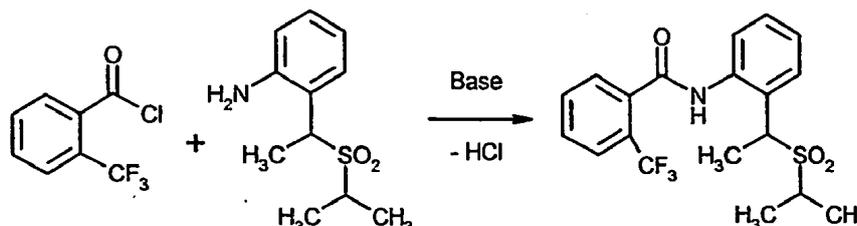
Las definiciones o explicaciones de restos indicadas anteriormente indicadas en general o en los intervalos de preferencia pueden combinarse discrecionalmente entre los intervalos y los intervalos de preferencia respectivos. Tienen validez para los productos finales, así como para los precursores y productos intermedios correspondientes. En particular, los compuestos mencionados en los grupos 1 a 6 pueden combinarse tanto con las definiciones

generales como también con las preferentes o particularmente preferentes, siendo posible también aquí respectivamente todas las combinaciones entre los intervalos de preferencia.

**Descripción de los procedimientos según la invención para preparar las hexilcarboxanilidas de la fórmula (I), así como los productos intermedios**

5 **Procedimiento (a)**

Se usa cloruro de ácido 2-trifluorometilbenzoico y {2-[1-(isopropilsofonil)etil]fenil}-amina como materiales de partida, de modo que el procedimiento (a) según la invención puede ilustrarse con el esquema de fórmulas siguiente:



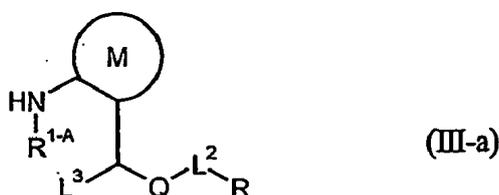
10 Los derivados de ácidos carboxílicos necesarios como materiales de partida para la realización del procedimiento (a) según la invención se definen, en general, por medio de la fórmula (II) En esta fórmula (II), A tiene preferentemente, de modo particularmente preferente o de modo muy particularmente preferente las definiciones que ya se han indicado en el contexto de la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferentes, particularmente preferentes o muy particularmente preferentes para A. X<sup>1</sup> representa preferentemente cloro, bromo o hidroxilo.

15 Los derivados de ácido carboxílico de la fórmula (I) son conocidos en su mayor parte y/o pueden prepararse mediante procedimientos conocidos (véanse los documentos WO 93/11117 , EP-A 0 545 099 , EP-A 0 589 301 y EP-A 0 589 313 ).

20 Los derivados de anilina necesarios también como materiales de partida para la realización del procedimiento (a) según la invención se definen, en general, por medio de la fórmula (III) En esta fórmula (III), R<sup>1</sup>, M, Q, L<sup>2</sup> y R tienen preferentemente, de modo particularmente preferente o de modo muy particularmente preferente las definiciones que ya se han indicado en el contexto de la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferentes, particularmente preferentes o muy particularmente preferentes para estos restos. L<sup>3</sup> representa preferente hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>, de modo particularmente preferente hidrógeno o metilo.

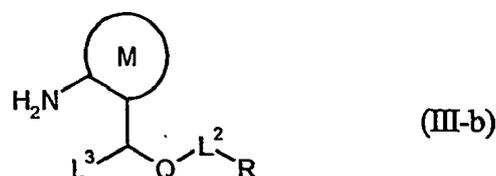
Los derivados de anilina de la fórmula (III) son nuevos.

25 Los derivados de anilina de la fórmula (III-a)

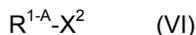


en la que R<sup>1-A</sup>, M, Q, L<sup>2</sup>, R y L<sup>3</sup> tienen los significados indicados anteriormente, se obtienen haciendo reaccionar

(d) derivados de anilina de la fórmula (III-b)



en la que M, Q, L<sup>2</sup>, R y L<sup>3</sup> tienen los significados indicados anteriormente,  
con halogenuros de la fórmula (VI)

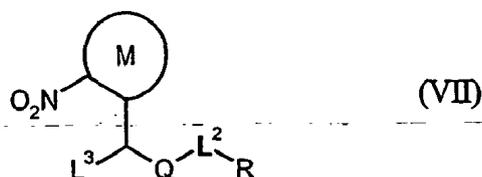


en la que R<sup>1-A</sup> y X<sup>2</sup> tienen los significados indicados anteriormente,

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

Los derivados de anilina de la fórmula (III-b) se obtienen haciendo reaccionar

(e) un nitrocompuesto de la fórmula (VII)



en la que M, Q, L<sup>2</sup>, R y L<sup>3</sup> tienen los significados indicados anteriormente,

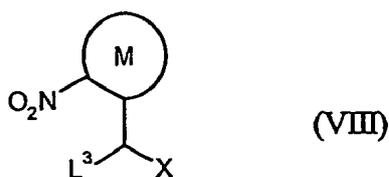
10 en presencia de un metal y un reductor, así como dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de otro coadyuvante de reacción.

Los nitrocompuestos necesarios como materiales de partida para la realización del procedimiento (a) según la invención se definen, en general, por medio de la fórmula (VII) En esta fórmula (VII), M, Q, L<sup>2</sup>, R y L<sup>3</sup> tienen preferentemente, de modo particularmente preferente o de modo muy particularmente preferente las definiciones que ya se han indicado en el contexto de la descripción de los compuestos de la fórmula (I) o la fórmula (III) según la invención como preferentes, particularmente preferentes o muy particularmente preferentes para estos restos.

15

Los nitrocompuestos de la fórmula (VII) se obtienen haciendo reaccionar

(f) un nitrocompuesto de la fórmula (VIII)



20 en la que

M y L<sup>3</sup> tienen los significados indicados anteriormente,

X representa cloro, bromo o yodo,

con un compuesto de la fórmula (IX)



25 en la que Q, L<sup>1</sup> y R tienen los significados indicados anteriormente,

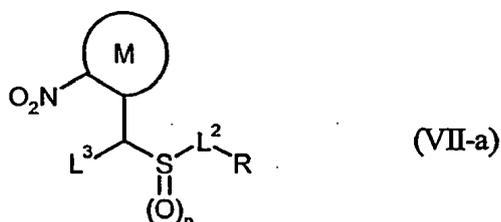
en presencia de una base y dado el caso en presencia de un diluyente.

5 Los nitrocompuestos necesarios como materiales de partida para la realización del procedimiento (f) según la invención se definen, en general, por medio de la fórmula (VIII) En esta fórmula (VIII), M y L<sup>3</sup> tienen preferentemente, de modo particularmente preferente o de modo muy particularmente preferente las definiciones que ya se han indicado en el contexto de la descripción de los compuestos de la fórmula (I) o la fórmula (III) según la invención como preferentes, particularmente preferentes o muy particularmente preferentes para estos restos. X representa preferentemente cloro.

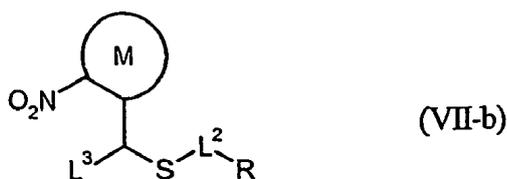
10 Los compuestos necesarios también como materiales de partida para la realización del procedimiento (f) según la invención se definen, en general, por medio de la fórmula (IX) En esta fórmula (IX), Q, L<sup>2</sup> y R tienen preferentemente, de modo particularmente preferente o de modo muy particularmente preferente las definiciones que ya se han indicado en el contexto de la descripción de los compuestos de la fórmula (I) o la fórmula (III) según la invención como preferentes, particularmente preferentes o muy particularmente preferentes para estos restos.

Los compuestos de la fórmula (IX) son conocidos o pueden obtenerse según procedimientos conocidos.

Los nitrocompuestos de la fórmula (VII-a)



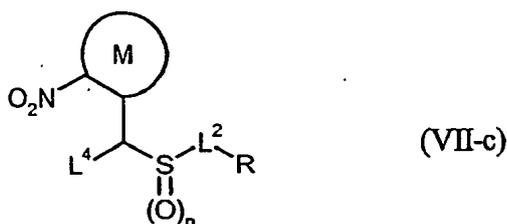
15 en la que  
M, L<sup>2</sup>, R y L<sup>3</sup> tienen los significados indicados anteriormente,  
N representa 1 o 2,  
se obtienen haciendo reaccionar  
(g) un nitrocompuesto de la fórmula (VII-b)



20 en la que M, L<sup>2</sup>, R y L<sup>3</sup> tienen los significados indicados anteriormente,

en presencia de un oxidante, así como dado el caso en presencia de un diluyente y dado el caso en presencia de otro coadyuvante de reacción.

Los nitrocompuestos de la fórmula (VII-c)



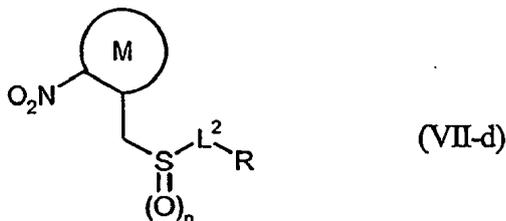
25 en la que

M, L<sup>2</sup>, R y n tienen los significados indicados anteriormente,

L<sup>4</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>, preferentemente alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>, de modo particularmente preferente metilo,

se obtienen haciendo reaccionar

(h) un nitrocompuesto de la fórmula (VII-d)



5

en la que M, L<sup>2</sup>, R y n tienen los significados indicados anteriormente,

con halogenuros de la fórmula (X)



10

en la que L<sup>4</sup> y X<sup>2</sup> tienen los significados indicados anteriormente,

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

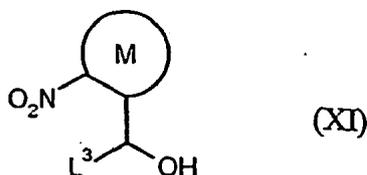
Los halogenuros de la fórmula (X) son conocidos.

15

Los compuestos de las fórmulas (VII-a), (VII-b), (VII-c) y (VII-d) son subgrupos de los nitrocompuestos de la fórmula (VII) y están comprendidos en la descripción general de estos compuestos. Las definiciones preferentes, particularmente preferentes, etc. tienen validez en este caso de forma correspondiente.

Los nitrocompuestos de la fórmula (VIII) se obtienen hidrogenando

(j) derivados hidroxílicos de la fórmula (XI)



20

en la que M y L<sup>3</sup> tienen los significados indicados anteriormente,

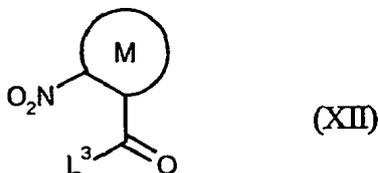
dado el caso en presencia de un diluyente, dado el caso en presencia de un aceptor de ácidos y dado el caso en presencia de un catalizador.

25

Los derivados hidroxílicos necesarios como materiales de partida para la realización del procedimiento (j) según la invención se definen, en general, por medio de la fórmula (XI). En esta fórmula (XI), M y L<sup>3</sup> tienen preferentemente, de modo particularmente preferente o de modo muy particularmente preferente las definiciones que ya se han indicado en el contexto de la descripción de los compuestos de la fórmula (I) o la fórmula (III) según la invención como preferentes, particularmente preferentes o muy particularmente preferentes para estos restos.

Los derivados hidroxílicos de la fórmula (XI) se obtienen haciendo reaccionar

(k) compuestos aromáticos acrilados de la fórmula (XII)



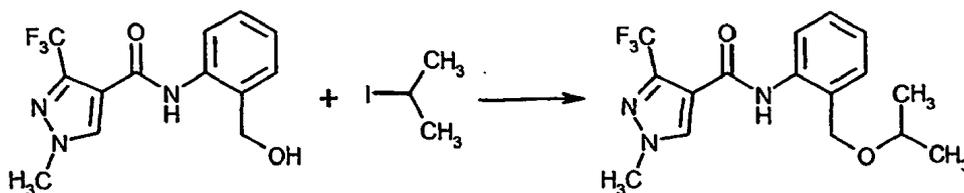
en la que M y L<sup>3</sup> tienen los significados indicados anteriormente,

- 5 en presencia de un reductor, así como dado el caso en presencia de un diluyente, dado el caso en presencia de un ácido y dado el caso en presencia de un catalizador.

Los derivados de anilina de la fórmula (III) también pueden obtenerse de modo análogo a procedimientos conocidos (véase el documento EP-A 0 737 682).

#### Procedimiento (b)

- 10 Si se usan N-[2-(hidroximetil)fenil]-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida y 2-yodopropano como materiales de partida, el procedimiento (b) según la invención puede ilustrarse mediante el esquema de fórmulas siguiente:

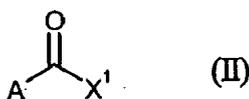


- 15 Las carboxamidas necesarias como materiales de partida para la realización del procedimiento (b) según la invención se definen, en general, por medio de la fórmula (IV) En esta fórmula (IV), M, L<sup>1</sup>, Q y A tienen preferentemente, de modo particularmente preferente o de modo muy particularmente preferente las definiciones que ya se han indicado en el contexto de la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferentes, particularmente preferentes o muy particularmente preferentes para A.

- 20 Los compuestos necesarios también como materiales de partida para la realización del procedimiento (b) según la invención se definen, en general, por medio de la fórmula (V) En esta fórmula (V), L<sup>2</sup> y R tienen preferentemente, de modo particularmente preferente o de modo muy particularmente preferente las definiciones que ya se han indicado en el contexto de la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferentes, particularmente preferentes o muy particularmente preferentes para A. Y representa preferentemente cloro, bromo, yodo, triflato (trifluorometilsulfonilo), mesilato (metilsulfonilo) o tosilato (4-metilfenilsulfonilo), de modo particularmente preferente bromo, yodo o triflato (trifluorometilsulfonilo).

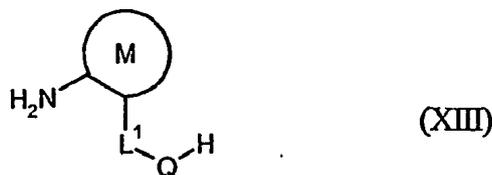
Los compuestos de la fórmula (V) son conocidos o pueden obtenerse según procedimientos conocidos. Las carboxamidas de la fórmula (IV) son nuevas. Se obtienen haciendo reaccionar

(m) derivados de ácido carboxílico de la fórmula (II)



- 30 en la que  
A tiene los significados indicados anteriormente y  
X<sup>1</sup> representa halógeno o hidroxilo,

con derivados de anilina de la fórmula (XIII)



en la que M, L<sup>1</sup> y Q tienen los significados indicados anteriormente,

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

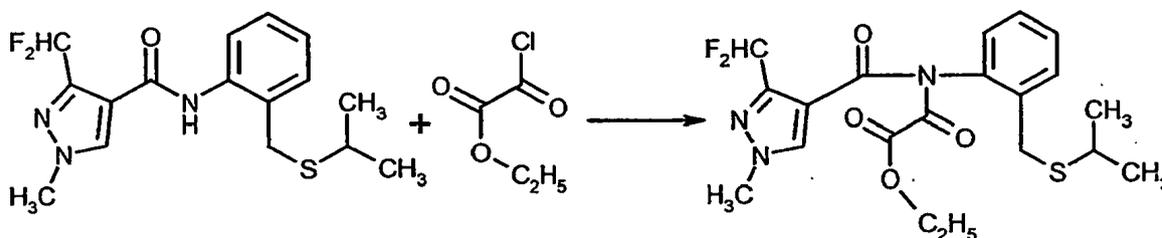
Los derivados de ácido carboxílico de la fórmula (II) necesarios como materiales de partida para la realización del procedimiento (m) según la invención ya se han descrito en el contexto con el procedimiento (a) según la invención.

10 Los derivados de anilina necesarios también como materiales de partida para la realización del procedimiento (m) según la invención se definen, en general, por medio de la fórmula (XIII) En esta fórmula (XIII), M, L<sup>1</sup> y Q tienen preferentemente, de modo particularmente preferente o de modo muy particularmente preferente las definiciones que ya se han indicado en el contexto de la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferentes, particularmente preferentes o muy particularmente preferentes para estos restos.

Los derivados de anilina de la fórmula (XIII) son conocidos o pueden obtenerse según procedimientos conocidos.

#### Procedimiento (c)

15 Si se usan 3-(difluorometil)-N-{2-[(isopropiltio)metil]fenil}-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y cloro(oxo)acetato de etilo como materiales de partida, puede ilustrarse el proceso del procedimiento (c) según la invención mediante el esquema de fórmulas siguiente:



20 Las hexilcarboxanilidas necesarias como materiales de partida para la realización del procedimiento (c) según la invención se definen, en general, por medio de la fórmula (I-a) En esta fórmula (I-a), M, L<sup>1</sup>, Q, L<sup>2</sup>, R y A tienen preferentemente, de modo particularmente preferente o de modo muy particularmente preferente las definiciones que ya se han indicado en el contexto de la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferentes, particularmente preferentes o muy particularmente preferentes para estos restos.

25 Las hexilcarboxanilidas de la fórmula (I-a) también son compuestos según la invención y objeto de la presente solicitud. Pueden obtenerse según el procedimiento (a) según la invención (con R<sup>1</sup> = hidrógeno).

30 Los halogenuros necesarios también como materiales de partida para la realización del procedimiento (c) según la invención se definen, en general, por medio de la fórmula (VI) En esta fórmula (VI), R<sup>1-A</sup> tiene preferentemente, de modo particularmente preferente o de modo muy particularmente preferente las definiciones que ya se han indicado en el contexto de la descripción de los compuestos de fórmula (I-b) según la invención como preferentes, particularmente preferentes o muy particularmente preferentes para este resto. X<sup>2</sup> representa preferentemente cloro o bromo.

Los halogenuros de la fórmula (VI) son conocidos.

#### Condiciones de reacción

5 Como diluyentes para la realización de los procedimientos (a) y (m) según la invención se consideran todos los disolventes orgánicos inertes. A los mismos pertenecen preferentemente hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos tales como, por ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados tales como, por ejemplo, clorobenzoilo, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-terc-butiléter, metil-terc-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol o amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico.

10 Los procedimientos (a) y (m) según la invención se llevan a cabo dado el caso en presencia de un aceptor de ácidos adecuado. Como tales se consideran todas las bases inorgánicas u orgánicas habituales. A los mismos pertenecen preferentemente hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrogenocarbonatos de metales alcalinotérreos y alcalinos, tales como, por ejemplo, hidruro de sodio, amida de sodio, metilato de sodio, etilato de sodio, terc-butilato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de amonio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, acetato de amonio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio o carbonato de amonio, así como aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

20 Los procedimientos (a) y (m) según la invención se llevan a cabo dado el caso en presencia de un agente de condensación adecuado. Como tales se consideran todos los agentes de condensación que se pueden usar habitualmente para reacciones de amidación de este tipo. Se pueden mencionar, por ejemplo, formadores de halogenuros de ácidos tales como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, oxiclorigenuro de fósforo, cloruro de oxalilo o cloruro de tionilo; formadores de anhídridos tales como éster etílico del ácido clorofórmico, éster metílico del ácido clorofórmico, éster propílico del ácido clorofórmico, éster butílico del ácido clorofórmico o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas, tales como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes de condensación habituales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonildiimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetracloruro de carbono o hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidinofosfonio.

30 Los procedimientos (a) y (m) según la invención se llevan a cabo dado el caso en presencia de un catalizador. Se pueden mencionar, por ejemplo, 4-dimetilaminopiridina, 1-hidroxi-benzotriazol o dimetilformamida.

Las temperaturas de reacción pueden variar en la realización de los procedimientos (a) y (m) según la invención dentro de un intervalo amplio. En general se opera a temperaturas de 0 °C a 150 °C, preferentemente a temperaturas de 0 °C a 80 °C.

35 Para la realización del procedimiento según la invención (a) para la preparación de compuestos de la fórmula (I) se usan por mol del derivado de ácido carboxílico de la fórmula (II), en general, de 0,2 a 5 mol, preferentemente de 0,5 a 2 mol de derivado de anilina de la fórmula (III).

Para la realización del procedimiento según la invención (m) para la preparación de compuestos de la fórmula (V) se usan por mol del derivado de ácido carboxílico de la fórmula (II), en general, de 0,2 a 5 mol, preferentemente de 0,5 a 2 mol de derivado de anilina de la fórmula (XIII).

40 Como diluyentes para la realización de los procedimientos (b), (c), (d) y (h) según la invención se consideran todos los disolventes orgánicos inertes. A los mismos pertenecen preferentemente hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como, por ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados tales como, por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-terc-butiléter, metil-terc-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol o amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico.

50 Los procedimientos (b), (c), (d) y (h) según la invención se llevan a cabo en presencia de una base. Como tales se consideran todas las bases inorgánicas u orgánicas habituales. A las mismas pertenecen preferentemente hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrogenocarbonatos de metales alcalinotérreos y alcalinos, tales como, por ejemplo, hidruro de sodio, amida de sodio, metilato de sodio, etilato de sodio, terc-butilato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de amonio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, acetato de amonio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio o carbonato de cesio, así como aminas terciarias, tales como trimetilamina,

trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

5 Las temperaturas de reacción pueden variar en la realización de los procedimientos (b), (c), (d) y (h) según la invención dentro de un intervalo amplio. En general se opera a temperaturas de 0 °C a 150 °C, preferentemente a temperaturas de 20 °C a 110 °C.

Para la realización del procedimiento (b) según la invención para la preparación de compuestos de la fórmula (I) se usan por mol de la carboxamida de la fórmula (IV), en general, de 0,2 a 5 mol, preferentemente de 0,5 a 2 mol de un compuesto de la fórmula (V).

10 Para la realización del procedimiento (c) según la invención para la preparación de compuestos de la fórmula (I) se usan por mol de la hexilcarboxanilida de la fórmula (I-a), en general, de 0,2 a 5 mol, preferentemente de 0,5 a 2 mol de un halogenuro de la fórmula (VI).

Para la realización del procedimiento (d) según la invención para la preparación de compuestos de la fórmula (III-a) se usan por mol del derivado de anilina de la fórmula (III-b), en general, de 0,2 a 5 mol, preferentemente de 0,5 a 2 mol de derivado de halogenuro de la fórmula (VI).

15 Para la realización del procedimiento (h) según la invención para la preparación de compuestos de la fórmula (VII-c) se usan por mol de un nitrocompuesto de la fórmula (VII-d), en general, de 0,2 a 5 mol, preferentemente de 0,5 a 2 mol de halogenuro de la fórmula (X).

20 Como diluyentes para la realización del procedimiento (e) según la invención se consideran todos los disolventes orgánicos inertes. A los mismos pertenecen preferentemente hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como, por ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-terc-butiléter, metil-terc-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico, sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido; sulfonas, tales como sulfolano; alcoholes, tales como metanol, etanol, n- o iso-propanol, n-, iso-, sec- o terc-butanol, etanodiol, propano-1,2-diol, etoxietanol, metoxietanol, dietilenglicolmonometiléter, dietilenglicolmonoetiléter, trietilenglicol, sus mezclas con agua o agua pura.

30 El procedimiento (e) según la invención se lleva a cabo en presencia de un metal. Como tales se consideran preferentemente metales de transición, tales como, por ejemplo, paladio, platino, rodio, níquel (níquel Raney), hierro, cobalto, rutenio, iridio, cinc u osmio. Los metales pueden estar unidos, dado el caso, a materiales de soporte, tales como, por ejemplo, carbón, resinas, ceolitas, sulfatos alcalinos o alcalinotérreos.

El procedimiento (e) según la invención se lleva a cabo en presencia de un reductor. Como tales se consideran preferentemente hidrógeno elemental, sales de formiato, preferentemente sales de formiato de alquilo, tales como, por ejemplo: formiato de sodio, pero también formiato de amonio o también hidruros metálicos o hidruros metálicos complejos, tales como, por ejemplo, hidruro de aluminio y litio, borohidruro de sodio.

35 El procedimiento (e) según la invención se lleva a cabo en presencia de ácidos. Como tales se consideran preferentemente ácidos orgánicos, tales como, por ejemplo, ácido fórmico, ácido acético, ácido ascórbico, pero también ácidos minerales, tales como, por ejemplo ácido clorhídrico o ácido sulfúrico.

40 El procedimiento (e) según la invención se lleva a cabo en presencia de bases. Como tales se consideran preferentemente bases orgánicas, tales como, por ejemplo, piridina, pero también soluciones acuosas de hidróxidos de metales alcalinos y alcalinotérreos, tales como, por ejemplo, hidróxido de sodio o hidróxido de bario.

Las temperaturas de reacción pueden variar en la realización del procedimiento (e) según la invención dentro de un intervalo amplio. En general se opera a temperaturas de -80 °C a 300 °C, preferentemente a temperaturas de 0°C a 200 °C.

45 En caso de usar hidrógeno elemental, el procedimiento (e) según la invención se lleva a cabo a una presión de hidrógeno de entre 50 y 20000 kPa, preferentemente de entre 100 y 10000 kPa.

Para la realización del procedimiento (e) según la invención para la preparación de compuestos de la fórmula (III-b) se usan por mol de un nitrocompuesto de la fórmula (VII), en general, de 0,8 a 1000 mol, preferentemente de 1 a 500 mol de reductor (formiato de amonio, hidruro, etc.).

5 Como diluyentes para la realización del procedimiento (f) según la invención se consideran todos los disolventes orgánicos inertes. A los mismos pertenecen preferentemente hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos tales como, por ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados tales como, por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-terc-butiléter, metil-terc-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol o amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico.

10 El procedimiento (f) según la invención se lleva a cabo en presencia de una base. Como tales se consideran todas las bases inorgánicas u orgánicas habituales. A las mismas pertenecen preferentemente hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrogenocarbonatos de metales alcalinotérreos y alcalinos, tales como, por ejemplo, hidruro de sodio, amida de sodio, metilato de sodio, etilato de sodio, terc-butilato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de amonio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, acetato de amonio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio  
15 o carbonato de cesio, así como aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

20 Las temperaturas de reacción pueden variar en la realización del procedimiento (f) según la invención dentro de un intervalo amplio. En general se opera a temperaturas de 0 °C a 200 °C, preferentemente a temperaturas de 20 °C a 150 °C.

Para la realización del procedimiento (f) según la invención para la preparación de compuestos de la fórmula (VII) se usan por mol de un nitrocompuesto de la fórmula (VIII), en general, de 0,2 a 5 mol, preferentemente de 0,5 a 2 mol de un compuesto de la fórmula (IX).

25 Como diluyentes para la realización del procedimiento (g) según la invención se consideran todos los disolventes orgánicos inertes. A los mismos pertenecen preferentemente hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos tales como, por ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-terc-butiléter, metil-terc-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico; sulfóxidos, tales como dimetilsulfóxido, sulfonas, tales como sulfolano.  
30

35 El procedimiento (g) según la invención se lleva a cabo en presencia de un oxidante. Como tales se consideran todos los oxidantes orgánicos e inorgánicos, preferentemente oxígeno elemental, ozono, peróxidos, tales como, por ejemplo, peróxido de hidrógeno, ácido m-cloroperbenzoico, peróxido de benzoílo, peróxido de terc-butilo; lejía de cloro (hipoclorito de sodio); sales de cromo tales como óxido de cromo(VI), ácido crómico, dicromato de sodio, clorocromato de piridinio; sales de manganeso tales como, por ejemplo, permanganato de potasio, dióxido de manganeso; dióxido de selenio; yodatos y peryodatos; peroxodisulfato de potasio.

El procedimiento (g) según la invención puede llevarse a cabo en presencia de ácidos. Como tales se consideran preferentemente ácidos orgánicos, tales como, por ejemplo, ácido fórmico, ácido acético, ácido ascórbico, pero también ácidos minerales, tales como, por ejemplo ácido clorhídrico o ácido sulfúrico.

40 El procedimiento (g) según la invención puede llevarse a cabo en presencia de bases. Como tales se consideran preferentemente bases orgánicas, tales como, por ejemplo, piridina, pero también soluciones acuosas de hidróxidos de metales alcalinos y alcalinotérreos, tales como, por ejemplo, hidróxido de sodio o hidróxido de bario.

45 Las temperaturas de reacción pueden variar en la realización del procedimiento (g) según la invención dentro de un intervalo amplio. En general se opera a temperaturas de -80 °C a 300 °C, preferentemente a temperaturas de -20 °C a 100 °C.

Para la realización del procedimiento (g) según la invención para la preparación de compuestos de la fórmula (VII-a) se usan por mol de un nitrocompuesto de la fórmula (VII-b), en general, de 0,6 a 10 mol, preferentemente de 0,8 a 5 mol de oxidante.

50 Como diluyentes para la realización del procedimiento (j) según la invención se consideran todos los disolventes orgánicos inertes. A los mismos pertenecen preferentemente hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos tales como, por ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados tales como, por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano,

cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-terc-butiléter, metil-terc-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol o amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico.

5 El procedimiento (j) según la invención se lleva a cabo dado el caso en presencia de un aceptor de ácidos adecuado. Como tales se consideran todas las bases inorgánicas u orgánicas habituales. A las mismas pertenecen preferentemente hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o hidrogenocarbonatos de metales alcalinotérreos y alcalinos, tales como, por ejemplo, hidruro de sodio, amida de sodio, metilato de sodio, etilato de sodio, terc-butilato de potasio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de amonio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, acetato de amonio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio o carbonato de amonio, así como aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

15 El procedimiento (j) según la invención se lleva a cabo dado el caso en presencia de un agente de halogenación adecuado. Como tales se consideran todos los agentes de halogenación que se pueden usar habitualmente para reacciones de halogenación de este tipo. Se pueden mencionar, por ejemplo, formadores de halogenuros tales como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, oxiclururo de fósforo, cloruro de oxalilo o cloruro de tionilo; formadores de anhídridos tales como éster etílico del ácido clorofórmico, éster metílico del ácido clorofórmico, éster propílico del ácido clorofórmico, éster butílico del ácido clorofórmico o cloruro de metanosulfonilo; u otros agentes de condensación habituales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonildiimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetracloruro de carbono o hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidinofosfonio.

25 El procedimiento (j) según la invención se lleva a cabo en presencia de un catalizador. Se pueden mencionar, por ejemplo, 4-dimetilaminopiridina, 1-hidroxi-benzotriazol o dimetilformamida.

Las temperaturas de reacción pueden variar en la realización del procedimiento (j) según la invención dentro de un intervalo amplio. En general se opera a temperaturas de 0 °C a 200 °C, preferentemente a temperaturas de 0 °C a 150 °C.

30 Para la realización del procedimiento (j) según la invención para la preparación de compuestos de la fórmula (VIII) se usan por mol de un derivado hidroxílico de la fórmula (XI), en general, de 0,2 a 10 mol, preferentemente de 0,5 a 5 mol de agente de halogenación.

35 Como diluyentes para la realización del procedimiento (k) según la invención se consideran todos los disolventes orgánicos inertes. A los mismos pertenecen preferentemente hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos tales como, por ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados tales como, por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-terc-butiléter, metil-terc-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol o amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico; alcoholes, tales como metanol, etanol, iso-propanol.

40 El procedimiento (k) según la invención se lleva a cabo en presencia de un reductor adecuado. Como tales se consideran todos los reductores inorgánicos u orgánicos habituales. A los mismos pertenecen preferentemente hidruros de metales alcalinotérreos o alcalinos, tales como, por ejemplo, hidruro de sodio o hidruros complejos, tales como, por ejemplo, hidruro de aluminio y litio, borohidruro de sodio, cianoborohidruro de sodio, hidruro de diisobutilaluminio, borano, diborano o complejos de borano, tales como, por ejemplo, borano-piridina, silanos, tales como, por ejemplo, trietilsilano, metales, tales como, por ejemplo, sodio, litio, cinc, hierro o hidrógeno.

50 El procedimiento (k) según la invención se lleva a cabo dado el caso en presencia de un ácido o ácido de Lewis adecuado. Como tales se consideran todos los ácidos/ácidos de Lewis que se pueden usar habitualmente para reducciones mediadas por ácidos/ácidos de Lewis de este tipo. Se pueden mencionar, por ejemplo, ácido clorhídrico, ácido trifluoroacético, trifluoruro de boro o trifluoruros de boro complejos, tales como, por ejemplo, eterato de trifluoruro de boro, tricloruro de aluminio, tricloruro de cerio, compuestos inorgánicos u orgánicos de titanio, tales como, por ejemplo, tetracloruro de titanio, tetrakisopropilato de titanio.

El procedimiento (k) según la invención se lleva a cabo dado el caso en presencia de un catalizador. Se pueden mencionar, por ejemplo, metales o sales metálicas, en particular metales de transición o sus sales, tales como, por ejemplo, platino, paladio, níquel (níquel Raney), iridio, rodio, osmio, hierro, rutenio, cobalto. Estos metales o sales

metálicas también pueden, dado el caso, estar unidos a, o soportados por, resinas o superficies o materiales de soporte (por ejemplo carbón).

5 Las temperaturas de reacción pueden variar en la realización del procedimiento (k) según la invención dentro de un intervalo amplio. En general se opera a temperaturas de 0 °C a 200 °C, preferentemente a temperaturas de 0 °C a 150 °C.

En caso de usar hidrógeno como reductor, puede variar el procedimiento (k) según la invención en un intervalo de presiones amplio. En general se opera a presiones de 100 kPa a 30000 kPa, preferentemente de 100 kPa a 10000 kPa.

10 Para la realización del procedimiento (k) según la invención para la preparación de compuestos de la fórmula (XI) se usan por mol de un compuesto aromático acilado de la fórmula (XII), en general, de 0,2 a 10 mol, preferentemente de 0,5 a 5 mol de reductor.

Si no se indica lo contrario, todos los procedimientos según la invención se llevan a cabo, en general, a presión normal. No obstante, también es posible operar a presión aumentada o a presión reducida, en general entre 10 kPa y 1000 kPa.

15 Las sustancias de acuerdo con la invención presentan una acción microbicida potente y pueden usarse para combatir microorganismos no deseados, como hongos y bacterias, en fitoprotección y en protección de materiales.

Los fungicidas pueden usarse en fitoprotección para combatir plasmodioforomicetos, oomicetos, quitridiomicetos, zigomicetos, ascomicetos, basidiomicetos y deuteromicetos.

20 Los bactericidas pueden usarse en fitoprotección para combatir Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae y Streptomyetaceae.

Como ejemplos, pero no limitantes, se pueden mencionar algunos organismos patógenos de enfermedades fúngicas y bacterianas incluidos en los conceptos generales enumerados anteriormente:

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

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

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

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

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

especies de *Pseudoperonospora* tales como, por ejemplo, *Pseudoperonospora humuli* o

*Pseudoperonospora cubensis*;

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

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

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

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

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

35 especies de *Podosphaera* tales como, por ejemplo, *Podosphaera leucotricha*;

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

- especies de *Pyrenophora* tales como, por ejemplo, *Pyrenophora teres* o *P. graminea*  
(forma de conidios: *Drechslera*, Sin: *Helminthosporium*);
- especies de *Cochliobolus* tales como, por ejemplo, *Cochliobolus sativus*  
(forma de conidios: *Drechslera*, Sin: *Helminthosporium*);
- 5 especies de *Uromyces* tales como, por ejemplo, *Uromyces appendiculatus*;  
especies de *Puccinia* tales como, por ejemplo, *Puccinia recondita*;  
especies de *Sclerotinia* tales como, por ejemplo, *Sclerotinia sclerotiorum*;  
especies de *Tilletia* tales como, por ejemplo, *Tilletia caries*;  
especies de *Ustilago* tales como, por ejemplo, *Ustilago nuda* o *Ustilago avenae*;
- 10 especies de *Pellicularia* tales como, por ejemplo, *Pellicularia sasakii*;  
especies de *Pyricularia*, como por ejemplo *Pyricularia oryzae*;  
especies de *Fusarium* tales como, por ejemplo, *Fusarium culmorum*;  
especies de *Botrytis* tales como, por ejemplo, *Botrytis cinerea*;  
especies de *Septoria*, como por ejemplo *Septoria nodorum*;
- 15 especies de *Leptosphaeria* tales como, por ejemplo, *Leptosphaeria nodorum*;  
especies de *Cercospora* tales como, por ejemplo, *Cercospora canescens*;  
especies de *Alternaria* tales como, por ejemplo, *Alternaria brassicae*;  
especies de *Pseudocercospora* tales como, por ejemplo, *Pseudocercospora heipotrichoides*,  
especies de *Rhizoctonia* tales como, por ejemplo, *Rhizoctonia solana*.
- 20 Los principios activos según la invención presentan también una acción potente de fortalecimiento en las plantas. Son, por lo tanto, apropiados para la movilización de fuerzas de defensa presentes en la propia planta contra el ataque de microorganismos no deseados.
- 25 Por sustancias fortalecedoras de plantas (inductores de resistencia) se entiende en el presente contexto aquellas sustancias capaces de estimular el sistema defensivo de las plantas, de tal manera que las plantas tratadas muestran una amplia resistencia contra microorganismos no deseados inoculados tras la aplicación.
- 30 Por microorganismos no deseados se entiende en el presente caso bacterias, hongos y virus fitopatógenos. Las sustancias según la invención pueden usarse también para proteger plantas durante un periodo de tiempo determinado después del tratamiento contra el ataque de los patógenos mencionados. El periodo dentro del cual se proporciona una acción protectora se extiende en general de 1 a 10 días, de modo preferente de 1 a 7 días, tras el tratamiento de las plantas con los principios activos.
- El hecho de que los principios activos, en las concentraciones necesarias para combatir las enfermedades vegetales, sean bien tolerados por las plantas, permite el tratamiento de partes aéreas de las plantas, del material de propagación y de la semilla, y del suelo.

A este respecto se pueden usar los principios activos según la invención, con éxito particularmente bueno, para combatir enfermedades de cereales, como por ejemplo contra especies de *Puccinia* y enfermedades en viticultura, cultivo de frutas y de verduras, como por ejemplo frente a especies de *Botrytis*, *Venturia* o *Alternaria*.

5 Los principios activos según la invención son también adecuados para aumentar el rendimiento de la cosecha. Además, presentan un grado de toxicidad bajo y son bien tolerados por las plantas.

Los principios activos según la invención pueden usarse, dado el caso, en determinadas concentraciones y cantidades de aplicación también como herbicidas, para influir en el crecimiento de las plantas, así como para combatir parásitos animales. Dado el caso, también pueden usarse como intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.

10 Según la invención, pueden tratarse todas las plantas y partes de plantas. Por plantas se entiende, a este respecto, todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (incluidas las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos de biotecnología e ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, incluidas las plantas transgénicas e  
15 incluidas las variedades de plantas que pueden estar o no protegidas por los derechos de obtentor. Por partes de plantas se entiende todas las partes y órganos de las plantas subterráneos y aéreos, tales como brote, hoja, flor y raíz, enumerando a modo de ejemplo hojas, acículas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas, así como raíces, bulbos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también los productos cosechados, así como el material reproductivo vegetativo y generativo, por ejemplo, plantones, bulbos, rizomas, esquejes y semillas.

20 El tratamiento según la invención de las plantas y partes de plantas con los principios activos se realiza directamente o por acción sobre sus alrededores, hábitat o espacio de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo por inmersión, atomización, evaporación, nebulización, dispersión, unción y en el caso de material de reproducción, especialmente en el caso de semillas, además mediante recubrimiento con una o más capas.

25 En protección de materiales, se pueden usar las sustancias según la invención para proteger materiales técnicos contra el ataque y la destrucción por microorganismos no deseados.

En el presente contexto, se entiende que materiales industriales significa materiales inanimados preparados para su uso en tecnología. Por ejemplo, entre los materiales industriales que pueden protegerse por medio de los principios activos según la invención contra la modificación o destrucción por parte de microbios pueden encontrarse  
30 adhesivos, colas, papel y cartón, textiles, cuero, madera, pinturas y artículos plásticos, lubricantes refrigeradores y otros materiales susceptibles de ser atacados o destruidos por microorganismos. También se pueden mencionar en el marco de los materiales que pueden protegerse partes de instalaciones de producción, por ejemplo circuitos de agua de refrigeración, que pueden verse afectadas adversamente por la multiplicación de microorganismos. Materiales industriales que se pueden mencionar en el marco de la presente invención son, preferentemente,  
35 adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, pinturas, lubricantes refrigeradores y fluidos intercambiadores de calor, y de modo especialmente preferente, madera.

Como microorganismos que pueden degradar o modificar los materiales industriales se pueden mencionar, por ejemplo, bacterias, hongos, levaduras, algas y mixomicetos. Los principios activos según la invención actúan preferentemente contra hongos, en particular mohos, hongos que coloran la madera, hongos que destruyen la  
40 madera (basidiomicetos) y contra mixomicetos y algas.

Se pueden mencionar, por ejemplo, microorganismos de los géneros siguientes:

*Alternaria*, como *Alternaria tenuis*,

*Aspergillus*, como *Aspergillus niger*,

*Chaetomium*, como *Chaetomium globosum*,

45 *Coniophora*, como *Coniophora puetana*,

*Lentinus*, como *Lentinus tigrinus*,

*Penicillium*, como *Penicillium glaucum*,

Polyporus, como Polyporus versicolor,

Aureobasidium, como Aureobasidium pullulans,

Sclerophoma, como Sclerophoma pityophila,

Trichoderma, como Trichoderma viride,

5 Escherichia, como Escherichia coli,

Pseudomonas, como Pseudomonas aeruginosa,

Staphylococcus, como Staphylococcus aureus.

10 Los principios activos pueden transformarse en función de sus propiedades físicas y/o químicas correspondientes en las formulaciones habituales, como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, pastas, gránulos, aerosoles, microencapsulaciones en sustancias poliméricas y en recubrimientos para semillas, así como en formulaciones de volumen ultrabajo (ULV) de niebla fría y caliente.

15 Estas formulaciones se preparan de modo conocido, por ejemplo mezclando los principios activos con diluyentes, es decir disolventes líquidos, gases licuados a presión y/o vehículos sólidos, dado el caso usando tensioactivos, es decir emulsionantes y/o dispersantes y/o espumantes. En caso de usar agua como diluyente también es posible usar, por ejemplo, disolventes orgánicos como codisolventes. Como disolventes líquidos se consideran esencialmente: compuestos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobenzenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de aceites minerales, alcoholes tales como butanol o glicol y también sus éteres y ésteres, cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como agua. Diluyentes o vehículos gaseosos licuados son líquidos que son gaseosos a temperatura ambiente y a presión normal, por ejemplo propulsores para aerosoles, tales como hidrocarburos halogenados, y también butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono. Como vehículos sólidos se consideran: por ejemplo sales de amonio y minerales naturales en polvo tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y minerales sintéticos en polvo, tales como ácido silícico muy disperso, óxido de aluminio y silicatos. Como vehículos sólidos para gránulos se consideran: por ejemplo, rocas naturales quebradas y fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita y gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como gránulos de material orgánico como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y varas de tabaco. Como emulsionantes y/o espumantes se consideran: por ejemplo emulsionantes no ionógenos y aniónicos, como ésteres grasos de polioxietileno, éteres polioxietilénicos de alcohol graso, por ejemplo alquilarilpoliglicoléteres, alquilsulfonatos, sulfatos de alquilo, arilsulfonatos, así como hidrolizados de proteína. Como dispersantes se consideran: por ejemplo, lejías sulfúricas de lignina de desecho y metilcelulosa.

25 En las formulaciones pueden usarse agentes de adherencia tales como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex, tales como goma arábiga, poli(alcohol vinílico), poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos posibles son aceites minerales y vegetales.

30 Es posible usar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia, y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y colorantes de ftalocianina metálica, y oligonutrientes tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

40 Las formulaciones contienen en general entre el 0,1 y el 95 % en porcentaje en peso de principio activo, preferentemente entre el 0,5 y el 90 %.

45 Los principios activos según la invención, como tales o en sus formulaciones, también pueden usarse en mezcla con fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas o insecticidas conocidos, por ejemplo para ampliar el espectro de actividad o para prevenir el desarrollo de resistencia. En muchos casos se obtiene, a este respecto, un efecto sinérgico, es decir, la actividad de la mezcla es superior a la actividad de los componentes por separado.

Como asociados de mezcla se consideran, por ejemplo, los compuestos siguientes:

**Fungicidas:**

2-fenilfenol, sulfato de 8-hidroxiquinolina, acibenzolar-S-metilo, aldimorf, amidoflumet, ampropilfós, ampropilfós-potasio, andoprim, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo, benalaxilo-M, benodanilo, benomilo, bentiavalicarb-isopropilo, benzamacrilo, benzamacrilo-isobutilo, bilanafós, binapacril, bifenilo, bitertanol, blasticidina-S, bromuconazol, bupirimato, butiobato, butilamina, poli(sulfuro de calcio), capsimicina, captafol, captán, carbendazima, carboxina, carpropamida, carvona, quinometionato, clobentiazona, clorfenazol, cloroneb, clorotalonilo, clozolinato, clozilacón, ciazofamida, ciflufenamida, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, ciprofuram, Dagger G, debacarb, diclofluanida, diclona, diclorofeno, diciclotmet, diclomezina, diclorán, dietofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimetirimol, dimetormorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, difenilamina, dipiritiona, ditalimfós, ditianona, dodina, drazoxolona, edifenfós, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenapanilo, fenaripimorf; ferbam; fluazinam; flubencimina; fludioxonilo; flumetover; flumorf; fluoromida; fluoxastrobina; fluquinconazol; fluiprimidol; flusilazol; flusulfamida; flutolanilo; flutriafol; folpet; fosetilo-Al; fosetilo-sodio; fuberidazol; furalaxilo; furametpir; furcarbanilo; furmeciclox; guazatina; hexaclorobenceno; hexaconazol; himexazol; imazalilo; imibenconazol; triacetato de iminoctadina; tris(albesiato) de iminoctadina; yodocarb; ipconazol; iprobenfós; iprodina; iprovalicarb; irumamicina; isoprotiolano; isovalidona; kasugamicina; kresoxim-metilo; mancozeb; maneb; meferimzona; mepanipirim; mepronilo; metalaxilo; metalaxilo-M; metconazol; metasulfocarb; metfuroxam; metiram; metominostrobina; metsulfovax; mildiomicina; miclobutanilo; miclozolina; natamicina; nicobifeno; nitromal-isopropilo; noviflumuron; nuarimol; ofurace; orisastrobina; oxadixilo; ácido oxolínico; oxpoconazol; oxicarboxina; oxifentiina; paclobutrazol; pefurazoato; penconazol; penciclorón; fosdifeno; ftalida; picoxistrobina; piperalina; polioxinas; polioxorim; probenazol; procloraz; procimidona; propamocarb; propanosina-sodio; propiconazol; propineb; proquinazida; protioconazol; piraclostrobina; pirazofós; pirifenox; pirimetanilo; piroquilona; piroxifur; pirrolnitrina; quinconazol; quinoxifeno; quintozeno; simeconazol; esfoxamina; azufre; tebuconazol; teclotalam; tecnazeno; tetciclacis; tetraconazol; tiabendazol; ticiofeno; tiffuzamida; tiofanato-metilo; tram; tioximida; tolclofós-metilo; tolifluanida; triadimefona; triadimenol; triazbutilo; triázóxido; triciclamida; triciclazol; tridemorf; trifloxistrobina; triflumizol; triforina; triticonazol; uniconazol; validamicina A; vinclozolina; zineb; ziram; zoxamida, (2S)-N-[2-(4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanamida, 1-(1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona, 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida, 3,4,5-tricloro-2,6-piridincarbonitrilo, actinovato, 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, carbonato de monopotasio, N-(6-metoxi-3-piridinil)ciclopropanocarboxamida, N-butil-8-(1,1-dimetiletil)-1-oxaesp[iro]4.5]decan-3-amina, tetratiocarbonato de sodio, así como sales y preparados de cobre tales como mezcla Bordeaux, hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, cufraneb, óxido cuproso, mancobre, oxina de cobre.

#### Bactericidas:

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

#### Insecticidas / acaricidas / nematocidas:

##### 1. Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE)

1.1 Carbamatos (por ejemplo alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, alixicarb, aminocarb, azametifós, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurán, carbosulfán, cloetocarb, cumafós, cianofenfós, cianofós, dimetilán, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, formetanato, furatiocarb, isoprocab, metam-sodio, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, promecarb, propoxur, tiocarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC, xilicarb)

1.2 Organofosfatos (por ejemplo acefato, azametifós, azinfós (-metilo, -etilo), bromofós-etilo, bromfenvinfós (-metilo), butatofós, cadusafós, carbofenotión, cloroetoxifós, clorofenvinfós, cloromefós, cloropirifós (-metilo/-etilo), cumafós, cianofenfós, cianofós, clorofenvinfós, demeton-S-metilo, demeton-S-metilsulfona, dialifós, diazinona, ficlofentión, diclorovos/DDVP, dicrotofós, dimetoato, dimetilvinfós, dioxabenzofós, disulfoton, EPN, etión, etoprofós, etrimfós, famfur, fenamifós, fenitrotión, fensulfotión, fentión, flupirazofós, fonofós, formotión, fosmetilan, fostiazato, heptenofós, yodofenfós, iprobenfós, isazofós, isofenfós, O-salicilato de isopropilo, isoxatión, malatión, mecarb, metacrifós, metamidofós, metidatión, mevinfós, monocrotofós, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paratión (-metilo/-etilo), fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, fosfocarb, foxim, pirimifós (-metilo/-etilo), profenofós, propafós, propetamfós, protiofós, protoato, piraclofós, piridafentión, piridatión, quinalfós, sebufós, sulfotep, sulprofós, tebupirimfós, temefós, terbufós, tetraclorovinifós, tiometón, triazofós, triclorfón, vamidotión)

##### 2. Moduladores del canal de sodio / bloqueador del canal de sodio dependiente de la tensión

Piretroides (por ejemplo acrintrina, aletrina (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrina, bifentrina, bioaletrina, isómero de bioaletrina-S-ciclopentilo, bioetanometrina, biopermetrina, bioresmetrina, clovaportrina, cis-cipermetrina, cis-resmetrina, cis-permetrina, clocitrina, cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cipermetrina (alfa-, beta-, theta-, zeta-),

- 5 cifenotrina, deltametrina, eflusilanato, empentrina (isómero 1R), esfenvalerato, etofenprox, fenflutrina, fenpropatrina, fenpiritrina, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flufenprox, flumetrina, fluvalinato, fubfenprox, gamma-cihalotrina, imiprotrina, cadertrina, lambda-cihalotrina, metoflutrina, (cis-, trans-) permetrina, fenotrina (isómero 1R-trans), praletrina, proflutrina, protrifenbut, piresmetrina, piretrina, resmetrina, RU 15525, silafluofeno, tau-fluvalinato, teflutrina, teraletrina, tetrametrina (isómero -1R), tralometrina, transflutrina, ZXI 8901, piretrinas (piretrum))
- 2.2 Oxadiazinas (por ejemplo, indoxacarb)
3. *Agonistas / antagonistas del receptor de acetilcolina*
- 3.1 Cloronicotinilos/neonicotinoides (por ejemplo acetamiprid, clotianidina, dinotefurán, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid, tiametoxam)
- 10 3.2 Nicotina, bensultap, cartap
4. *Moduladores del receptor de acetilcolina*
- 4.1 Espinosinas (por ejemplo, espinosad)
5. *Antagonistas del canal de cloruro controlado por GABA*
- 15 5.1 Ciclodienos organoclorados (por ejemplo canfeclor, clordano, endosulfán, gamma-HCH, HCH, heptaclor, lindano, metoxiclor)
- 5.2 Fiproles (por ejemplo, acetoprol, etiprol, fipronilo, vaniliprol)
6. *Activadores del canal de cloruro*
- 6.1 Mectinas (por ejemplo abamectina, emamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, lepimectina, milbemicina)
- 20 7. *Miméticos de la hormona juvenil*
- (por ejemplo, diofenolán, epofenonano, fenoxicarb, hidropreno, quinopreno, metopreno, piriproxifeno, tripreno)
8. *Agonistas/disruptores de ecdisona*
- 8.1 Diacilhidrazinas (por ejemplo, cromafenoazida, halofenoazida, metoxifenoazida, tebufenoazida)
9. *Inhibidores de la biosíntesis de quitina*
- 25 9.1 Benzoilureas (por ejemplo bistriflurón, clofluazurón, diflubenzurón, fluazurón, fluciclozurón, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón, penflurón, teflubenzurón, triflumurón)
- 9.2 Buprofezina
- 9.3 Ciromazina
10. *Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP*
- 30 10.1 Diafentiurón
- 10.2 Compuestos de organoestaño (por ejemplo, azociclotina, cihexatina, óxido de fenbutatina)
11. *Desacopladores de la fosforilación oxidativa mediante interrupción del gradiente del protón H*
- 11.1 Pirroles (por ejemplo, clorfenapir)

- 11.2 Dinitrofenoles (por ejemplo, binapacirl, dinobutón, dinocap, DNOC)
12. *Inhibidores del transporte de electrones del sitio I*
- 12.1 METI (por ejemplo fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad)
- 12.2 Hidrametilnonas
- 5 12.3 Dicofol
13. *Inhibidores del transporte de electrones del sitio II*
- 13.1 Rotenona
14. *Inhibidores del transporte de electrones del sitio III*
- 14.1 Acequinocilo, fluacripirim
- 10 15. *Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insectos*
- Cepas de *Bacillus thuringiensis*
16. *Inhibidores de la síntesis de grasa*
- 16.1 Ácidos tetrónicos (por ejemplo espirodiclofeno, espiromesifeno)
- 15 16.2 Ácidos tetramicos [por ejemplo carbonato de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-4il-etilo (o bien: éster 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-4il-etílico del ácido carbónico, N° de reg. CAS: 382608-10-8) y éster cis-3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-4il-etílico del ácido carbónico, (N° de reg. CAS: 203313-25-1)]
17. *Carboxamidas*
- (por ejemplo flonicamida)
- 20 18. *Agonistas octopaminérgicos*
- (por ejemplo, amitraz)
19. *Inhibidores de ATPasa estimulada con magnesio*
- (por ejemplo, propargita)
20. *Ftalamidas*
- 25 (por ejemplo, N<sup>2</sup>-[1,1-dimetil-2-(metilsulfonil)etil]-3-yodo-N<sup>1</sup>-[2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoro-metil)etil]fenil]-1,2-bencenodicarboxamida (N° de reg. CAS: 272451-65-7), flubendiamida)
21. *Análogos de nereistoxina*
- (por ejemplo, hidrogenooxilato de tiociclám, tiosultap-sodio)
22. *Productos biológicos, hormonas o feromonas*
- 30 (por ejemplo, azadiractina, *Bacillus spec.*, *Beauveria spec.*, codlemona, *Metarrhizium spec.*, *Paecilomyces spec.*, turingiensina, *Verticillium spec.*

23. Principios activos con mecanismo de acción desconocido o no específico

23.1 Fumigantes (por ejemplo, fosfuro de aluminio, bromuro de metilo, fluoruro de sufurilo)

23.2 Inhibidores selectivos de la nutrición (por ejemplo, criolita, flonicamida, pimetrozina)

23.3 Inhibidores del crecimiento de ácaros (por ejemplo, clofentezina, etoxazol, hexitiazox)

5 23.4 Amidoflumet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, buprofezina, quinometionato, clorodimeform, clorobencilato, cloropicrina, clotiazobeno, ciclopreno, ciflumetofeno, ciciclanilo, fenoxacrim, fentrifanilo, flubencimina, flufenerim, flutenzina, gosiplure, hidrametilnona, japonilure, metoxadiazona, petróleo, butóxido de piperonilo, oleato de potasio, pirafuprol, piridialilo, pirirol, sulfluramida, tetradifón, tetrasul, triarateno, verbutina.

10 también el compuesto carbamato de 3-metil-fenil-propilo (Tsumacida Z), el compuesto 3-(5-cloro-3-piridinil)-8-(2,2,2-trifluoroetil)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitrilo (Nº de reg. CAS 185982-80-3) y el correspondiente isómero 3-endo (Nº de reg. CAS 185984-60-5) (véanse los documento WO 96/37494 , WO 98/25923 ), así como preparados que contienen extractos de plantas, nematodos, hongos o virus con actividad insecticida.

Es también posible una mezcla con otros principios activos conocidos, tales como herbicidas, o con fertilizantes y reguladores del crecimiento, antidotos y/o productos semioquímicos.

15 Además los compuestos de la fórmula (I) según la invención presentan también efectos antimicóticos muy buenos. Presentan un espectro de actividad antimicótica muy amplio, especialmente contra dermatofitos y levaduras, mohos y hongos bifásicos (por ejemplo contra las especies de Candida tales como Candida albicans, Candida glabrata) así como Epidermophyton floccosum, especies de Aspergillus como Aspergillus niger y Aspergillus fumigatus, especies de Trichophyton como Trichophyton mentagrophytes, especies de Microsporon como Microsporon canis y audouinii.  
20 La enumeración de estos hongos no representa de ningún modo una limitación del espectro micótico abarcado; sólo tiene carácter explicativo.

Los principios activos pueden aplicarse como tales, en forma de formulaciones o de sus formas de aplicación preparadas, como soluciones, suspensiones, polvos humectables para pulverización, pastas, polvos solubles, agentes de espolvoreo y granulos preparados para su uso. La aplicación se realiza de un modo habitual, por ejemplo  
25 vertido, pulverización, atomización, dispersión, esparcido, espumación, unción, etc. También es posible la aplicación de las sustancias activas mediante el procedimiento por volumen ultrabajo o la inyección en el suelo de la preparación de principios activos o de los mismos principios activos. También es posible tratar las semillas de las plantas.

En el uso de los principios activos según la invención como fungicidas pueden variar las cantidades de aplicación, así como los modos de aplicación, en un gran intervalo. En el tratamiento de partes de plantas, las cantidades de aplicación de los principios activos varían en general entre 0,1 y 10.000 g/ha, preferentemente entre 10 y 1.000 g/ha. En el tratamiento de semillas, las cantidades de aplicación de los principios activos varían en general entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semillas, preferentemente entre 0,01 y 10 g por kilogramo de semillas. En el tratamiento de  
35 suelos, las cantidades de aplicación de los principios activos varían en general entre 0,1 y 10.000 g/ha, preferentemente entre 1 y 5.000 g/ha.

Como ya se ha mencionado anteriormente, se pueden tratar según la invención todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente se pueden tratar especies y variedades de plantas de origen natural u obtenidas mediante procedimientos convencionales de cultivo biológico, como cruzamiento o fusión de protoplastos, así como sus partes. En una forma de realización preferida adicional, se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas que se han obtenido mediante procedimientos de ingeniería genética, dado el caso en combinación con procedimientos convencionales (organismos modificados genéticamente), y sus partes. Los términos y expresiones "partes" o "partes de plantas " o "partes de planta" se han explicado anteriormente.

De forma particularmente preferente, se tratan plantas según la invención de las variedades de plantas comerciales o que se encuentran en uso, respectivamente. Por variedades de plantas se entiende plantas con propiedades nuevas ("rasgos") que se han obtenido mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o usando técnicas de ADN recombinante. Éstas pueden ser variedades, subespecies, biotipos y genotipos.  
45

Según la especie de planta o variedad de planta, su hábitat y condiciones de crecimiento (suelo, clima, periodo vegetativo, alimentación), pueden aparecer también efectos superaditivos ("sinérgicos") con el tratamiento según la invención. Así, son posibles, por ejemplo, cantidades de aplicación reducidas y/o ampliaciones del espectro de acción y/o un reforzamiento de la actividad de las sustancias y agentes que pueden usarse según la invención,  
50

mejor crecimiento de plantas, tolerancia elevada frente a altas o bajas temperaturas, tolerancia elevada frente a sequedad o frente al contenido de sal del agua o el suelo, rendimiento de floración elevado, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos cosechados, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados que superan los efectos que realmente se esperan.

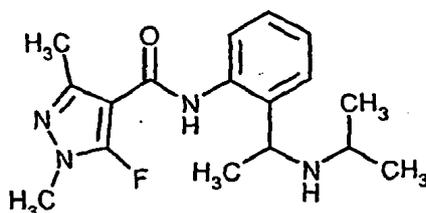
A las plantas o variedades de plantas transgénicas (obtenidas por ingeniería genética) que se tratan preferentemente según la invención pertenecen todas las plantas que, mediante la modificación por ingeniería genética, han obtenido material genético que confiere a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("rasgos"). Son ejemplos de dichas propiedades: mejor crecimiento de planta, tolerancia elevada frente a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada frente a sequedad o frente al contenido de sal de agua o suelo, rendimiento de floración elevado, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos cosechados, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados. Son ejemplos adicionales y especialmente destacados de dichas propiedades una defensa elevada de las plantas frente a plagas animales y microbianas, como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, así como una tolerancia elevada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas pueden mencionarse las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, algodón, colza, así como plantas frutales (con los frutos manzana, pera, frutos cítricos y uvas viníferas), siendo especialmente destacadas maíz, soja, patata, algodón y colza. Como propiedades ("rasgos"), se destacan especialmente la defensa elevada de las plantas contra insectos, arácnidos, nematodos y caracoles mediante toxinas presentes en las plantas, particularmente aquellas que se producen en las plantas mediante el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, mediante los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF, así como sus combinaciones) generadas en las plantas (en adelante "plantas Bt"). Como propiedades ("rasgos"), también se destaca especialmente el aumento de la defensa de plantas frente a hongos, bacterias y virus mediante resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, pitoalexina, elicitores, así como genes de resistencia y las proteínas y toxinas expresadas correspondientes. Como propiedades ("rasgos"), se destaca especialmente, también, el aumento de la tolerancia de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glufosato o fosfinotricina (por ejemplo, gen "PAT"). Los genes que confieren las propiedades deseadas respectivas ("rasgos") pueden estar presentes también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas Bt", se pueden mencionar variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata que se comercializan con las denominaciones comerciales YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotr® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes a herbicida, se pueden mencionar variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan con las denominaciones comerciales Roundup Ready® (tolerancia frente a glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia frente a fosfinotricina, por ejemplo, colza), IML® (tolerancia frente a imidazolinonas) y STS® (tolerancia frente a sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Como plantas resistentes a herbicida (cultivadas de forma convencional con tolerancia a herbicida), se pueden mencionar también las variedades comercializadas con la referencia Clearfield® (por ejemplo maíz). Naturalmente, estas indicaciones son válidas también para las variedades de plantas desarrolladas en el futuro o presentes en el mercado futuro con estas u otras propiedades ("rasgos") genéticas desarrolladas en el futuro.

Las plantas mencionadas pueden tratarse de modo especialmente ventajoso según la invención con los compuestos de la fórmula general (I) o con las mezclas de principios activos según la invención. Los intervalos preferentes mencionados anteriormente para los principios activos o las mezclas también son aplicables al tratamiento de estas plantas. El tratamiento de plantas con los compuestos o las mezclas indicados especialmente en el presente texto es particularmente destacado.

La preparación y el uso de los principios activos según la invención se desprenden de los ejemplos siguientes.

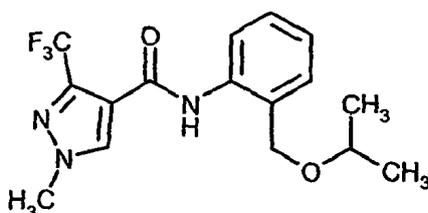
#### **Ejemplos de preparación.**

##### Preparación del compuesto N° 40



- 5 A una solución constituida por 0,27 g (1,5 mmol) de 2-[1-(isopropilamino)etil]anilina (III-4) y 0,42 ml (3,0 mmol) de trietilamina en 5 ml de diclorometano se añade gota a gota una solución constituida por 0,27 g (1,5 mmol) de cloruro de ácido 5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxílico en 10 ml de diclorometano. La mezcla de reacción se agita durante 2 horas a 50 °C y, a continuación, durante 16 h a temperatura ambiente. Para el procesamiento, la mezcla de reacción se vierte en agua, la fase orgánica se seca sobre sulfato de magnesio y se concentra al vacío. La cromatografía en columna (hexano/acetona 4 : 1) proporciona 0,27 g (56 % del valor teórico) de 5-fluoro-N-[2-[1-(isopropilamino)etil]fenil]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida [log P (pH 2,3) = 0,58].

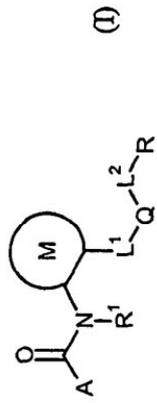
Preparación del compuesto N° 60



- 10 A temperatura ambiente se añaden 156,0 mg (3,9 mmol) de hidruro de sodio al 60 % en aceite a una solución constituida por 897,8 mg (3,0 mmol) de N-[2-(hidroximetil)fenil]-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida (IV-1) en 2 ml de dimetilformamida. Después de 30 minutos se añaden 0,6 ml (6,0 mmol) de 2-yodopropano. La mezcla de reacción se agita durante 6 horas a 100 °C y durante 16 h a temperatura ambiente. A continuación se añade 1 ml de metanol, se vierte en agua, se extrae con acetato de etilo, la fase orgánica se seca sobre sulfato de magnesio, se retira el secante por filtración y se concentra al vacío. La cromatografía en columna (ciclohexano/acetato de etilo 3 : 1) proporciona 100,0 mg (9,7 % del valor teórico) de N-[2-(isopropoximetil)fenil]-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida [logP (pH 2,3) = 2,85].

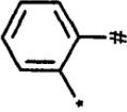
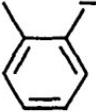
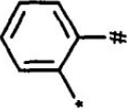
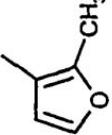
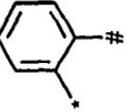
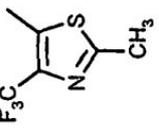
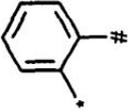
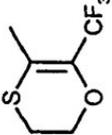
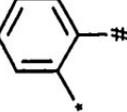
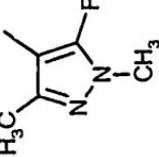
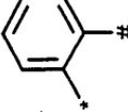
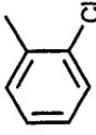
- 20 De modo análogo a los ejemplos 1 y 2, así como de forma correspondiente a los datos en la descripción general de los procedimientos de preparación según la invención (a) a (m) también se obtuvieron los compuestos de la fórmula (I) que se presentan en la tabla 1 siguiente:

Tabla 1



N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3) Pf (°C)
1	H		-CH <sub>2</sub> -O <sub>2</sub> H <sub>3</sub>		2,18
2	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,07
3	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,30
4	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,38
5	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		1,68
6	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,53

(continuación)

Nº	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3) Pf (°C)
7	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,43
8	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,21
9	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,35
10	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,39
11	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		1,66
12	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,23

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
13	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,16	
14	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		1,46	
15	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,09	
16	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		1,86	
17	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,53	

(continuación)

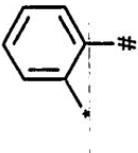
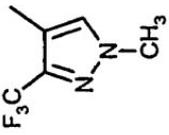
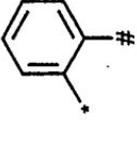
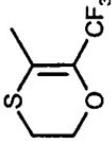
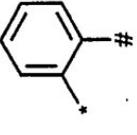
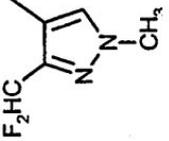
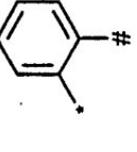
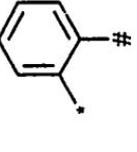
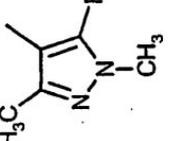
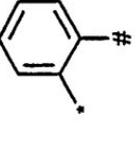
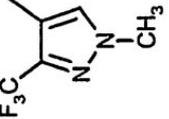
N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
18	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,27	
19	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,98	
20	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		4,03	
21	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,74	
22	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,95	
23	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,90	

(continuación)					
N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3) Pf (°C)
24	H		-CH(CH <sub>3</sub> ) <sup>2</sup> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,71
25	H		-CH(CH <sub>3</sub> ) <sup>2</sup> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,73
26	H		-CH(CH <sub>3</sub> ) <sup>2</sup> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,79
27	H		-CH(CH <sub>3</sub> ) <sup>2</sup> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,91
28	H		-CH(CH <sub>3</sub> ) <sup>2</sup> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,01
29	H		-CH(CH <sub>3</sub> ) <sup>2</sup> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,55

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3) PF (°C)
30	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,76
31	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH <sub>3</sub>		2,17
32	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH <sub>3</sub>		2,46
33	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH <sub>3</sub>		3,56
34	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH <sub>3</sub>		2,99
35	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,27

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH2,3) Pf (°C)
36	H		CH <sub>2</sub> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,05
37	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,48
38	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,76
39	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,68
40	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-NH-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		0,58
41	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-NH-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		1,06

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
42	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,02	4,02
43	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		3,82	3,82
44	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,52	4,52
45	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,14	4,14
46	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		3,38	3,38
47	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,75	4,75

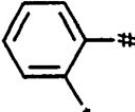
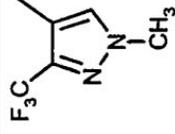
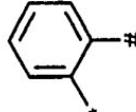
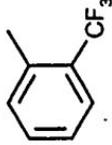
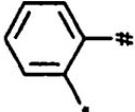
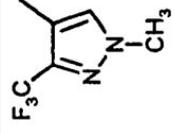
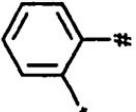
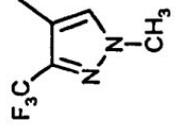
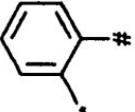
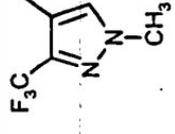
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
48	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,12	4,12
49	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,33	4,33
50	H		-CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CHCl <sub>2</sub>		3,15	3,15
51	H		-CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,39	2,39
52	H		-CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CHCl <sub>2</sub>		2,36	2,36
53	H		-CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,24	3,24

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
54	H		-CH <sub>2</sub> -O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,51	2,51
55	H		-CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,74	2,74
56	H		-CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CHCl <sub>2</sub>		2,69	2,69
57	H		-CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,38	2,38
58	H		-CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CHCl <sub>2</sub>		2,38	2,38
59	C(O)i-Pr		-CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,49	3,49

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3) Pf (°C)
60	H		-CH <sub>2</sub> -O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,85
61	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> O-C(O)-CH <sub>3</sub>		3,30
64	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-C(O)-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,79
65	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>		4,59
66	H		-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-C(O)-CHCl <sub>2</sub>		2,76

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
67	H		$-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$		2,40	
68	H		$-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{C}(\text{O})-\text{CHCl}_2$		2,43	
69	H		$-(\text{CH}_2)_2\text{O}-\text{S}(\text{CH}_3)_2-\text{C}(\text{CH}_3)_3$		4,49	
70	H		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$		4,71	
71	H		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$		4,93	
72	H		$-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$		4,60	

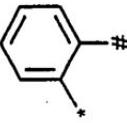
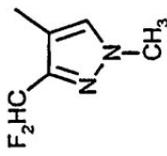
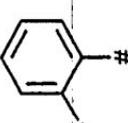
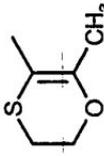
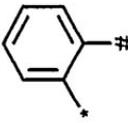
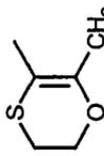
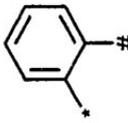
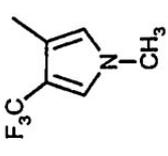
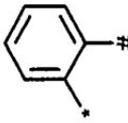
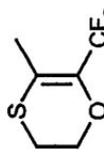
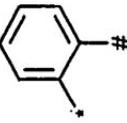
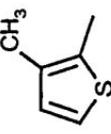
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
73	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>		4,17	4,17
74	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>		4,17	4,17
75	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>		4,31	4,31
76	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>		4,47	4,47
77	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>		4,61	4,61
78	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>		3,95	3,95

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3) Pf (°C)
79	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,36
80	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		3,38
81	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,63
82	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		3,27
83	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,21
84	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		2,90

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
85	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		3,76	
86	H		CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,07	
87	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,53	
88	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		3,92	
89	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,10	
90	H		—CH(CH <sub>3</sub> )—S— 		3,16	

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3) Pf (°C)
91	H				4,31
92	H				4,29
93	H				4,34
94	H				4,24
95	H				3,04
96	H				3,76

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
97	H		$\text{---CH(CH}_3\text{)---S---}$ 		4,41	4,41
98	H		$\text{---CH(CH}_3\text{)---S---CH(CH}_3\text{)---}$ 		3,65	3,65
99	H		$\text{---CH(CH}_3\text{)---S---}$ 		4,44	4,44
100	H		$\text{---CH(CH}_3\text{)---S---}$ 		4,03	4,03
101	H		$\text{---CH(CH}_3\text{)---S---}$ 		3,48	3,48
102	H		$\text{---CH(CH}_3\text{)---S---}$ 		4,07	4,07

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
103	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,88	
104	H		CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,20	
105	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,57	
106	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,63	
107	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		4,24	
108	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		4,21	

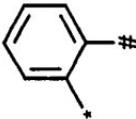
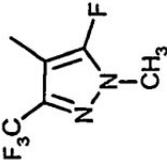
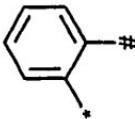
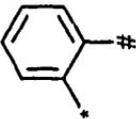
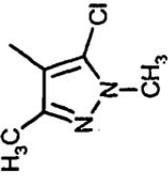
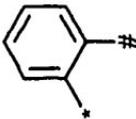
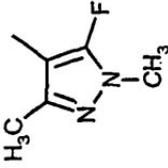
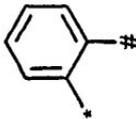
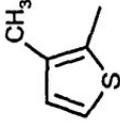
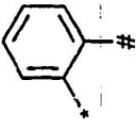
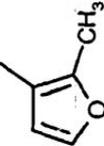
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3) Pf (°C)
109	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,29
110	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,49
111	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,38
112	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,76
113	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,07
114	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		3,79

(continuación)

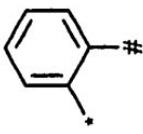
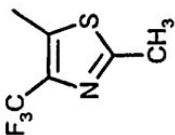
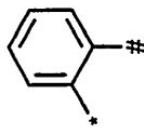
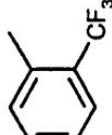
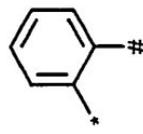
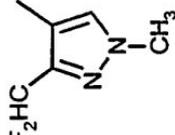
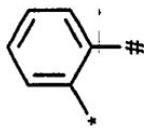
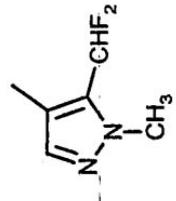
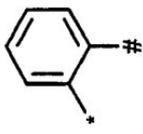
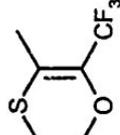
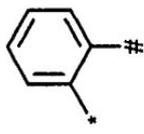
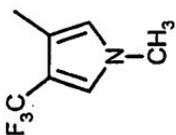
N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
115	H		$\text{---CH(CH}_3\text{)---S---}$ 		4,02	
116	H		$\text{---CH(CH}_3\text{)---S---}$ 		3,46	
117	H		$\text{---CH(CH}_3\text{)---S---}$ 		4,45	
118	H		$\text{---CH(CH}_3\text{)---S---}$ 		4,12	
119	H		$\text{---CH(CH}_3\text{)---S---}$ 		3,76	
120	H		$\text{---CH(CH}_3\text{)---S---CH(CH}_3\text{)CH}_2\text{CH}_3$		3,35	

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
121	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		3,99	
122	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		4,31	
123	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		3,60	
124	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,90	
125	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		4,50	
126	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,80	

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
127	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,14	
128	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,47	
129	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,75	
130	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,83	
131	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,58	
132	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,72	

(continuación)					
N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH2,3) Pf (°C)
133	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,65
134	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,81
135	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		2,89
136	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,67
137	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		3,64
138	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		5,60

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3) Pf (°C)
139	H		-CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		98°C
140	H		-CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		
141	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
142	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		103°C
143	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		96°C

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
144	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			
145	H		-CH <sub>2</sub> -SO-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			
146	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			105°C
147	H		-CH <sub>2</sub> -SO-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			
148	H		-CH <sub>2</sub> -SO-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
149	H		-CH <sub>2</sub> -SO-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>			
150	H		-CH <sub>2</sub> -SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>			148°C
151	H		-CH <sub>2</sub> -SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>			135°C
152	H		-CH <sub>2</sub> -SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>			142°C
153	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>			142°C

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
154	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			116°C
155	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			125°C
156	H		-CH <sub>2</sub> S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			72°C
157	H		-CH <sub>2</sub> -SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			
158	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			135°C

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3) Pf (°C)
159	H		-CH <sub>2</sub> -SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		143°C
160	H		-CH <sub>2</sub> -SO-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
161	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		127°C
162	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
163	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf. (°C)
164	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			116°C
165	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			98°C
166	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			132°C
167	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			86°C
168	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			110°C

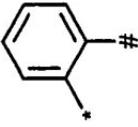
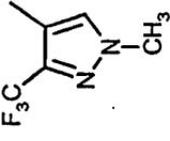
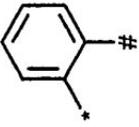
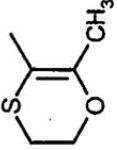
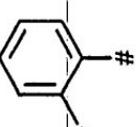
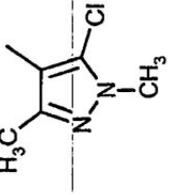
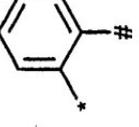
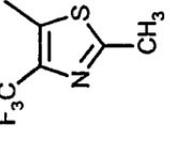
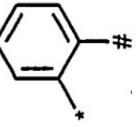
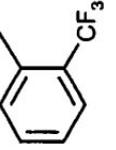
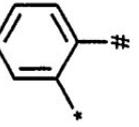
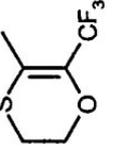
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH2,3) Pf (°C)
169	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		79°C
170	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		75°C
171	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		105°C
172	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		112°C
173	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		138°C
174	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		120°C

(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2.3)	Pf (°C)
175	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			71°C
176	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			
177	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>			68°C
179	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			92°C
180	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			
181	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			86°C

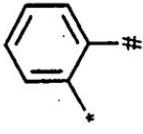
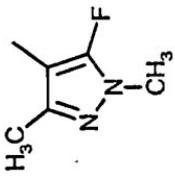
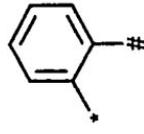
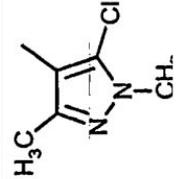
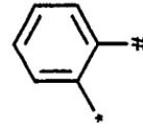
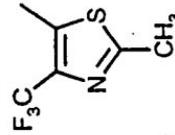
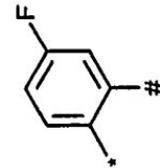
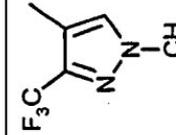
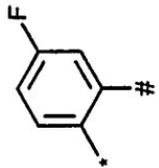
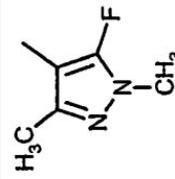
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3)	Pf (°C)
182	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		82°C	
183	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		45°C	
184	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			
185	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>			
186	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		94°C	
187	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		77°C	

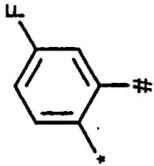
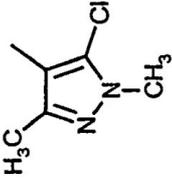
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3) Pf (°C)
188	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		96°C
189	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		147°C
190	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		147°C
191	H		-CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>3</sub>		
192	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		

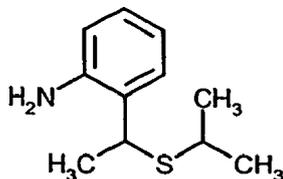
(continuación)

N°	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3) Pf (°C)
193	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
194	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
195	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
196	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		
197	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		

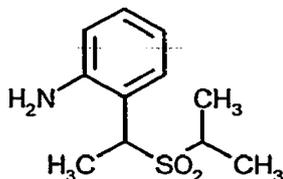
(continuación)

Nº	R <sup>1</sup>	M	-L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R	A	logP (pH 2,3) Pf (°C)
198	H		-CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>		

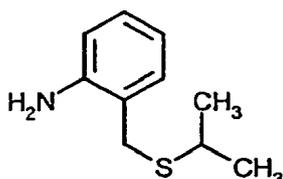
a) el enlace marcado con "\*" está enlazado con la amida

**Preparación de los materiales de partida de la fórmula (III):**Ejemplo (III-1)

5 Se disuelven 44 g (0,188 mol) de 1-[1-(isopropil)etil]-2-nitrobenceno (VII-1) en 250 ml de etanol, se añaden 3 g de níquel Raney y se hidrogena en un autoclave a temperatura ambiente durante 6 horas con 300 kPa de hidrógeno. Después de 6 horas se añaden de nuevo 3 g de níquel Raney y se hidrogena durante otras 16 horas a temperatura ambiente con 300 kPa de hidrógeno. Para el procesamiento se retira el catalizador por filtración y el disolvente se elimina al vacío. El producto bruto se purifica mediante cromatografía en columna (gel de sílice, hexano/metil-terc-butiléter 3:1). Se obtienen 32 g (contenido: 97,3 %, HPLC, 84,4 % del valor teórico) de 2-[1-(isopropil)etil]anilina en forma de un aceite amarillo [logP (pH 2,3) = 2,45].

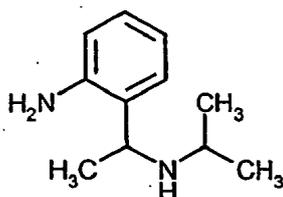
Ejemplo (III-2)

15 En un matraz de tres bocas de 500 ml con agitador y termómetro se disponen 16,2 g (60,5 mmol) de 1-[1-(isopropilsulfonil)etil]-2-nitrobenceno (VII-4) en 160 ml de metanol, se añaden con agitación 160 ml de ácido clorhídrico concentrado y se añaden a 20-40 °C en porciones 31,5 g de estaño en polvo (265,2 mmol). La mezcla se agita a 40 °C durante aproximadamente 1 hora. Para el procesamiento se enfría, se filtra y se agita con 1575 ml de una solución de hidróxido de sodio al 10 %. Se extrae dos veces con diclorometano, se seca sobre sulfato de sodio y se retira el disolvente al vacío. Se obtienen 13,3 g (contenido: 95,8 %, HPLC, 92,6 % del valor teórico) de 2-[1-(isopropilsulfonil)etil]anilina [logP (pH 2,3) = 1,28].

Ejemplo (III-3)

25 En un matraz de tres bocas de 500 ml con agitador y termómetro se disponen 11,8 g (55,6 mmol) de 1-[1-(isopropil)etil]-2-nitrobenceno (VII-2) en 150 ml de metanol, se añaden con agitación 150 ml de ácido clorhídrico concentrado y se añaden a 20-40 °C en porciones 17,6 g de estaño en polvo (148,5 mmol). La mezcla se agita a 40 °C durante aproximadamente 1 hora. Para el procesamiento se enfría, se filtra y se agita con 1.300 ml de una solución de hidróxido de sodio al 10 %. Se extrae dos veces con diclorometano, se seca sobre sulfato de sodio y se evapora el disolvente al vacío. El producto bruto se purifica con hexano/metil-terc-butiléter 3:1 en gel de sílice. Se obtienen 4,6 g (contenido: 94,6 %, HPLC, 43,2 % del valor teórico) de 2-[(isopropil)etil]anilina en forma de un aceite amarillo [logP (pH 2,3) = 1,94].

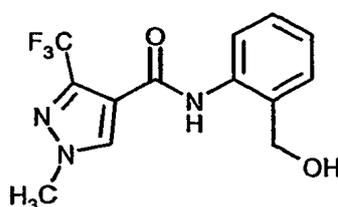
Ejemplo (III-4)



5 En un autoclave, a una solución de 5 g de N-[1-(2-nitrofenil)etil]propan-2-amina (VII-5) (24 mmol) en 30 ml de metano se añaden 0,5 g de níquel Raney y se hidrogena durante 5 horas a 50 °C y 5000 kPa de hidrógeno. Para el procesamiento se enfría, el catalizador se retira por filtración y el disolvente se elimina al vacío. Se obtienen 2,8 g (contenido: 98,1 %, 64,2 % del valor teórico) de 2-[1-(isopropil-amino)etil]anilina [ $\log P$  (pH 2,3) = 0,05].

**Preparación de los materiales de partida de la fórmula (IV):**

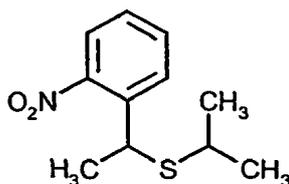
Ejemplo (IV-1)



10 A temperatura ambiente, se añade gota a gota una solución constituida por 34,5 g (0,16 mol) de cloruro de ácido 1-metil-3-trifluorometil-1H-pirazol-4-carboxílico en 50 ml de tetrahidrofurano a una solución constituida por 20,0 g (0,16 mol) de (2-amino-fenil)-metanol y 36 ml (0,26 mol) de trietilamina en 250 ml de tetrahidrofurano. Después de extinguirse el calor de reacción exotérmico se somete a reflujo durante 6 horas y se agita a temperatura ambiente durante otras 48 horas. La mezcla de reacción se vierte en aproximadamente 250 ml de agua, se extrae con acetato de etilo, se lava con ácido clorhídrico 2 M, se seca sobre sulfato de magnesio y se concentra al vacío. La cromatografía en columna (gradiente de ciclohexano/acetato de etilo) proporciona 33,8 g (69 % del valor teórico) de N-[2-(isopropoximetil)fenil]-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida [ $\log P$  (pH 2,3) = 1,55].

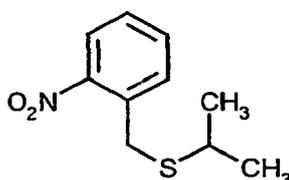
**Preparación de los materiales de partida de la fórmula (VII):**

Ejemplo (VII-1)



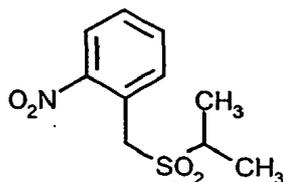
20 En un matraz de tres bocas de 1 litro con agitador, embudo de goteo y termómetro se disponen 34,8 g (0,354 mol) de 2-propanotiolato de sodio en 450 ml de acetonitrilo y se añaden gota a gota a una temperatura de 30-40 °C 63 g de 1-(1-cloroetil)-2-nitrobenzono (VIII-1) (contenido: 99,4 %, 0,337 mol) disueltos en 20 ml de acetonitrilo. La suspensión se agita durante 16 horas a 40 °C, se enfría y el disolvente se retira al vacío. El residuo remanente se recoge en diclorometano, se lava, se seca sobre sulfato de sodio y el disolvente se elimina al vacío. El producto bruto se purifica mediante cromatografía en columna (gel de sílice, hexano/acetona 29:1). Se obtienen 48 g (contenido: 98,8 %, HPLC, 62,4 % del valor teórico) de 1-[1-(isopropiltio)etil]nitrobenzono en forma de un aceite amarillo [ $\log P$  (pH 2,3) = 3,89].

Ejemplo (VII-2)



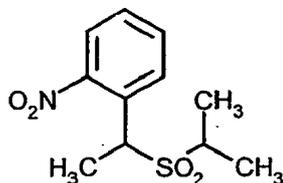
En un matraz de tres bocas de 250 ml con agitador, embudo de goteo y termómetro se disponen 10,3 g (0,105 mol) 2-propanotiolato de sodio en 75 ml de acetonitrilo y con refrigeración a 30-40 °C se añade gota a gota una solución de 17,2 g (0,1 mol) de cloruro de 2-nitrobencilo en 20 ml de acetonitrilo. La suspensión se agita durante 16 horas a 40-50 °C. Para completar la reacción se añaden 6 g más de 2-propanotiolato de sodio (0,061 mol) y se agita durante otras 24 horas a 40-50 °C. Para el procesamiento se enfría y el disolvente se elimina al vacío. El residuo se recoge en metil-terc-butiléter, se lava y se seca sobre sulfato de sodio. El sulfato de sodio se retira por filtración y la solución se concentra al vacío. El producto bruto se purifica mediante cromatografía en columna (gel de sílice, ciclohexano/acetato de etilo 50:1). Se obtienen 11,8 g (contenido: 92 %, HPLC, 51,2 % del valor teórico) de 1-[1-(isopropiltio)metil]-2-nitrobenceno en forma de un aceite marrón [logP (pH 2,3) = 3,28].

10 Ejemplo (VII-3)



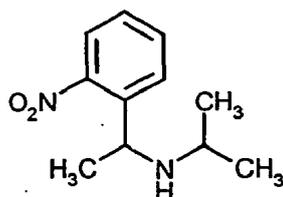
En un matraz de tres bocas de 1 litro con agitador, embudo de goteo y termómetro se disponen 32,8 g de 1-[1-(isopropiltio)metil]-2-nitrobenceno (VII-2) (0,155 mol) en 465 ml de diclorometano y, con agitación, se añaden sucesivamente 14,3 g de ácido fórmico (0,31 mol) y 1,6 g de molibdato de amonio. Con agitación rápida a temperatura ambiente se añaden gota a gota 45,3 g (0,466 mol) de solución de peróxido de hidrógeno al 35 %. La mezcla se agita durante 16 horas. Para el procesamiento se retira la fase orgánica, se lava una vez respectivamente con solución de hidrogenosulfito de sodio y con agua y la solución orgánica se seca sobre sulfato de sodio. El disolvente se retira por destilación al vacío y el residuo se agita con dietiléter, el producto precipitado se retira mediante filtración con succión y se seca. Se obtienen 30,5 g (contenido: 99 %, HPLC, 80 % del valor teórico) de 1-[(isopropilsulfonilo)metil]nitrobenceno en forma de un sólido amarillo [logP (pH 2,3) = 1,63].

20 Ejemplo (VII-4)

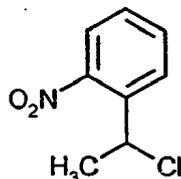


En un matraz de tres bocas de 1 litro con agitador y termómetro se disponen 18,9 g (77,7 mmol) de 1-[(isopropilsulfonil)metil]-2-nitrobenceno (VII-3) en 390 ml de acetonitrilo y se añaden sucesivamente 90,1 g (652 mmol) de carbonato de potasio, 0,26 g de 18-corona-6 y 12,1 g (85,5 mmol) de yodometano. Se agita durante 4 horas a reflujo, se añaden después otros 2,5 g de yodometano (17,6 mmol) y se agita durante otras 4 horas a reflujo. Para el procesamiento, se enfría y se concentra al vacío. El residuo se recoge en acetato de etilo, se lava con agua y se seca sobre sulfato de sodio. Después de retirar el disolvente, el producto bruto se purifica mediante cromatografía en columna (gel de sílice, hexano/acetona 7:3). Se obtienen 16,2 g (contenido: 96,1 %, HPLC, 77,9 % del valor teórico) de 1-[1-(isopropilsulfonil)etil]-2-nitrobenceno [logP (pH 2,3) = 1,99].

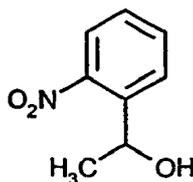
30 Ejemplo (VII-5)



En un autoclave se agitan 13,8 g de 1-(1-cloroetil)-2-nitrobenceno (VIII-1) (al 98,3 %, 73,1 mmol) y 43,2 g de isopropilamina (731 mmol) durante 24 horas a 60 °C y a propia presión. Después de enfriar la mezcla de reacción, se elimina el exceso de isopropilamina al vacío y el producto bruto se purifica con ciclohexano/acetato de etilo 4:1 en gel de sílice. Se obtienen 5 g (contenido: 94,4 %, HPLC, 31 % del valor teórico) de 1-[2-(nitrofenil)etil]propan-2-amina en forma de un aceite [logP (pH 2,3) = 0,55].

**Preparación de los materiales de partida de la fórmula (VIII):**Ejemplo (VIII-1)

5 En un matraz de tres bocas de 6 litros con agitador, embudo de goteo y termómetro se disuelven 311 g de 1-(2-nitrofenil)etanol (XI-1) (contenido 95,8 %, 1,78 mol) en 3000 ml de dimetilformamida. Con agitación se añaden 921,4 g (7,13 mol) de diisopropiletilamina, se agita durante 5 minutos y con una buena refrigeración se añaden gota a gota en un intervalo de temperatura de entre 20 y 35 °C 612,5 g (5,35 mol) de cloruro de ácido metanosulfónico. Después de extinguirse la reacción se agita durante otras 90 horas a temperatura ambiente, se elimina el disolvente al vacío, se recoge en acetato de etilo, se lava 3 veces con agua, se seca sobre sulfato de sodio y el disolvente se elimina al vacío. El producto bruto se purifica mediante cromatografía en columna (gel de sílice, hexano/acetona 9:1). Se obtienen 219 g (contenido: 100 %, HPLC, 66,2 % del valor teórico) de 1-(1-cloroetil)-2-nitrobenzene en forma de un aceite marrón [logP (pH 2,3) = 2,87].

**Preparación de los materiales de partida de la fórmula (XI):**Ejemplo (XI-1)

15 En un matraz de tres bocas de 6 litros con agitador, embudo de goteo, termómetro y contador de burbujas se disponen 320 g (1,938 mol) de 2-nitroacetofenona en 3200 ml de metanol y con una refrigeración suave a 30-40 °C se añade gota a gota una solución de 73,3 g (1,938 mol) de borohidruro de sodio en 288 ml de agua. Después de extinguirse la reacción se agita durante otras 16 horas a temperatura ambiente. Para el procesamiento se neutraliza con ácido clorhídrico diluido y el disolvente se elimina en un evaporador rotatorio. El residuo remanente se recoge en diclorometano, se lava con agua, se seca sobre sulfato de sodio y el disolvente se elimina al vacío. Se obtienen 311 g (contenido: 95,1 %, HPLC, 91,3 % del valor teórico) de 1-(2-nitrofenil)etanol [logP (pH 2,3) = 1,49] en forma de un aceite claro.

25 La determinación de los valores de logP indicados se realizó según la directiva de la CEE 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alto rendimiento) en una columna de fase inversa (C18). Temperatura: 43 °C.

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

30 La calibración se realizó usando alcan-2-onas no ramificadas (con 3 a 16 átomos de carbono) con valores de logP conocidos (determinación de los valores logP por medio de los tiempos de retención mediante interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los valores de lambda-max se calcularon por medio de espectros UV de 200 nm a 400 nm en el máximo de la señal cromatográfica.

**Ejemplos de aplicación:**35 Ejemplo A**Ensayo de Podosphaera (manzana) / de protección**

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona  
 24,5 partes en peso de dimetilacetamida  
 Emulsionante: 1 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

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

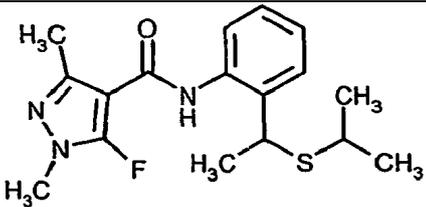
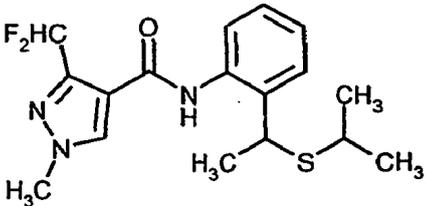
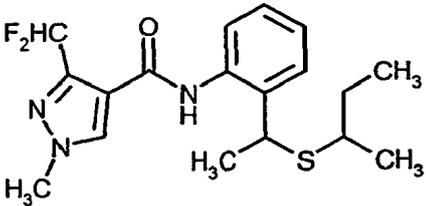
5 Para examinar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la cantidad de aplicación indicada de la preparación de principio activo. Después de secarse la capa de pulverizado se inocula a las plantas una suspensión acuosa de esporas de organismos patógenos del mildiu de la manzana *Podosphaera leucotricha*. Las plantas se disponen después en un invernadero a 23 °C y a una humedad relativa de aproximadamente el 70 %.

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

10

Tabla A

Ensayo de *Podosphaera* (manzana) / de protección

Principio activo según la invención	Cantidad de aplicación de principio activo en g/ha	Eficacia en %
	100	91
	100	84
	100	94

15

Ejemplo B**Ensayo de Venturia (manzana) / de protección**

Disolvente:	24,5	partes en peso de acetona
	24,5	partes en peso de dimetilacetamida
Emulsionante:	1	parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

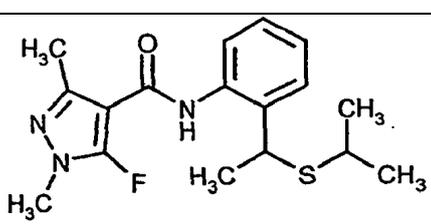
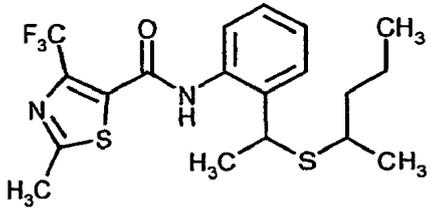
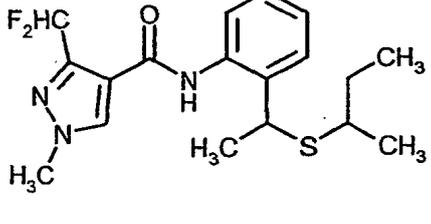
5 Para elaborar una preparación de principios activos conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

Para examinar la actividad protectora se pulverizan las plantas jóvenes con la preparación de principio activo con la cantidad de aplicación mencionada. Tras secarse la capa de pulverizado, se inocula a las plantas con una suspensión acuosa de conidios de organismos patógenos de la roña de la manzana *Venturia inaequalis* y se mantienen durante 1 día a aproximadamente 20 °C y el 100 % de humedad relativa en una cabina de incubación.

10 Las plantas se disponen después en un invernadero a 21 °C y a una humedad relativa de aproximadamente el 90 %.

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

Tabla B**Ensayo de Venturia (manzana) / de protección**

Principio activo según la invención	Cantidad de aplicación de principio activo en g/ha	Eficacia en %
	100	95
	100	89
	100	99

Ejemplo C

**Ensayo de Botrytis (alubia) / de protección**

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona  
 24,5 partes en peso de dimetilacetamida  
 Emulsionante: 1 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

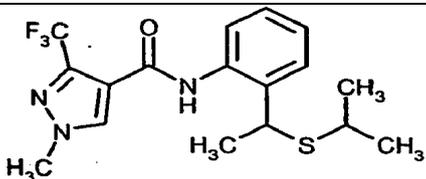
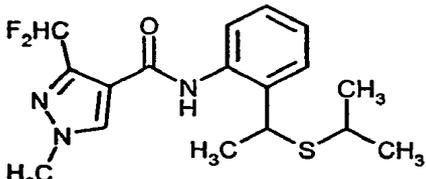
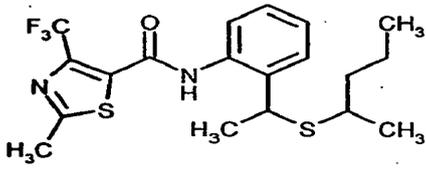
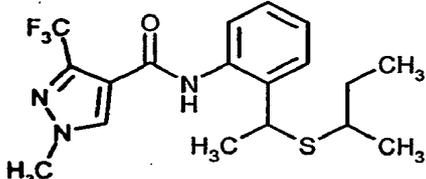
5 Para elaborar una preparación de principios activos conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

Para examinar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la cantidad de aplicación indicada de la preparación de principio activo. Después de secarse la capa de pulverizado, se aplica a cada hoja 2 pequeñas porciones de agar cubiertas con Botrytis cinerea. Las plantas inoculadas se disponen en una cámara a oscuras a aproximadamente 20 °C y el 100 % de humedad relativa.

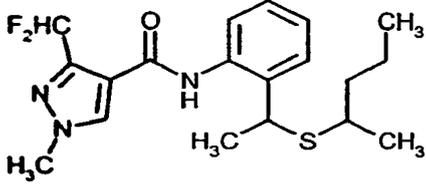
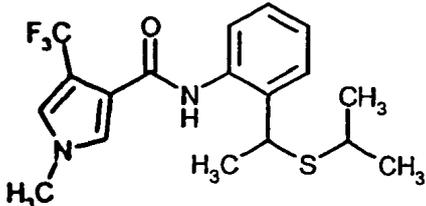
10 2 días después de la inoculación se analiza el tamaño de las manchas de infestación en las hojas. A este respecto, un 0 % significa una eficacia que corresponde a la del control, mientras que una eficacia del 100 % significa que no se observa ninguna infestación.

Tabla C

**Ensayo de Botrytis (alubia) / de protección**

Principio activo según la invención	Cantidad de aplicación de principio activo en g/ha	Eficacia en %
	500	84
	500	100
	500	99
	500	100

**Ensayo de Botrytis (alubia) / de protección**

Principio activo según la invención	Cantidad de aplicación de principio activo en g/ha	Eficacia en %
	500	97
	500	97

Ejemplo D**Ensayo de Puccinia (trigo) / de protección**

5

Disolvente: 50 partes en peso de N,N-dimetilacetamida

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilarilpoliglicol éter

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

10 Para examinar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la cantidad de aplicación indicada de la preparación de principio activo. Después de secarse la capa de pulverizado, se pulverizan las plantas con una suspensión de conidios de Puccinia recondita. Las plantas se mantienen durante 48 horas a 20 °C y a una humedad relativa del 100 % en una cabina de incubación.

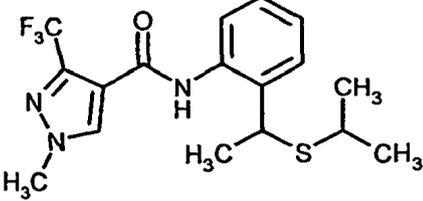
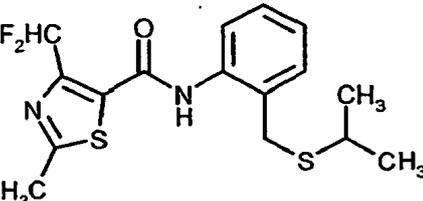
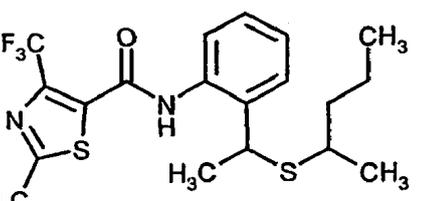
Las plantas se disponen en un invernadero a una temperatura de aproximadamente 20 °C y a una humedad relativa del aire del 80 %, para favorecer el desarrollo de pústulas de roya.

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

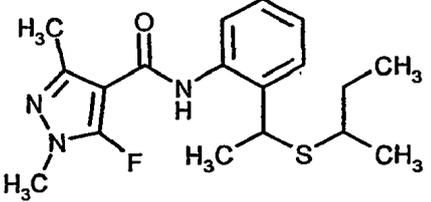
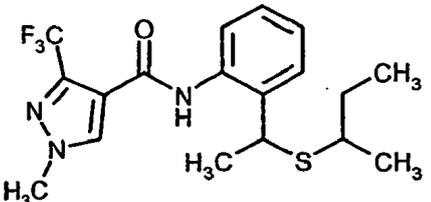
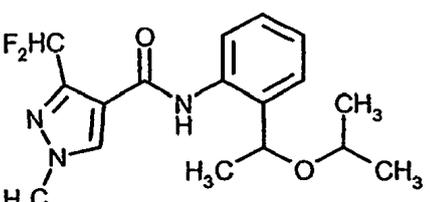
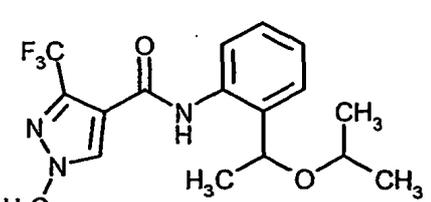
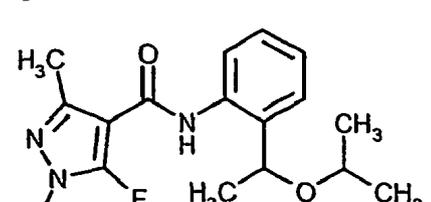
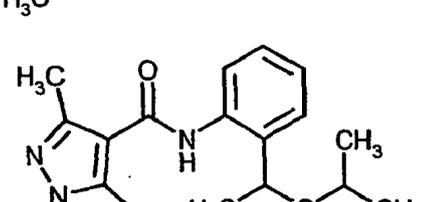
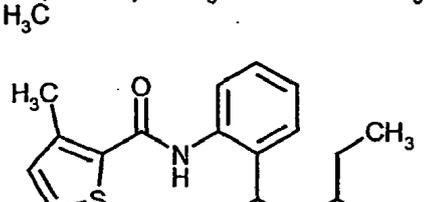
20

Tabla D

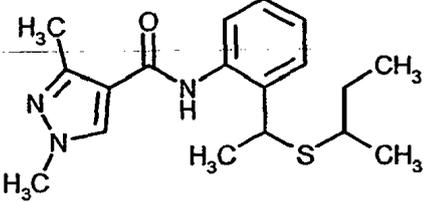
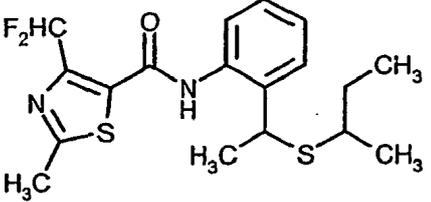
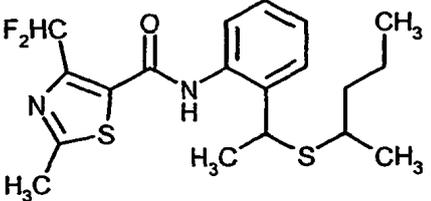
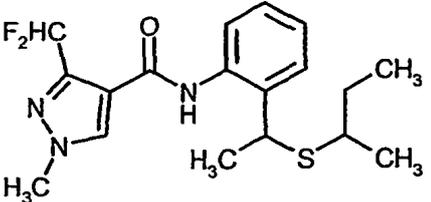
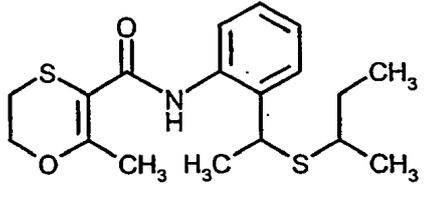
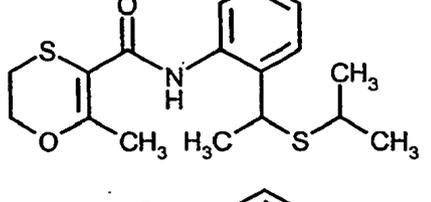
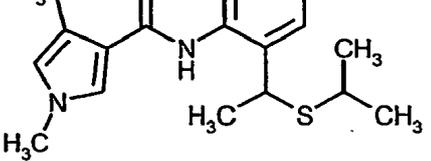
Ensayo de Puccinia (trigo) / de protección

Principio activo según la invención	Cantidad de aplicación de principio activo en g/ha	Eficacia en %
	500	100
	500	93
	500	100

(continuación)  
**Ensayo de Puccinia (trigo) / de protección**

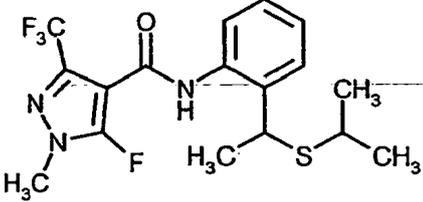
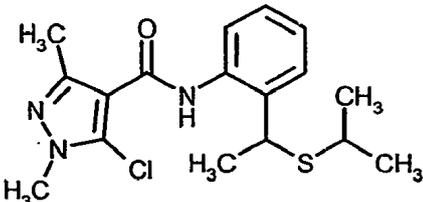
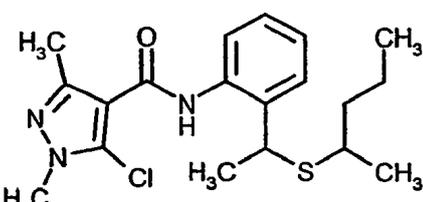
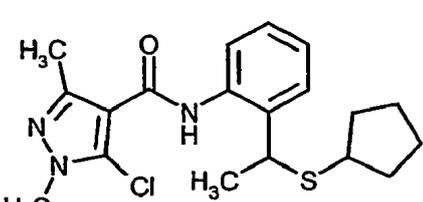
Principio activo según la invención	Cantidad de aplicación de principio activo en g/ha	Eficacia en %
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

(continuación)  
**Ensayo de Puccinia (trigo) / de protección**

Principio activo según la invención	Cantidad de aplicación de principio activo en g/ha	Eficacia en %
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

(continuación)

**Ensayo de Puccinia (trigo) / de protección**

Principio activo según la invención	Cantidad de aplicación de principio activo en g/ha	Eficacia en %
	500	96
	500	100
	500	100
	500	100

Ejemplo E

**Ensayo de Alternaria (tomate) / de protección**

5

Disolvente: 49 partes en peso de N,N-dimetilacetamida

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

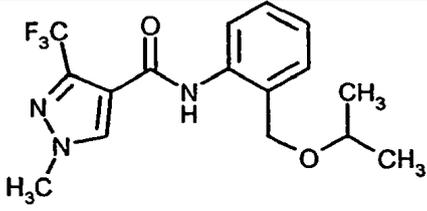
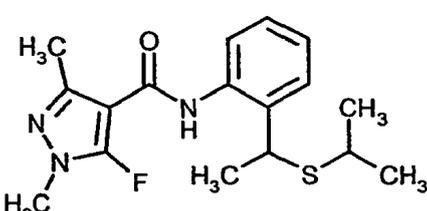
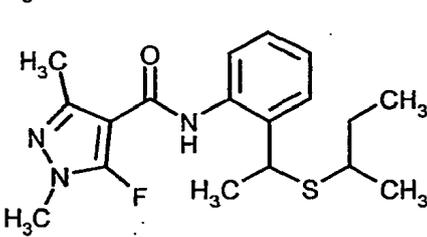
Para elaborar una preparación de principios activos conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada.

10 Para examinar la actividad protectora se pulverizan plantas de tomate jóvenes con la cantidad de aplicación indicada de la preparación de principio activo. 1 día después del tratamiento, se inocula a las plantas una suspensión de esporas de *Alternaria solani* y, a continuación, se mantienen durante 24 h al 100 % de humedad relativa y 22 °C. A continuación, las plantas se mantienen al 96 % de humedad relativa y a una temperatura de 20 °C.

La evaluación se lleva a cabo 7 día después de la inoculación. A este respecto, un 0 % significa una eficacia que corresponde a la del control, mientras que una eficacia del 100 % significa que no se observa ninguna infestación.

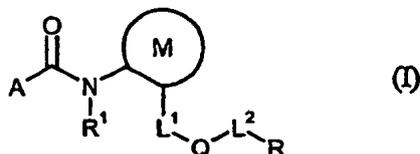
Tabla E

**Ensayo de Alternaria (tomate) / de proteccion**

Principio activo según la invención	Cantidad de aplicación de principio activo en g/ha	Eficacia en %
	750	95
	750	90
	750	95

## REIVINDICACIONES

1. Carboxamidas de la fórmula (I)



en la que

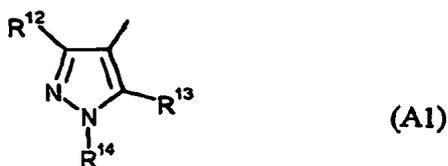
- 5  $R^1$  representa hidrógeno, alquilo  $C_1-C_8$ , alquil  $C_1-C_6$ -sulfonilo, alquil  $C_1-C_6$ -sulfonilo, alcoxi  $C_1-C_4$ -alquilo  $C_1-C_4$ , cicloalquilo  $C_3-C_8$ ; halogenoalquilo  $C_1-C_6$ , halogenoalquil  $C_1-C_4$ -tio, halogenoalquil  $C_1-C_4$ -sulfinilo, halogenoalquil  $C_1-C_4$ -sulfonilo, halogenoalcoxi  $C_1-C_4$ -alquilo  $C_1-C_4$ , halogenocicloalquilo  $C_3-C_8$  con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; formilo, formil-alquilo  $C_1-C_3$ , (alquil  $C_1-C_3$ )carbonil-alquilo  $C_1-C_3$ , (alcoxi  $C_1-C_3$ )carbonil-alquilo  $C_1-C_3$ ; halogeno-(alquil  $C_1-C_3$ )carbonil-alquilo  $C_1-C_3$ , halogeno-(alcoxi  $C_1-C_3$ )carbonil-alquilo  $C_1-C_3$  con, respectivamente, 1 a 13 átomos de flúor, cloro y/o bromo; (alquil  $C_1-C_8$ )carbonilo, (alcoxi  $C_1-C_8$ )carbonilo, (alcoxi  $C_1-C_4$ -alquil  $C_1-C_4$ )carbonilo, (cicloalquil  $C_3-C_8$ )carbonilo; (halogenoalquil  $C_1-C_6$ )carbonilo, (halogenoalcoxi  $C_1-C_6$ )carbonilo, (halogeno-alcoxi  $C_1-C_4$ -alquil  $C_1-C_4$ )carbonilo, (halogenocicloalquil  $C_3-C_8$ )carbonilo con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; o  $-C(=O)C(=O)R^2$ ,  $-CONR^3R^4$  o  $-CH_2NR^5R^6$ ,
- 10  $R^2$  representa hidrógeno, alquilo  $C_1-C_8$ , alcoxi  $C_1-C_8$ , alcoxi  $C_1-C_4$ -alquilo  $C_1-C_4$ , cicloalquilo  $C_3-C_8$ ; halogenoalquilo  $C_1-C_6$ , halogenoalcoxi  $C_1-C_6$ , halogenoalcoxi  $C_1-C_4$ -alquilo  $C_1-C_4$ , halogenocicloalquilo  $C_3-C_8$  con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo,
- $R^3$  y  $R^4$  representan independientemente uno de otro, respectivamente, hidrógeno, alquilo  $C_1-C_8$ , alcoxi  $C_1-C_4$ -alquilo  $C_1-C_4$ , cicloalquilo  $C_3-C_8$ ; halogenoalquilo  $C_1-C_8$ , halogenoalcoxi  $C_1-C_4$ -alquilo  $C_1-C_4$ , halogenocicloalquilo  $C_3-C_8$  con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo,
- 20  $R^3$  y  $R^4$ , además, conjuntamente con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclo con 5 a 8 átomos de anillo saturado, dado el caso sustituido una o más veces, de forma igual o distinta, con halógeno o alquilo  $C_1-C_4$ , pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes de la serie de oxígeno, azufre o  $NR^7$ ,
- 25  $R^5$  y  $R^6$ , independientemente uno de otro, representan hidrógeno, alquilo  $C_1-C_8$ , cicloalquilo  $C_3-C_8$ ; halogenoalquilo  $C_1-C_8$ , halogenocicloalquilo  $C_3-C_8$  con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo,
- $R^5$  y  $R^6$ , además, conjuntamente con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclo con 5 a 8 átomos de anillo saturado, dado el caso sustituido una o más veces, de forma igual o distinta, con halógeno o alquilo  $C_1-C_4$ , pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes de la serie de oxígeno, azufre o  $NR^7$ ,
- 30  $R^7$  representa hidrógeno o alquilo  $C_1-C_6$ ,
- M representa un anillo de fenilo, respectivamente sustituido una vez con  $R^8$ ,
- $R^8$  representa hidrógeno, flúor, cloro metilo, iso-propilo, metiltio o trifluorometilo,
- $R^8$ , además, representa metoxi
- $R^{8-A}$  representa hidrógeno, metilo, metiltio o trifluorometilo,
- 35  $L^1$  representa alquileno (alcanodiilo)  $C_1-C_{10}$ ,
- Q representa O, S, SO,  $SO_2$  o  $NR^9$ ,
- $L^2$  representa un enlace directo,  $SiR^{10}R^{11}$  o CO,

R representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>,

R<sup>9</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>,

- 5 R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,

A representa el resto de la fórmula (A1)



en la que

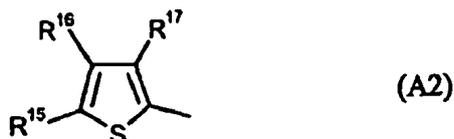
- 10 R<sup>12</sup> representa hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno, aminocarbonilo o aminocarbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

R<sup>13</sup> representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio,

- 15 R<sup>14</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, hidroxil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno, o fenilo,

o

A representa el resto de la fórmula (A2)



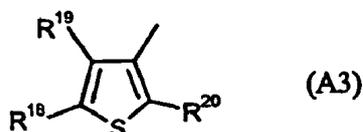
- 20 en la que

R<sup>15</sup> y R<sup>16</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

R<sup>17</sup> representa halógeno, ciano o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con respectivamente 1 a 5 átomos de halógeno,

- 25 o

A representa el resto de la fórmula (A3)



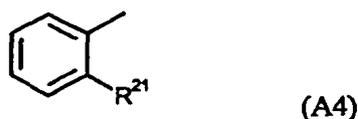
en la que

R<sup>18</sup> y R<sup>19</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

R<sup>20</sup> representa hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

5 o

A representa el resto de la fórmula (A4)

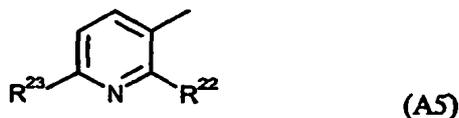


en la que

10 R<sup>21</sup> representa halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogeno-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa el resto de la fórmula (A5)



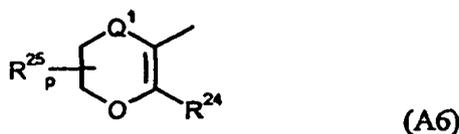
en la que

15 R<sup>22</sup> representa halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno,

R<sup>23</sup> representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfinilo o alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo,

o

20 A representa el resto de la fórmula (A6)



en la que

R<sup>24</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

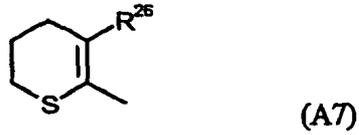
R<sup>25</sup> representa alquilo (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>),

25 Q<sup>1</sup> representa S (azufre), SO, SO<sub>2</sub> o CH<sub>2</sub>,

p representa 0, 1 o 2, representando R<sup>25</sup> restos idénticos o diferentes cuando p representa 2,

o

A representa el resto de la fórmula (A7)



en la que

5 R<sup>26</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa el resto de la fórmula (A8)

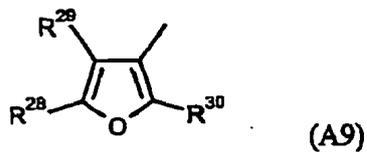


en la que

10 R<sup>27</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa el resto de la fórmula (A9)



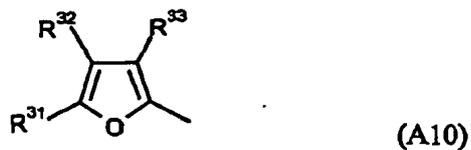
en la que

15 R<sup>28</sup> y R<sup>29</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, halógeno, amino, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

R<sup>30</sup> representa hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa el resto de la fórmula (A10)



20

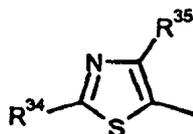
en la que

R<sup>31</sup> y R<sup>32</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, halógeno, amino, nitro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

R<sup>33</sup> representa hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

5 A representa el resto de la fórmula (A11)



(A11)

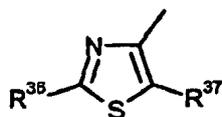
en la que

R<sup>34</sup> representa hidrógeno, halógeno, amino, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino, di-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)amino, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

10 R<sup>35</sup> representa halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa el resto de la fórmula (A12)



(A12)

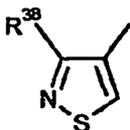
en la que

15 R<sup>36</sup> representa hidrógeno, halógeno, amino, -alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino, di-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)amino, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

R<sup>37</sup> representa halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa el resto de la fórmula (A13)



(A13)

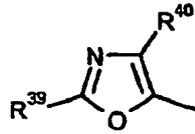
20

en la que

R<sup>38</sup> representa halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa el resto de la fórmula (A14)



(A14)

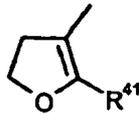
en la que

R<sup>39</sup> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

R<sup>40</sup> representa halógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

5 o

A representa el resto de la fórmula (A15)



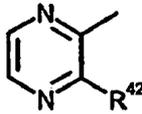
(A15)

en la que

R<sup>41</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

10 o

A representa el resto de la fórmula (A16)



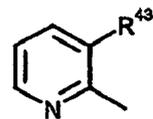
(A16)

en la que

R<sup>42</sup> representa hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de halógeno,

15 o

A representa el resto de la fórmula (A17)



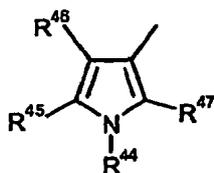
(A17)

en la que

20 R<sup>43</sup> representa halógeno, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa el resto de la fórmula (A18)



(A18)

en la que

5  $R^{44}$  representa hidrógeno, ciano, alquilo  $C_1-C_4$ , halogenoalquilo  $C_1-C_4$  con 1 a 5 átomos de halógeno, alcoxi  $C_1-C_4$ -alquilo  $C_1-C_4$ , hidroxialquilo  $C_1-C_4$ , alquil  $C_1-C_4$ -sulfonilo, di(alquil  $C_1-C_4$ )aminosulfonilo, alquil  $C_1-C_4$ -carbonilo o fenilsulfonilo o benzoilo respectivamente, dado el caso, sustituidos,

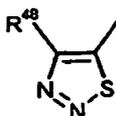
$R^{45}$  representa hidrógeno, halógeno, alquilo  $C_1-C_4$  o halogenoalquilo  $C_1-C_4$  con 1 a 5 átomos de halógeno,

$R^{46}$  representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo  $C_1-C_4$  o halogenoalquilo  $C_1-C_4$  con 1 a 5 átomos de halógeno,

$R^{47}$  representa hidrógeno, halógeno, alquilo  $C_1-C_4$  o halogenoalquilo  $C_1-C_4$  con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

10 A representa el resto de la fórmula (A19)



(A19)

en la que

$R^{48}$  representa alquilo ( $C_1-C_4$ ).

15 2. Carboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que R no representa alcoxi cuando  $L^2$  representa un enlace directo.

3. Carboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1 o 2, en la que

20  $R^1$  representa hidrógeno, alquilo  $C_1-C_6$ , alquil  $C_1-C_4$ -sulfinilo, alquil  $C_1-C_4$ -sulfonilo, alcoxi  $C_1-C_4$ -alquilo  $C_1-C_3$ , cicloalquilo  $C_4-C_6$ ; halogenoalquilo  $C_1-C_4$ , halogenoalquil  $C_1-C_4$ -tio, halogenoalquil  $C_1-C_4$ -sulfinilo, halogenoalquil  $C_1-C_4$ -sulfonilo, halogenoalcoxi  $C_1-C_3$ -alquilo  $C_1-C_3$ , halogenocicloalquilo  $C_3-C_6$  con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; formilo, formil-alquilo  $C_1-C_3$ , (alquil  $C_1-C_4$ )carbonil-alquilo  $C_1-C_3$ , (alcoxi  $C_1-C_3$ )carbonil-alquilo  $C_1-C_3$ ; halogeno-(alquil  $C_1-C_3$ )carbonil-alquilo  $C_1-C_4$ , halogeno-(alcoxi  $C_1-C_3$ )carbonil-alquilo  $C_1-C_3$  con, respectivamente, 1 a 13 átomos de flúor, cloro y/o bromo; (alquil  $C_1-C_6$ )carbonilo, (alcoxi  $C_1-C_4$ )carbonilo, (alcoxi  $C_1-C_3$ -alquil  $C_1-C_3$ )carbonilo, (cicloalquil  $C_3-C_6$ )carbonilo; (halogenoalquil  $C_1-C_4$ )carbonilo, (halogenoalcoxi  $C_1-C_4$ )carbonilo, (halogeno-alcoxi  $C_1-C_3$ -alquil  $C_1-C_3$ )carbonilo, (halogenocicloalquil  $C_3-C_6$ )carbonilo con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; o  $-C(=O)C(=O)R^2$ ,  $-\text{CONR}^3R^4$  o  $-\text{CH}_2\text{NR}^5R^6$ ,

$R^2$  representa hidrógeno, alquilo  $C_1-C_6$ , alcoxi  $C_1-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_3$ -alquilo  $C_1-C_3$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ ; halogenoalquilo  $C_1-C_4$ , halogenoalcoxi  $C_1-C_4$ , halogenoalcoxi  $C_1-C_3$ -alquilo  $C_1-C_3$ , halogenocicloalquilo  $C_3-C_4$  con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

30  $R^3$  y  $R^4$  representan independientemente uno de otro, respectivamente, hidrógeno, alquilo  $C_1-C_4$ , alcoxi  $C_1-C_3$ -alquilo  $C_1-C_3$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ ; halogenoalquilo  $C_1-C_4$ , halogenoalcoxi  $C_1-C_3$ -alquilo  $C_1-C_3$ , halogenocicloalquilo  $C_3-C_6$  con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

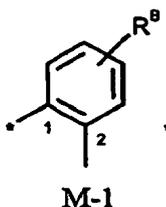
35  $R^3$  y  $R^4$ , además, conjuntamente con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclo con 5 o 6 átomos de anillo saturado, dado el caso sustituido de una o a cuatro veces, de forma igual o distinta, con halógeno o alquilo  $C_1-C_4$ , pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes de la serie de oxígeno, azufre o  $\text{NR}^7$ ,

R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

5 R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup>, además, conjuntamente con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un heterociclo con 5 o 6 átomos de anillo saturado, dado el caso sustituido una o más veces, de forma igual o distinta, con halógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes de la serie de oxígeno, azufre o NR<sup>7</sup>,

R<sup>7</sup> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>,

M representa



10 estando unido el enlace marcado con "\*" con la amida,

R<sup>8</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro metilo, iso-propilo, metiltio o trifluorometilo,

R<sup>8</sup>, además, representa metoxi,

R<sup>8-A</sup> representa hidrógeno, metilo, metiltio o trifluorometilo,

L<sup>1</sup> representa alquileno (alcanodiilo) C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>,

15 Q representa O, S, SO, SO<sub>2</sub> o NR<sup>9</sup>,

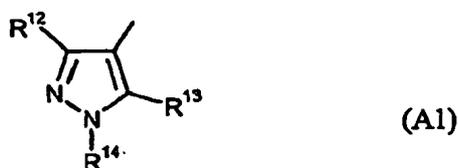
L<sup>2</sup> representa un enlace directo, SiR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> o CO,

R representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>,

R<sup>9</sup> representa hidrógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>,

20 R<sup>10</sup> y R<sup>11</sup>, independientemente uno de otro, representan alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> o alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>,

A representa el resto de la fórmula (A1)



en la que

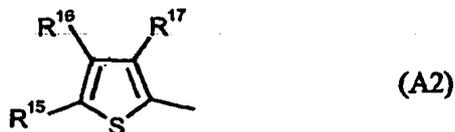
25 R<sup>12</sup> representa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, iso-propilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, ciclopropilo, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo, trifluorometiltio, difluorometiltio, aminocarbonilo, aminocarbonilmetilo o aminocarboniletilo,

R<sup>13</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio o etiltio,

R<sup>14</sup> representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo, hidroximetilo, hidroximetilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo o fenilo,

o

A representa el resto de la fórmula (A2)



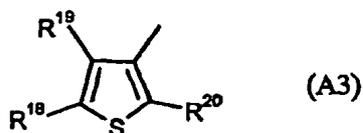
en la que

R<sup>15</sup> y R<sup>16</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

10 R<sup>17</sup> representa flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>1</sub> o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

o

A representa el resto de la fórmula (A3)



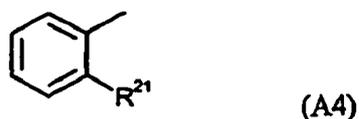
en la que

15 R<sup>18</sup> y R<sup>19</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

R<sup>20</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

o

20 A representa el resto de la fórmula (A4)

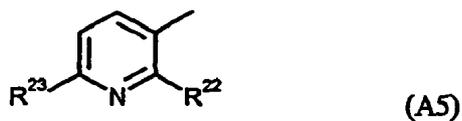


en la que

R<sup>21</sup> representa flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-tio con, respectivamente, 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

25 o

A representa el resto de la fórmula (A5)



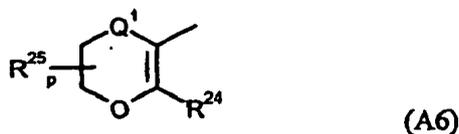
en la que

5 R<sup>22</sup> representa flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

R<sup>23</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-sulfinilo o alquil C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-sulfonilo,

o

10 A representa el resto de la fórmula (A6)



en la que

R<sup>24</sup> representa metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

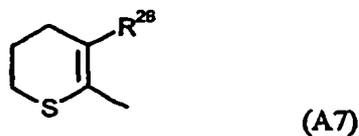
R<sup>25</sup> representa metilo o etilo,

15 Q<sup>1</sup> representa S (azufre), SO<sub>2</sub> o CH<sub>2</sub>,

p representa 0 o 1,

o

A representa el resto de la fórmula (A7)



20 en la que

R<sup>26</sup> representa metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

o

A representa el resto de la fórmula (A8)



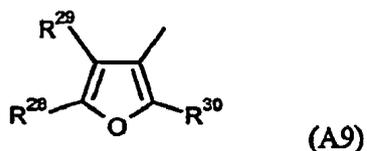
en la que

R<sup>27</sup> representa metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluoroclorometilo o triclorometilo,

o

A representa el resto de la fórmula (A9)

5



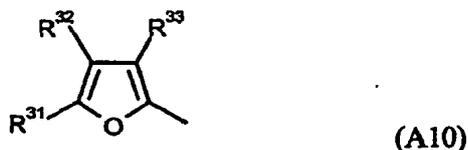
en la que

R<sup>28</sup> y R<sup>29</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

10 R<sup>30</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

o

A representa el resto de la fórmula (A10)



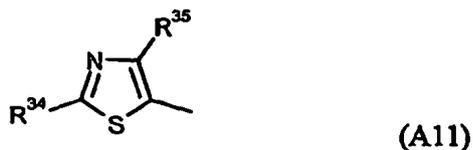
en la que

15 R<sup>31</sup> y R<sup>32</sup>, independientemente uno de otro, representan hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, nitro, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

R<sup>33</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

o

20 A representa el resto de la fórmula (A11)



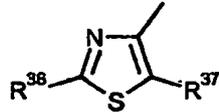
en la que

R<sup>34</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)amino, ciano, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

25 R<sup>35</sup> representa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

o

A representa el resto de la fórmula (A12)



(A12)

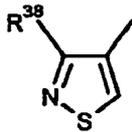
en la que

5 R<sup>36</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-amino, di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)amino, ciano, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

R<sup>37</sup> representa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

o

A representa el resto de la fórmula (A13)



(A13)

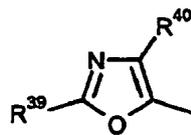
10

en la que

R<sup>38</sup> representa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

o

A representa el resto de la fórmula (A14)



(A14)

15

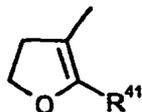
en la que

R<sup>39</sup> representa hidrógeno, metilo o etilo,

R<sup>40</sup> representa flúor, cloro, bromo, metilo o etilo,

o

20 A representa el resto de la fórmula (A15)



(A15)

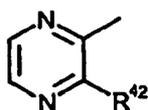
en la que

R<sup>41</sup> representa metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

o

A representa el resto de la fórmula (A16)

5



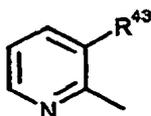
(A16)

en la que

R<sup>42</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

o

10 A representa el resto de la fórmula (A17)



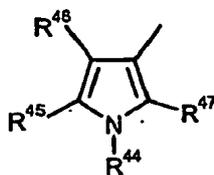
(A17)

en la que

15 R<sup>43</sup> representa flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con, respectivamente, 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

o

A representa el resto de la fórmula (A18)



(A18)

en la que

20 R<sup>44</sup> representa hidrógeno, metilo, etilo halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, hidroximetilo, hidroxietilo, metilsulfonilo o dimetilaminosulfonilo,

R<sup>45</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

25 R<sup>46</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

R<sup>47</sup> representa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> con 1 a 5 átomos de flúor, cloro y/o bromo,

o

A representa el resto de la fórmula (A19)



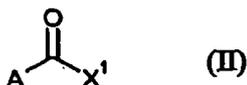
5

en la que

R<sup>48</sup> representa metilo, etilo, n-propilo o iso-propilo.

4. Procedimiento de preparación de carboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, **caracterizado porque**

10 (a) se hacen reaccionar derivados de ácido carboxílico de la fórmula (II)

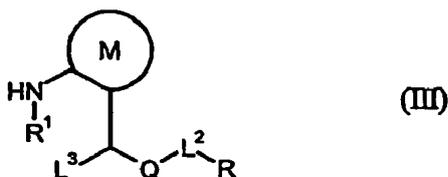


en la que

A tiene los significados indicados anteriormente y

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

15 con derivados de anilina de la fórmula (III)



en la que

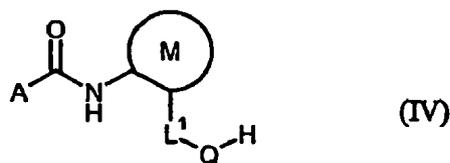
R<sup>1</sup>, M, Q, L<sup>2</sup> y R tienen los significados indicados anteriormente,

L<sup>3</sup> representa hidrógeno o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>9</sub>,

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

o

(b) se hacen reaccionar carboxamidas de la fórmula (IV)



en la que M, L<sup>1</sup>, Q y A tienen los significados indicados anteriormente, con un compuesto de la fórmula (V)



en la que

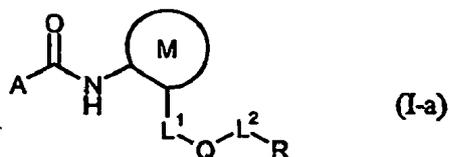
5 L<sup>2</sup> y R tienen los significados indicados anteriormente,

Y representa halógeno, triflato (trifluorometilsulfonilo), mesilato (metilsulfonilo) o tosilato (4-metilfenilsulfonilo),

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

o

(c) se hacen reaccionar carboxamidas de la fórmula (I-a)



10

en la que M, L<sup>1</sup>, Q, L<sup>2</sup>, R y A tienen los significados indicados anteriormente,

con halogenuros de la fórmula (VI)



15

en la que

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

18 R<sup>1-A</sup> representa alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-tio, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-sulfonilo, halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; formilo, formil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>; halogeno-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, halogeno-(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> con, respectivamente, 1 a 13 átomos de flúor, cloro y/o bromo; (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo, (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)carbonilo; (halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, (halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)carbonilo, (halogeno-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo, (halogenocicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)carbonilo con, respectivamente, 1 a 9 átomos de flúor, cloro y/o bromo; o -C(=O)C(=O)R<sup>2</sup>, -CONR<sup>3</sup>R<sup>4</sup> o -CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>,

25

teniendo R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> los significados indicados anteriormente,

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

5. Agente para combatir microorganismos no deseados ,**caracterizado por** un contenido de al menos una carboxamida de la fórmula (I) según la reivindicación 1 junto con diluyentes y/o sustancias tensioactivas.

6. Uso de carboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1 para combatir microorganismos no deseados.

5 7. Procedimiento para combatir microorganismos no deseados, **caracterizado porque** se aplican carboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1 sobre los microorganismos y/o su hábitat.

8. Procedimiento de fabricación de agentes para combatir microorganismos no deseados, **caracterizado porque** se mezclan carboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1 con diluyentes y/o sustancias tensioactivas.

10