

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 549 409**

51 Int. Cl.:

**C07C 233/65** (2006.01)

**A01N 37/18** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **21.11.2006** **E 06830065 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **19.08.2015** **EP 1960350**

54 Título: **Nuevos derivados de N-(1-metil-2-feniletil)benzamida**

30 Prioridad:

**22.11.2005 EP 05356201**

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:  
**27.10.2015**

73 Titular/es:

**BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH  
(100.0%)  
Alfred-Nobel-Strasse 10  
40789 Monheim am Rhein , DE**

72 Inventor/es:

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

74 Agente/Representante:

**CARPINTERO LÓPEZ, Mario**

**ES 2 549 409 T3**

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

## DESCRIPCIÓN

Nuevos derivados de N-(1-metil-2-feniletil)benzamida

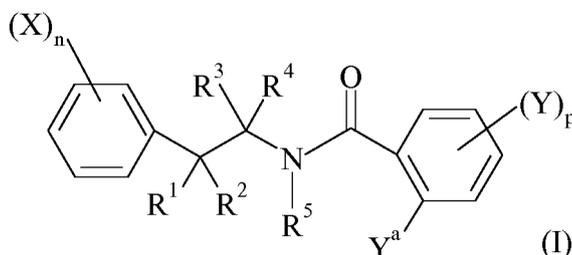
La presente invención se refiere a derivados de N-(1-metil-2-feniletil)benzamida novedosos, a su procedimiento de preparación, a su uso como fungicidas, en particular en forma de composiciones fungicidas y a procedimientos para combatir hongos fitopatógenos de plantas usando estos compuestos o sus composiciones.

La solicitud de patente internacional WO 97/08135 divulga derivados de acilaminosalicilamidas y su uso como fungicida. No obstante, los compuestos de acuerdo con la presente invención no están abarcados ni se divulgan en esa solicitud de patente. El documento EP-A 1 389 614 divulga N-(2-piridil) etil-benzamidas que no están sustituidas en el puente de etileno. El documento US 4.957.533 divulga fungicidas de N-alquilbenzamida que tampoco están sustituidas en el grupo alquileo que forma enlaces.

Siempre es de gran interés en el campo de las sustancias agroquímicas el uso de compuestos pesticidas novedosos con una alta eficacia para limitar y reducir el riesgo de aparición de cepas resistentes en los hongos que se van a tratar.

En la actualidad, los inventores han encontrado una nueva familia de compuestos que muestra una actividad fungicida.

En consecuencia, la presente invención se refiere a derivado de N-(1-metil-2-feniletil)benzamida de fórmula general (I)



- en la que:
- n es 1, 2;
  - p es 1;
  - X es el mismo o diferente y es un átomo de halógeno, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
  - R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> son un átomo de hidrógeno;
  - R<sup>3</sup> es un grupo metilo y R<sup>4</sup> es un átomo de hidrógeno;
  - R<sup>5</sup> es un átomo de hidrógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o un ciclopropilo;
  - Y es un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno; y
  - Y<sup>a</sup> es un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos de metaloides e isómeros ópticamente activos; con la condición de que el compuesto de fórmula general (I) sea diferente de:

- 2,4-dicloro-N-[1-metil-2-(3-trifluorometilfenil)etil]-benzamida;
- 2-cloro-N-[2-(4-clorofenil)-1-metil-etil]-benzamida.

En el contexto de la presente invención:

- halógeno significa flúor, bromo, cloro o yodo.
- carboxi significa -C(=O)OH ;
- carbonilo significa -C(=O)- ;
- carbamoilo significa -C(=O)NH<sub>2</sub>;
- N-hidroxicarbamoilo significa -C(=O)NHOH ;

- un grupo alquilo, un grupo alqueno y un grupo alquilo, así como restos que contienen estos términos, pueden ser lineales o ramificados; y
- heteroátomo significa azufre, nitrógeno u oxígeno.

5 En el contexto de la presente invención, también se entiende que en el caso de amino disustituido y de radicales carbamoilo disustituidos, los dos sustituyentes pueden formar conjuntamente con el átomo de nitrógeno que los porta un anillo heterocíclico saturado que contiene de 3 a 7 átomos.

10 Cualquiera de los compuestos de la presente invención puede existir en una o más formas isómeras ópticas o quirales, dependiendo del número de centros asimétricos del compuesto. Así la presente invención se refiere igualmente a todos los isómeros ópticos y a sus mezclas racémicas o escalémicas (el término “escalémica” denomina a una mezcla de enantiómeros en diferentes proporciones) y a las mezclas de todos los posibles estereoisómeros, en todas las proporciones. Los diastereómeros y/o los isómeros ópticos pueden separarse de acuerdo con los procedimientos que se conocen por sí mismos por el experto en la técnica.

Cualquiera de los compuestos de la presente invención puede existir también en una o más formas isómeras geométricas, dependiendo del número de enlaces dobles del compuesto.

15 La invención se refiere así igualmente a todos los isómeros geométricos y a todas las mezclas posibles, en todas las proporciones. Los isómeros geométricos pueden separarse de acuerdo con procedimientos generales, que se conocen por sí mismos por el experto en la técnica.

20 Cualquiera de los compuestos de fórmula general (I) en los que X representa un hidroxilo, un grupo sulfanilo o un grupo amino pueden encontrarse en su forma tautómera, como resultado del desplazamiento del protón de dicho grupo hidroxilo, sulfanilo o amino. Dichas formas tautómeras de dichos compuestos son también parte de la presente invención. Dicho de forma más general, todas las formas tautómeras de compuestos de la fórmula general (I) en las X representa un hidroxilo, un grupo sulfanilo o un grupo amino, así como las formas tautómeras de los compuestos que pueden usarse opcionalmente como intermedios en los procedimientos de preparación y que se definirán en la descripción de estos procedimientos, también son parte de la presente invención.

25 De acuerdo con la presente invención, el grupo fenilo puede estar sustituido en cualquier posición por  $(X)_n$ , en el que X y n son según se definen anteriormente. Preferentemente, la presente invención se refiere a derivado de N-(1-metil-2-feniletíl)benzamida de fórmula general (I) en el que las distintas características pueden elegirse por separado o en combinación de modo que sean:

- en lo que respecta a n, n es 1 o 2; y

30 – en lo que respecta a X, X se elige como que es un átomo de halógeno, o un halogenoalquilo  $C_1C_8$  que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

35 De acuerdo con la presente invención, los átomos de carbono del resto carboxamida del compuesto de fórmula (I) están sustituidos con  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  y  $R^4$ ; siendo  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  y  $R^4$  según se definen anteriormente. Preferentemente, la presente invención también se refiere a derivado de N-(1-metil-2-feniletíl)benzamida de fórmula general (I) en la que las distintas características pueden elegirse por separado o en combinación, de modo que sean:

- en lo que respecta a  $R^1$  y  $R^2$ ,  $R^1$  y  $R^2$  se eligen como un átomo de hidrógeno;
- en lo que respecta a  $R^3$  y  $R^4$ ,  $R^3$  se elige como un grupo metilo y  $R^4$  se elige, como un átomo de hidrógeno.

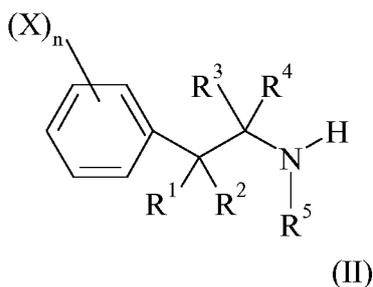
De acuerdo con la presente invención, el átomo de nitrógeno del resto carboxamida del compuesto de fórmula (I) está sustituido con  $R^5$ , siendo  $R^5$  un átomo de hidrógeno o un ciclopropilo.

40 De acuerdo con la presente invención, el grupo fenilo orto-sustituido puede estar sustituido en la posición orto por  $Y^a$  y en cualquier otra posición por cualquier otro  $(Y)_p$ , en los que  $Y^a$ , Y y p son según se definen anteriormente. Preferentemente, la presente invención se refiere a derivados de N-(1-metil-2-feniletíl)benzamida de fórmula general (I) en los que las distintas características pueden elegirse por separado o en combinación, de modo que sean:

- en lo que respecta a p, p es 1; y

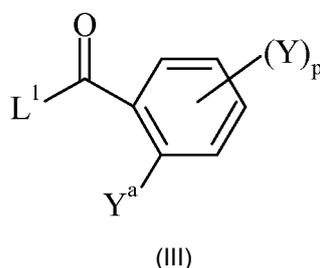
45 – en lo que respecta a Y, Y se elige como un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno.

La presente invención se refiere también a un procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). Así, de acuerdo con otro aspecto de la presente invención se proporciona un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula general (I) según se define anteriormente, lo que comprende hacer reaccionar un derivado de 1-alquil-2-feniletilamina de fórmula general (II) o una de sus sales



en el que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, X y n son según se definen anteriormente;

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

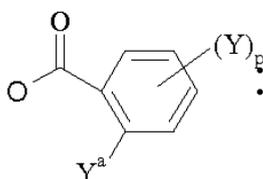


5

en la que:

– Y<sup>a</sup>, Y y p son según se definen anteriormente; y

– L<sup>1</sup> es un grupo saliente elegido como un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, -OR<sup>6</sup>, -OCOR<sup>6</sup>, R<sup>6</sup> siendo un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula



10

en presencia de un catalizador y si L<sup>1</sup> es un grupo hidroxilo, en presencia de un agente condensante.

El procedimiento de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de un catalizador. Puede elegirse un catalizador adecuado de modo que sea 4-dimetil-aminopiridina, 1-hidroxibenzotriazol o dimetilformamida.

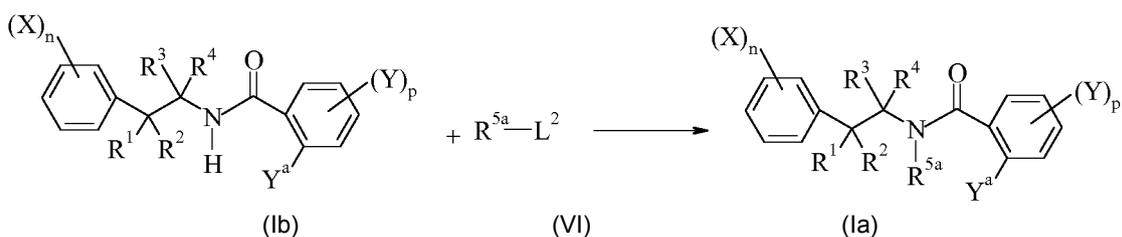
15

En caso de que L<sup>1</sup> sea un grupo hidroxilo, el procedimiento de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de un agente condensante. Puede elegirse un agente condensante adecuado de modo que sea un formador de haluros de ácidos, tal como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, tricloruro óxido de fósforo o cloruro de tionilo; formador de anhídrido, tal como cloroformiato de etilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de de isobutilo o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas, tales como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes condensantes habituales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonil-diimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano, hidrato de cloruro de 4-(4,6-dimetoxi[1.3.5]triazin-2-il)-4-metilmorfolinio o bromo-tripirrolidino-fosfonio-hexafluorofosfato.

20

25

Cuando R<sup>5</sup> es un átomo de hidrógeno, el procedimiento mencionado anteriormente para la preparación del compuesto de fórmula general (I) puede completarse opcionalmente mediante una etapa adicional de acuerdo con el siguiente esquema de reacción:



en el que:

- R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, X, n, Y<sup>a</sup>, Y y p son según se definen anteriormente;
- 5 - L<sup>2</sup> es un grupo saliente elegido de modo que sea un átomo de halógeno, un 4-metilsulfoniloxi o un metilsulfoniloxi; y
- R<sup>5a</sup> es un grupo alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o un ciclopropilo;

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Ib) con un compuesto de fórmula general (VI) proporcionando un compuesto de fórmula general (Ia).

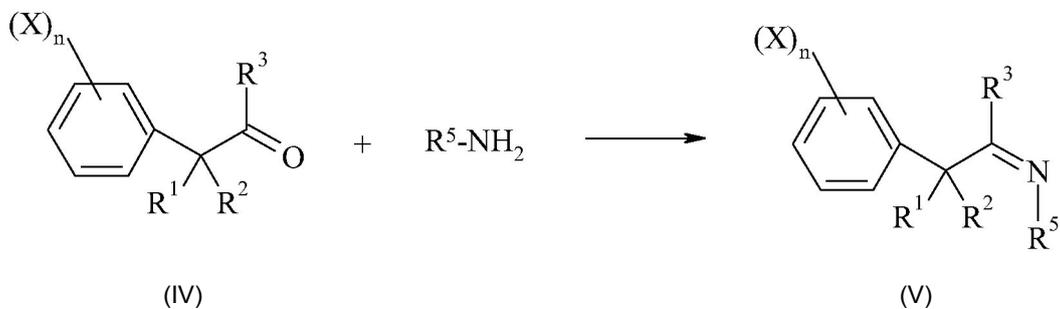
10 Dependiendo de la definición de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, X y n, pueden prepararse derivados de amina de fórmula general (II) por medio de diferentes procedimientos. Un ejemplo (A) de tal procedimiento puede ser cuando:

- R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup>, X y n son según se definen anteriormente; y
- R<sup>4</sup> es un átomo de hidrógeno;

15 entonces, el derivado amina de fórmula general (II) puede prepararse de acuerdo con un procedimiento que comprende:

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

Esquema A-1

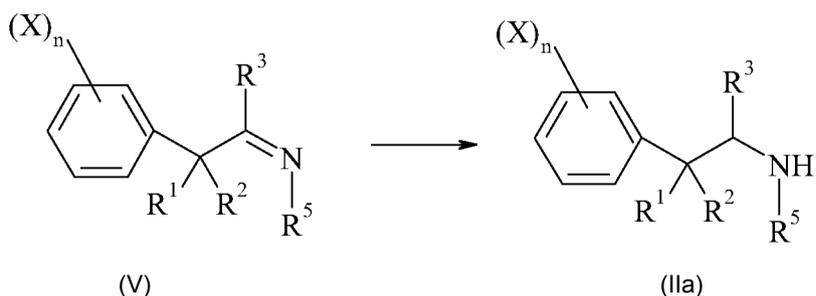


20 en el que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, X y n son según se definen anteriormente;

comprendiendo la reacción de un compuesto de fórmula general (IV) con una amina de fórmula R<sup>5</sup>-NH<sub>2</sub> para proporcionar un derivado de imina de fórmula general (V);

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

Esquema A-2



25

en el que  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^5$ , X y n son según se definen anteriormente;

que comprende la reducción de un derivado de imina de fórmula general (V) por hidrogenación o mediante un donante de hidruros, en el mismo recipiente o en uno diferente, proporcionando un derivado de imina de fórmula general (IIa) o una de sus sales. Preferentemente, el donador hidruro se elige de hidruros de metales o metaloides tales como  $LiAlH_4$ ,  $NaBH_4$ ,  $NaBH_3CN$ ,  $KBH_4$ ,  $B_2H_6$ .

El compuesto de acuerdo con la presente invención puede prepararse de acuerdo con los procedimientos generales de preparación descritos anteriormente. No obstante, se entiende que, sobre la base de su conocimiento general y de publicaciones disponibles, el operario experto será capaz de adaptar este procedimiento de acuerdo con la especificidad de cada uno de los compuestos, lo que es deseable para su síntesis.

Sobre la base de sus conocimientos generales y de publicaciones disponibles, el operario experto también será capaz de preparar compuestos intermedios de fórmula (V) de acuerdo con la presente invención.

La presente invención también se refiere a una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un material activo de fórmula general (I). De este modo, de acuerdo con la presente invención, se proporciona una composición fungicida que comprende, como un ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula general (I) tal como se ha definido anteriormente y un soporte, vehículo o carga agrícolamente aceptable.

En la presente memoria descriptiva, el término "soporte" designa un material natural o sintético, orgánico o inorgánico, con el que se combina el material activo para facilitar la aplicación, de forma notable a las partes de la planta. Este soporte es, por lo tanto, generalmente inerte y deberá ser agrícolamente aceptable. El soporte puede ser un sólido o un líquido. Los ejemplos de soportes adecuados incluyen arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, agua, alcoholes, en particular butanol, disolventes orgánicos, aceites minerales o vegetales y derivados de los mismos. Se pueden usar también mezclas de tales soportes.

La composición puede comprender también componentes adicionales. En particular, la composición puede comprender adicionalmente un tensioactivo. El tensioactivo puede ser un emulsionante, un agente dispersante o un agente humectante de tipo iónico o no iónico o una mezcla de tales tensioactivos. Puede hacerse mención, por ejemplo, de sales de ácido poliácrico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (en particular alquifenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (en particular tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polioxiethylados, ésteres de ácido graso de polioles y derivados de los compuestos anteriores que contienen funciones sulfato, sulfonato y fosfato. La presencia de al menos un tensioactivo es generalmente esencial cuando el material activo y/o el soporte inerte son insolubles en agua y cuando el agente vector para la aplicación es agua. Preferentemente, el contenido de tensioactivo puede estar comprendido entre el 5 % y el 40 % en peso de la composición.

Opcionalmente, pueden incluirse también otros componentes adicionales, por ejemplo coloides protectores, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, agentes de penetración, estabilizantes, agentes secuestrantes. De forma más general, los materiales activos pueden combinarse con cualquier aditivo sólido o líquido que satisfaga las técnicas de formulación habituales.

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

Las composiciones de acuerdo con la presente invención pueden usarse en diversas formas, tales como dispensador de aerosol, suspensión en cápsula, concentrado de niebla fría, polvo espolvoreable, concentrado emulsionante, emulsión de aceite en agua, emulsión de agua en aceite, gránulo encapsulado, gránulo fino, concentrado fluidizable para el tratamiento de semillas, gas (sometido a presión), producto generador de gas, gránulo, concentrado de niebla caliente, macrogránulo, microgránulo, polvo dispersable en aceite, concentrado fluidizable miscible en aceite, líquido miscible en aceite, pasta, varilla para plantas, polvo para tratamiento de semillas en seco, semillas recubiertas con un plaguicida, concentrado soluble, polvo soluble, solución para tratamiento de semillas, concentrado de suspensión (concentrado fluidizable), líquido de volumen ultra bajo (ULV), suspensión de volumen ultra bajo (ULV), gránulos o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento de suspensión, gránulos o comprimidos solubles en agua, polvo soluble en agua para tratamiento de semillas y polvo humectable.

Estas composiciones incluyen no solamente composiciones que están preparadas para aplicar a las plantas o semillas que hay que tratar por medio de un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo para pulverizar o espolvorear, sino también composiciones comerciales concentradas que deben diluirse antes de la aplicación al cultivo.

Los compuestos de la invención también pueden mezclarse con uno o más insecticidas, fungicidas, bactericidas, atrayentes, acaricidas o feromonas u otros compuestos con actividad biológica. Las mezclas obtenidas de este modo tienen un espectro de actividad ampliado. Las mezclas con otros fungicidas son particularmente ventajosas. Ejemplos de asociados de mezcla fungicidas adecuados pueden seleccionarse de las siguientes listas:

1) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de ácido nucleico como benalaxilo, benalaxilo-M, bupirimato, quiralaxilo,

- clozilacon, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, mefenoxam, himexazol, metalaxilo, metalaxilo-M, ofurace, oxadixilo, ácido oxolínico;
- 2) un compuesto capaz de inhibir la mitosis y la división celular tal como benomilo, carbendazim, dietofencarb, etaboxam, fuberidazol, pencicuron, tiabendazol, tiofanato-metilo, zoxamida;
- 5 3) un compuesto capaz de inhibir la respiración, por ejemplo como inhibidor de la respiración en el CI tal como diflumentorim;
- como inhibidor de la respiración en el CII tal como boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanilo, furametpir, furmeciclox, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tiofluzamida;
- 10 como inhibidor de la respiración CIII tal como amisulbrom, azoxistrobina, ciazofamid, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominoestrobina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, trifloxistrobina;
- 4) un compuesto capaz de actuar como un desacoplador tal como dinocap, dluazinam, meptildinocap;
- 5) un compuesto capaz de inhibir la producción de ATP tal como acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, siltiofam;
- 15 6) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de aminoácidos y proteínas tal como andoprim, blasticidina-S, ciprodinilo, kasugamicina, clorhidrato de kasugamicina hidrato, mepanipirim y pirimetanilo;
- 7) un compuesto capaz de inhibir la transducción de señal tal como fenciclonilo, fludioxonilo, quinoxifeno;
- 8) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de lípidos y membrana tal como bifenilo, clozolinato, edifenfós, etridiazol, iodocarb, iprobenfós, iprodiona, isoprotilano, procimidona, propamocarb, clorhidrato de propamocarb, pirazofós, 20 tolclofós-metilo, vinclozolina.
- 9) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de ergosterol tal como aldimorf, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, dodemorf, acetato de dodemorf, epoxiconazol, etaconazol, fenarimol, fenbuconazol, fenhexamid, fenpropidina, fenpropimorf, fluquinconazol, flurprimidol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol, ipconazol, 25 metconazol, miclobutanilo, naftifina, nuarimol, oxpoconazol, paclobutrazol, pefurazoato, penconazol, procloraz, propiconazol, protioconazol, piributicarb, pirifenox, simeconazol, espiroxamina, tebuconazol, terbinafina, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, tridemorf, triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol, viniconazol, voriconazol;
- 10) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de la pared celular tal como bentiavalicarb, bialafós, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, mandipropamid, polioxinas, polioxorim, validamicina A;
- 30 11) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de melanina tal como carpropamid, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, piroquilón, triciclazol;
- 12) un compuesto capaz de inducir una defensa en el huésped tal como acibenzolar-S-metilo, probenazol, tianidilo;
- 13) un compuesto capaz de tener una acción en múltiples sitios como mezcla burdeos, captafol, captan, clorotalonilo, naffenato de cobre, óxido de cobre, oxiclورو de cobre, preparaciones de cobre tales como hidróxido de cobre, sulfato de cobre, diclofluanid, ditianon, dodina, base exenta de dodina, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, mancobre, mancozeb, maneb, metiram, metiram cinc, oxina-cobre, propineb, azufre y preparaciones de azufre, incluidos polisulfuro de calcio, tiram, 35 tolifluanida, zineb, ziram;
- 14) un compuesto seleccionado de la lista siguiente:
- 40 (2E)-2-(2-{{6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il}oxi}fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida,  
 (2E)-2-{2-[[{(1E)-1-(3-[[{(E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi}fenil)etilideno]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida,  
 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol,  
 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxilato, 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina,  
 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)nicotinamida,  
 45 2-fenilfenol y sales, 3,4,5-tricloropiridina-2,6-dicarbonitrilo, 3,4-dicloro-N-(2-cianofenil)isotiazol-5-carboxamida,  
 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina,  
 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina,  
 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina,  
 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, sulfato de  
 50 8-hidroxiquinolina, bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvona, quinometionato, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanilo,  
 dazomet, debacarb, diclorofeno, diclomezina, dicloran, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina,  
 ferimzona, flumetover, fluopicolida, fluoroimida, flusulfamida, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio,  
 hexaclorobenceno, irumamicina, isotianilo, metasulfocarb,

(2E)-2-[(2-[(ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil)tio]metil]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, isotiocianato de metilo, metrafenona, mildiomicina, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxibenzamida, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metilbencenosulfonamida, N-(4-clorobencil)-3[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-ilo)fenil]propanamida, N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-ilo)fenil]propanamida, N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloronicotinamida, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodonicotinamida, N-[2-(4-[[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi]-3-metoxifenil)etil]-N<-(metilsulfonil)valinamida, N-{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino]}[6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, N-{2-[1,1'-bi(ciclopropil)-2-il]fenil}-3-(difluorometil)-, 1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluorometil)benzamida, natamicina, N-etil-N-metil-N'-(2-metil-5-(difluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil]imidaformamida, N-etil-N-metil-N'-(2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil]imidaformamida, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, 1H-imidazol-1-carbotioato de O-{1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropilo}, octilina, oxamocarb, oxifentina, pentaclorofenol y sales, ácido fosforoso y sus sales, piperalina, fosetilato de propamocarb, propanosina-sodio, proquinazid, piribencarb, pirrolnitrina, quintoceno, tecloftalam, tecnaceno, triazóxido, triclamida, valifenal y zarilamida.

La composición de acuerdo con la invención que comprende una mezcla de un compuesto de fórmula (I) con un compuesto bactericida también puede ser particularmente ventajosa. Los ejemplos de asociados de mezcla bactericidas adecuados se pueden seleccionar en la siguiente lista: bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilina, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomycin, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Las composiciones fungicidas de la presente invención pueden usarse para combatir curativa o preventivamente hongos fitopatógenos de cultivos. De este modo, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento para combatir curativa o preventivamente hongos fitopatógenos de cultivos caracterizado porque se aplica una composición fungicida tal como se ha definido anteriormente a la semilla, la planta y/o al fruto de la planta o al suelo en el que crece la planta o en el que se desea que crezca.

La composición tal como se usa contra hongos fitopatógenos de cultivos comprende una cantidad eficaz y no fitotóxica de un material activo de fórmula general (I).

La expresión "cantidad eficaz y no fitotóxica" significa una cantidad de composición de acuerdo con la invención que es suficiente para combatir o destruir los hongos presentes o propensos a aparecer en cultivos y que no conlleva ningún síntoma apreciable de fitotoxicidad para dichos cultivos. Una cantidad tal puede variar dentro de un intervalo amplio dependiendo del hongo a combatir, el tipo de cultivo, las condiciones climáticas y los compuestos incluidos en la composición fungicida de acuerdo con la invención.

Esta cantidad puede determinarse mediante ensayos de campo sistemáticos, que están dentro de las capacidades de un experto en la técnica.

El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la presente invención es útil para tratar material de propagación tal como tubérculos o rizomas, pero también semillas, plántulas o plántulas para transplantar y plantas o plantas para transplantar. Este procedimiento de tratamiento también puede ser útil para tratar raíces. El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la presente invención también puede ser útil para tratar las partes aéreas de la planta tales como troncos, tallos o cañas, hojas, flores y frutos de las plantas implicadas.

Entre las plantas que se pueden proteger con el procedimiento de acuerdo con la presente invención, se puede hacer mención de algodón; lino; parrá; fruto o cultivos de hortalizas tales como *Rosaceae* sp. (por ejemplo, fruta de pepita tal como manzanas y peras, pero también fruta de carozo tal como albaricoques, almendras y melocotones), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (por ejemplo bananos y plátanos), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (por ejemplo limones, naranjas y pomelo); *Solanaceae* sp. (por ejemplo tomates), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (por ejemplo, lechugas), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, guisantes), *Rosaceae* sp. (por ejemplo, fresas); cultivos principales tales como *Graminae* sp. (por ejemplo maíz, césped o cereales, tales como trigo, arroz, cebada y triticale), *Asteraceae* sp. (por ejemplo, girasol), *Cruciferae* sp. (por ejemplo, colza), *Fabaceae* sp. (por ejemplo cacahuetes), *Papilionaceae* sp. (por ejemplo soja), *Solanaceae* sp. (por ejemplo patatas), *Cherropodiaceae* sp. (por ejemplo remolachas rojas); cultivos hortícolas y forestales; así como homólogos genéticamente modificados de estos cultivos.

Entre las enfermedades de plantas o cultivos que pueden controlarse por el procedimiento de acuerdo con la presente invención, pueden mencionarse:

enfermedades por mildiú pulverulento tales como:

- enfermedades por Blumeria, causadas por ejemplo por *Blumeria graminis*;
- enfermedades por Podosphaera causadas, por ejemplo, por *Podosphaera leucotricha*;
- enfermedades por Sphaerotheca, causadas por ejemplo por *Sphaerotheca fuliginea*;
- 5 enfermedades por Uncinula, causadas por ejemplo por *Uncinula necator*;

enfermedades de la roya tales como:

- enfermedades por Gymnosporangium causadas por ejemplo por *Gymnosporangium sabinae*;
- enfermedades por Hemileia causadas por ejemplo por *Hemileia vastatrix*;
- enfermedades por Phakopsora, causadas por ejemplo por *Phakopsora pachyrhizi* o *Phakopsora meibomiae*;
- 10 enfermedades por Puccinia provocadas por ejemplo por *Puccinia recondita*;
- enfermedades por Uromyces, provocadas por ejemplo, por *Uromyces appendiculatus*;

enfermedades por oomicetos tales como:

- enfermedades por Bremia, causadas por ejemplo por *Bremia lactucae*;
- enfermedades por Peronospora, causadas por ejemplo por *Peronospora pisi* o *Peronospora brassicae*;
- 15 enfermedades por Phytophthora, causadas por ejemplo por *Phytophthora infestans*;
- enfermedades por Plasmopara, causadas por ejemplo por *Plasmopara viticola*;
- enfermedades por Pseudoperonospora, causadas por ejemplo por *Pseudoperonospora humuli* y *Pseudoperonospora cubensis*;
- enfermedades por Pythium, causadas por ejemplo por *Pythium ultimum*;

20 enfermedades de mancha foliar, roncha foliar y tizón foliar tales como:

- enfermedades por Alternaria causadas por ejemplo por *Alternaria solani*;
- enfermedades por Cercospora, causadas por ejemplo por *Cercospora beticola*;
- enfermedades por Cladosporium, causadas por ejemplo por *Cladosporium cucumerinum*;
- enfermedades por Cochliobolus, causadas por ejemplo por *Cochliobolus sativus*;
- 25 enfermedades por Colletotrichum, causadas por ejemplo por *Colletotrichum lindemuthianum*;
- enfermedades por Cycloconium, causadas por ejemplo por *Cycloconium oleaginum*;
- enfermedades por Diaporthe, causadas por ejemplo por *Diaporthe citri*;
- enfermedades por Elsinoe, causadas por ejemplo por *Elsinoe fawcettii*;
- enfermedades por Gloeosporium, causadas por ejemplo por *Gloeosporium laeticolor*;
- 30 enfermedades por Glomerella, causadas por ejemplo por *Glomerella cingulata*;
- enfermedades por Guignardia, causadas por ejemplo por *Guignardia bidwellii*;
- enfermedades por Leptosphaeria, causadas por ejemplo por *Leptosphaeria maculans*; *Leptosphaeria nodorum*;
- enfermedades por Magnaporthe, causadas por ejemplo por *Magnaporthe grisea*;
- 35 enfermedades por *Mycosphaerella*, causadas por ejemplo por *Mycosphaerella graminicola*; *Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;
- enfermedades por Phaeosphaeria, causadas por ejemplo por *Phaeosphaeria nodorum*;
- enfermedades por Pyrenophora, causadas por ejemplo por *Pyrenophora teres*;

enfermedades por *Ramularia*, causadas por ejemplo por *Ramularia collo-cygni*;  
enfermedades por *Rhynchosporium*, causadas por ejemplo por *Rhynchosporium secalis*;  
enfermedades por *Septoria*, causadas por ejemplo por *Septoria apii* o *Septoria lycopersici*;  
enfermedades por *Typhula*, causadas por ejemplo por *Typhula incarnata*;  
5 enfermedades por *Venturia*, causadas por ejemplo por *Venturia inaequalis*;

enfermedades de la raíz y el tallo tales como:

enfermedades por *Corticium*, causadas por ejemplo por *Corticium graminearum*;  
enfermedades por *Fusarium*, causadas por ejemplo por *Fusarium oxysporum*;  
enfermedades por *Gaeumannomyces* causadas por ejemplo por *Gaeumannomyces graminis*;  
10 enfermedades por *Rhizoctonia*, causadas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;  
enfermedades por *Tapesia*, causadas por ejemplo por *Tapesia acuformis*;  
enfermedades por *Thielaviopsis*, causadas por ejemplo por *Thielaviopsis basicola*;

enfermedades de la espiga y la mazorca tales como:

enfermedades por *Alternaria*, causadas por ejemplo por *Alternaria sp.*;  
15 enfermedades por *Aspergillus*, causadas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;  
enfermedades por *Cladosporium*, causadas por ejemplo por *Cladosporium sp.*;  
enfermedades por *Claviceps*, causadas por ejemplo por *Claviceps purpurea*;  
enfermedades por *Fusarium*, causadas por ejemplo por *Fusarium culmorum*;  
enfermedades por *Gibberella*, causadas por ejemplo por *Gibberella zeae*;  
20 enfermedades por *Monographella*, causadas por ejemplo por *Monographella nivalis*;

enfermedades del tizón y el hollín tales como:

enfermedades por *Sphacelotheca*, causadas por ejemplo por *Sphacelotheca reiliana*;  
enfermedades por *Tilletia*, causadas por ejemplo por *Tilletia caries*;  
enfermedades por *Urocystis*, causadas por ejemplo por *Urocystis occulta*;  
25 enfermedades por *Ustilago*, causadas por ejemplo por *Ustilago nuda*;

enfermedades de pudrición y moho de las frutas tales como:

enfermedades por *Aspergillus*, causadas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;  
enfermedades por *Botrytis*, causadas por ejemplo por *Botrytis cinerea*;  
enfermedades por *Penicillium*, causadas por ejemplo por *Penicillium expansum*;  
30 enfermedades por *Sclerotinia*, causadas por ejemplo por *Sclerotinia sclerotiorum*;  
enfermedades por *Verticillium*, causadas por ejemplo por *Verticillium alboatrum*;

enfermedades de deterioro, moho, marchitado, putrefacción y ahogamiento de semillas y edáficas:

enfermedades por *Fusarium*, causadas por ejemplo por *Fusarium culmorum*;  
enfermedades por *Phytophthora*, causadas por ejemplo por *Phytophthora cactorum*;  
35 enfermedades por *Pythium* causadas, por ejemplo por *Pythium ultimum*;  
enfermedades por *Rhizoctonia*, causadas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;  
enfermedades por *Sclerotium*, causadas por ejemplo por *Sclerotium rolfsii*;

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

enfermedades de cancro, escoba y acrenosis tales como:

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

enfermedades del tizón tales como:

5 enfermedades por *Monilinia* causadas, por ejemplo por *Monilinia laxa*;

enfermedades de la ampolla de la hoja o el rizado de la hoja tales como:

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

enfermedades de declive de plantas leñosas tales como:

enfermedades por *Esca*, causadas por ejemplo por *Phaemoniella clamydospora*;

10 enfermedades de flores y semillas tales como:

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

enfermedades de tubérculos tales como:

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

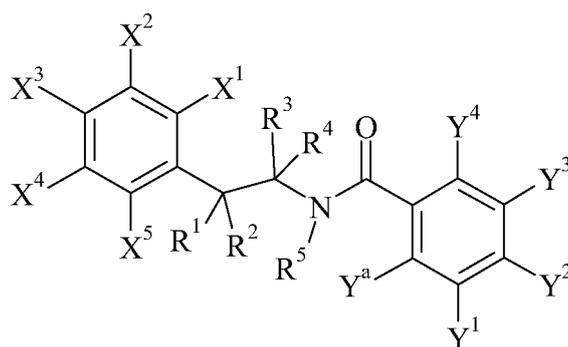
15 La composición fungicida de acuerdo con la presente invención puede usarse también contra enfermedades fúngicas propensas a desarrollarse sobre o en el interior de la madera. El término "madera" significa todos los tipos de especies de madera y todos los tipos de procesado de esta madera destinados a la construcción, por ejemplo madera sólida, madera de alta densidad, madera laminada y madera contrachapada. El procedimiento para tratar madera de acuerdo con la invención consiste principalmente en ponerla en contacto con uno o más compuestos de la presente invención, o con una composición de acuerdo con la invención; esto incluye por ejemplo aplicación directa, pulverización, 20 inmersión, inyección o cualquier otro medio adecuado.

La dosis de material activo que se aplica habitualmente en el tratamiento de acuerdo con la presente invención se encuentra general y ventajosamente entre 10 y 800 g/ha, preferentemente entre 50 y 300 g/ha, para aplicaciones en tratamiento foliar. La dosis de sustancia activa que se aplica se encuentra, general y ventajosamente, entre 2 y 200 g por cada 100 kg de semillas, preferentemente entre 3 y 150 g por cada 100 kg de semillas, en el caso de tratamiento de 25 semillas. Se entiende claramente que las dosis indicadas anteriormente se dan como ejemplos ilustrativos de la invención. Un experto en la técnica sabrá como adaptar las dosis de aplicación de acuerdo con la naturaleza del cultivo que hay que tratar.

30 La composición fungicida de acuerdo con la presente invención también puede usarse en el tratamiento de organismos genéticamente modificados con los compuestos de acuerdo con la invención o composiciones agroquímicas de acuerdo con la invención. Plantas genéticamente modificadas son plantas en cuyo genoma se ha integrado de forma estable un gen heterólogo que codifica una proteína de interés. La expresión "gen heterólogo que codifica una proteína de interés" significa esencialmente genes que confieren a la planta transformada propiedades agronómicas novedosas o genes que mejoran la calidad agronómica de la planta transformada.

35 Las composiciones de acuerdo con la presente invención pueden usarse también para la preparación de una composición útil para tratar de forma curativa o preventiva enfermedades fúngicas humanas y animales tales como por ejemplo micosis, dermatosis, enfermedades por *Trichophyton* y candidiasis o enfermedades causadas por *Aspergillus sp.*, por ejemplo *Aspergillus fumigatus*.

40 Los aspectos de la presente invención se ilustrarán a continuación con referencia a las tablas siguientes de compuestos y ejemplos. La tabla siguiente ilustra de un modo no limitante ejemplos de compuestos fungicidas de acuerdo con la presente invención. En los siguientes Ejemplos, M+1 (o M-H) significa el pico del ion molecular, más o menos 1 u.m.a. (unidad de masa atómica) respectivamente, como se observa en espectroscopía de masas y M (Apcl+) significa el pico del ion molecular como se encontró por medio de ionización química a presión atmosférica positiva en espectroscopía de masas.



Compuesto	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	X <sup>5</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	Y <sup>4</sup>	Y <sup>a</sup>	(M+1)
1	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	342
2	H	H	Me	H	Ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	382
3	H	H	Me	H	Ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Br	392
4	H	H	Me	H	Ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	I	440
5	H	H	Me	H	Ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Cl	348
6	H	H	Me	H	Ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Me	328
7	H	H	Me	H	Ciclopropilo	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CHF <sub>2</sub>	363
8	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	Cl	Cl	342
9	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Br	352
10	H	H	Me	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	CHF <sub>2</sub>	324

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

#### Preparación de 2,6-dicloro-N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]benzamida, (Compuesto 8)

- 5 Se diluyen 100 mg de clorhidrato de 1-(4-clorofenil)propan-2-amina (0,728 mmol) y 0,10 ml de trietilamina (0,728 mmol) en 3 ml de diclorometano a temperatura ambiente; se añaden a la mezcla de reacción 152 mg de cloruro de 2,6-diclorobenzoino (0,728 mmol). Después de 24 horas de agitación, se añaden 20 ml de DCM y 10 ml de solución saturada de cloruro de amonio a la mezcla de reacción.

Después de la separación, la fase orgánica se lavó con 10 ml de una solución saturada de bicarbonato de sodio.

- 10 Después de separación sobre sulfato de magnesio, filtración y concentración al vacío, se obtienen 0,24 g de 2,6-dicloro-N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]benzamida (rendimiento = 93 %).

[M + 1] = 342.

#### Preparación de N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]-N-ciclopropil-2-(difluorometil)benzamida (Compuesto 7)

##### Preparación de clorhidrato N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]ciclopropanamina

- 15 Se mezclan en argón, en 150 ml de metanol, 10,1 g de ciclopropilamina (0,177 mol) y 12,6 ml de ácido acético (0,221 mol). Después se añaden 15,0 g de 1-(4-clorofenil)acetona (0,088 mol) y 15 g de filtros moleculares de 3 Å. La mezcla de reacción se somete a reflujo durante 3 horas. Después de enfriar a temperatura ambiente, se añaden 8,34 g de cianoborohidruro de sodio (0,13 mol) a la mezcla de reacción, que se somete de nuevo a reflujo durante 3 horas.
- 20 Después de una noche a temperatura ambiente, se añaden 3 g de cianoborohidruro (0,048 mol) y 8 ml de ácido acético (0,126 mol) a la mezcla de reacción que se somete a reflujo durante tres horas. Después de enfriamiento a temperatura ambiente, filtración sobre celite y concentración *al vacío*, se añaden 250 ml de diclorometano y 400 ml de NaOH 1 M a la mezcla de reacción.

Después de la separación, la fase acuosa se extrae con 250 ml de diclorometano, las fases orgánicas combinadas se lavan con 1.550 ml de agua y 200 ml de salmuera.

Después de secado sobre sulfato de magnesio, filtración y concentración, la amina en bruto se precipita con HCl 2 M en éter proporcionando 19,06 g de clorhidrato de N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]ciclopropanamina (rendimiento = 88 %). [M+1-HCl] = 210.

**Preparación de N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]-N-ciclopropil-2-(difluorometil)benzamida**

- 5 Se someten a reflujo 300 mg de clorhidrato de N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]ciclopropanamina (1,218 mmol), 220 mg de ácido 2-(di-fluorometil)benzoico (1,28 mmol), 16 mg de 1-hidroxibenzotriazol (0,12 mmol), 256 mg de clorhidrato de 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida (1,34 mmol) y 0,171 ml de TEA (1,22 mmol) en 10 ml de diclorometano durante una hora. Después de 48 horas a temperatura ambiente, la reacción se inactiva con 5 ml de HCl 0,5 M.

- 10 Después de la separación, la fase orgánica se lava con 5 ml de agua y 5 ml de solución saturada de bicarbonato de sodio, se seca sobre sulfato de magnesio, se filtra y se concentra al vacío. El producto en bruto se somete a cromatografía ultrarrápida sobre sílice con heptano/EtOAc para proporcionar 149 mg de N-[2-(4-clorofenil)-1-metiletil]-N-ciclopropil-2-(difluorometil)benzamida (rendimiento = 37 %).

[M+1] = 363.

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

- 15 **Ejemplo A: ensayo *in vivo* sobre *Alternaria brassicae* (mancha foliar de crucíferas)**

Los ingredientes activos analizados se preparan mediante homogeneización en una mezcla de acetona/tween/DMSO; después se diluyen con agua obteniéndose la concentración deseada de material activo.

- 20 Plantas de rábano (variedad Pernot), sembradas sobre un sustrato de suelo de turba/puzolana 50/50 en macetas de siembra y cultivadas a 18-20 °C se tratan en el estadio de cotiledones pulverizando con el ingrediente activo preparado como se describe anteriormente.

Se tratan las plantas, usadas como controles, con la mezcla de acetona/tween/DMSO/agua que no contiene el material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria brassicae* (40.000 esporas por cm<sup>3</sup>). Las esporas se recogen de un cultivo de 12 a 13 días de edad.

- 25 Las plantas de rábano contaminadas se incuban durante 6-7 días a aproximadamente 18 °C, en una atmósfera húmeda.

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

En estas condiciones, se observa una protección buena (al menos el 70 %) o total a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 1, 9 y 10.

- 30 **Ejemplo B: ensayo *in vivo* sobre *Pyrenophora teres* (mancha en red de la cebada)**

Los ingredientes activos analizados se preparan mediante homogeneización en una mezcla de acetona/tween/DMSO; después se diluyen con agua obteniéndose la concentración deseada de material activo.

- 35 Se tratan plantas de cebada (variedad Express) en el estadio de 1 hoja (10 cm de altura), sembradas sobre sustrato de suelo de turba/puzolana 50/50 en macetas de siembra y cultivadas a 12 °C, pulverizando con el ingrediente activo preparado tal como se ha descrito anteriormente. Se tratan las plantas, usadas como controles, con la mezcla de acetona/tween/DMSO/agua que no contiene el material activo.

- 40 Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Pyrenophora teres* (12.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de un cultivo de 12 días de edad. Las plantas de cebada contaminadas se incuban durante 24 horas a aproximadamente 20 °C y al 100 % de humedad relativa y después durante 12 días al 80 % de humedad relativa.

La evaluación se realiza 12 días después de la contaminación, en comparación con las plantas control.

En estas condiciones, se observa protección buena (al menos de un 70 %) o total a una dosis de 500 ppm con el siguiente compuesto: 1.

**Ejemplo C: Ensayo *in vivo* de *Mycosphaerella graminicola* (mancha foliar de trigo)**

- 45 Los ingredientes activos analizados se preparan mediante homogeneización en una mezcla de acetona/tween/DMSO; después se diluyen con agua obteniéndose la concentración deseada de material activo.

Se tratan en el estadio de 1 hoja (10 cm de altura), plantas de trigo (variedad Scipion) sembradas sobre sustrato de suelo de turba/puzolana 50/50 en macetas de siembra y cultivadas a 12 °C, pulverizando con el ingrediente activo

## ES 2 549 409 T3

preparado tal como se ha descrito anteriormente. Se tratan las plantas, usadas como controles, con la mezcla de acetona/tween/DMSO/agua que no contiene el material activo.

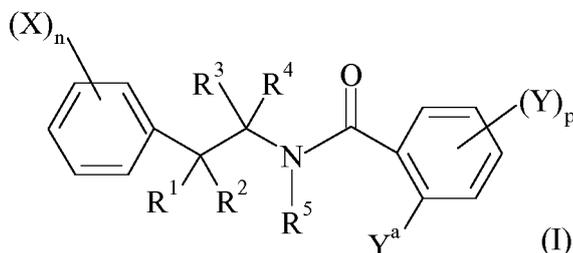
5 Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Mycosphaerella graminicola* (500.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de un cultivo de 7 días de edad. Las plantas de trigo contaminadas se incuban durante 72 horas a 18 °C y a humedad relativa del 100 % y después durante 21 a 28 días a humedad relativa del 90 %.

La evaluación (% de eficacia) se realiza de 21 a 28 días después de la contaminación, en comparación con las plantas control.

10 En estas condiciones, se observa una protección buena (al menos el 70 %) o total a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 1, 9 y 10.

REIVINDICACIONES

1. Un derivado de compuesto de fórmula general (I):



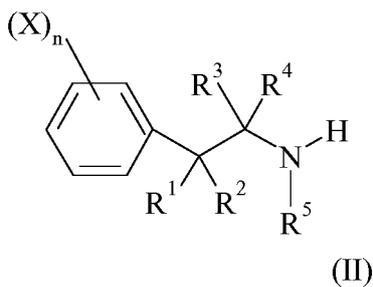
en la que:

- 5
- n es 1, 2;
  - p es 1;
  - X es el mismo o diferente y es un átomo de halógeno, un C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-halogenoalquilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
  - R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> son un átomo de hidrógeno, - R<sup>3</sup> es un grupo metilo y R<sup>4</sup> es un átomo de hidrógeno;
- 10
- R<sup>5</sup> es un átomo de hidrógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o un ciclopropilo;
  - Y es un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno; y
  - Y<sup>a</sup> es un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

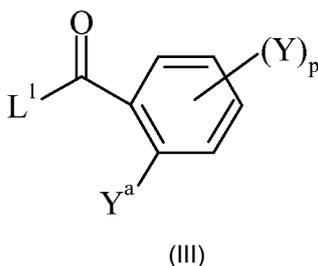
así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos de metaloides e isómeros ópticamente activos; con la condición de que el compuesto de fórmula general (I) sea diferente de:

- 15
- 2,4-dicloro-N-[1-metil-2-(3-trifluorometilfenil)etil]-benzamida;
  - 2-cloro-N-[2-(4-clorofenil)-1-metil-etil]-benzamida.

2. Un procedimiento de preparación de compuesto de fórmula general (I) según se define en la reivindicación 1, que comprende un derivado de 1-alquil-2-feniletilamina de fórmula general (II) o una de sus sales

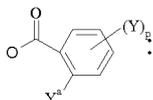


- 20
- en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, X y n son como se definen en la reivindicación 1;
- con un derivado de ácido carboxílico de la fórmula general (III)



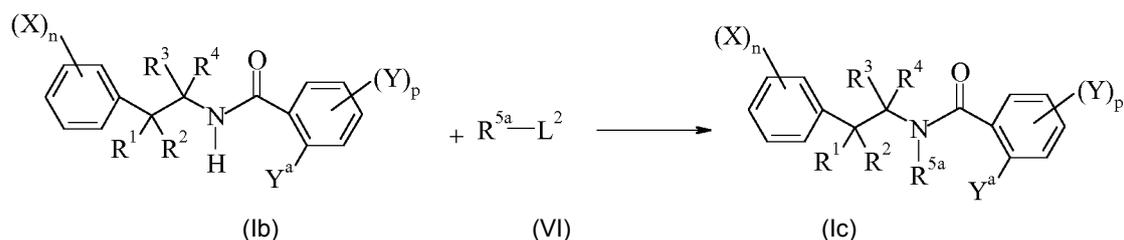
en la que:

- $Y^a$ , Y y p son según se definen en la reivindicación 1; y
- $L^1$  es un grupo saliente elegido como un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo,  $-OR^1$ ,  $-OCOR^6$ ,  $R^6$  siendo un alquilo  $C_1-C_6$ , un haloalquilo  $C_1-C_6$ , un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula



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

3. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 2, **caracterizado porque**  $R^5$  es un átomo de hidrógeno y porque el procedimiento se completa por una etapa adicional de acuerdo con el esquema de reacción siguiente:



10 en las que:

- $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ , X, n,  $Y^a$ , Y y p son como se definen en la reivindicación 1;
- $L^2$  es un grupo saliente elegido de modo que sea un átomo de halógeno, un 4-metilfenilsulfonilo o un metilsulfonilo; y
- $R^{5a}$  es un grupo alquilo  $C_1-C_6$  o un ciclopropilo;

15 que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Ib) con un compuesto de fórmula general (VI) para proporcionar un compuesto de fórmula general (Ic).

4. Una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 y un soporte agricolamente aceptable.

20 5. Un procedimiento para combatir preventiva o curativamente los hongos fitopatógenos de cultivos, **caracterizado porque** se aplica una cantidad eficaz y no fitotóxica de una composición de acuerdo con la reivindicación 4 a las semillas de plantas o a las hojas de plantas y/o a los frutos de plantas o al suelo en el que las plantas están creciendo o en el que se desea que crezcan.