



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

05-91401

21. EXPEDIENTE No.

54. TITULO

OXATIINCARBOXAMIDAS

51. CLASIFICACION INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BAYER CROPSCIENCE AG

DOMICILIO

Monheim, República Federal de Alemania.

74. APODERADO

EMILIO FERRERO

C.C. 438.019 de Usaquén.

22. BOGOTA, D.C.,

PETITORIO

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 05/09/1401 00000000

Folios: 258

Fecha (AMD): 2005-09-09 17:27:18

Trámite : 011 PCT-PATENT 3/8 FASE NACI 411 PRESENTAC

Dependencia: 2000 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE

PCT

ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

1

☒ Patente de Invención.
☒ Capítulo I.

☐ Patente de Modelo de Utilidad.
☐ Capítulo II.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: **BAYER CROPSCIENCE AG**
sociedad constituida y existente bajo las
leyes de la República Federal de Alemania

Dirección: Alfred-Nobel-Str. 50,
40789 Monheim,
República Federal de Alemania

Domicilio: Monheim, República Federal de
Alemania

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☐ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____
Número _____

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: **EMILIO FERRERO**
Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35
Teléfono: 347 36 11
Fax: 211 86 50
E-mail: clientes@camyp.com.
Domicilio: Bogotá, Colombia.

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐
C.E. ☐ Otro ☐
Cual _____
Número 438.019 T.P 31.929

4

INVENTOR (ES)
(72)

1. Ralf DUNKEL

Krischer Str. 22,
40789 Monheim,
República Federal de Alemania

3. Heiko RIECK

9, rue Claude Monet,
F-69110 Ste. Foy lès Lyon
Francia

5. Ulrike WACHENDORFF-NEUMANN

Oberer Markenweg 85,
56566 Neuwied,
República Federal de Alemania

7. Karl-Heinz KUCK

Pastor-Löh-Str. 30a,
40764 Langenfeld,
República Federal de Alemania

2. Hans-Ludwig ELBE

Dasnöckel 59,
42329 Wuppertal,
República Federal de Alemania

4. Nico Jörg GREUL

Am Sandberg 30 a,
42799 Leichlingen,
República Federal de Alemania

6. Peter DAHMEN

Altebrückerstr. 61,
41470 Neuss,
República Federal de Alemania

8. Benoit HARTMANN

Färberstr. 1,
40223 Langenfeld,
República Federal de Alemania

5

PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2004/001053 Fecha: 05 de Febrero de 2004
Publicación Internacional No. WO 2004/072023 A2 Fecha: 26 de Agosto de 2004

6

Título (54)

OXATIINCARBOXAMIDAS

7

Clasificación Internacional (51)

C07D 327/06, A01N 43/84

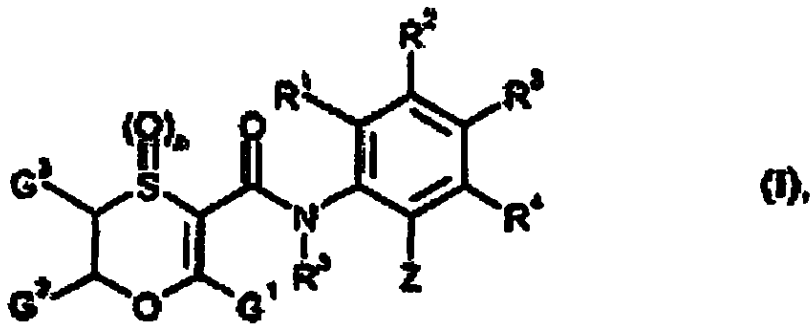
8	Pri ridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
		<u>DE</u> <u>DE</u>	<u>14 de Febrero de 2003</u> <u>13 de Mayo de 2003</u>	<u>103 06 244.0</u> <u>103 21 270.1</u>

9	Comprobante de pago N .: <u>05 – 67,461</u>	Fecha: <u>05 de Septiembre de 2005</u>
----------	--	---

10	Anexos:
☒	Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 443.000.oo.
☐	Comprobante de pago por reivindicación de prioridad.
☒	Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica.
☒	Poderes, si fuere el caso.
☐	Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante.
☐	Declaraciones.
☒	Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
☒	Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
☐	Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
☐	Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA.
☐	De ser el caso, copia del contrato de acceso.
☐	De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
☐	De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
☒	Arte final 12x12
☐	De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
☒	Otros. VER HOJA ANEXA CON LISTADO DE DOCUMENTOS APORTADOS EXTRACTO DE PUBLICACIÓN

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

EMILIO FERRERO

FIRMA :

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

DLM

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ **Publicación Internacional WO 2004/072023 A2**

Descripción:

Páginas 80 en el idioma original

Páginas 111 en español

Reivindicaciones: Número (s) 18

Figuras: Número (s) 0

2. ☒ **Forma PCT/RO/101. PCT Request**
3. ☐ **Forma PCT/RO/106. Invitation to Correct Defects.**
4. ☒ **Forma PCT/ISA/210. Informe de Búsqueda Internacional.**
5. ☐ **Forma PCT/ISA/220. Notificación De La Transmisión Del Informe De Búsqueda Internacional Y De La Opinión Escrita De La Administración Encargada De La Búsqueda Internacional, O De La Declaración.**
6. ☐ **Forma PCT/ISA/237. Opinión Escrita De La Administración Encargada De La Búsqueda Internacional.**
7. ☐ **Forma PCT/IB/304. Notification Concerning Submission Or Transmittal Of Priority Document.**
8. ☐ **Forma PCT/IB/306. Notification Of The Recoding Of A Change.**
Descripción De Modificación:

9. ☐ **Forma PCT/IB/308. Notice Informing The Applicant Of The Communication Of The International Application To The Designated Offices.**
10. ☐ **Forma PCT/IB/332. Information Concerning Elected Offices Notified Of Their Election.**
11. ☐ **Forma PCT/IPEA/401. PCT Demand**
12. ☐ **Forma PCT/IPEA/402. Notification Of Receipt Of Demand By Competent International Preliminary Examining Authority.**
13. ☐ **Forma PCT/IPEA/408. Written Opinion.**
14. ☐ **Forma PCT/IPEA/416. Notification Of Transmittal Of The International Preliminary Examination Report.**
15. ☐ **Forma PCT/IPEA/409. Informe Del Examen Preliminar Internacional. SIN ANEXOS**
16. ☐ **Traducción Al Español Del Informe Del Examen Preliminar Internacional.**
17. ☐ **Traducción Al Español De Los Anexos Presentados Junto Con El Informe Del Examen Preliminar Internacional.**
18. ☒ **Extracto de Publicación**

Representación y Poder con autenticación notarial y Apostille para patentes, modelos de utilidad, diseños industriales, marcas de fábrica, nombres comerciales, enseñas, nombres de dominio, lemas comerciales, licencias.

Representation and Power-of-Attorney with notarial authentication and Apostille for patents, utility models, industrial designs, trademarks, commercial names, trade emblems, domain names, slogans, licenses.

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER-OF-ATTORNEY 13549
10966

Yo (nosotros), abajo firmado (s)/I (we), the undersigned
Bayer CropScience AG

domiciliado (s) en/of Alfred-Nobel-Str. 50,

40789 Mannheim, Germany, hereby ratify the patent application

No. 03.005.574 filed by Emilio FERRERO on January 28, 2003 and

por el presente nombramos a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 y GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4ª N° 72 35, Bogotá, Colombia, en obediencia a lo dispuesto en el parágrafo 1o del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

in due compliance with the terms of paragraph 1st. of article 543 of the Commercial Code, do hereby appoint EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa. 23555 and GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciled at Carrera 4ª N° 72 35, Bogotá, Colombia, the first as principal and the others as alternates, in the order of their appointment, as our representatives for all industrial property matters with faculty to receive notifications and to appoint attorneys in and out of Court. The first alternate shall replace the principal in case of his absence or of temporal or definitive impediment. The same rule will apply when the second alternate representative is to replace the first one, or when the third is to replace the first or second alternates in their turn, or both of them, second. In such cases, the principal representative, or the first or second alternates in their turn, or both of them, shall state their intention not to act as representatives through a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official or a Colombian Consul abroad; and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact of its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternate in their turn shall have the same effect as the exercise of the representation by the principal.

In addition, we grant Power of Attorney in favor of the above named attorneys at law so that they may obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons,

Además, confiero (conferimos) poder a los abogados arriba nombrados, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden

6
strativo, contencioso administrativo y judicial, así como los
iales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes
itos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y
seños industriales; el registro de marcas de fábrica, colectivas,
defensivas, de servicio, lemas comerciales, nombres comerciales,
enseñas, nombres de dominio, variedades vegetales y denominaciones de
origen; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio,
cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos;
b) Las acciones de competencia desleal, protección del consumidor,
oposiciones u observaciones, cancelación administrativa y judicial,
nulidad, medidas cautelares, concesión de licencias, la tutela, la
protección de secretos industriales, y en general los juicios civiles,
penales, administrativos o contencioso administrativos relacionados con
estos derechos; acciones y procesos que promovamos o se nos
promuevan. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan
sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del
proceso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de
agentes oficiosos.

with or without jurisdiction, specially those administrative,
administrative contentious and judicial, as well as before
Arbitration Court, in all matters concerning the following: a)
Obtainment of patents, utility models and industrial designs;
the registration of trademarks, collective, defensive and service
marks, slogans, commercial names, trade emblems, domain
names, vegetal varieties and denominations of origin; its
renewal, assignment, change of name or domicile, voluntary
cancellation; and the registration of licenses of use of the above
rights; b) Actions of unfair competition, protection to the
consumer, oppositions or observations, administrative or Court
cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, the
action for writ mandamus, the protection of trade secrets, and
in general the civil, penal, and administrative suits relating to
those rights; actions and suits instituted by me (us) or against
me (us). And that in all the above matters they may substitute
this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts
of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done
by representatives without a power of attorney.

Dado y firmado hoy/Given and signed this 12th of February, 2003

en/in Leverkusen

por/by Dr. Axel Bader, Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

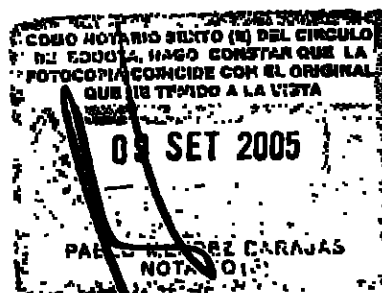
Firma

Signature

Bayar CropScience AG

Ha. BL

[Signature]



7
AUTENTICACION NOTARIAL (SOCIEDAD)

El suscrito Notario Certifica: Que la firma que antecede de Dr. Axel Bader y Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

es auténtica; que el signatario desempeña actualmente el cargo de Secretarias de la compañía Bayer CropScience AG

✓ sociedad que actualmente existe y está organizada de acuerdo a las leyes de Alemania

que la dirección de dicha compañía es Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Alemania

y que el signatario tiene facultad para otorgar este documento.

Todos los hechos anteriores le constan por haber examinado los documentos respectivos y de todo ello da fe.

Dado y firmado en Leverkusen

El 12 de febrero, 2003

NOTARIAL AUTHENTICATION (COMPANY)

The undersigned Notary certifies: That the preceding signature of

Dr. Axel Bader and Dr. Ralf-Rüdiger Jesse is authentic, that the signatory currently acts in the position of secretaries

of the company Bayer CropScience AG

a company currently existing and organized under the laws of Germany

that the address is Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Germany

and that the signatory has the power to grant this document.

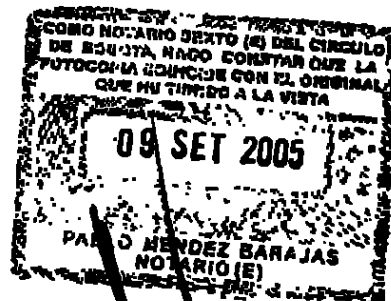
The Notary Public is aware and attests to the above facts upon examination of the corresponding documents.

Given and signed in Leverkusen

On 12th of February, 2003

El Notario Público
(Firma-sello)

The Notary Public
(Signature-seal)



URNr. 242/2003

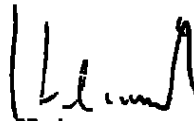
Ich beglaubige die vor mir vollzogenen Unterschriften :

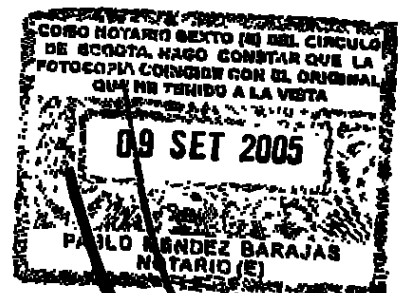
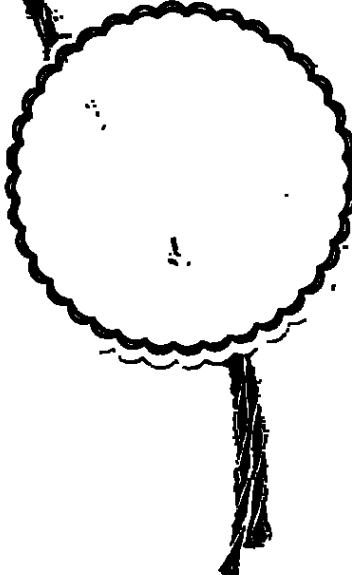
1. des Herrn Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,
2. des Herrn Dr. Axel Bader, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,

- persönlich bekannt -.

Ich bescheinige aufgrund Einsicht in das Handelsregister des
Amtsgerichts Langenfeld - HRB 3990 -, daß die genannten Herren
berechtigt sind, die Bayer CropScience Aktiengesellschaft in
Monheim am Rhein als Prokuristen einzeln zu vertreten.

Leverkusen, den 2. Februar 2003


Notar



APOSTILLE

(Convention de La Haya du 5 octobre 1961)

1. Land: Bundesrepublik Deutschland

Diese öffentliche Urkunde

2. Ist unterschrieben von

Dirk Heiderhoff

3. in seiner Eigenschaft als Notar

4. sie ist versehen mit dem Stempel/Siegel des (der)

Notars Dirk Heiderhoff

in Leverkusen

Bestätigt

17. FEB. 2003

5. in Köln

6. am

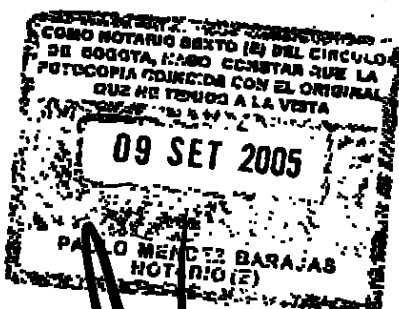
7. durch den Vizepräsidenten des Landgerichts Köln

8. unter Nr. 482103

9. Stempel/Siegel:

10. Unterschrift:

L. Caliebe



Geb 5 100 - Eul 13.-
528
28,08

Präsident des Landgerichts Köln

TRADUCCIÓN OFICIAL No. 10.09/02 realizada por Diego Vargas, Traductor Oficial, Resolución No. 0001 de 1999 del Ministerio de Justicia y registrado ante el Ministerio de Relaciones Exteriores de Colombia.

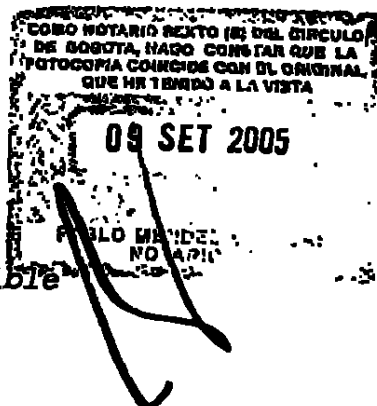
A continuación se traducen los sellos y legalizaciones de un documento escrito en inglés y español por medio del cual Bayer CropScience AG, domiciliado en Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Alemania, por el presente ratifica la solicitud de patente No. 03.005.574, presentada por EMILIO FERRERO el 28 de enero de 2003 y otorga derechos de representación y poder a los Doctores EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PÁEZ, tpa. 23555 y GERMÁN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4° No. 72-35.

Dado y firmado hoy 12 de febrero de 2003
 en Leverkusen
 por Dr. Axel Brader, Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

Bayer CropScience AG

Firma Ilegible

Firma Ilegible



(ANEXO)

AUTENTICACIÓN NOTARIAL (SOCIEDAD) en donde se certifican la firma anterior del Doctor Axel Bader y del Doctor Ralf-Rüdiger Jesse como

Diego F. Vargas
DIEGO F. VARGAS Z.

TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
 ESPAÑOL - INGLES - INGLES - ESPAÑOL
 RES. 0001 DE ENERO 4 DE 1999

Secretarios de Bayer CropScience AG, una sociedad actualmente existente y organizada de acuerdo a las leyes de Alemania y con dirección en Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Alemania. Dado y firmado en Leverkusen el 12 de febrero del 2003.

Firma Ilegible
Notario Público

Sello

Se anexa autenticación notarial en alemán de las firmas anteriores.

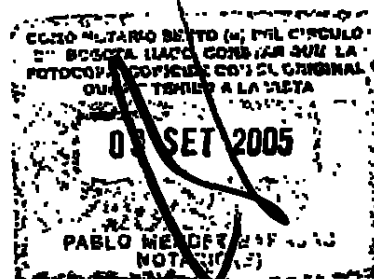
Respaldo:

Apostilla expedida por Alemania y certificado el de febrero de 2003 bajo el número 482/03.

Es traducción fiel y completa de la cual se deja copia en esta oficina para su confrontación.

DVZ/ID-4268/WPCL002G/COLO 13549-841-002-0

Diego F. Vargas
DIEGO F. VARGAS
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAÑOL - INGLÉS - INGLÉS - ESPAÑOL
RES. 0001 DE ENERO 4 DE 1999
MINISTERIO DE JUSTICIA



NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2007 MAR 18 P 12:24

JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTA D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE STAFFE DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) ANTERIORES FIR-
MA(S) PUESTA(S) POR

IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s)

ES(SON) AUTENTICA(S)

SANTAFE DE BOGOTA, 18 MAR 2007

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208992

COYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPENA
LAS FUNCIONES INDICADAS

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA

09 SET 2005

PABLO MENA SANCHEZ
NOTARIO (E)



TRADUCCION OFICIAL No. 9450

de un documento escrito en Alemán, efectuada por Luz Arriaga de Herber, resolución del Ministerio de Justicia 599 del 6 de marzo 1978.-

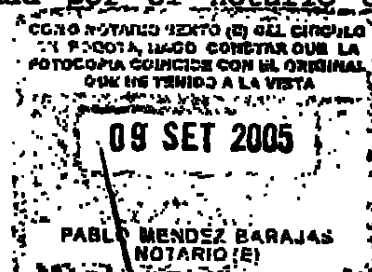
Traducción de los sellos y autenticaciones que aparecen en el documento de representación y poder, escrito en español e inglés, por medio del cual la firma Bayer CropScience AG, domiciliada en Alfred-Nobel-Str. 50, D 40789 Monheim, Alemania, otorga poder a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, tpa. 831; LUZ CLEMENCIA DE PAEZ, tpa 23555 y GERMAN CAVELIER, tpa. 832, domiciliados en la Carrera 4 No. 72-35, Bogotá, Colombia. Dado y firmado el 12 de febrero 2003 en Leverkusen, Alemania, por los señores Dr. Axel Bader y Dr. Ralf-Rüdiger Jesse.

Autenticación en español e inglés de las firmas antecedentes y certificación de existencia de la sociedad por el notario de Leverkusen, Dirk Heiderhoff.

Fdo.: firma ilegible

Sello redondo en tinta:

Dirk Heiderhoff, notario de Leverkusen



LUZ ARRIAGA DE HERBER
TRADUCCION OFICIAL
Recepcion 11.11.2005

Protocolo notarial 242/2003

Certifico la autenticidad de la firma antecedentes puestas
ante mí por los señores

1. Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, con domicilio comercial en D-51368, Bayerwerk, Alemania,
2. Dr. Axel Bader, con domicilio comercial en D-51368, Bayerwerk, Alemania,

a quienes conozco en persona.

Certifico, por haber tenido la lista el registro de comercio del Juzgado Municipal de Langenfeld -HRB 3990- que los mencionados señores están facultados, en su calidad de apoderados, para representar individualmente a la firma Bayer CropScience Aktiengesellschaft, domiciliada en Monheim am Rhein.

Leverkusen, 12 de febrero 2003
(Hilo y oblea notarial)
Fdo.: firma ilegible, Notario

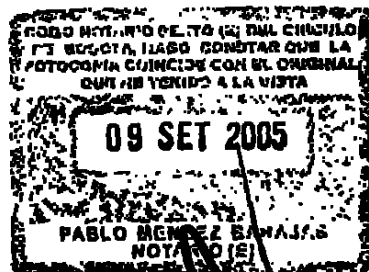
Costas

Art. 141, 154 KostO

Valor EUROS 3.000,-

Derechos Art. 32,45

EUROS 10,-



1112 APRIL 14 DE HERBER
EN-GUTTOR (S) ENPRI E OFICIAL
Resolur - N - ...

Derechos Art. 58	EUROS 10,-
Derechos Art. 150	Euros 13,-
IVA	<u>EUROS 5,28</u>
Total	EUROS 38,28

Fdo.: Heiderhoff, notario

APOSTILLA

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por Dirk Heiderhoff

3. Actuando en calidad de notario

4. Lleva el sello del notario Dirk Heiderhoff, notario en
Leverkusen

Certificado

5. en Colonia

6. El 17 de febrero 2003

7 por el Vicepresidente del Tribunal Regional de Colonia

8. bajo el No 482/03

9. Sello

10. Firma

El Presidente del

Fdo.: firma ilegible

Tribunal Regional de Colonia

Caliebe

ES TRADUCCIÓN FIEL COMPLETA, de la cual se deja copia en los
archivos de estas oficinas para su confrontación.

Bogotá, 14 de marzo 2003.

[Handwritten signature]

Resolución No. 5

COMO NOTARIO EN LA CIUDAD DE BOGOTÁ, PARA CERTIFICAR LA FOTOCOPIA, CARGO DE CON EL ORIGINAL, QUE EN LUGAR A LA FOTOCOPIA

09 SET 2003

PABLO MENDEZ BARRAS
NOTARIO (E)

208993
FINDA
CITA PARA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEÑEA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
2003 MAR 18 P 12:24
JEE TELECOMUNICACIONES
BOGOTÁ D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE
BOGOTA, HAY QUE CONSTAR QUE EN LAS ANTERIORES (ES) FIR-
MAS PUESTAS POR Georgio Jose
Febrero
IDENTIFICADOS CON C.C. No. (S)
ES(SON) AUTENTICAS
SANTAFE DE BOGOTA, 18 MAR 2003

COPIA FIDELMENTE DEL ORIGINAL
DEBE CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA SE HIZO CON EL ORIGINAL
CON ATENCIÓN A LA VISTA

09 SET 2005

PAULO MENDEZ SARAJAS
NOTARIO(E)

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
26. August 2004 (26.08.2004)

PCT

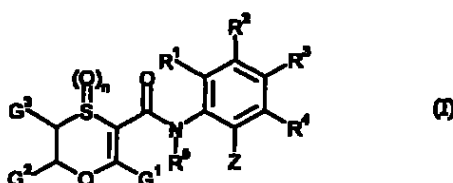
(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2004/072023 A2

not Sk

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D (74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT; Law and Patents, Patents and Licensing, Kaiser-Wilhelm-Allee, 51368 Leverkusen (DE).
- (21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/001053
- (22) Internationales Anmeldedatum: 5. Februar 2004 (05.02.2004) (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (25) Einreichungssprache: Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache: Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:
103 06 244.0 14. Februar 2003 (14.02.2003) DE
103 21 270.1 13. Mai 2003 (13.05.2003) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim (DE).
- (72) Erfinder; und
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): DUNKEL, Ralf [DE/DE]; Krischer Str. 22, 40789 Monheim (DE). ELBE, Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal (DE). RIECK, Helko [DE/FR]; 9, rue Claude Monet, F-69110 Ste Poy les Lyon (FR). GREUL, Nico, Jörg [DE/DE]; Am Sandberg 30 a, 42799 Leichlingen (DE). WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE]; Oberer Markeweg 85, 56566 Neuwied (DE). DAHMEN, Peter [DE/DE]; Altherrlicherstr. 61, 41470 Neuss (DE). KUCK, Karl-Helz [DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30a, 40764 Langenfeld (DE). HARTMANN, Benoit [FR/DE]; Färberstr. 1, 40223 Langenfeld (DE).
- (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), carasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- Veröffentlicht:
— ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts
- Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: OXATHIIN CARBOXAMIDE

(54) Bezeichnung: OXATHIINCARBOXAMIDE



(57) Abstract: The invention relates to the novel oxathiin carboxamide of formula (I), wherein G¹, G², G³, n, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ and Z are defined as in the description. The invention also relates to several methods for producing these substances and their use for controlling undesired microorganisms, and to novel intermediates and their production.

(57) Zusammenfassung: Neue Oxathiincarboxamide der Formel (I), in welcher G¹, G², G³, n, R¹, R², R³, R⁴, R⁵ und Z die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, sowie neue Zwischenprodukte und deren Herstellung.

LeA 36 354

Oxathiincarboxamide

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Oxathiincarboxamide, mehrere Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen.

5

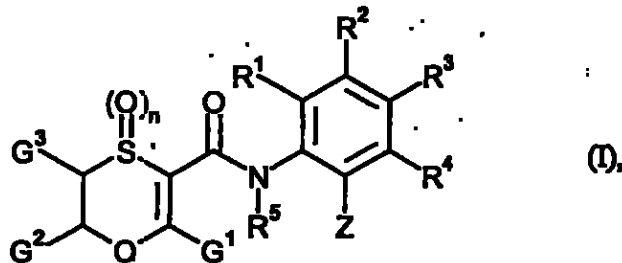
Es ist bereits bekannt, dass zahlreiche Carboxamide fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. z.B. EP-A 0 591 699, EP-A 0 545 099, DE-OS 16 17 921, JP-A 2001-302605, JP-A 10-251240, JP-A 8-176112, JP-A 53-72823 und US 3,657,449).

10

So sind bereits einige 6-Methyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-carboxamide bekannt geworden. Beispielfhaft seien genannt *N*-(4'-Fluor-1,1'-biphenyl-2-yl)-6-methyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-carboxamid und (6-Methyl(2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-yl))-*N*-[2-(2-methylpropyl)phenyl]-carboxamid aus EP-A 0 545 099, (6-Methyl(2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-yl))-*N*-(2,4,6-trimethylphenyl)carboxamid aus DE-OS 16 17 921, *N*-[2-(1,3-Dimethylbutyl)phenyl](6-methyl(2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-yl))carboxamid aus JP-A 10-251240 und (6-Methyl(2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-yl))-*N*-(2-methylphenyl)carboxamid aus US 3,657,449. Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber in manchen Fällen, z.B. bei niedrigen Aufwandmengen zu wünschen übrig.

15

Es wurden nun neue Oxathiincarboxamide der Formel (I)



20

gefunden, in welcher

G^1 für Halogen, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Cyclopropyl steht,

G^2 und G^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff oder Methyl stehen,

n für 0, 1 oder 2 steht,

25

R^1 , R^2 , R^3 und R^4 unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl oder Methylthio stehen,

R^5 für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_8 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Formyl- C_1 - C_3 -alkyl, (C_1 - C_3 -Alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, (C_1 -

30

- C_3 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl; (C_1 - C_3 -Halogenalkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, (C_1 - C_3 -Halogenalkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl mit jeweils 1 bis 7 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, (C_1 - C_3 -Alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenalkyl, (C_1 - C_3 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenalkyl mit jeweils 1 bis 6 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, (C_1 - C_3 -Halogenalkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenalkyl, (C_1 - C_3 -Halogenalkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenalkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; -COR⁶, -CONR⁷R⁸ oder -CH₂NR⁹R¹⁰ steht,
- 5 R^6 für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_1 - C_8 -Alkoxy- C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl; C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkoxy, Halogen- C_1 - C_8 -alkoxy- C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_8 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; -COR¹¹ steht,
- 10 R^7 und R^8 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy- C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl; C_1 - C_8 -Halogenalkyl, Halogen- C_1 - C_8 -alkoxy- C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_8 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- 15 R^7 und R^8 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_8 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹² enthalten kann,
- 20 R^9 und R^{10} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl; C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_3 - C_8 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- 25 R^9 und R^{10} außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_8 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹² enthalten kann,
- 30 R^{11} für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_1 - C_8 -Alkoxy- C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl; C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkoxy, Halogen- C_1 - C_8 -alkoxy- C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_8 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,
- R^{12} für Wasserstoff oder C_1 - C_8 -Alkyl steht,
- 35 Z für Z¹, Z², Z³ oder Z⁴ steht, worin
 Z¹ für gegebenenfalls einfach bis fünffach, gleich oder verschieden substituiertes Phenyl steht,

Z^1 für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Cycloalkyl oder Bicycloalkyl steht,

Z^2 für unsubstituiertes C_2-C_{20} -Alkyl oder für einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3-C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_1-C_{20} -Alkyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_1-C_4 -Alkyl substituiert sein kann,

Z^3 für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3-C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_2-C_{20} -Alkenyl oder C_2-C_{20} -Alkynyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_1-C_4 -Alkyl substituiert sein kann,

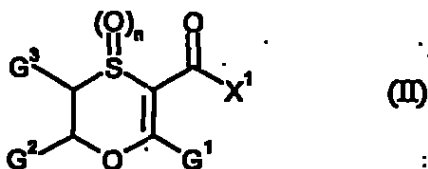
oder

R^1 , R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff oder Fluor stehen und

Z und R^4 gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen gegebenenfalls substituierten 5- oder 6-gliedrigen carbocyclischen oder heterocyclischen Ring bilden.

Weiterhin wurde gefunden, dass man Oxathiincarboxamide der Formel (I) erhält, indem man

a) Oxathiincarbonsäurederivate der Formel (II)

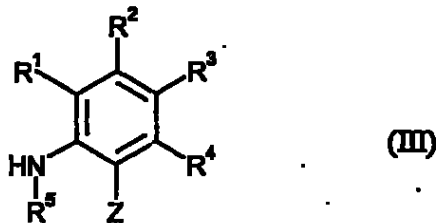


in welcher

G^1 , G^2 , G^3 und n die oben angegebenen Bedeutungen haben und

X^1 für Halogen oder Hydroxy steht,

mit Anilin-Derivaten der Formel (III)



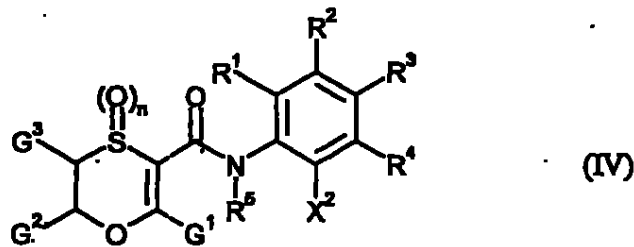
in welcher

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

5

b) Halogenoxathiincarboxamide der Formel (IV)

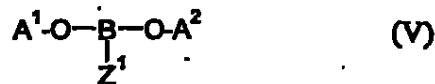


in welcher

$G^1, G^2, G^3, n, R^1, R^2, R^3, R^4$ und R^5 die oben angegebenen Bedeutungen haben,
 X^2 für Brom oder Iod steht,

10

mit Boronsäure-Derivaten der Formel (V)



in welcher

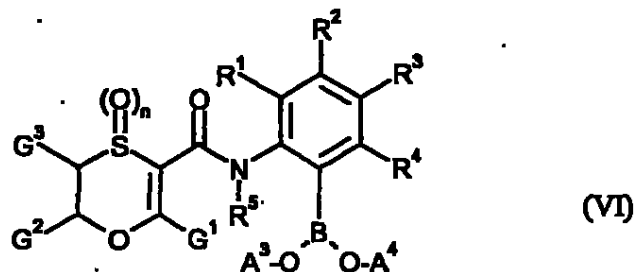
Z^1 die oben angegebenen Bedeutungen hat und
 A^1 und A^2 jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen stehen,

15

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

20

c) Oxathiincarboxamid-Boronsäure-Derivate der Formel (VI)



in welcher

$G^1, G^2, G^3, n, R^1, R^2, R^3, R^4$ und R^5 die oben angegebenen Bedeutungen haben,
 A^3 und A^4 jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen stehen,

25

mit Phenyl-Derivaten der Formel (VII)



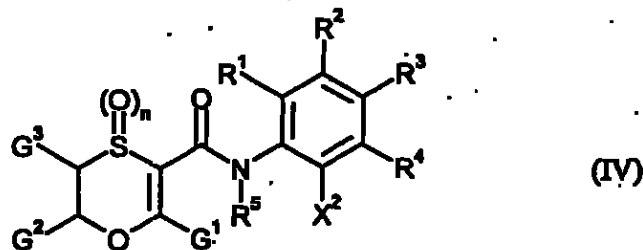
in welcher

Z^1 die oben angegebenen Bedeutungen hat und

5 X^3 für Chlor, Brom, Iod oder Trifluormethylsulfonat steht,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebinde-
mittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

10 d) Halogenoxathiincarboxamide der Formel (IV)



in welcher

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

X^2 für Brom oder Iod steht,

15

mit Phenyl-Derivaten der Formel (VII)



in welcher

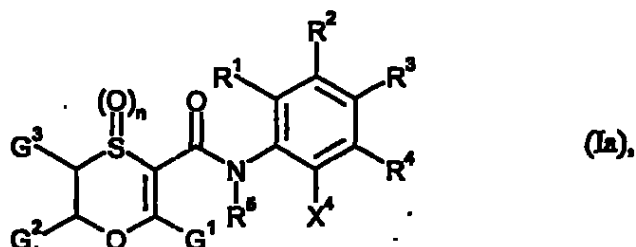
Z^1 die oben angegebenen Bedeutungen hat und

20 X^3 für Chlor, Brom, Iod oder Trifluormethylsulfonat steht,

in Gegenwart eines Palladium- oder Nickel-Katalysators und in Gegenwart von
4,4,4',4'',5,5,5'',5'-Octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolan, gegebenenfalls in Gegen-
wart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungs-
mittels umgesetzt, oder

25

e) Oxathiincarboxamide der Formel (Ia)



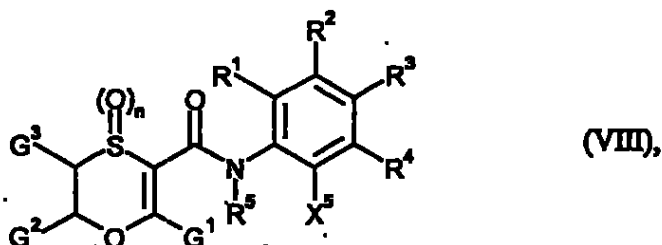
in welcher

$G^1, G^2, G^3, n, R^1, R^2, R^3, R^4$ und R^5 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 X^4 für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3-C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_2-C_{20} -Alkanyl oder C_2-C_{20} -Alkynyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1-C_4 -Alkyl substituiert sein kann,

10 gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert, oder

f) Hydroxyalkyloxathiincarboxamide der Formel (VIII)



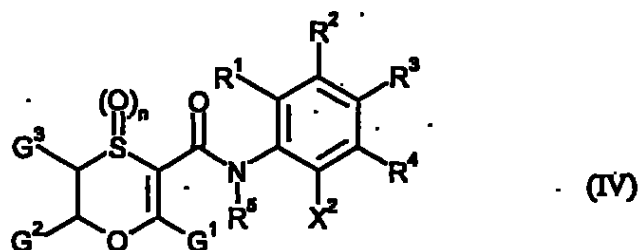
15 in welcher

$G^1, G^2, G^3, n, R^1, R^2, R^3, R^4$ und R^5 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20 X^5 für gegebenenfalls zusätzlich einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3-C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_2-C_{20} -Hydroxyalkyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1-C_4 -Alkyl substituiert sein kann,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure dehydratisiert, oder

g) Halogenoxathimcarboxamide der Formel (IV)



in welcher

$G^1, G^2, G^3, n, R^1, R^2, R^3, R^4$ und R^5 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

X^2 für Brom oder Iod steht,

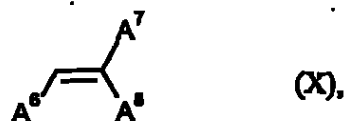
mit einem Alkin der Formel (IX)



in welcher

A^5 für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_2 - C_{11} -Alkyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann,

oder einem Alken der Formel (X)

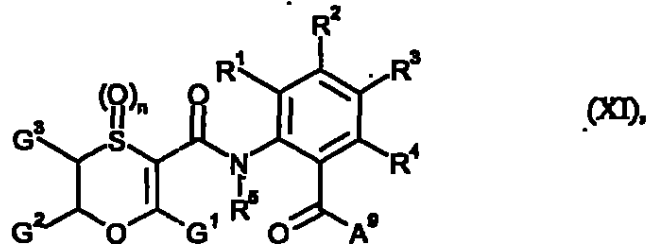


in welcher

A^6, A^7 und A^8 unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff oder gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes Alkyl stehen, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann und die Gesamtzahl der Kohlenstoffatome des offenkettigen Molekülteils die Zahl 20 nicht übersteigt,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und in Gegenwart eines oder mehrerer Katalysatoren umgesetzt, oder

b) Ketone der Formel (XI)



in welcher

$G^1, G^2, G^3, n, R^1, R^2, R^3, R^4$ und R^5 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

A^9 für Wasserstoff oder gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_1 - C_{18} -Alkyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann,

10

mit einer Phosphorverbindung der allgemeinen Formel (XII)



in welcher

A^{10} für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_1 - C_{18} -Alkyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann,

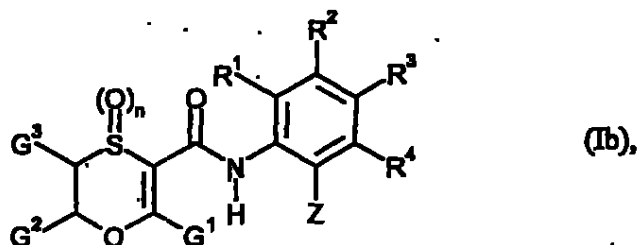
15

P_x für eine Gruppierung $-P^+(C_6H_5)_3$, Cl^- , $-P^+(C_6H_5)_3$, Br^- , $-P^+(C_6H_5)_3$, I^- , $-P(=O)(OCH_3)_3$ oder $-P(=O)(OC_2H_5)_3$ steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

20

i) Oxathimcarboxamide der Formel (Ib)



in welcher

$G^1, G^2, G^3, n, R^1, R^2, R^3, R^4$ und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25

mit Halogeniden der Formel (XIII)



in welcher

R^{5-1} für C_1-C_8 -Alkyl, C_1-C_6 -Alkylsulfinyl, C_1-C_6 -Alkylsulfonyl, C_1-C_4 -Alkoxy-
 C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -Cycloalkyl; C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Halogenalkylthio,
 C_1-C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1-C_4 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1-C_4 -
 5 alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-,
 Chlor- und/oder Bromatomen, Formyl- C_1-C_3 -alkyl, $(C_1-C_3$ -Alkyl)carbonyl-
 C_1-C_3 -alkyl, $(C_1-C_3$ -Alkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl; $(C_1-C_3$ -Halogenalkyl)-
 carbonyl- C_1-C_3 -alkyl, $(C_1-C_3$ -Halogenalkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl mit je-
 weils 1 bis 7 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, $(C_1-C_3$ -Alkyl)carbonyl-
 10 C_1-C_3 -halogenalkyl, $(C_1-C_3$ -Alkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -halogenalkyl mit jeweils
 1 bis 6 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, $(C_1-C_3$ -Halogenalkyl)carbonyl-
 C_1-C_3 -halogenalkyl, $(C_1-C_3$ -Halogenalkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -halogenalkyl mit
 jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; $-COR^6$, $-CONR^7R^8$
 oder $-CH_2NR^9R^{10}$ steht,

15 R^6, R^7, R^8, R^9 und R^{10} die oben angegebenen Bedeutungen haben,

X^6 für Chlor, Brom oder Iod steht,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

20 Schließlich wurde gefunden, dass die neuen Oxathiincarboxamide der Formel (I) sehr gute
 mikrobizide Eigenschaften besitzen und zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen
 sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz verwendbar sind.

25 Überraschenderweise zeigen die erfindungsgemäßen Oxathiincarboxamide der Formel (I)
 eine wesentlich bessere fungizide Wirksamkeit als die konstitutionell ähnlichsten, vorbe-
 kannten Wirkstoffe gleicher Wirkungsrichtung.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls als Mischungen verschie-
 dener möglicher isomerer Formen, insbesondere von Stereoisomeren, wie z. B. E- und Z-,
 30 threo- und erythro-, sowie optischen Isomeren, gegebenenfalls aber auch von Tautomeren
 vorliegen. Es werden sowohl die E- als auch die Z-Isomeren, wie auch die threo- und
 erythro-, sowie die optischen Isomeren, beliebige Mischungen dieser Isomeren, sowie die
 möglichen tautomeren Formen beansprucht.

35 Die erfindungsgemäßen Oxathiincarboxamide sind durch die Formel (I) allgemein definiert.
 Bevorzugte Restdefinitionen der vorstehenden und nachfolgend genannten Formeln sind im

Folgenden angegeben. Diese Definitionen gelten für die Endprodukte der Formel (I) wie für alle Zwischenprodukte gleichermaßen.

- 5 G^1 steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Cyclopropyl.
- G^1 steht besonders bevorzugt für Chlor, Brom, Iod, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Cyclopropyl.
- G^1 steht ganz besonders bevorzugt für Trifluormethyl.
- G^1 steht auch ganz besonders bevorzugt für Difluormethyl.
- 10 G^1 steht auch ganz besonders bevorzugt für Cyclopropyl.
- G^2 steht bevorzugt für Wasserstoff.
- G^2 steht auch bevorzugt für Methyl.
- G^3 steht bevorzugt für Wasserstoff.
- G^3 steht auch bevorzugt für Methyl.
- 15 G^2 und G^3 stehen besonders bevorzugt gleichzeitig für Wasserstoff.
- n steht bevorzugt 0 oder 2.
- n steht besonders bevorzugt für 0.
- n steht auch besonders bevorzugt für 2.
- 20 R^1 steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Methyl.
- R^1 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor oder Chlor.
- R^1 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.
- R^1 steht auch ganz besonders bevorzugt für Fluor.
- 25 R^2 steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, iso-Propyl oder Methylthio.
- R^2 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, iso-Propyl oder Methylthio.
- R^2 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.
- R^3 steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Methyl.
- R^3 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Fluor.
- 30 R^3 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.
- R^3 steht auch ganz besonders bevorzugt für Fluor.
- R^4 steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Methyl.
- R^4 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.
- R^4 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.
- 35 R^4 steht auch ganz besonders bevorzugt für Methyl.
- R^1 , R^2 , R^3 und R^4 stehen ganz besonders bevorzugt gleichzeitig für Wasserstoff.

- R^5 steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Formyl- C_1 - C_3 -alkyl, $(C_1$ - C_3 -Alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, $(C_1$ - C_3 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl; $(C_1$ - C_3 -Halogenalkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, $(C_1$ - C_3 -Halogenalkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl mit jeweils 1 bis 7 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, $(C_1$ - C_3 -Alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenalkyl, $(C_1$ - C_3 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenalkyl mit jeweils 1 bis 6 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, $(C_1$ - C_3 -Halogenalkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenalkyl, $(C_1$ - C_3 -Halogenalkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenalkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; $-COR^6$, $-CONR^7R^8$ oder $-CH_2NR^9R^{10}$.
- R^5 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl,
- $-CH_2-CHO$, $-CH_2CH_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2-C(O)OCH_3$, $-CH_2-C(O)OCH_2CH_3$, $-CH_2-C(O)OCH(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH_2CH_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH(CH_3)_2$,
- $-CH_2-CO-CF_3$, $-CH_2-CO-CCl_3$, $-CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-CH_2CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-CH_2-C(O)OCH_2CF_3$, $-CH_2-C(O)OCF_2CF_3$, $-CH_2-C(O)OCH_2CCl_3$, $-CH_2-C(O)OCCl_2CCl_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH_2CF_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCF_2CF_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH_2CCl_3$, $-CH_2CH_2-C(O)O-CCl_2CCl_3$; $-COR^6$, $-CONR^7R^8$ oder $-CH_2NR^9R^{10}$.
- R^5 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Methoxymethyl, $-CH_2-CHO$, $-CH_2CH_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$ oder $-COR^6$.
- R^6 steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, Halogen- C_1 - C_3 -

alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, -COR¹¹.

R⁶ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, iso-Propoxy, tert-Butoxy, Cyclopropyl; Trifluormethyl, Trifluormethoxy, -COR¹¹.

R⁶ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, -COCH₃, -CHO, -COCH₂OCH₃, -COCO₂CH₃, -COCO₂CH₂CH₃.

R⁷ und R⁸ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R⁷ und R⁸ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹² enthalten kann.

R⁷ und R⁸ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl.

R⁷ und R⁸ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R¹² substituiert sein kann.

R⁹ und R¹⁰ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₆-Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R⁹ und R¹⁰ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₄-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹² enthalten kann.

R⁹ und R¹⁰ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxy-

ethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl.

R^9 und R^{10} bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R^{12} substituiert sein kann.

R^{11} steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkoxy, Halogen- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Halogenycycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R^{11} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, iso-Propoxy, tert-Butoxy, Cyclopropyl; Trifluormethyl, Trifluormethoxy.

R^{12} steht bevorzugt für Wasserstoff oder C_1 - C_4 -Alkyl.

R^{12} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl.

Z steht bevorzugt für Z^1 .

Z^1 steht bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis fünffach, gleich oder verschieden substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten aus der Liste W^1 ausgewählt sind.

Z^1 steht besonders bevorzugt für einfach substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten aus der Liste W^1 ausgewählt sind.

Z^1 steht auch besonders bevorzugt für zweifach, gleich oder verschieden substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten aus der Liste W^1 ausgewählt sind.

Z^1 steht auch besonders bevorzugt für dreifach, gleich oder verschieden substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten aus der Liste W^1 ausgewählt sind.

Z^1 steht ganz besonders bevorzugt für einfach in 4-Position substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten aus der Liste W^1 ausgewählt sind.

Z^1 steht ganz besonders bevorzugt für zweifach, gleich oder verschieden in 3,4-Position substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten aus der Liste W^1 ausgewählt sind.

Z^1 steht ganz besonders bevorzugt für zweifach, gleich oder verschieden in 2,4-Position substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten aus der Liste W^1 ausgewählt sind.

Z' steht ganz besonders bevorzugt für zweifach, gleich oder verschieden in 3,5-Position substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten aus der Liste W' ausgewählt sind.

Z' steht ganz besonders bevorzugt für dreifach, gleich oder verschieden in 2,4,6-Position substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten aus der Liste W' ausgewählt sind.

W' steht für Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl, Thiocarbamoyl;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Hydroxyalkyl, Oxoalkyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Dialkoxyalkyl, Alkylthio, Alkylsulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 8 Kohlenstoffatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;

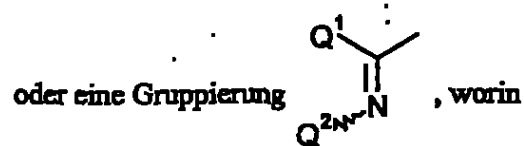
jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halogenalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 11 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy carbonyl, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Arylalkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyloxy mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den jeweiligen Kohlenwasserstoffketten, Alkenylcarbonyl oder Alkinylcarbonyl, mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen in den jeweiligen Kohlenwasserstoffketten;

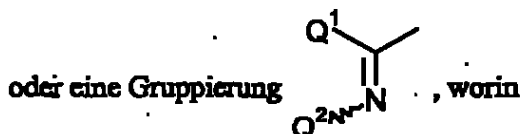
Cycloalkyl oder Cycloalkyloxy mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen;

jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Oxo, Methyl, Trifluormethyl oder Ethyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, Oxyalkylen mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen oder Dioxyalkylen mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen;



Q¹ für Wasserstoff, Hydroxy oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen oder Cycloalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht und

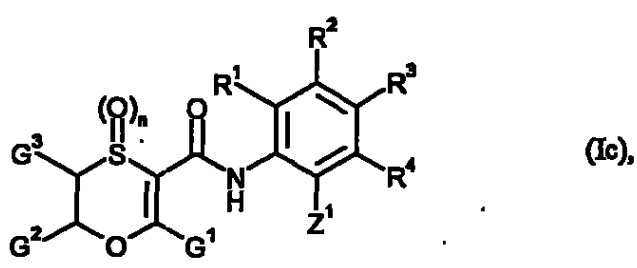
- Q² für Hydroxy, Amino, Methylamino, Phenyl, Benzyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino oder Phenyl substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, oder für Alkenyloxy oder Alkinyloxy mit jeweils 2 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,
- 5 sowie jeweils gegebenenfalls im Ringteil einfach bis dreifach durch Halogen, und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzoyl, Benzoylphenyl, Cinnamoyl, Heterocyclyl oder Phenylalkyl, Phenylalkyloxy, Phenylalkylthio, oder Heterocyclalkyl, mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den jeweiligen Alkylteilen.
- 10 W¹ steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, s- oder t-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder i-Propoxy, Trifluormethyl, Trifluorethyl, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trifluorethoxy, jeweils
- 15 zweifach verknüpftes Difluormethyldioxy oder Tetrafluorethyldioxy,



- Q¹ für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Trifluormethyl steht und
- Q² für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, Propoxy oder Isopropoxy steht.
- 20 Z steht auch bevorzugt für Z².
- Z² steht bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C₁-C₄-Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Bicycloalkyl mit jeweils 3 bis 10 Kohlenstoffatomen.
- 25 Z² steht besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Chlor und/oder Methyl substituiertes Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl, Cyclooctyl, Cyclononyl, Bicyclo[2.2.1]heptyl oder Bicyclo[2.2.2]octyl.
- Z² steht ganz besonders bevorzugt für durch Chlor und Methyl substituiertes Cyclopropyl.
- 30 Z steht auch bevorzugt für Z³.
- Z³ steht bevorzugt für unsubstituiertes C₂-C₂₀-Alkyl oder für einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Iod und/oder C₃-C₆-Cycloalkyl substituiertes C₁-C₂₀-Alkyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls

- einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Iod, C₁-C₄-Alkyl und/oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiert sein kann.
- Z³ steht besonders bevorzugt für unsubstituiertes C₂-C₂₀-Alkyl.
- Z³ steht auch besonders bevorzugt für durch Chlor, Cyclopropyl, Dichlorcyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl substituiertes C₁-C₂₀-Alkyl.
- 5 Z steht auch bevorzugt für Z⁴.
- Z⁴ steht bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Iod und/oder C₃-C₆-Cycloalkyl substituiertes C₂-C₂₀-Alkenyl oder C₂-C₂₀-Alkynyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Iod, C₁-C₄-Alkyl und/oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiert sein kann.
- 10 Z⁴ steht besonders bevorzugt für C₂-C₂₀-Alkenyl oder C₂-C₂₀-Alkynyl.
- 15 Z und R⁴ stehen auch bevorzugt gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituierten 5- oder 6-gliedrigen carbocyclischen oder heterocyclischen Ring.
- Z und R⁴ stehen auch besonders bevorzugt gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, für einen gegebenenfalls einfach, zweifach oder dreifach durch Methyl substituierten 5- oder 6-gliedrigen carbocyclischen Ring.
- 20 Bevorzugt sind solche Verbindungen der Formel (I), in welcher alle Reste jeweils die oben genannten bevorzugten Bedeutungen haben.
- 25 Besonders bevorzugt sind solche Verbindungen der Formel (I), in welcher alle Reste jeweils die oben genannten besonders bevorzugten Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind außerdem Verbindungen der Formel (Ic)



- 30 in welcher
G¹, G², G³, n, R¹, R², R³, R⁴ und Z¹ die oben angegebenen Bedeutungen haben.

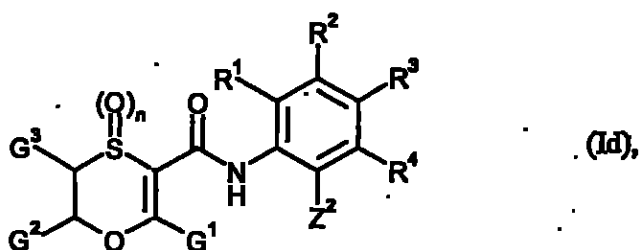
Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Ic), in welcher G^1 für Trifluormethyl steht.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Ic), in welcher G^1 für Difluormethyl steht.

5 Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Ic), in welcher R^1 , R^2 , R^3 und R^4 jeweils für Wasserstoff stehen.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Ic), in welcher n für 0 steht.

Bevorzugt sind außerdem Verbindungen der Formel (Id)



10

in welcher

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und Z^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben.

15

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Id), in welcher G^1 für Trifluormethyl steht.

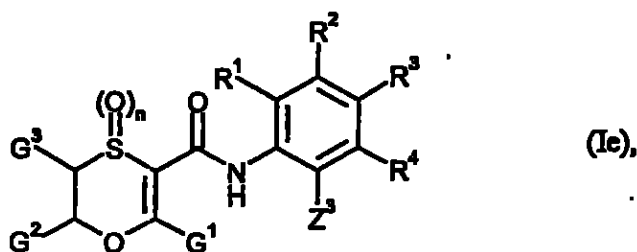
Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Id), in welcher G^1 für Difluormethyl steht.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Id), in welcher R^1 , R^2 , R^3 und R^4 jeweils für Wasserstoff stehen.

20

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Id), in welcher n für 0 steht.

Bevorzugt sind außerdem Verbindungen der Formel (Ie)



in welcher

25

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und Z^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben.

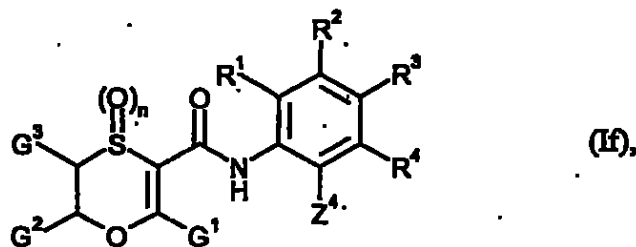
Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Ie), in welcher G^1 für Trifluormethyl steht.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Ie), in welcher G^1 für Difluormethyl steht.

5 Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Ie), in welcher R^1 , R^2 , R^3 und R^4 jeweils für Wasserstoff stehen.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Ie), in welcher n für 0 steht.

Bevorzugt sind außerdem Verbindungen der Formel (If)



10

in welcher

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und Z^4 die oben angegebenen Bedeutungen haben.

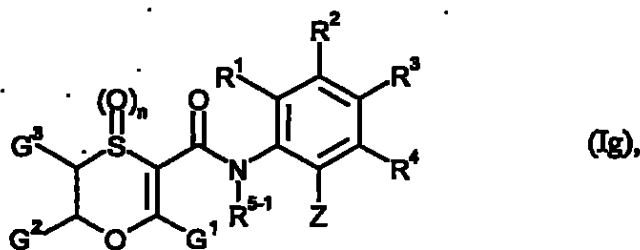
15 Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (If), in welcher G^1 für Trifluormethyl steht.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (If), in welcher G^1 für Difluormethyl steht.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (If), in welcher R^1 , R^2 , R^3 und R^4 jeweils für Wasserstoff stehen.

20 Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (If), in welcher n für 0 steht.

Bevorzugt sind außerdem Verbindungen der Formel (Ig)



in welcher

25 G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{5-1} und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben.

- R^{5-1} steht bevorzugt für C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_3 -Alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_4 -Halogenalkyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylthio, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Formyl- C_1 - C_3 -alkyl, $(C_1$ - C_3 -Alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, $(C_1$ - C_3 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl; $(C_1$ - C_3 -Halogenalkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, $(C_1$ - C_3 -Halogenalkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl mit jeweils 1 bis 7 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, $(C_1$ - C_3 -Alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenalkyl, $(C_1$ - C_3 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenalkyl mit jeweils 1 bis 6 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, $(C_1$ - C_3 -Halogenalkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenalkyl, $(C_1$ - C_3 -Halogenalkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenalkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; $-COR^6$, $-CONR^7R^8$ oder $-CH_2NR^9R^{10}$.
- R^{5-1} steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl, $-CH_2-CHO$, $-CH_2CH_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2-C(O)OCH_3$, $-CH_2-C(O)OCH_2CH_3$, $-CH_2-C(O)OCH(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH_2CH_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO-CF_3$, $-CH_2-CO-CCl_3$, $-CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-CH_2CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-CH_2-C(O)OCH_2CF_3$, $-CH_2-C(O)OCF_2CF_3$, $-CH_2-C(O)OCH_2CCl_3$, $-CH_2-C(O)OCCl_2CCl_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH_2CF_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCF_2CF_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH_2CCl_3$, $-CH_2CH_2-C(O)O-CCl_2CCl_3$; $-COR^6$, $-CONR^7R^8$ oder $-CH_2NR^9R^{10}$.
- R^{5-1} steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Methoxymethyl, $-CH_2-CHO$, $-CH_2CH_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$ oder $-COR^6$.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Ig), in welcher G^1 für Trifluormethyl steht.

- 35 Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Ig), in welcher G^1 für Difluormethyl steht.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Ig), in welcher R^1 , R^2 , R^3 und R^4 jeweils für Wasserstoff stehen.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel (Ig), in welcher n für 0 steht.

- 5 Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl oder Alkenyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

10 Die Definition C_1 - C_{20} -Alkyl umfasst den größten hierin definierten Bereich für einen Alkylrest. Im Einzelnen umfasst diese Definition die Bedeutungen Methyl-, Ethyl, n-, iso-Propyl, n-, iso-, sec-, tert-Butyl, sowie jeweils alle isomeren Pentyle, Hexyle, Heptyle, Octyle, Nonyle, Decyle, Undecyle, Dodecyle, Tridecyle, Tetradecyle, Pentadecyle, Hexadecyle, Heptadecyle, Octadecyle, Nonadecyle und Eicosyle.

15 Die Definition C_2 - C_{20} -Alkenyl umfasst den größten hierin definierten Bereich für einen Alkenylrest. Im Einzelnen umfasst diese Definition die Bedeutungen Ethenyl, n-, iso-Propenyl, n-, iso-, sec-, tert-Butenyl, sowie jeweils alle isomeren Pentenyle, Hexenyle, Heptenyle, Octenyle, Nonenyle, Decenyle, Undecenyle, Dodecenyle, Tridecenyle, Tetradecenyle, Pentadecenyle, Hexadecenyle, Heptadecenyle, Octadecenyle, Nonadecenyle und Eicosenyle:

20

Die Definition C_2 - C_{20} -Alkinyl umfasst den größten hierin definierten Bereich für einen Alkinylrest. Im Einzelnen umfasst diese Definition die Bedeutungen Ethinyl, n-, iso-Propinyl, n-, iso-, sec-, tert-Butinyl, sowie jeweils alle isomeren Pentinyle, Hexinyle, Heptinyle, Octinyle, Noninyle, Decinyle, Undecinyle, Dodecinyle, Tridecinyle, Tetradecinyle, Pentadecinyle, Hexadecinyle, Heptadecinyle, Octadecinyle, Nonadecinyle und Eicosinyle.

25

Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein können.

30 Durch Halogen substituierte Reste, wie z.B. Halogenalkyl, sind einfach oder mehrfach halogeniert. Bei mehrfacher Halogenierung können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Halogen steht dabei für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

35 Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen bzw. Erläuterungen können zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen

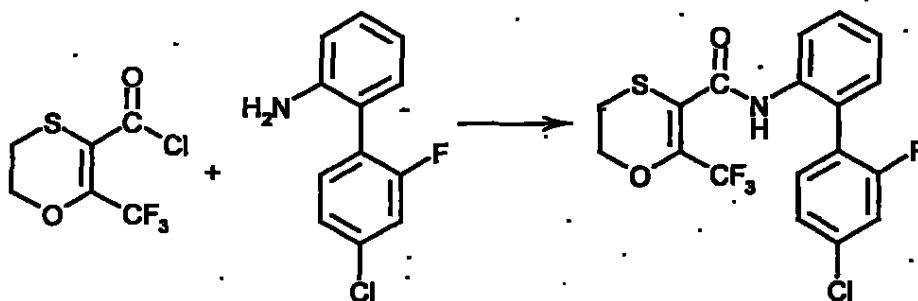
beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.

Erläuterungen der Verfahren und Zwischenprodukte:

5

Verfahren (a)

Verwendet man 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-carbonsäurechlorid und 4'-Chlor-2'-fluor-1,1'-biphenyl-2-amin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



10

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Oxathiincarbonsäure-Derivate sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) haben G^1 , G^2 , G^3 und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für G^1 , G^2 , G^3 und n angegeben wurden. X^1 steht bevorzugt für Chlor oder Hydroxy.

15

Die Ausgangsstoffe der Formel (II) sind größtenteils bekannt und/oder können nach bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. Han'guk Noughwa Hakhoechi 2001, 44, 191-196). Neue Verbindungen der Formel (II) sowie Verfahren zu deren Herstellung sind den Herstellungsbeispielen zu entnehmen.

20

Verbindungen der Formel (II), in welcher n für 1 oder 2 steht, werden aus den entsprechenden Verbindungen, in welchen n für 0 steht, durch übliche Methoden der Oxidation erhalten, beispielsweise durch Umsetzung mit Wasserstoffperoxid (H_2O_2) in Gegenwart von Ameisensäure und einem Verdünnungsmittel (z.B. 4-Methyl-2-pentanone). Der Grad der Oxidation lässt sich jeweils durch die Reaktionsbedingungen steuern.

25

Auf die gleiche Weise ist es auch möglich, Verbindungen der Formel (I), in welcher n für 0

30

steht, zu oxidieren und so Verbindungen der Formel (I) zu erhalten, in welcher n für 1 oder 2 steht. Der Grad der Oxidation lässt sich jeweils durch die Reaktionsbedingungen steuern.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Anilin-Derivate sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) haben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

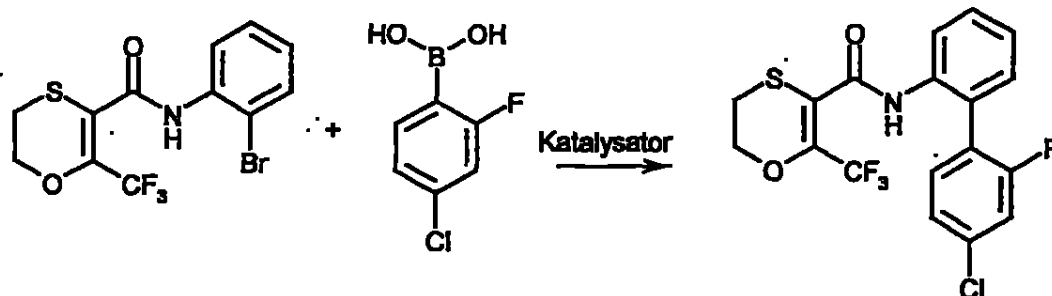
Die Ausgangsstoffe der Formel (III) sind größtenteils bekannt und/oder können nach bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. z.B. Bull. Korean Chem. Soc. 2000, 21, 165-166; Chem. Pharm. Bull. 1992, 40, 240-244; Heterocycles 1989, 29, 1013-1016; J. Med. Chem. 1996, 39, 892-903; Synthesis 1995, 713-16; Synth. Commun. 1994, 24, 267-272; Synthesis 1994, 142-144; DE-A 27 27 416; EP-A 0 824 099; WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301, EP-A 0 589 313 und WO 02/38542).

Es ist auch möglich, zunächst Anilin-Derivate der Formel (III), in welcher R^5 für Wasserstoff steht, herzustellen und die so erhaltenen Verbindungen anschließend nach üblichen Methoden zu derivatisieren [z.B. analog zum erfindungsgemäßen Verfahren (i)].

Neue Verbindungen der Formel (III) sowie Verfahren zu deren Herstellung sind den Herstellungsbeispielen zu entnehmen.

Verfahren (b)

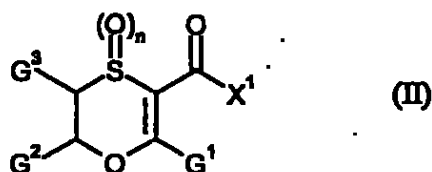
Verwendet man *N*-(2-Bromphenyl)-6-trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-carboxamid und 4-Chlor-2-fluorphenylboronsäure als Ausgangsstoffe sowie einen Katalysator, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Halogenoxathiincarboxamide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel (IV) haben G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste bzw. diesen Index angegeben wurden. X^2 steht für Brom oder Iod.

Die Halogenoxathiincarboxamide der Formel (IV) sind noch nicht bekannt. Sie sind als neue chemische Verbindungen ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung. Sie werden erhalten, indem man

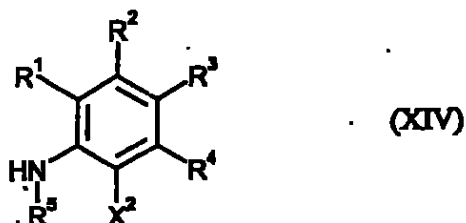
j) Oxathiincarbonsäure-Derivate der Formel (II)



in welcher

G^1 , G^2 , G^3 und n die oben angegebenen Bedeutungen haben und X^1 für Halogen oder Hydroxy steht,

mit Halogenanilinen der Formel (XIV),



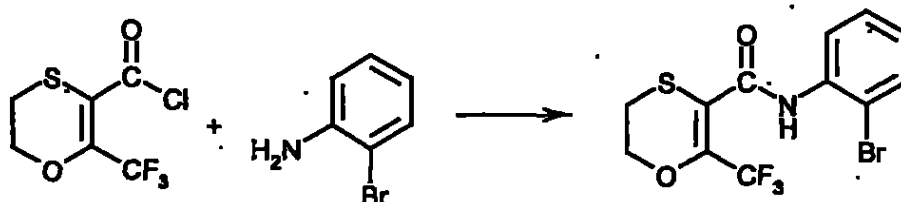
in welcher

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und X^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, umgesetzt

Verfahren (j)

Verwendet man 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-carbonsäurechlorid und 2-Bromanilin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) als Ausgangsstoffe benötigten Oxathiincarbonsäure-Halogide der Formel (II) sind bereits weiter oben im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) beschrieben worden.

- Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Halogenaniline sind durch die Formel (XIV) allgemein definiert. In dieser Formel (XIV) haben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und X^2 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I), bzw. die Vorprodukte der Formel (III) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

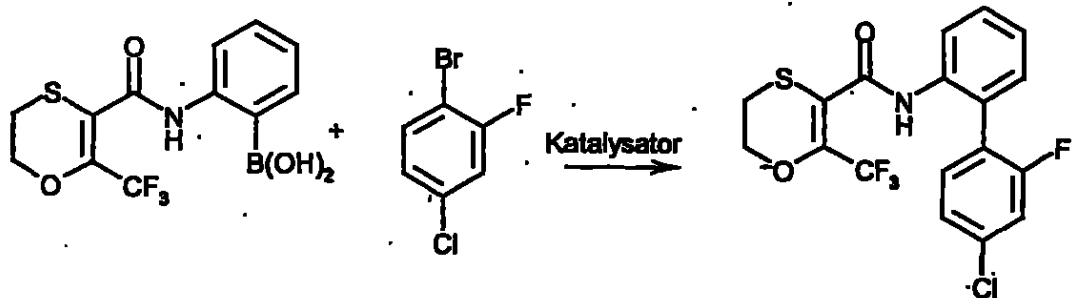
Die Halogenaniline der Formel (XIV) sind handelsübliche Syntheschemikalien oder können nach bekannten Verfahren erhalten werden. Im Fall, dass R^5 nicht für Wasserstoff steht, kann der Rest R^5 auf der Stufe der Verbindungen der Formel (XIV) durch übliche Derivatisierungsmethoden eingeführt werden. Es ist auch möglich, zunächst Verbindungen der Formel (IV), in denen R^5 für Wasserstoff steht, herzustellen und die erhaltenen Produkte anschließend durch übliche Methoden zu derivatisieren [vgl. das erfindungsgemäße Verfahren (i)].

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Boronsäure-Derivate sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel (V) hat Z^1 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für Z^1 angegeben wurden. A^1 und A^2 stehen jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen.

Die Boronsäure-Derivate der Formel (V) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen (vgl. z.B. WO 01/90084 und US 5,633,218).

Verfahren c)

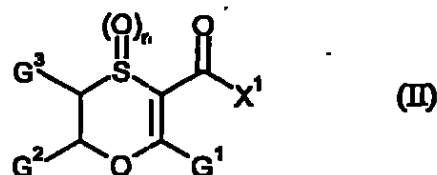
- 5 Verwendet man 2-[[6-(Trifluormethyl)-2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-yl]carbonylamino}phenyl-boronsäure und 1-Brom-4-chlor-2-fluorbenzol als Ausgangsstoffe sowie einen Katalysator, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



- 10 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Oxathiincarboxamid-Boronsäure-Derivate sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel (VI) haben G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als
- 15 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste bzw. diesen Index angegeben wurden. A^3 und A^4 stehen jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen.

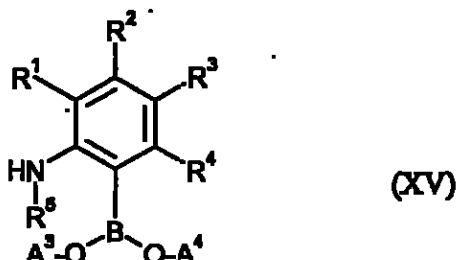
- Die Oxathiincarboxamid-Boronsäure-Derivate der Formel (VI) sind noch nicht bekannt. Sie sind neue chemische Verbindungen und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.
- 20 Sie werden erhalten, indem man

- k) ein Oxathiincarbonsäurederivat der Formel (II)



- 25 in welcher G^1 , G^2 , G^3 und n die oben angegebenen Bedeutungen haben und X^1 für Halogen oder Hydroxy steht,

mit einem Anilinboronsäurederivat der Formel (XV)



in welcher

$R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, A^3$ und A^4 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

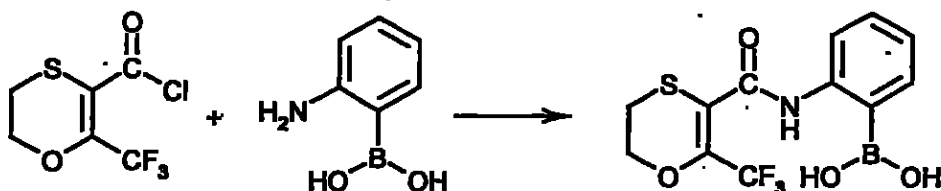
5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, umgesetzt.

10

Verfahren (k)

Verwendet man 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathin-5-carbonsäurechlorid und 2-Aminophenylboronsäure als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



15

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) als Ausgangsstoffe benötigten Oxathiincarbonsäurederivate der Formel (II) sind bereits weiter oben im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) beschrieben worden.

20

Die weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) als Ausgangsstoffe benötigten Anilinboronsäurederivate sind durch die Formel (XV) allgemein definiert. In dieser Formel (XV) haben R^1, R^2, R^3, R^4 und R^5 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden. A^3 und A^4 stehen jeweils für Wasserstoff oder gemeinsam für Tetramethylethylen.

25

Die Anilinboronsäurederivate der Formel (XV) sind bekannte Syntheschemikalien oder können nach bekannten Verfahren erhalten werden. Im Fall, dass R^5 nicht für Wasserstoff

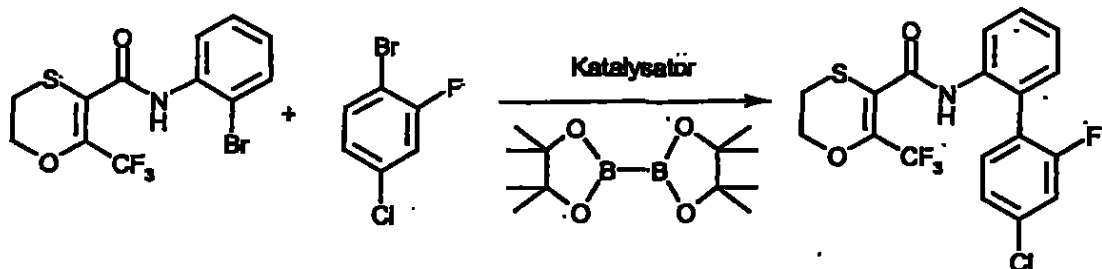
steht, kann der Rest R^5 auf der Stufe der Verbindungen der Formel (XV) durch übliche Derivatisierungsmethoden eingeführt werden. Es ist auch möglich, zunächst Verbindungen der Formel (VI), in denen R^5 für Wasserstoff steht, herzustellen und die erhaltenen Produkte anschließend durch übliche Methoden zu derivatisieren [vgl. das erfindungsgemäße Verfahren (i)].

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Phenyl-Derivate sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel (VII) hat Z^1 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für Z^1 angegeben wurden. X^3 steht für Chlor, Brom, Iod oder Trifluormethylsulfonat.

Die Phenyl-Derivate der Formel (VII) sind bekannte Syntheschemikalien.

Verfahren d)

Verwendet man *N*-(2-Bromphenyl)-6-trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-carboxamid und 1-Brom-4-chlor-2-fluorbenzol als Ausgangsstoffe sowie einen Katalysator und 4,4,4',4',5,5,5',5'-Octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolan, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

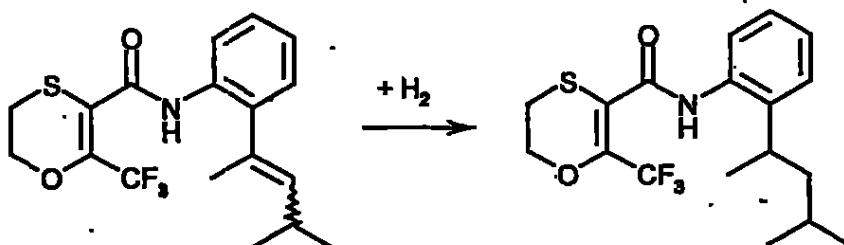


Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) als Ausgangsstoffe benötigten Halogenoxathiincarboxamide der Formel (IV), sowie die Phenyl-Derivate der Formel (VII) sind bereits weiter oben im Zusammenhang mit den erfindungsgemäßen Verfahren (b) und (c) beschrieben worden.

Das weiterhin zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) benötigte 4,4,4',4',5,5,5',5'-Octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolan ist eine handelsübliche Syntheschemikalie.

Verfahren e)

Hydriert man beispielsweise *N*-[2-(1,3-Dimethylbut-1-enyl)phenyl][6-(trifluormethyl)(2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-yl)]carboxamid, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) als Ausgangsstoffe benötigten Oxathiincarboxamide sind durch die Formel (Ia) allgemein definiert. In dieser Formel (Ia) haben G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 und R^4 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste bzw. diesen Index angegeben wurden.

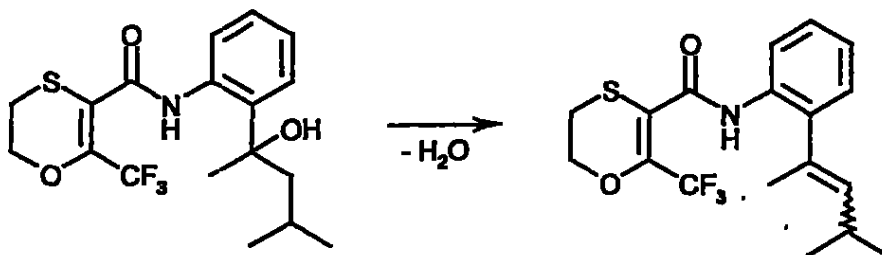
X^4 steht bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Iod und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_2 - C_{20} -Alkenyl oder C_2 - C_{20} -Alkynyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Iod, C_1 - C_4 -Alkyl und/oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl substituiert sein kann.

X^4 steht besonders bevorzugt für C_2 - C_{20} -Alkenyl oder C_2 - C_{20} -Alkynyl.

Die Verbindungen der Formel (Ia) sind erfindungsgemäße Verbindungen und können nach den Verfahren (a), (f), (g) oder (h) hergestellt werden.

Verfahren (f)

Dehydratisiert man beispielsweise *N*-[2-(1-Hydroxy-1,3-dimethylbutyl)phenyl][6-(trifluormethyl)(2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-yl)]carboxamid, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe benötigten Hydroxyalkyloxathiincarboxamide sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel (VIII) haben G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste bzw. diesen Index angegeben wurden.

X^5 steht bevorzugt für gegebenenfalls zusätzlich einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Chlor, Fluor, Brom und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_2 - C_{12} -Hydroxyalkyl, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann.

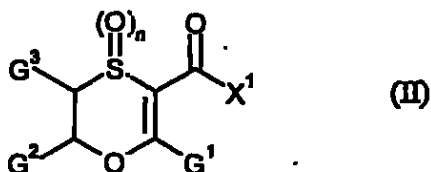
X^5 steht besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Cyclopropyl, Difluorcyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und/oder Cyclohexyl substituiertes, jeweils geradkettiges oder verzweigtes, jeweils an beliebiger Stelle verknüpftes Hydroxyethyl, Hydroxypropyl, Hydroxybutyl, Hydroxypentyl, Hydroxyhexyl, Hydroxyheptyl, Hydroxyoctyl, Hydroxynonyl oder Hydroxydecyl.

Die Verbindungen der Formel (VIII) sind noch nicht bekannt und als neue Verbindungen ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Es wurde auch gefunden, dass die Hydroxyalkylpyrazolylcarboxamide der Formel (VIII) sehr gute mikrobizide Eigenschaften besitzen und zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz eingesetzt werden können.

Die Hydroxyalkylpyrazolylcarboxamide der Formel (VIII) werden erhalten, indem man

1) Oxathiincarbonsäurederivate der Formel (II)

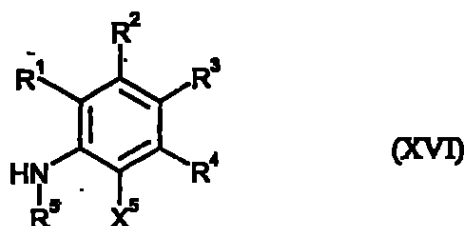


in welcher

G^1 , G^2 , G^3 und n die oben angegebenen Bedeutungen haben und

X^1 für Halogen oder Hydroxy steht,

mit einem Hydroxyalkylaminlinderivat der Formel (XVI)



in welcher

5 R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 und X^5 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

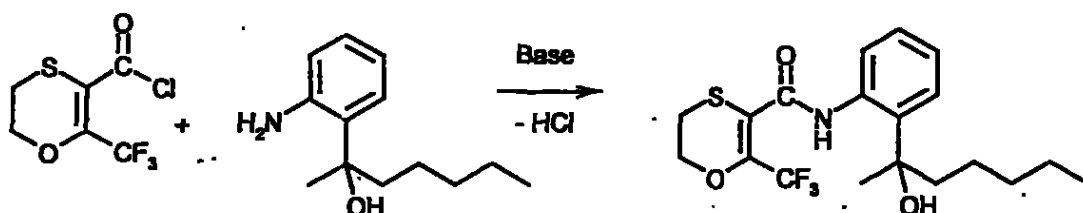
gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, umgesetzt.

10

Verfahren (I)

Verwendet man beispielsweise 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-carbonsäurechlorid und 2-(2-Aminophenyl)-2-heptanol als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (I) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:

15



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (I) als Ausgangsstoffe benötigten Oxathiincarbonsäurederivate der Formel (II) sind bereits weiter oben im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) beschrieben worden.

20

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (I) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Hydroxyalkylaminlinderivate sind durch die Formel (XVI) allgemein definiert. In dieser Formel (XVI) haben R^1, R^2, R^3, R^4, R^5 und X^5 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formeln (I) bzw. (VIII) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

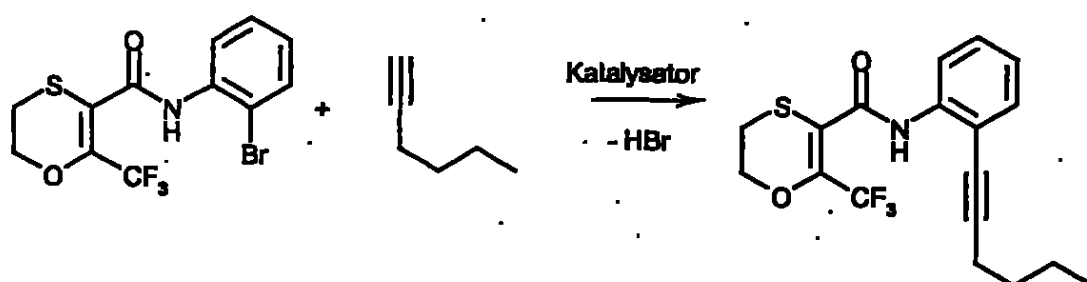
25

Die Hydroxyalkylaminlinderivate der Formel (XVI) sind bekannt und/oder können nach bekannten Methoden erhalten werden (vgl. z.B. US 3,917,592 oder EP-A 0 824 099). Im Fall,

dass R⁵ nicht für Wasserstoff steht, kann der Rest R⁵ auf der Stufe der Verbindungen der Formel (XVI) durch übliche Derivatisierungsmethoden eingeführt werden. Es ist auch möglich, zunächst Verbindungen der Formel (VIII), in denen R⁵ für Wasserstoff steht, herzustellen und die erhaltenen Produkte anschließend durch übliche Methoden zu derivatisieren [vgl. das erfindungsgemäße Verfahren (i)].

Verfahren (g)

Verwendet man beispielsweise *N*-(2-Bromphenyl)-6-trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathin-5-carboxamid und 1-Hexin als Ausgangsstoffe sowie einen Katalysator, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) als Ausgangsstoffe benötigten Halogenoxathiincarboxamide der Formel (IV) sind bereits weiter oben im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (c) beschrieben worden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Alkine sind durch die Formel (IX) allgemein definiert.

A⁵ steht bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom und/oder C₃-C₈-Cycloalkyl substituiertes C₂-C₁₀-Alkyl, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann.

A⁵ steht besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Cyclopropyl, Difluorcyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und/oder Cyclohexyl substituiertes, jeweils geradkettiges oder verzweigtes, jeweils an beliebiger Stelle verknüpftes Ethyl, Propyl, Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl oder Octyl.

Die Alkine der Formel (VI) sind bekannte Syntheschemikalien.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) weiterhin alternativ als Ausgangsstoffe benötigten Alkene sind durch die Formel (X) allgemein definiert.

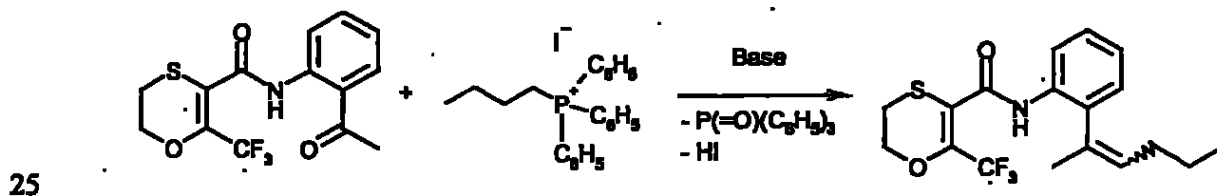
5 A⁶, A⁷ und A⁸ stehen unabhängig voneinander bevorzugt jeweils für Wasserstoff oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom und/oder C₃-C₆-Cycloalkyl substituiertes Alkyl, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann und die Gesamtzahl der Kohlenstoffatome des offenkettigen Molekülteils die Zahl 12 nicht übersteigt.

10 A⁶, A⁷ und A⁸ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt jeweils für Wasserstoff oder gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Cyclopropyl, Difluorcyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und/ oder Cyclohexyl substituiertes, jeweils geradkettiges oder verzweigtes, jeweils an beliebiger Stelle verknüpftes Ethyl, Propyl, Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl oder Octyl, wobei die
15 Gesamtzahl der Kohlenstoffatome des offenkettigen Molekülteils die Zahl 12 nicht übersteigt.

Die Alkene der Formel (VII) sind bekannte Syntheschemikalien.

20 Verfahren (h)

Verwendet man N-(2-Acetylphenyl)[6-(trifluormethyl)(2,3-dihydro-1,4-oxathin-5-yl)]-carboxamid und Butyl(triphenyl)-phosphonium-iodid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) als Ausgangsstoffe benötigten Ketone sind durch die Formel (XI) allgemein definiert. In dieser Formel haben G¹, G², G³, n, R¹, R², R³, R⁴ und R⁵ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste bzw. diesen Index angegeben wurden.

30

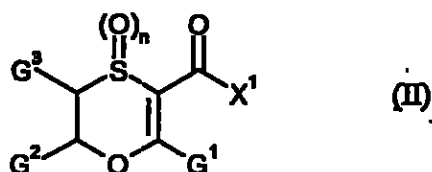
A⁹ steht bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom und/oder C₃-C₆-Cycloalkyl substituiertes C₁-C₁₀-Alkyl, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C₁-C₄-Alkyl substituiert sein kann.

5 A⁹ steht besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Cyclopropyl, Difluorcyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und/oder Cyclohexyl substituiertes, jeweils geradkettiges oder verzweigtes, jeweils an beliebiger Stelle verknüpftes Ethyl, Propyl, Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl oder Octyl.

10

Die Ketone der Formel (XI) sind noch nicht bekannt. Sie sind als neue chemische Verbindungen ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung. Sie werden erhalten, indem man

15 m) Oxathiincarbonsäurederivate der Formel (II)



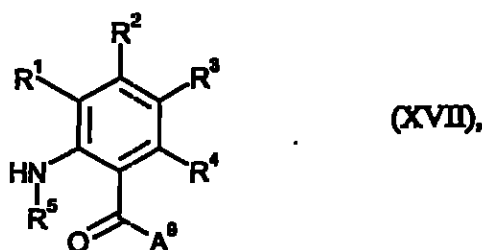
in welcher

G¹, G², G³ und n die oben angegebenen Bedeutungen haben und

X¹ für Halogen oder Hydroxy steht,

20

mit Ketoanilinen der Formel (XVII)



in welcher

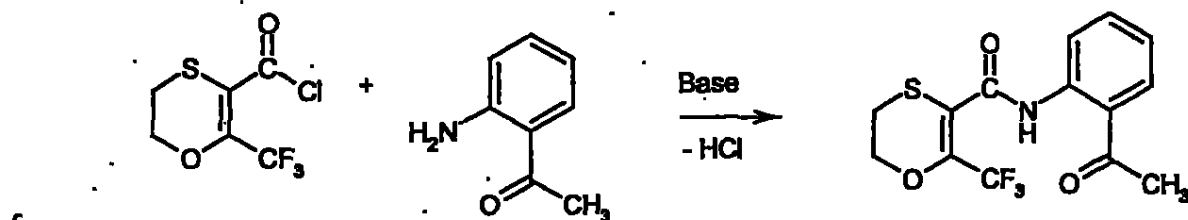
R¹, R², R³, R⁴, R⁵ und A⁹ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, umsetzt.

Verfahren (m)

Verwendet man 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-carbonsäurechlorid und 1-(2-Aminophenyl)ethanon als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (m) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (m) als Ausgangsstoffe benötigten Oxathiincarbonsäurederivate der Formel (II) sind bereits weiter oben im Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahrens a) beschrieben worden.

- 10 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (m) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Ketoaniline sind durch die Formel (XVII) allgemein definiert. In dieser Formel (XVII) haben R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und A^9 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formeln (I) bzw. (XI) als bevorzugt, besonders
- 15 bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Die Ketoaniline der Formel (XII) sind allgemein übliche Syntheschemikalien (vgl. z.B. J. Am. Chem. Soc. 1978, 100, 4842-4857 oder US 4,032,573). Im Fall, dass R^5 nicht für Wasserstoff steht, kann der Rest R^5 auf der Stufe der Verbindungen der Formel (XVII) durch

20 übliche Derivatisierungsmethoden eingeführt werden. Es ist auch möglich, zunächst Verbindungen der Formel (XI), in denen R^5 für Wasserstoff steht, herzustellen und die erhaltenen Produkte anschließend durch übliche Methoden zu derivatisieren [vgl. das erfindungsgemäße Verfahren (i)].

- 25 Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Phosphorverbindungen sind durch die Formel (XII) allgemein definiert.

A^{10} steht bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Chlor, Fluor, Brom und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_2 - C_{10} -Alkyl, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann.

30

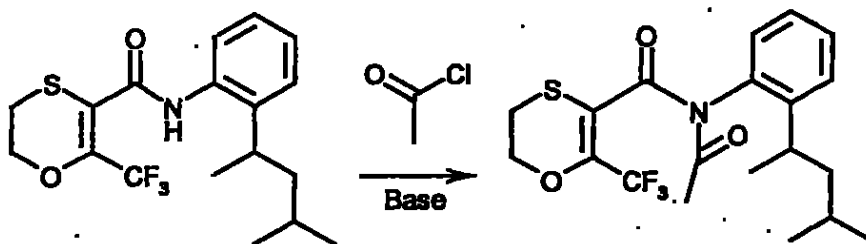
A¹⁰ steht besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Cyclopropyl, Difluorcyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und/oder Cyclohexyl substituiertes, jeweils geradkettiges oder verzweigtes, jeweils an beliebiger Stelle verknüpftes Ethyl, Propyl, Butyl, Pentyl, Hexyl, Heptyl oder Octyl.

Px. steht bevorzugt für eine Gruppierung $-P^+(C_6H_5)_3 Cl^-$, $-P^+(C_6H_5)_3 Br^-$, $-P^+(C_6H_5)_3 I^-$, $-P(=O)(OCH_3)_3$ oder $-P(=O)(OC_2H_5)_3$.

Die Phosphorverbindungen der Formel (XII) sind bekannt und/oder können nach bekannten Verfahren hergestellt werden (vgl. z.B. Justus Liebigs Ann. Chem. 1953, 580, 44-57 oder Pure Appl. Chem. 1964, 2, 307-335).

Verfahren (i)

Verwendet man *N*-[2-(1,3-Dimethylbutyl)phenyl]-2-(trifluormethyl)-5,6-dihydro-1,4-oxathioin-3-carboxamid und Acetylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (i) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (i) als Ausgangsstoffe benötigten Iodpyrazolylcarboxanilide sind durch die Formel (Ib) allgemein definiert. In dieser Formel (Ib) haben G¹, G², G³, n, R¹, R², R³, R⁴ und Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste bzw. diesen Index angegeben wurden.

Die Verbindungen der Formel (Ib) sind erfindungsgemäße Verbindungen und können nach den Verfahren (a) bis (h) hergestellt werden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (i) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Halogenide sind durch die Formel (XIII) allgemein definiert. In dieser Formel (XIII) steht R⁵⁻¹ bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits oben in Zusammenhang mit der Beschreibung der Verbindungen

gen der Formel (Ig) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden. X⁶ steht für Chlor, Brom oder Iod.

Halogenide der Formel (XIII) sind bekannt.

5

Reaktionsbedingungen

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (j), (k), (l) und (m) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chlороform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methyl-isobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

20 Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (j), (k), (l) und (m) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Lithiumdiisopropylamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (j), (k), (l) und (m) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Kondensationsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Amidierungsreaktionen verwendbaren Kondensationsmittel infrage. Beispielhaft genannt seien Säurehalogenidbildner wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid oder Thionylchlorid; Anhy-

35

dridbildner wie Chlorameisensäureethylester, Chlorameisensäuremethylester, Chlorameisensäureisopropylester, Chlorameisensäureisobutylester oder Methansulfonylchlorid; Carbodiimide, wie N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder andere übliche Kondensationsmittel, wie Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol, 2-Ethoxy-
5 N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EEDQ), Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff oder Brom-tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphat.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a), (j), (k), (l) und (m) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Beispielsweise genannt seien 4-Dimethyl-
10 aminopyridin, 1-Hydroxy-benzotriazol oder Dimethylformamid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (a), (j), (k), (l) und (m) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C; vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis
15 80°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Oxathiincarbonsäurederivates der Formel (II) im Allgemeinen 0,8 bis 15 Mol, vorzugsweise 0,8 bis 8 Mol an Anilin-Derivat der Formel (III)
20 ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (IV) setzt man pro Mol des Oxathiincarbonsäurederivates der Formel (II) im Allgemeinen 0,8 bis 15 Mol, vorzugsweise 0,8 bis 8 Mol an Halogenaniline der Formel
25 (XIV) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (VI) setzt man pro Mol des Oxathiincarbonsäurederivates der Formel (II) im Allgemeinen 0,8 bis 15 Mol, vorzugsweise 0,8 bis 8 Mol an Anilinboronsäurederivat der
30 Formel (XV) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (l) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (VIII) setzt man pro Mol des Oxathiincarbonsäurederivates der Formel (II) im Allgemeinen 0,8 bis 15 Mol, vorzugsweise 0,8 bis 8 Mol an Hydroxyalkylanilinderivat der
35 Formel (XVI) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (m) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (IX) setzt man pro Mol des Oxathiomcarbonsäurederivates der Formel (II) im Allgemeinen 0,8 bis 15 Mol, vorzugsweise 0,8 bis 8 Mol an Ketoanilin der Formel (XVII) ein.

5

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (b), (c) und (d) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonnitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

20

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (b), (c) und (d) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 180°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 150°C.

25

Die der erfindungsgemäßen Verfahren (b), (c) und (d) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, fluoride, phosphate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Lithiumdiisopropylamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumacetat, Natriumphosphat, Kaliumphosphat, Kaliumfluorid, Cäsiumfluorid, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Cäsiumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

35

Die der erfindungsgemäßen Verfahren (b), (c) und (d) werden in Gegenwart eines Katalysators, wie beispielsweise eines Palladiumsalzes oder -komplexes, durchgeführt. Hierzu kommen vorzugsweise Palladiumchlorid, Palladiumacetat, Tetrakis-(triphenylphosphin)-Palladium, Bis-(triphenylphosphin)-Palladiumdichlorid oder (1,1'-Bis(diphenylphosphino)-ferrocenpalladium(II)chlorid) infrage.

Es kann auch ein Palladiumkomplex in der Reaktionsmischung erzeugt werden, wenn man ein Palladiumsalz und ein Komplexligand, wie z.B. Triethylphosphan, Tri-tert-butylphosphan, Tri-cyclohexylphosphan, 2-(Dicyclohexylphosphan)-biphenyl, 2-(Di-tert-butylphosphan)-biphenyl, 2-(Dicyclohexylphosphan)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, Triphenylphosphan, Tris-(o-tolyl)-phosphan, Natrium 3-(Diphenylphosphino)benzolsulfonat, Tris-2-(Methoxyphenyl)-phosphan, 2,2'-Bis-(diphenylphosphan)-1,1'-binaphthyl, 1,4-Bis-(diphenylphosphan)-butan, 1,2-Bis-(diphenylphosphan)-ethan, 1,4-Bis-(dicyclohexylphosphan)-butan, 1,2-Bis-(dicyclohexylphosphan)-ethan, 2-(Dicyclohexylphosphan)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, Bis(diphenylphosphino)ferrocen oder Tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphit getrennt zur Reaktion zugibt.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Halogenoxathiincarboxamids der Formel (IV) im Allgemeinen 1 bis 15 Mol, vorzugsweise 2 bis 8 Mol an Boronsäurederivat der Formel (V) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Oxathiincarboxamid-Boronsäure-Derivate der Formel (VI) im Allgemeinen 0,8 bis 15 Mol, vorzugsweise 0,8 bis 8 Mol an Phenyl-Derivat der Formel (VII) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Halogenoxathiincarboxamides der Formel (IV) im Allgemeinen 0,8 bis 15 Mol, vorzugsweise 0,8 bis 8 Mol an Phenyl-Derivat der Formel (VII) und 0,8 bis 15 Mol, vorzugsweise 0,8 bis 8 Mol an 4,4,4',4',5,5',5'-Octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolan ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische oder alicyclische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan

oder 1,2-Diethoxyethan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

5

Das erfindungsgemäße (e) Verfahren wird in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Als solche kommen alle Katalysatoren infrage, die für Hydrierungen üblicherweise verwendet werden. Beispielfhaft seien genannt: Raney-Nickel, Palladium oder Platin, gegebenenfalls auf einem Trägermaterial, wie beispielsweise Aktivkohle.

10

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 100°C.

15

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ketone, wie Aceton, Butanon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonnitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

20

25

30

35

Das erfindungsgemäße Verfahren (f) wird gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure durchgeführt. Als solche kommen alle anorganischen und organischen Protonen- wie auch Lewis-säuren, sowie auch alle polymeren Säuren infrage. Hierzu gehören beispielsweise Chlorwasserstoff, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, Trifluoressigsäure, Methansulfonsäure, Trifluormethansulfonsäure, Toluolsulfonsäure, Bortrifluorid (auch als Etherat), Bortribromid, Aluminiumtrichlorid, Titan-tetrachlorid, Tetrabutylorthotitanat, Zink-

chlorid, Eisen-III-chlorid, Antimonpentachlorid, saure Ionenaustauscher, saure Tonerden und saures Kieselgel.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 100°C.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

Das erfindungsgemäße Verfahren (g) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethylbenzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Das erfindungsgemäße Verfahren (g) wird in Gegenwart eines oder mehrerer Katalysatoren durchgeführt.

Dazu eignen sich besonders Palladiumsalze oder -komplexe. Hierzu kommen vorzugsweise Palladiumchlorid, Palladiumacetat, Tetrakis-(triphenylphosphin)-Palladium oder Bis-(triphenylphosphin)-Palladiumdichlorid infrage. Es kann auch ein Palladiumkomplex in der Reaktionsmischung erzeugt werden, wenn man ein Palladiumsalz und ein Komplexligand getrennt zur Reaktion zugibt.

Als Liganden kommen vorzugsweise Organophosphorverbindungen infrage. Beispielfhaft seien genannt: Triphenylphosphin, tri-o-Tolylphosphin, 2,2'-Bis(diphenylphosphino)-1,1'-

binaphthyl, Dicyclohexylphosphinebiphenyl, 1,4-Bis(diphenylphosphino)butan, Bisdiphenylphosphinoferrrocen, Di(tert.-butylphosphino)biphenyl, Di(cyclohexylphosphino)biphenyl, 2-Dicyclohexylphosphino-2'-N,N-dimethylaminobiphenyl, tricyclohexylphosphine, tri-tert.-butylphosphine. Es kann aber auch auf Liganden verzichtet werden.

5

Das erfindungsgemäße Verfahren (g) wird ferner gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Metallsalzes, wie Kupfersalzen, beispielsweise Kupfer-(I)-iodid durchgeführt.

10

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 50°C bis 150°C.

15

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro mol des Halogenoxathiincarboxamides der Formel (IV) im Allgemeinen 1 bis 5 mol, vorzugsweise 1 bis 2 mol an Alkin der Formel (IX) oder Alken der Formel (X) ein.

20

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie z.B. Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder i-Propanol, n-, i-, sek- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether.

30

35

Das erfindungsgemäße Verfahren (h) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen starken Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate oder Alkalimetall-Kohlenwasserstoffverbindungen, wie beispielsweise

Natriumhydrid, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Natriumamid, Litiumdiisopropylamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Methylitium, Phenyllitium oder Butyllitium.

5 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von -80°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von -30°C bis 80°C.

10 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro mol des Ketons der Formel (XI) im Allgemeinen 1 bis 5 mol, vorzugsweise 1 bis 2 mol an Phosphorverbindung der Formel (XII) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (i) kommen
15 alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-tert-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan,
20 Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol oder Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

Das erfindungsgemäße Verfahren (i) wird in Gegenwart einer Base durchgeführt. Als solche
25 kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie beispielsweise Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat,
30 Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Caesiumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylamin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

35

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (i) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 110°C.

- 5 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (i) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Oxathiincarboxamids der Formel (Ib) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Halogenid der Formel (XIII) ein.
- Alle erfindungsgemäßen Verfahren werden im Allgemeinen unter Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck – im
10. Allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar – zu arbeiten.

Die erfindungsgemäßen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Fungi und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

- 15 Fungizide lassen sich Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes und Deuteromycetes einsetzen.

- 20 Bakterizide lassen sich im Pflanzenschutz zur Bekämpfung von Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae und Streptomycetaceae einsetzen.

Beispielhaft aber nicht begrenzend seien einige Erreger von pilzlichen und bakteriellen Erkrankungen, die unter die oben aufgezählten Oberbegriffe fallen, genannt:

- 25 Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;
Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;
Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;
Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;
30 Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder *Pseudoperonospora cubensis*;
Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;
Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;
Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;
35 Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;
Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;

- Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;
 Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis;
 Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea
 (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);
 5 Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliobolus sativus
 (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);
 Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;
 Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;
 Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise Sclerotinia sclerotiorum;
 10 Tilletia-Arten, wie beispielsweise Tilletia caries;
 Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;
 Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;
 Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;
 Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;
 15 Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;
 Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum;
 Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;
 Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;
 Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;
 20 Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise Pseudocercospora herpotrichoides.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe weisen auch eine starke stärkende Wirkung in Pflanzen
 auf. Sie eignen sich daher zur Mobilisierung pflanzeneigener Abwehrkräfte gegen Befall
 durch unerwünschte Mikroorganismen.

- 25 Unter pflanzenstärkenden (resistenzinduzierenden) Stoffen sind im vorliegenden Zu-
 sammenhang solche Substanzen zu verstehen, die in der Lage sind, das Abwehrsystem von
 Pflanzen so zu stimulieren, dass die behandelten Pflanzen bei nachfolgender Inokulation mit
 unerwünschten Mikroorganismen weitgehende Resistenz gegen diese Mikroorganismen
 30 entfalten.

- Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze,
 Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt
 werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den
 35 Befall durch die genannten Schaderreger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen
 Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im Allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1

bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

Die gute Pflanzenverträglichkeit der Wirkstoffe in den zur Bekämpfung von Pflanzenkrankheiten notwendigen Konzentrationen erlaubt eine Behandlung von oberirdischen Pflanzenteilen, von Pflanz- und Saatgut, und des Bodens.

Dabei lassen sich die erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit besonders gutem Erfolg zur Bekämpfung von Getreidekrankheiten, wie beispielsweise gegen Puccinia-Arten und von Krankheiten im Wein-, Obst- und Gemüseanbau, wie beispielsweise gegen Botrytis-, Venturia- oder Alternaria-Arten, einsetzen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Erntertrages. Sie sind außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen und Aufwandmengen auch als Herbizide, zur Beeinflussung des Pflanzenwachstums, sowie zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- und Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaeren oder nicht schützbaeren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum

nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

- 5 Im Materialschutz lassen sich die erfindungsgemäßen Stoffe zum Schutz von technischen Materialien gegen Befall und Zerstörung durch unerwünschte Mikroorganismen einsetzen.

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nichtlebende Materialien zu verstehen, die für die Verwendung in der Technik zubereitet worden sind. Beispielsweise
 10 können technische Materialien, die durch erfindungsgemäße Wirkstoffe vor mikrobieller Veränderung oder Zerstörung geschützt werden sollen, Klebstoffe, Leime, Papier und Karton, Textilien, Leder, Holz, Anstrichmittel und Kunststoffartikel, Kühlschmierstoffe und andere Materialien sein, die von Mikroorganismen befallen oder zersetzt werden können. Im Rahmen der zu schützenden Materialien seien auch Teile von Produktionsanlagen, beispielsweise Kühlwasserkreisläufe, genannt, die durch Vermehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden
 15 können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

- 20 Als Mikroorganismen, die einen Abbau oder eine Veränderung der technischen Materialien bewirken können, seien beispielsweise Bakterien, Pilze, Hefen, Algen und Schleimorganismen genannt. Vorzugsweise wirken die erfindungsgemäßen Wirkstoffe gegen Pilze, insbesondere Schimmelpilze, holzverfärbende und holzzerstörende Pilze (Basidiomyceten) sowie gegen Schleimorganismen und Algen.

25 Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

- Alternaria, wie *Alternaria tenuis*,
 Aspergillus, wie *Aspergillus niger*,
 Chaetomium, wie *Chaetomium globosum*,
 30 Coniophora, wie *Coniophora puetana*,
 Lentinus, wie *Lentinus tigrinus*,
 Penicillium, wie *Penicillium glaucum*,
 Polyporus, wie *Polyporus versicolor*,
 Aureobasidium, wie *Aureobasidium pullulans*,
 35 Sclerophoma, wie *Sclerophoma pityophila*,
 Trichoderma, wie *Trichoderma viride*,

Escherichia, wie Escherichia coli,
 Pseudomonas, wie Pseudomonas aeruginosa,
 Staphylococcus, wie Staphylococcus aureus.

5 Die Wirkstoffe können in Abhängigkeit von ihren jeweiligen physikalischen und/ oder chemischen Eigenschaften in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Pulver, Schäume, Pasten, Granulate, Aerosole, Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen und in Hüllmassen für Saatgut, sowie ULV-Kalt- und Warmnebel-Formulierungen.

10

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum erzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im Wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkyl-naphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen infrage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen infrage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Bims, Marmor, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängel. Als Emulgier und/oder schaum erzeugende Mittel kommen infrage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylaryl-polyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

15
20
25
30
35

Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulverige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummi-arabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kephaleine und Lecithine, und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyaninfarbstoffe und Spurennährstoffe, wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

Die Formulierungen enthalten im Allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gewichtsprozent Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche oder in ihren Formulierungen auch in Mischung mit bekannten Fungiziden, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden oder Insektiziden verwendet werden, um so z.B. das Wirkungsspektrum zu verbreitern oder Resistenzentwicklungen vorzubeugen. In vielen Fällen erhält man dabei synergistische Effekte, d.h. die Wirksamkeit der Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen infrage:

Fungizide:

2-Phenylphenol; 8-Hydroxychinolinsulfat; Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprüm; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin; Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamin; Calcium polysulfide; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazole; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenoconazole; Diflunetorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Dipiconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon; Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimide; Fludioxonil; Flumetover;

Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Furnecyclox; Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesil; 5 Iodocarb; Iaconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovalledione; Kasugamycin; Kresoxim-methyl; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovar; Mildiomycin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl; Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthim; Paclobutrazol; Pefurazate; Penconazole; 10 Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxina; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propanosine-sodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenoxy; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxifen; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-methyl; Tolyfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorphenyl)-2-propinyl]-oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamid; 1-(1-Naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion; 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin; 2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolcarboxamid; 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridin-carboxamide; 3,4,5-Trichlor-2,6-pyridindicarbonitril; Actinovate; cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol; Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat; Monokaliumcarbonat; N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid; N-Butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amin; Natriumtetrathiocarbonat; sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; Kupferhydroxid; Kupfernaphtenat; Kupferoxychlorid; Kupfersulfat; Cufraneb; Kupferoxid; Mancopper; Oxine-copper.

30 Bakterizide:

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Ocithilidon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

35 Insektizide / Akarizide / Nematizide:

Abamectin, ABG-9008; Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-

1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin, Allethrin 1R-isomers, Alpha-Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflumet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-methyl, Azinphos-ethyl, Azocyclotin, *Bacillus popilliae*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* strain EG-2348, *Bacillus thuringiensis* strain GC-91, *Bacillus thuringiensis* strain NCTC-11821, Baculoviren, *Beauveria bassiana*, *Beauveria tenella*, Bendiocarb, Benfluracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bioallethrin, Bioallethrin-S-cyclopentyl-isomer, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Biorecanmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophos-ethyl, Bromopropylate, Bromfeninfos (-methyl), BTG-504, BTG-505, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocboxim, Butoxycarboxim, Butylpyridaben, Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbofuran, Carbo-phenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-methyl, Chlorpyrifos (-ethyl), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clo-cythrins, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin, Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, *Cydia pomonella*, Cyfluthrin, Cyhalo-thrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (1R-trans-isomer), Cyromazine, DDT, Delta-methrin, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methylsulphon, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Diflubenzuron, Dimethoate, Di-methylvinphos, Dinobuton, Dinocap, Dinotefuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodium, Dofenapyn, DOWCO-439, Eflusilanate, Enamectin, Enamectin-benzoate, Empenthrin (1R-isomer), Endosulfan, *Entomophthora* spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etiofenprox, Etoxazole, Etrimfos, Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenfluthrin, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb, Fenoxacrin, Fenoxycarb, Fen-propathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fen-valerate, Fipronil, Flonicamid, Flusacrypyrim, Fluazuron, Flubenzimine, Flubrocycythrinate, Flu-cyclohexuron, Flucythrinate, Flufenacrin, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Flupyrzofos, Flutenzin (Flufenzine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fos-thiazate, Fubfenprox (Fluproxyfen), Furathiocarb, Gamma-HCH, Gossypure, Grandlure, Granuloseviren, Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydramethylnone, Hydroprene, IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxa-carb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isafenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin, Japonilure, Kadethrin, Kempolyederviren, Kinoprene, Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron, Malathion, Mecarbam, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodium, Methacrifos, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methio-

carb, Methomyl, Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700, Monocrotophos, Moxidectin, MTH-800, Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine, Nitenpyram, Nithiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Noviflumuron, OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxydemeton-methyl, Paccilomyces fumosoroseus, Parathion-methyl, Parathion (-ethyl), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-6045, Phenothrin (1R-trans isomer), Phenothoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butoxide, Pirimicarb, Pirimiphos-methyl, Pirimiphos-ethyl, Prallethrin, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propargite, Propetamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbutate, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen, Quinalphos, Resmethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Spiromesifen, Sulfuramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121, Tau-Flurvalinate, Tebufenozone, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temiviphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatrithos, Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodium, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralocythrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlorphenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, Xyllycarb, ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901, die Verbindung 3-Methyl-phenyl-propyl-carbammat (Tsumacide Z), die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluorethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3-endo-Isomere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO-96/37494, WO-98/25923), sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren enthalten.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren, Safener bzw. Semiochemicals ist möglich.

Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus,

Trichophyton-Spezies wie *Trichophyton mentagrophytes*, Microsporon-Spezies wie *Microsporon canis* und *audouinii*. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

- 5 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, lösliche Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreichen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-
10 Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

- Beim Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe als Fungizide können die Aufwandmengen je nach Applikationsart innerhalb eines größeren Bereiches variiert werden. Bei der Behand-
15 lung von Pflanzenteilen liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im Allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 10 und 1.000 g/ha. Bei der Saatgutbehandlung liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im Allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im Allgemeinen zwischen
20 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

- Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren
25 bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetically Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff „Teile“ bzw. „Teile von Pflanzen“ oder „Pflanzenteile“ wurde oben erläutert.

- 30 Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit neuen Eigenschaften („Traits“), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken gezüchtet worden sind. Dies
35 können Sorten, Rassen, Bio- und Genotypen sein.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive („synergistische“) Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine
5 Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit
10 und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere
15 vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits“) verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere
20 Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der
25 Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders
30 hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden „Bt Pflanzen“). Als
35 Eigenschaften („Traits“) werden auch besonders hervorgehoben, die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR),

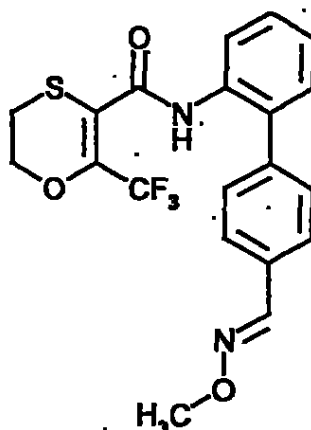
Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits“) werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, z.B. Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. „PAT“-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits“) verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für „Bt Pflanzen“ seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits“).

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

Herstellungsbeispiele

Beispiel 1

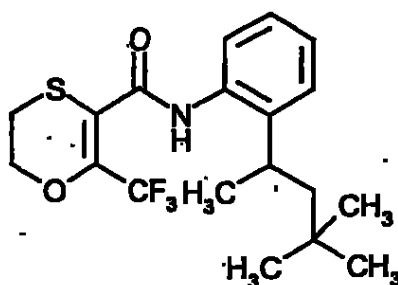


Verfahren a)

5 Eine Mischung aus 6 ml Dichlormethan, 100 mg (0,467 mmol) 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiazin-5-carbonsäure, 88 mg (0,389 mmol) 2'-Amino-biphenyl-4-carbaldehyd O-methyl-oxim, 100,6 mg (0,778 mmol) N,N-Diisopropylethylamin und 272 mg (0,584 mmol) Brom-tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphat wird 2 Tage bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird das Reaktionsgemisch mit 10 ml Wasser versetzt, die
10 organische Phase abgetrennt und zuerst mit 10 ml gesättigter Ammoniumchloridlösung, danach mit 10 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingedampft. Das Rohprodukt wird mittels präparativer HPLC (reversed phase Kieselgel (C₁₈), Laufmittel: Wasser/Acetonitril 34:66) gereinigt.

15 Man erhält: 35 mg (21 % der Theorie) 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiazin-5-carbonsäure [4'-(methoxyimino-methyl)-biphenyl-2-yl]-amid mit dem logP (pH 2.3) = 3.51.

Beispiel 2



20 Verfahren a)

300 mg (1.7 mmol) 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiazin-5-carbonsäurechlorid und 220 mg (1.1 mmol) 2-(1,3,3-Trimethyl-butyl)-phenylamin werden in 5 ml Acetonitril 4 Tage bei Raumtemperatur im abgeschlossenen Gefäß gerührt. Anschließend wird das Reaktions-

gemisch mit 10 ml Wasser versetzt, die organische Phase abgetrennt und zuerst mit 10 ml gesättigter Ammoniumchloridlösung, danach mit 10 ml Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und eingedampft. Das Rohprodukt wird mittels präparativer HPLC (reversed phase Kieselgel (C₁₈), Laufmittel: 2%ige Essigsäure/Acetonitril 25:75) gereinigt.

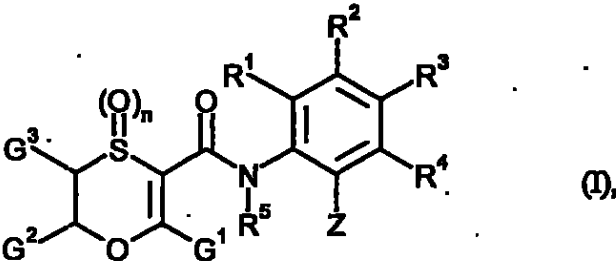
5

Man erhält: 200 mg (37 % der Theorie) 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-carbonsäure [2-(1,3,3-trimethyl-butyl)-phenyl]-amid mit dem logP (pH 2.3) = 4.18.

10

Analog Beispiel 1 und 2, sowie entsprechend den Angaben in der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellverfahren (a) bis (h) wurden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 genannten Verbindungen der Formel (I) erhalten:

Tabelle 1



Nr.	Z	R ⁴	R ³	R ²	R ¹	R ⁵	n	G ²	G ³	G ¹	logP Fp.
3	1,3-Dimethyl-butyl	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	4,24
4	1,3,3-Trimethyl-butyl	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	4,53
5	4-Fluor-3-methylphenyl	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	3,98
6	3,4-Dichlorophenyl	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	4,26
7	4-Chlor-3-trifluormethylphenyl	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	4,30
8	4-Isopropoximinomethylphenyl	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	4,57
9	4-Trifluormethylphenyl	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	4,06
10	Cycloheptyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	137°C
11	Cyclopentyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	159°C
12	-CH(CH ₃)-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	165°C
13	Cyclohexyl	H	F	H	H	H	0	H	H	CF ₃	204- 205°C
14	Cyclohexyl	H	Cl	H	H	H	0	H	H	CF ₃	169- 171°C

Nr.	Z	R ⁴	R ³	R ²	R ¹	R ⁵	n	G ²	G ³	G ¹	logP Fp.
15	Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	149°C
16	Cyclooctyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	102°C
17	3,4-Dichlorophenyl	H	F	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,95
18	1,3-Dimethyl-butyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,92
19	3,4-Dichlorophenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,91
20	4-Trifluoromethylphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,73
21	4-Isopropoximinomethyl-phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,22
22	4-Propoxyiminomethyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,25
23	4-Chlor-3-fluorphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,62
24	3-Chlor-4-fluorphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,60
25	3-Fluor-4-propoxyimino-methyl-phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,42
26	4-Chlor-2-methylphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,00
27	4-Bromphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,70
28	Cyclohexyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,69
29	3-Fluor-4-trifluoromethyl-phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,75 114- 116°C
30	4-Chlor-3-trifluoromethyl-phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,03
31	(2-Cyclohexyl)-1-methyl-ethyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,71
32	3,5-Difluorphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,35 167°C
33	4-Iodphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,85
34	1-Methyl-3-butenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,33
35	4-Fluor-3-methylphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,65
36	3-Fluor-4-methylphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,62
37	(2-Cyclopentyl)-1-methyl-ethyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,38
38	3-Chlor-4-methylphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,89
39	1-Methyl-butyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,63
40	4-(1-(3-Propinyloxy-imino)-ethyl)-phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,76 125- 127°C

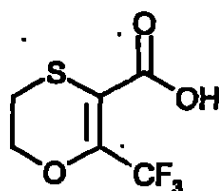
Nr.	Z	R ⁴	R ³	R ²	R ¹	R ⁵	n	G ²	G ³	G ¹	logP Fp.
41	4-(1-Amino-1-methoxy- imino-methyl)-phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	1,96
42	1-Methyl-nonyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	5,48
43	4-Brom-2-fluorphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,57
44	3-Chlor-5-fluor-phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,60
45	3-Chlor-4-(1-methoxy- imino-ethyl)-phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,45
46	3-Fluor-4-(1-methoxy- imino-ethyl)-phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,69
47	Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,32
48	1-Methyl-hexyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,34
49	1-Cyclohexylethyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,31
50	1,3-Dimethyl-butyl	H	F	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,94
51	1-Ethyl-propyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,62
52	1-Methyl-butyl	H	F	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,67
53	3-Chlor-4-trifluormethyl- phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,98 100- 102°C
54	1,3-Dimethyl-pentyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,25
55	2-(2,2-Dichlorcyclo- propyl)-1-methyl-ethyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,92
56	4-(1-Methoxyimino- propyl)-phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,08
57	4-Brom-3-fluor-phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,69
58	1,3,3-Trimethyl-pentyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,48
59	Bicyclo[2.2.1]hept-2-yl	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	5,36
60	-CH(CH ₃)-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,18
61	4-Trifluormethylphenyl	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,08
62	4-Methoxyiminomethyl- phenyl	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	3,81
63	1,3-Dimethyl-butyl	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,27
64	4-Isopropoximinomethyl- phenyl	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,56
65	3,4-Dichlorphenyl	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,27
66	1,3,3-Trimethyl-butyl	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,51
67	3,4-Dichlorphenyl	H	F	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,32

Nr.	Z	R ⁴	R ³	R ²	R ¹	R ⁵	n	G ²	G ³	G ¹	logP Fp.
68	3-Fluor-4-propoxyimino- methyl-phenyl	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,77
69	3-Fluor-4-methylphenyl	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	3,99
70	4-Fluor-3-methylphenyl	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	3,99
71	3-Fluor-4-trifluormethyl- phenyl	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,08
72	2-Chlor-4-methoxyimino- phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,81
73	3,5-Difluorphenyl	H	F	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,49
74	3,5-Difluorphenyl	H	H	H	F	H	0	H	H	CF ₃	3,20
75	3,5-Difluorphenyl	H	H	F	H	H	0	H	H	CF ₃	3,70
76	n-Hexyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,25
77	1-Ethyl-butyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,07
78	4-Cyanophenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	2,87
79	2,4-Dichlorphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,82
80	3,4-Dichlorphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	Cyclo- propyl	3,53
81	1,3,3-Trimethyl-butyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CHF ₂	4,29
82	1,3-Dimethyl-butyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CHF ₂	4,03
83	-CH(CH ₃)-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -	H	H	H	H	H	0	H	H	CHF ₂	4,00
84	3,4-Dichlorphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CHF ₂	3,92
85	3-Fluor-4-propoxyimino- methyl-phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CHF ₂	4,52
86	4-Methoxyiminomethyl- phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CHF ₂	
87	3-Methyl-1-propyl-butyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,65
88	3-Methyl-1-ethyl-butyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,30
89	1,3-Dimethyl-1-butenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,32
90	1,3-Dimethyl-butyl	H	H	H	H	H	2	H	H	CF ₃	3,53
91	4-Bromphenyl	H	H	H	H	H	2	H	H	CF ₃	3,35
92	4-Chlor-2-methylphenyl	H	H	H	H	H	2	H	H	CF ₃	3,66
93	3,4-Dichlorphenyl	H	H	H	H	H	2	H	H	CF ₃	3,57
94	1,2-Dimethyl-butyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,88
95	4-Chlor-3-fluorphenyl	H	H	H	H	H	2	H	H	CF ₃	3,28
96	(2-Cyclopropyl)- 1-methyl-ethyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,72

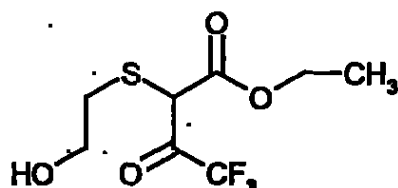
Nr.	Z	R ⁴	R ³	R ²	R ¹	R ⁵	n	G ²	G ³	G ¹	logP Fp.
97	3,3-Dimethyl-1-butinyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,42
98	4-Brom-3-methylphenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,06
99	1,3-Dimethyl-butyl	H	H	H	H	-COCH ₃	0	H	H	CF ₃	4,56
100	4-(2,2,2-Trifluor-N-methoxyethanimidoyl)phenyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	2,53
101	2,2-Dichlor-1-methyl-cyclopropyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,66
102	3-Methylbutyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,72
103	3,3-Dimethylbutyl	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,98

Herstellung der Vorstufen der Formel (II)

5 Beispiel (II-1)

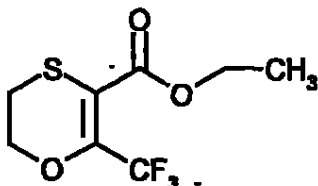


Erste Stufe (II-1a):



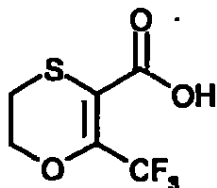
10 Zu einer Lösung von 20,0 g (0,092 mol) Ethyl-2-chlor-3-keto-4,4,4-trifluorbutyrat in 100 ml Toluol tropft man bei ca. 5°C 10,17 g (0,09 Mol) Triethylamin. Danach wird innerhalb von 1 Stunde eine Lösung von 7,0 g (0,09 Mol) 2-Mercaptoethanol in 5 ml Toluol zugetropft und 2 Stunden bei ca. 5°C nachgerührt. Die Suspension wird abfiltriert und mit wenig Toluol nachgewaschen. Das Filtrat wird zuerst mit 50 ml 1N Salzsäure, dann zweimal mit 50 ml gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung, zuletzt mit 50 ml Wasser gewaschen, 15 über Magnesiumsulfat getrocknet und eingedampft.

Man erhält: 18,8 g (62 % der Theorie) 4,4,4-Trifluor-2-(2-hydroxy-ethylsulfanyl)-3-oxobuttersäureethylester (vgl. Heterocycles, 1998, 48, 2253-2262).

Zweite Stufe (II-1b):

Zu einer Lösung von 18,7 g (0,071 mol) 4,4,4-Trifluor-2-(2-hydroxy-ethylsulfanyl)-3-oxobuttersäureethylester (II-1a) in 60 ml Toluol gibt man zuerst 6,25 g (0,079 Mol) Pyridin und tropft danach innerhalb von 30 Minuten bei 20°C 4 g (0,079 Mol) Thionylchlorid zu. Aufgrund der exothermen Reaktion muss die Temperatur der Reaktionsmischung mit Eiswasser gekühlt werden. Nach Ende der heftigen Reaktion wird noch 5 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Die Mischung wird filtriert und der Rückstand mit 10 ml Toluol gewaschen. Zum Filtrat wird bei ca. 10°C innerhalb von 1 Stunde 10,9 g (0,108 Mol) Triethylamin getropft und für 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Das Reaktionsgemisch wird zuerst zweimal mit 50 ml 1N Salzsäure, dann zweimal mit 50 ml gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung, zuletzt mit 50 ml Wasser gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und eingedampft. Der Rückstand wird mit Petrolether/Essigester (10:1 bis 1:1) an Kieselgel chromatografiert.

Man erhält 12,6 g (59,4 % der Theorie) 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathien-5-carbonsäureethylester (vgl. Heterocycles 1998, 48, 2253-2262).

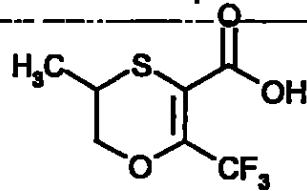
Dritte Stufe:

12,6 g (0,05 mol) 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathien-5-carbonsäureethylester (II-1b) und 3,14 g (0,08 mol) Natriumhydroxid werden in 50 ml Wasser 1 Stunde unter Rückfluss gekocht. Das Reaktionsgemisch wird abgekühlt und zweimal mit Dichlormethan extrahiert. Die wässrige Phase wird mit 6 N Salzsäure auf pH 2 angesäuert, dann 5 mal mit Diethylether extrahiert. Die vereinigten organischen Extrakte werden über Natriumsulfat getrocknet und eingedampft.

Man erhält 9,2 g (82 % der Theorie) 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathien-5-carbonsäure.

Analog Beispiel (II-1) wurden auch die in nachstehend genannten Verbindungen der Formel (II) erhalten:

Beispiel (II-2)

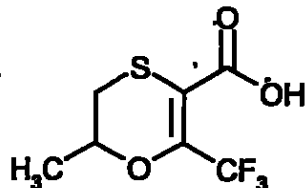


5

HPLC: $\log P = 1,69$

Diese Verbindung ist neu und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Beispiel (II-3)

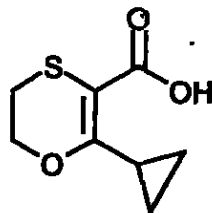


10

HPLC: $\log P = 1,72$

Diese Verbindung ist neu und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

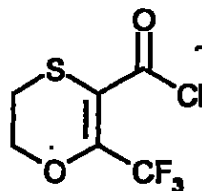
Beispiel (II-4)



15

Diese Verbindung ist neu und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Beispiel (II-5)



20

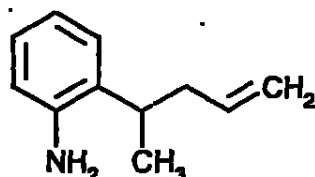
4.5 g (21 mmol) 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathien-5-carbonsäure (II-1) und 21 g Thionylchlorid werden in 10 ml Toluol 4 Stunden bei 80°C geführt. Das Ende der Reaktion wird festgestellt, indem aus der Reaktionslösung regelmäßig Proben entnommen und mit Methanol versetzt werden, wovon dann Dünnschichtchromatogramme angefertigt werden.

Nach Ende der Reaktion werden flüchtige Bestandteile abdestilliert. Der Rückstand wird dreimal mit jeweils 20 ml Dichlormethan verrührt und wieder eingedampft.

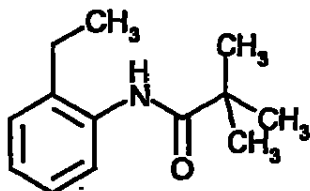
Man erhält 4,5 g (80 % der Theorie) 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-carbonsäurechlorid. Das Produkt wurde charakterisiert, indem eine Probe davon 2 Stunden mit Methanol gekocht wurde und der so erhaltene 6-Trifluormethyl-2,3-dihydro-1,4-oxathiin-5-carbonsäuremethylester mittels GC/MS nachgewiesen wurde.

Herstellung der Vorstufen der Formel (III)

Beispiel (III-1)



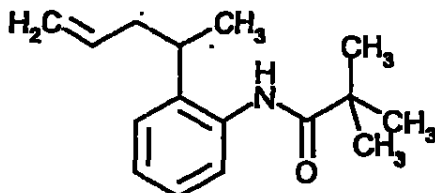
Erste Stufe (III-1a)



Zu einer Lösung von 15 g (124 mmol) 2-Ethylanilin, 25 g (248 mmol) Triethylamin in 150 ml Dichlormethan tropft man bei 0° C das 15 g (124 mmol) Pivalinsäurechlorid und rührt 2 Stunden bei 0°C und anschließend ohne weitere Kühlung für 16 Stunden. Das Gemisch wird mit Dichlormethan verdünnt, zuerst mit Wasser dann mit Ammoniumchlorid-Lösung gewaschen, die organische Phase abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und eingengt.

Man erhält 25 g (98 % der Theorie) *N*-(2-Ethyl-phenyl)-2,2-dimethyl-propionamid.

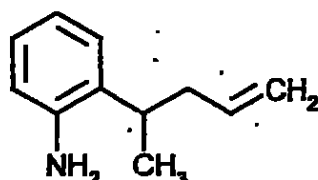
Zweite Stufe (III-1b)



Zu einer Lösung aus 5,6 g (0,0275 Mol) *N*-(2-Ethyl-phenyl)-2,2-dimethyl-propionamid (III-1a) in 150 ml *n*-Pentan/Methyl-*t*-butylether (1:1) gibt man unter Argon bei -25 °C zuerst 3,7 g (0,03 Mol) Diazabicyclo[2.2.2]octan (DABCO) dann 44,5 ml (0,058 mol) *sec*-Butyllithium-Lösung (1,3 molar in Hexan) und rührt weitere 2 Stunden bei der gleichen
5 Temperatur. Nun wird das Gemisch auf -78 °C gekühlt, 3,33 g (0,0275 Mol) Allylbromid zuge tropft und 60 Minuten bei -60 bis -78 °C gerührt. Reste von *sec*-Butyllithium werden durch Zugabe von 30 ml Methanol zersetzt. Das Gemisch wird auf Raumtemperatur erwärmt, mit 50 ml 5%iger Phosphorsäure geschüttelt. Die organische Phase wird abgetrennt, über Kieselgel filtriert und mittels präparativer HPLC (reversed phase Kieselgel
10 (C₁₈), Laufmittel: Wasser/Acetonitril 38:62) gereinigt.

Man erhält 1,8 g (26 % der Theorie) 2,2-Dimethyl-*N*-[2-(1-methyl-but-3-enyl)-phenyl]-propionamid.

15 Dritte Stufe (III-1)

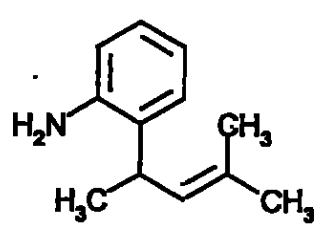


1,5g (6,1 mmol) 2,2-Dimethyl-*N*-[2-(1-methyl-but-3-enyl)-phenyl]-propionamid (III-1b) und 1,2 g (12,2 mmol) konzentrierter Salzsäure werden in 24,5 ml Dioxan 12 Stunden bei 80 °C gerührt. Das Reaktionsgemisch wird mit 10 ml Wasser versetzt und mit verdünnter
20 Natronlauge alkalisch gestellt und 5 mal mit Essigsäureethylester extrahiert. Die vereinigten, organischen Extrakte werden über Natriumsulfat getrocknet und eingedampft, über Kieselgel filtriert (Essigester/Methanol 5:1) und mittels präparativer HPLC (reversed phase Kieselgel (C₁₈), Laufmittel: 2%ige Essigsäure/Acetonitril 70:30) gereinigt.

25 Man erhält 0,3 g (30 % der Theorie) 2-(1-Methyl-but-3-enyl)-phenylamin.

Analog Beispiel (III-1) wurden auch die in nachstehend genannten Verbindungen der Formel (III) erhalten:

Beispiel (III-2)

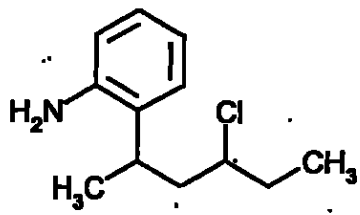


HPLC: logP = 1,19

Diese Verbindung ist neu und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

5

Beispiel (III-3)



HPLC: logP = 2,3

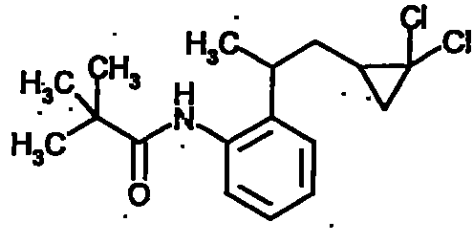
10

2-(3-Chlor-1-methylpentyl)phenylamin (III-3) wird erhalten, indem man zunächst *N*-[2-(2-Cyclopropyl-isopropyl)phenyl]-2,2-dimethylpropanamid analog den Beispielen (III-1a) und (III-1b) herstellt. In der dritten Stufe wird mit Salzsäure umgesetzt, wobei neben 2-(2-Cyclopropyl-isopropyl)phenylamin auch die Verbindung (III-3) erhalten wird.

15

Beispiel (III-4)

Erste Stufe (III-4a)



20

Zu einer Lösung von 2,2-Dimethyl-N-[2-(1-methyl-but-3-enyl)-phenyl]-propionamid (III-1b) 900 mg (3,7 mmol) in 5 ml Chloroform/Wasser (1:1) gibt man nacheinander bei Raumtemperatur 100 mg Benzyltriethylammoniumchlorid und 1 ml 50%ige Natronlauge und rührt 5 Tage. Das Reaktionsgemisch wird mit 20 ml Chloroform weiter verdünnt, mit 50 ml Natriumchlorid-Lösung gewaschen, die organische Phase abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und eingedunstet.

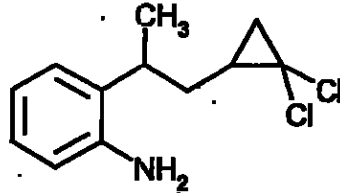
25

Man erhält 800 mg (37 % der Theorie) *N*-{2-[2-(2,2-Dichlorcyclopropyl)-1-methylethyl]-phenyl}-2,2-dimethyl-propionamid mit dem logP (pH 2,3) = 3,77.

Diese Verbindung ist neu und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

5

Zweite Stufe (III-4b)



800 mg (1,34 mmol) *N*-{2-[2-(2,2-Dichlorcyclopropyl)-1-methylethyl]-phenyl}-2,2-dimethyl-propionamid (III-4a) werden in 25 ml Dioxan gelöst und mit 0,1 ml konzentrierter Salzsäure versetzt, 72 Stunden bei Raumtemperatur und 24 Stunden bei 80°C geführt. Das Gemisch wird mit Eiswasser verdünnt, mit konzentrierter Natronlauge alkalisch gestellt und mit 50 ml Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wird über Natriumsulfat getrocknet und bei vermindertem Druck eingengt. Der Rückstand wird über Kieselgel mit Methanol filtriert und mittels präparativer HPLC (reversed phase Kieselgel (C₁₈), Laufmittel: 2%ige Phosphorsäure/Acetonitril 52:48) gereinigt.

15

Man erhält 0,8 g (60 % der Theorie) 2-[2-(2,2-Dichlorcyclopropyl)-1-methylethyl]-phenylamin mit dem logP (pH 2,3) = 2,52.

20 Diese Verbindung ist neu und ebenfalls Gegenstand der vorliegenden Anmeldung.

Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

25 Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich (pH 2,3): 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.

Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren LogP-Werte bekannt sind (Bestimmung der LogP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

30 Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

Anwendungsbeispiele**Beispiel A****5 Venturia - Test (Apfel) / protektiv**

Lösungsmittel : 24,5 Gewichtsteile Aceton

 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid

Emulgator : 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykolether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers *Venturia inaequalis* inokuliert und verbleiben dann 1 Tag bei ca. 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

20

Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.

25

10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0% ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

30

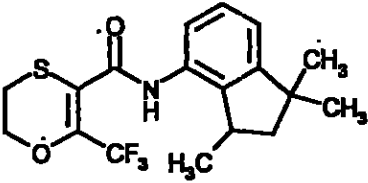
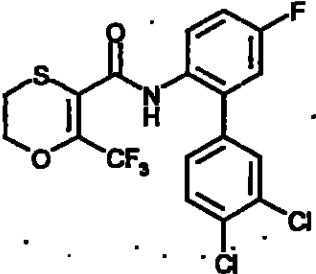
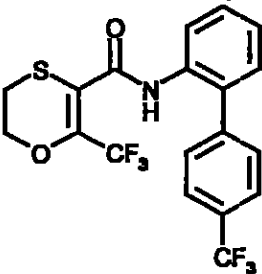
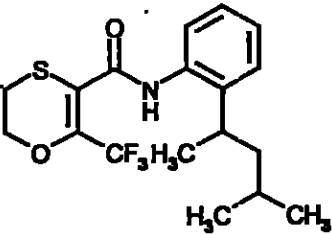
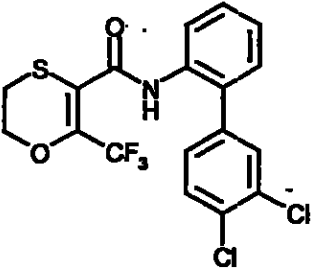
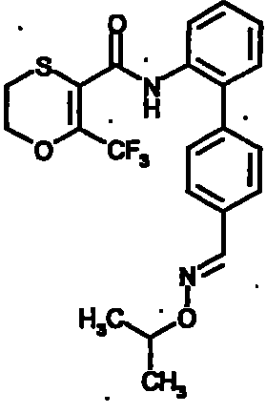
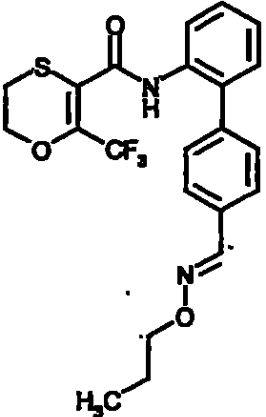
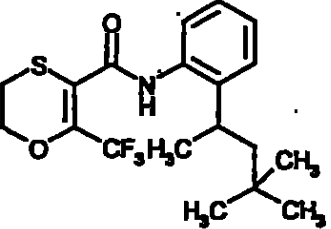
Tabelle A: Venturia - Test (Apfel) / protektiv			
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad
12		100	100
17		100	100
20		100	88
18		100	100
19		100	100

Tabelle A:			
Venturia - Test (Apfel) / protektiv			
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad
21		100	100
22		100	100
2		100	98

Beispiel B**Botrytis - Test (Bohne) / protektiv**

- 5 Lösungsmittel : 24,5 Gewichtsteile Aceton
 24,5 Gewichtsteile Dimethylacetamid
Emulgator : 1 Gewichtsteil Alkyl-Aryl-Polyglykoether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil
Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das
Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzuberei-
tung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages
werden auf jedes Blatt 2 kleine mit Botrytis cinerea bewachsene Agarstückchen aufgelegt.
Die inokulierten Pflanzen werden in einer abgedunkelten Kammer bei ca. 20°C und 100 %
relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt.

20 2 Tage nach der Inokulation wird die Größe der Befallsflecken auf den Blättern ausgewertet.
Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während
ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle
hervor.

25

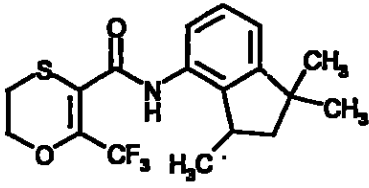
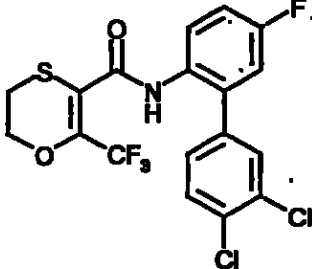
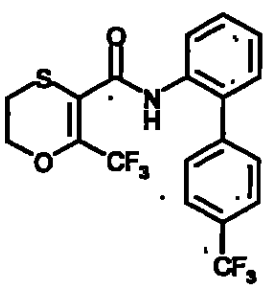
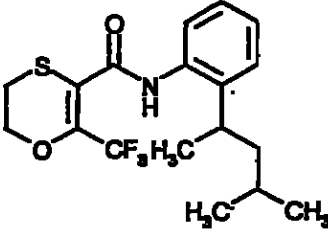
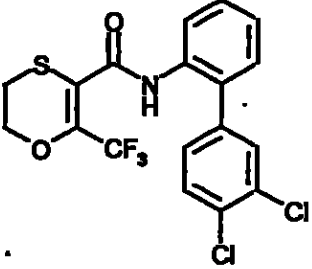
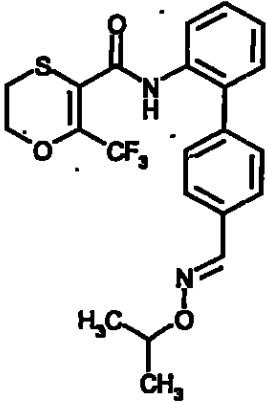
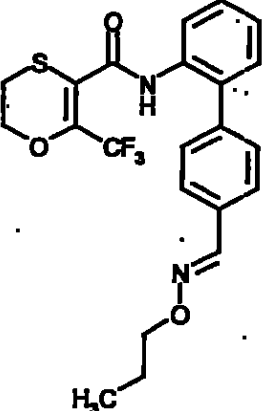
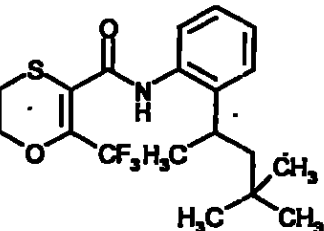
Tabelle B:			
Botrytis - Test (Bohne) / protektiv			
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad
12		500	97
17		500	96
20		500	100
18		500	100
19		500	100

Tabelle B:			
Botrytis - Test (Bohne) / protektiv			
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad
21		500	100
22		500	100
2		500	100

Beispiel C

Alternaria-Test (Tomate) / protektiv

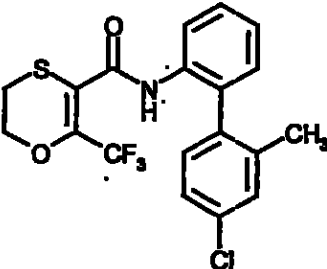
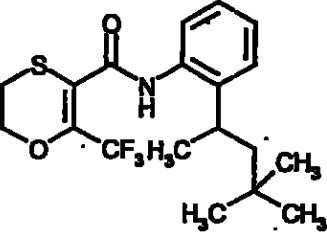
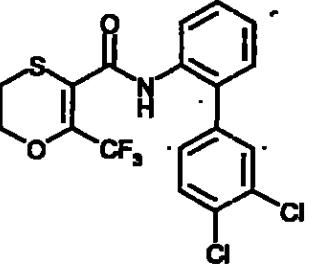
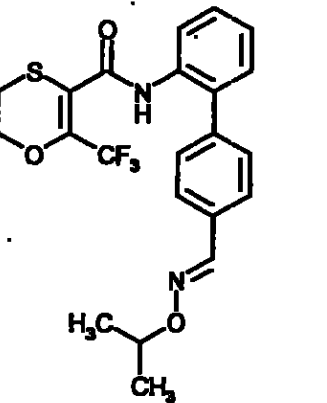
- 5 Lösungsmittel: 49 Gewichtsteile N,N-Dimethylformamid
 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Tomatenpflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Alternaria solani* inokuliert und stehen dann 24 h bei 100 % relativer Feuchte und 20°C. Anschließend stehen die Pflanzen bei 96 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 20°C.

20 7 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

Tabelle C:			
Alternaria-Test (Tomate) / protektiv			
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad
26		750	100
2		750	100
19		750	100
21		750	100

Beispiel D**Puccinia-Test (Weizen) / protektiv**

- 5 Lösungsmittel: N,N-Dimethylacetamid
 Emulgator: Alkylarylpolyglykolether

10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Konidien suspension von *Puccinia recondita* besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und 100 % relativer Luftfeuchtigkeit in einer Inkubationskabine.

20 Die Pflanzen werden dann in einem Gewächshaus bei einer Temperatur von ca. 20°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von 80 % aufgestellt, um die Entwicklung von Rost pusteln zu begünstigen.

25 10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Wirkstoffe, Aufwandmengen, Lösungsmittelmengen, Emulgatormengen und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

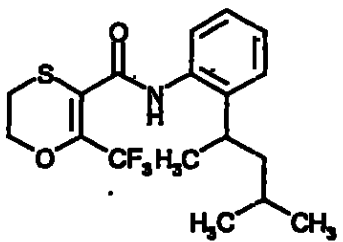
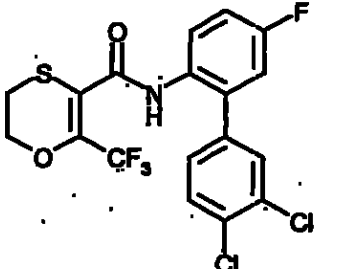
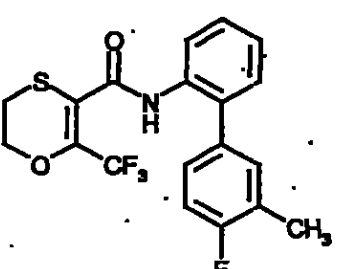
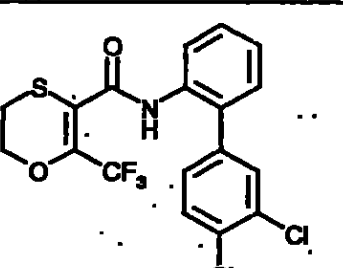
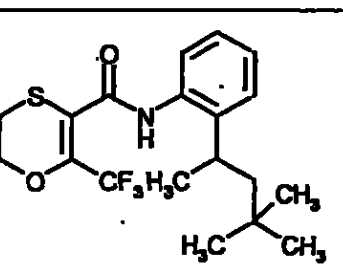
Tabelle D:				
Puccinia-Test (Weizen) / protektiv				
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad	Gewichtsteile Lösungsmittel/ Emulgator
18		500	100	25/0.6
17		500	86	25/0.6
35		500	88	25/0.6
19		500	100	25/0.6
2		500	100	25/0.6

Tabelle D:

Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

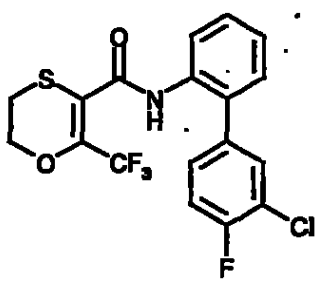
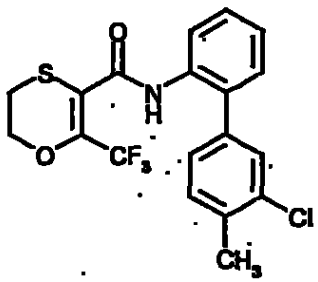
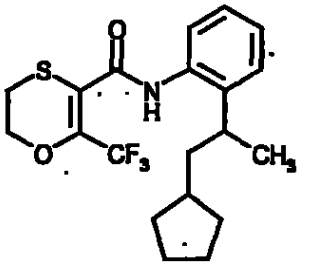
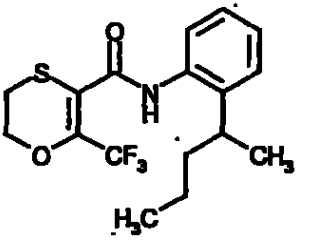
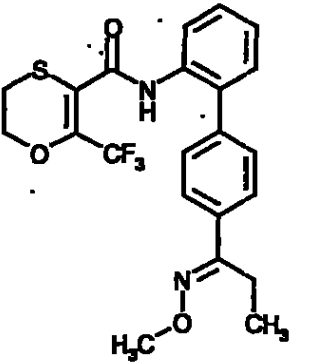
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad	Gewichtsteile Lösungsmittel/ Emulgator
24		500	100	25/0.6
38		500	88	25/0.6
37		500	93	25/0.6
36		500	100	25/0.6
56		500	88	25/0.6

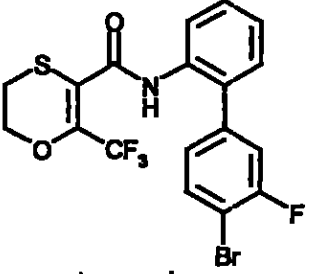
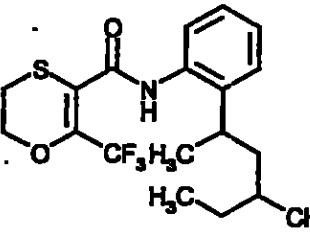
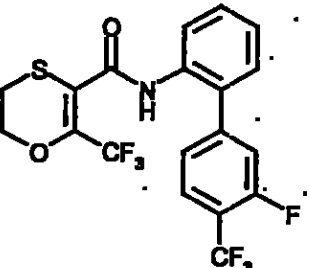
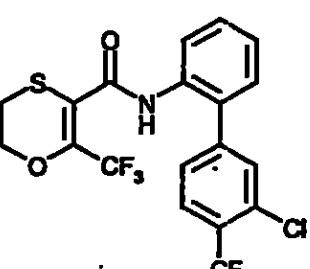
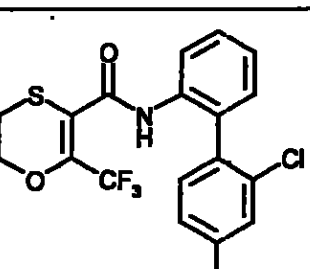
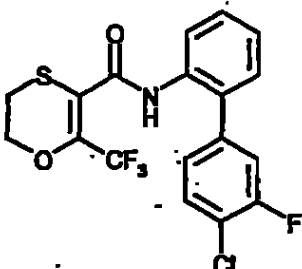
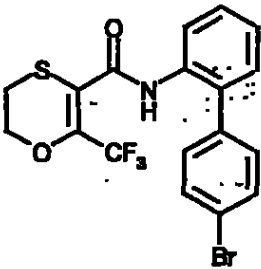
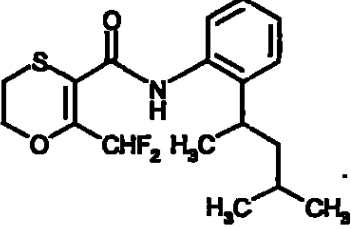
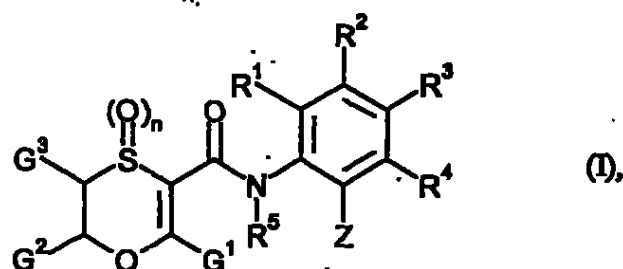
Tabelle D:				
Puccinia-Test (Weizen) / protektiv				
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad	Gewichtsteile Lösungsmittel/ Emulgator
57		500	88	25/0.6
54		500	100	50/1.0
29		500	94	50/1.0
53		500	100	50/1.0
79		500	86	50/1.0

Tabelle D:				
Puccinia-Test (Weizen) / protektiv				
Bsp.	Wirkstoff	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	% Wirkungsgrad	Gewichtsteile Lösungsmittel/ Emulgator
23		500	89	50/1.0
27		500	88	50/1.0
82		500	100	50/1.0

Patentansprüche

1. Oxathiincarboxamide der Formel (I)



5

in welcher

G¹ für Halogen, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Cyclopropyl steht,G² und G³ unabhängig voneinander für Wasserstoff oder Methyl stehen,

n für 0, 1 oder 2 steht,

10

R¹, R², R³ und R⁴ unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl oder Methylthio stehen,

R⁵ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkylsulfinyl, C₁-C₈-Alkylsulfonyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₄-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)-carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; (C₁-C₃-Halogenalkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-Halogenalkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 7 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₃-halogenalkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-halogenalkyl mit jeweils 1 bis 6 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, (C₁-C₃-Halogenalkyl)carbonyl-C₁-C₃-halogenalkyl, (C₁-C₃-Halogenalkoxy)carbonyl-C₁-C₃-halogenalkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; -COR⁶, -CONR⁷R⁸ oder -CH₂NR⁹R¹⁰ steht,

20

25

R⁶ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; -COR¹¹ steht,

30

R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

- 5 R^7 und R^8 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^{12} enthalten kann,
- R^9 und R^{10} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_3 - C_8 -Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- 10 R^9 und R^{10} außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_4 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^{12} enthalten kann,
- 15 R^{11} für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy, C_1 - C_4 -Alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Cycloalkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkoxy, Halogen- C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, C_3 - C_8 -Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,
- 20 R^{12} für Wasserstoff oder C_1 - C_8 -Alkyl steht,
- Z für Z^1 , Z^2 , Z^3 oder Z^4 steht, worn
- Z^1 für gegebenenfalls einfach bis fünffach, gleich oder verschieden substituiertes Phenyl steht,
- Z^2 für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Cycloalkyl oder Bicycloalkyl steht,
- 25 Z^3 für unsubstituiertes C_7 - C_{20} -Alkyl oder für einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3 - C_8 -Cycloalkyl substituiertes C_1 - C_{20} -Alkyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann,
- 30 Z^4 für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3 - C_8 -Cycloalkyl substituiertes C_2 - C_{20} -Alkenyl oder C_7 - C_{20} -Alkinyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann,
- 35 oder

R^1 , R^2 und R^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff oder Fluor stehen und
 Z und R^4 gemeinsam mit den Kohlenstoffatomen, an die sie gebunden sind, einen
 gegebenenfalls substituierten 5- oder 6-gliedrigen carbocyclischen oder
 heterocyclischen Ring bilden.

5

2. Oxathiincarboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
 G^1 für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Trifluormethyl, Difluormethyl oder
 Cyclopropyl,
 G^2 und G^3 unabhängig voneinander für Wasserstoff oder Methyl stehen,
 n für 0 oder 2 steht.

10

3. Oxathiincarboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
 R^5 für Wasserstoff steht.

15

4. Oxathiincarboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
 R^1 für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Methyl steht,
 R^2 für Wasserstoff, Fluor, Chlor, iso-Propyl oder Methylthio steht,
 R^3 für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Methyl steht,
 R^4 für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Methyl steht.

20

5. Oxathiincarboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
 Z für Z^1 steht,
 Z^1 für gegebenenfalls einfach bis fünffach, gleich oder verschieden
 substituiertes Phenyl, wobei die Substituenten aus der Liste W^1 ausgewählt
 sind,
 W^1 für Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Formyl, Carboxy, Carbamoyl,
 Thiocarbamoyl;
 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkyl, Hydroxyalkyl, Oxoalkyl,
 Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylthioalkyl, Dialkoxyalkyl, Alkylthio, Alkyl-
 sulfinyl oder Alkylsulfonyl mit jeweils 1 bis 8 Kohlenstoffatomen;
 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkenyl oder Alkenyloxy mit jeweils
 2 bis 6 Kohlenstoffatomen;
 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkyl, Halogenalkoxy, Halo-
 genalkylthio, Halogenalkylsulfinyl oder Halogenalkylsulfonyl mit jeweils 1
 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 13 gleichen oder verschiedenen Halogen-
 atomen;

25

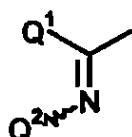
30

35

jeweils geradkettiges oder verzweigtes Halogenalkenyl oder Halogenalkenyloxy mit jeweils 2 bis 6 Kohlenstoffatomen und 1 bis 11 gleichen oder verschiedenen Halogenatomen;

5 jeweils geradkettiges oder verzweigtes Alkylamino, Dialkylamino, Alkylcarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkoxy-carbonyl, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Arylalkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyloxy mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen in den jeweiligen Kohlenwasserstoffketten, Alkenylcarbonyl oder Alkynylcarbonyl, mit 2 bis 6 Kohlenstoffatomen in den jeweiligen Kohlenwasserstoffketten;

10 Cycloalkyl oder Cycloalkyloxy mit jeweils 3 bis 6 Kohlenstoffatomen; jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Oxo, Methyl, Trifluormethyl oder Ethyl substituiertes, jeweils zweifach verknüpftes Alkylen mit 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, Oxyalkylen mit 2 oder 3 Kohlenstoffatomen oder Dioxyalkylen mit 1 oder 2 Kohlenstoffatomen;

oder eine Gruppierung , worin

20 Q^1 für Wasserstoff, Hydroxy oder Alkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, Halogenalkyl mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen und 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen oder Cycloalkyl mit 1 bis 6 Kohlenstoffatomen steht und

25 Q^2 für Hydroxy, Amino, Methylamino, Phenyl, Benzyl oder für jeweils gegebenenfalls durch Cyano, Hydroxy, Alkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino oder Phenyl substituiertes Alkyl oder Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, oder für Alkenyloxy oder Alkynyloxy mit jeweils 2 bis 4 Kohlenstoffatomen steht,

30 sowie jeweils gegebenenfalls im Ringteil einfach bis dreifach durch Halogen, und/oder geradkettiges oder verzweigtes Alkyl oder Alkoxy mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen substituiertes Phenyl, Phenoxy, Phenylthio, Benzoyl, Benzoyl-phenyl, Cinnamoyl, Heterocyclyl oder Phenylalkyl, Phenylalkyloxy, Phenylalkylthio, oder Heterocyclylalkyl, mit jeweils 1 bis 3 Kohlenstoffatomen in den jeweiligen Alkylteilen, steht.

6. Oxathuincarboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher
Z für Z^2 steht,

Z^2 für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiertes Cycloalkyl oder Bicycloalkyl mit jeweils 3 bis 10 Kohlenstoffatomen steht.

5 7. Oxathiincarboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

Z für Z^3 steht,

10 Z^3 für unsubstituiertes C_2 - C_{20} -Alkyl oder für einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Iod und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_1 - C_{20} -Alkyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Iod, C_1 - C_4 -Alkyl und/oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl substituiert sein kann, steht.

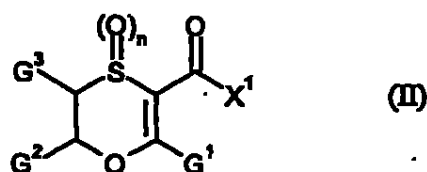
15 8. Oxathiincarboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

Z für Z^4 steht,

20 Z^4 für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Iod und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_2 - C_{20} -Alkenyl oder C_2 - C_{20} -Alkynyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Iod, C_1 - C_4 -Alkyl und/oder C_1 - C_4 -Halogenalkyl substituiert sein kann, steht.

9. Verfahren zum Herstellen der Oxathiincarboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

25 a) Oxathiincarbonsäurederivate der Formel (II)



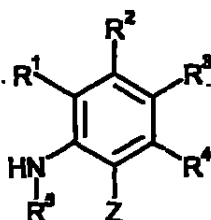
in welcher

G^1 , G^2 , G^3 und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

X^1 für Halogen oder Hydroxy steht,

30

mit Anilin-Derivaten der Formel (III)



(III)

in welcher

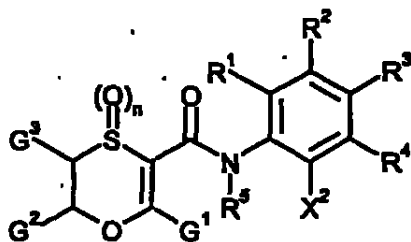
R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

10

b) Halogenoxathinincarboxamide der Formel (IV)



(IV)

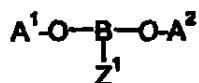
in welcher

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

15

X^2 für Brom oder Iod steht,

mit Boronsäure-Derivaten der Formel (V)



(V)

in welcher

20

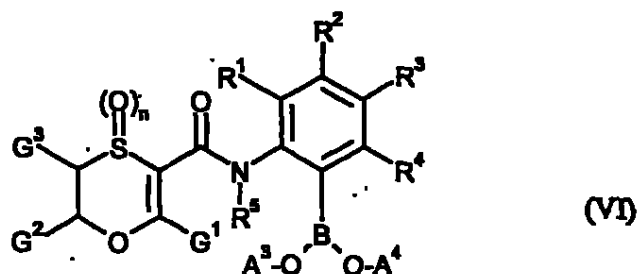
Z^1 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat und

A^1 und A^2 jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen stehen,

25

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

c) Oxathiincarboxamid-Boronsäure-Derivate der Formel (VI)



in welcher

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

A^3 und A^4 jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen stehen,

mit Phenyl-Derivaten der Formel (VII)



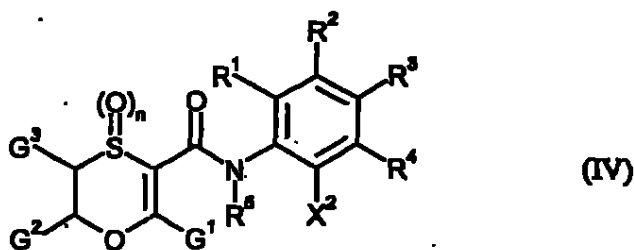
in welcher

Z^1 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat und

X^3 für Chlor, Brom, Iod oder Trifluormethylsulfonat steht,

in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

d) Halogenoxathiincarboxamide der Formel (IV)



in welcher

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

X^2 für Brom oder Iod steht,

mit Phenyl-Derivaten der Formel (VII)



in welcher

Z^1 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat und

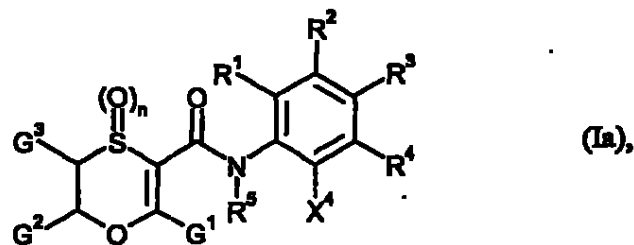
X^3 für Chlor, Brom, Iod oder Trifluormethylsulfonat steht,

5

in Gegenwart eines Palladium- oder Nickel-Katalysators und in Gegenwart von 4,4',4'',5,5',5''-Octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolan, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

10

e) Oxathiincarboxamide der Formel (Ia)



in welcher

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

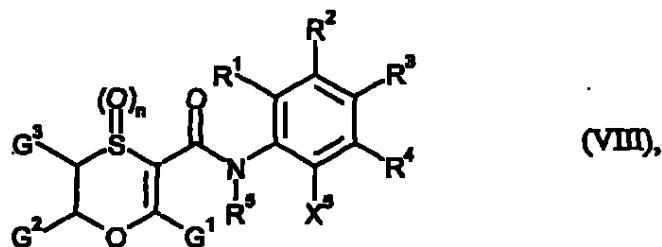
15

X^4 für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_2 - C_{20} -Alkenyl oder C_2 - C_{20} -Alkynyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators hydriert, oder

f) Hydroxyalkyloxathiincarboxamide der Formel (VIII)



25

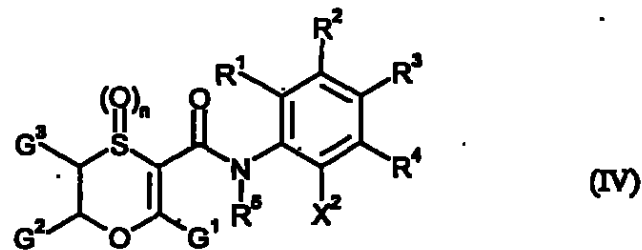
in welcher

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

X^3 für gegebenenfalls zusätzlich einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_2 - C_{20} -Hydroxyalkyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure dehydratisiert, oder

g) Halogenoxathiincarboxamide der Formel (IV)



in welcher

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

X^2 für Brom oder Iod steht,

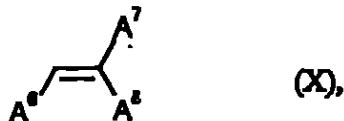
mit einem Alkin der Formel (IX)



in welcher

A^5 für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_7 - C_{18} -Alkyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann,

oder einem Alken der Formel (X)

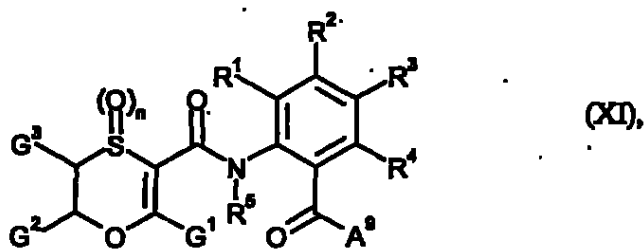


in welcher

A^6 , A^7 und A^8 unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff oder gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes Alkyl stehen, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann und die Gesamtzahl der Kohlenstoffatome des offenkettigen Molekülteils die Zahl 20 nicht übersteigt,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und in Gegenwart eines oder mehrerer Katalysatoren umgesetzt, oder

h) Ketone der Formel (XI)



in welcher

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

A^9 für Wasserstoff oder gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_1 - C_{18} -Alkyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann,

mit einer Phosphorverbindung der allgemeinen Formel (XII)



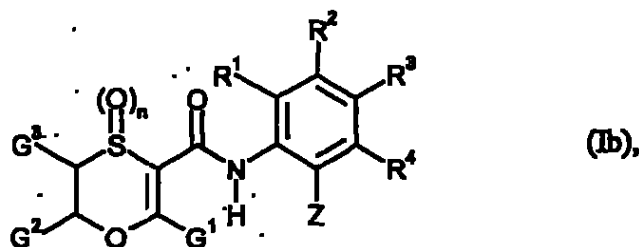
in welcher

A^{10} für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_1 - C_{18} -Alkyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann,

Px für eine Gruppierung $-P^+(C_6H_5)_3 Cl^-$, $-P^+(C_6H_5)_3 Br^-$, $-P^+(C_6H_5)_3 I^-$, $-P(=O)(OCH_3)_3$ oder $-P(=O)(OC_2H_5)_3$ steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt, oder

i) Oxathiincarboxamide der Formel (Ib)



in welcher

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogeniden der Formel (XIII)



in welcher

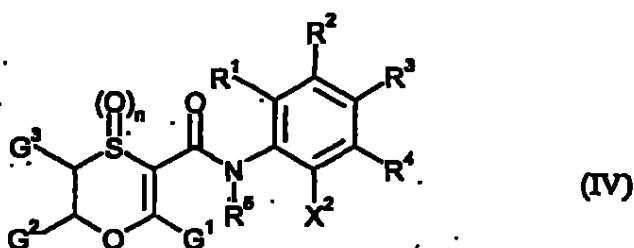
R^{5-1} für C_1-C_8 -Alkyl, C_1-C_8 -Alkylsulfinyl, C_1-C_8 -Alkylsulfonyl, C_1-C_8 -Alkoxy- C_1-C_8 -alkyl, C_3-C_8 -Cycloalkyl, C_1-C_8 -Halogenalkyl, C_1-C_8 -Halogenalkylthio, C_1-C_8 -Halogenalkylsulfinyl, C_1-C_8 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1-C_8 -alkoxy- C_1-C_8 -alkyl, C_3-C_8 -Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Formyl- C_1-C_8 -alkyl, $(C_1-C_3$ -Alkyl)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl, $(C_1-C_3$ -Alkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl; $(C_1-C_3$ -Halogenalkyl)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl, $(C_1-C_3$ -Halogenalkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl mit jeweils 1 bis 7 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, $(C_1-C_3$ -Alkyl)carbonyl- C_1-C_3 -halogenalkyl, $(C_1-C_3$ -Alkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -halogenalkyl mit jeweils 1 bis 6 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, $(C_1-C_3$ -Halogenalkyl)carbonyl- C_1-C_3 -halogenalkyl, $(C_1-C_3$ -Halogenalkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -halogenalkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; $-COR^6$, $-CONR^7R^8$ oder $-CH_2NR^9R^{10}$ steht,

R^6 , R^7 , R^8 , R^9 und R^{10} die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

X^6 für Chlor, Brom oder Iod steht,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

10. Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Oxathiincarboxamid der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.
11. Verwendung von Oxathiincarboxamiden der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen.
12. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Oxathiincarboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.
13. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Oxathiincarboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.
14. Halogenoxathiincarboxamide der Formel (IV)

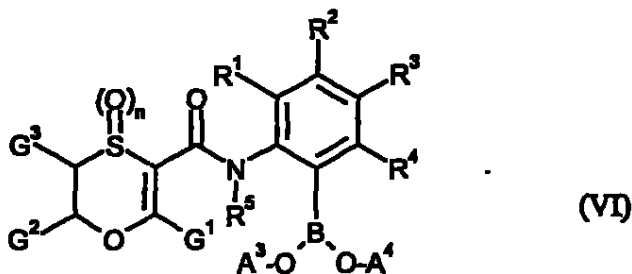


in welcher

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, und

X^2 für Brom oder Iod steht.

15. Oxathiincarboxamid-Boronsäure-Derivate der Formel (VI)



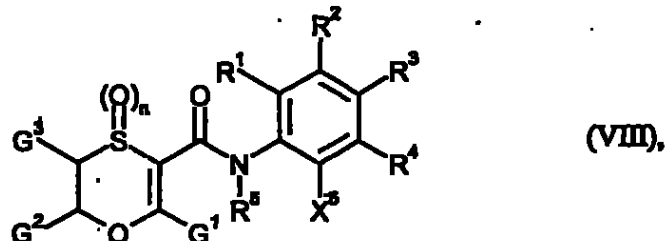
in welcher

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

A^3 und A^4 jeweils für Wasserstoff oder zusammen für Tetramethylethylen stehen.

5

16. Hydroxyalkyloxathiincarboxamide der Formel (VIII)



in welcher

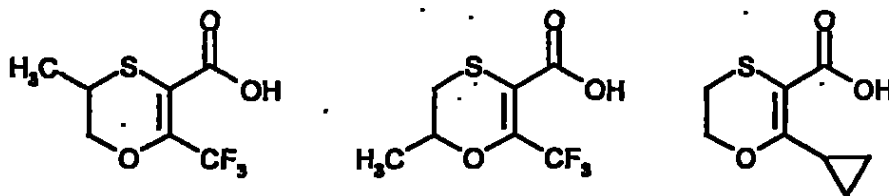
G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 und R^5 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

10

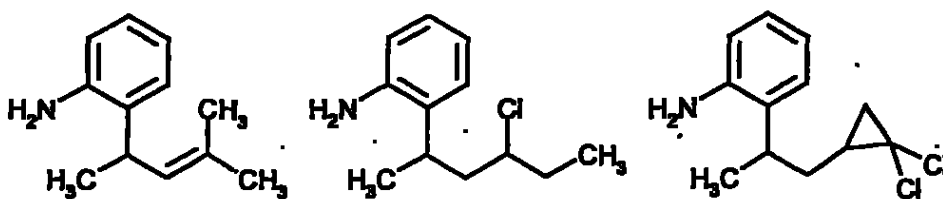
X^5 für gegebenenfalls zusätzlich einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen und/oder C_3 - C_6 -Cycloalkyl substituiertes C_2 - C_{20} -Hydroxyalkyl steht, wobei der Cycloalkylteil seinerseits gegebenenfalls durch Halogen und/oder C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann.

15

17. Oxathiincarbonsäurederivate der Formel (II) ausgewählt aus:



18. Anilin-Derivaten der Formel (III) ausgewählt aus



20

Le A 36 354-CO

- 1 -

OXATIINCARBOXAMIDAS.

Campo de la invención

La presente invención se refiere a nuevas oxatiincarboxamidas, a varios procedimientos para su obtención y a su empleo para la lucha contra microorganismos
5 indeseados.

Antecedentes de la invención

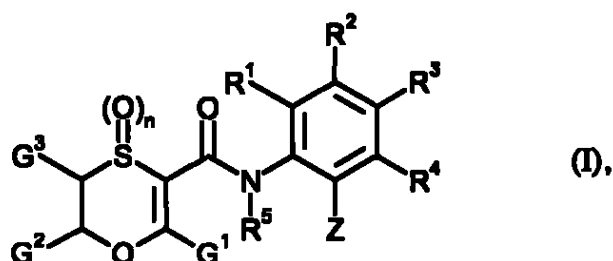
Se sabe ya que un gran número de carboxamidas presenta propiedades fungicidas (véanse, por ejemplo, las publicaciones EP-A 0 591 699, EP-A 0 545 099, DE-OS 16 17 921, JP-A 2001-302605, JP-A 10-251240, JP-A 8-176112, JP-A 53-
10 72823 y US 3,657,449).

De este modo, se han dado a conocer ya algunas 6-metil-2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-carboxamidas. De manera ejemplificativa pueden citarse la *N*-(4'-flúor-1,1'-bifenil-2-il)-6-metil-2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-carboxamida y la (6-metil(2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-il))-*N*-[2-(2-metilpropil)fenil]carboxamida por la publicación EP-A 0 545 099, la (6-
15 metil(2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-il))-*N*-(2,4,6-trimetilfenil)carboxamida por la publicación DE-OS 16 17 921, la *N*-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil](6-metil(2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-il))carboxamida por la publicación JP-A 10-251240 y la (6-metil(2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-il))-*N*-(2-metilfenil)carboxamida por la publicación US 3,657,449. La actividad de estos productos es buena pero, sin embargo, deja mucho que desear en algunos casos,
20 por ejemplo, con ocasión de cantidades bajas de aplicación.

Descripción detallada de la invención

Se han encontrado nuevas oxatiincarboxamidas de la fórmula (I)

- 2 -



en la que

G^1 significa halógeno, trifluórmétilo, difluórmétilo o ciclopropilo,

G^2 y G^3 significan, independientemente entre sí, hidrógeno o metilo,

5 n significa 0, 1 o 2,

R^1 , R^2 , R^3 y R^4 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, metilo, iso-propilo o metiltio,

R^5 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, Formil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; (halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 7 átomos de flúor, de cloro y/o de

- 3 -

- bromo, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, (halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; $-\text{COR}^6$, $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ o $-\text{CH}_2\text{NR}^9\text{R}^{10}$,
- R⁶** significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; $-\text{COR}^{11}$,
- R⁷ y R⁸** significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,
- R⁷ y R⁸** significan, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo con 5 hasta 8 átomos en el anillo, saturado, substituido, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo

- 4 -

contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR¹²,

R⁹ y R¹⁰ significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R⁹ y R¹⁰ significan, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo con 5 hasta 8 átomos en el anillo, saturado, substituido, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR¹²,

R¹¹ significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R¹² significa hidrógeno o alquilo con 1 a 6 átomos de carbono,

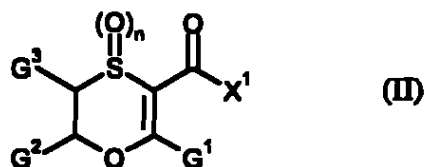
Z significa Z¹, Z², Z³ o Z⁴, donde

Z¹ significa fenilo substituido, en caso dado, de una hasta cinco veces, de forma igual o de formas diferentes,

Z² significa cicloalquilo o bicicloalquilo substituidos, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes,

- 5 -

- Z³** significa alquilo con 2 a 20 átomos de carbono, insustituido, o significa alquilo con 1 a 20 átomos de carbono sustituido una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar sustituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- Z⁴** significa alquenilo con 2 a 20 átomos de carbono o alquinilo con 2 a 20 átomos de carbono, sustituidos respectivamente, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono pudiendo estar sustituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- o
- R¹, R² y R³** significan, independientemente entre sí, hidrógeno o flúor y
- Z y R⁴** forman, junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, un anillo carbocíclico o heterocíclico con 5 o 6 miembros, en caso dado sustituido.
- Además, se ha encontrado, que se obtienen las oxatiincarboxamidas de la fórmula (I), si
- a) se hacen reaccionar derivados del ácido oxatiincarboxílico de la fórmula (II)



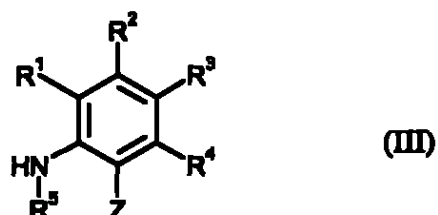
- 6 -

en la que

G^1 , G^2 , G^3 y n tienen los significados anteriormente indicados y

X^1 significa halógeno o hidroxilo,

con derivados de anilina de la fórmula (III)



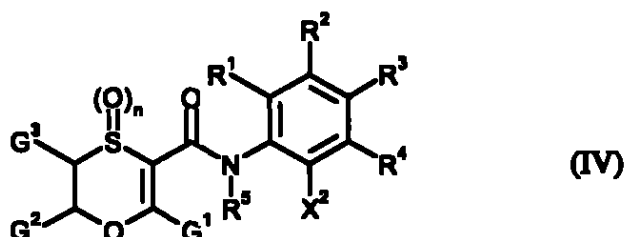
en la que

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y Z tienen los significados anteriormente indicados,

en caso dado en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente de condensación, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o

10

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



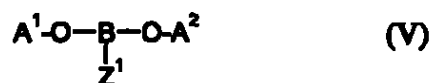
en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados anteriormente indicados,

15

X^2 significa bromo o yodo,

con derivados del ácido borónico de la fórmula (V)



- 7 -

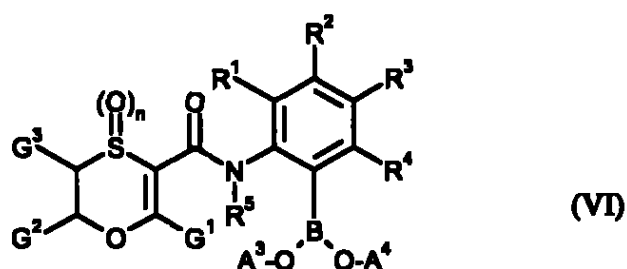
en la que

Z^1 tiene los significados anteriormente indicados y

A^1 y A^2 significan, respectivamente, hidrógeno o conjuntamente significan tetrametiletileno,

5 en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o

c) se hacen reaccionar derivados de oxatiincarcboxamida del ácido borónico de la fórmula (VI)



10 en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados anteriormente indicados,

A^3 y A^4 significan, respectivamente, hidrógeno o conjuntamente significan tetrametiletileno,

15 con derivados de fenilo de la fórmula (VII)



en la que

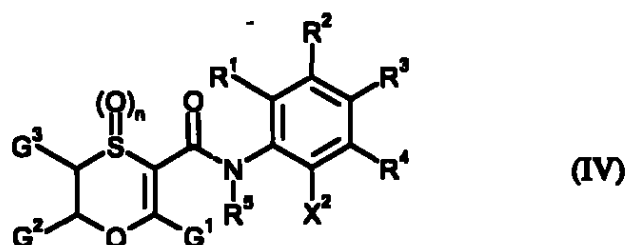
Z^1 tiene los significados anteriormente indicados y

X^3 significa cloro, bromo, yodo o sulfonato de trifluórmétilo,

20 en presencia d un catalizador, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o

d) se hacen reaccionar halógenooxatiincarcboxamidas de la fórmula (IV)

- 8 -



en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados anteriormente indicados,

- 5 X^2 significa bromo o yodo,
con derivados de fenilo de la fórmula (VII)

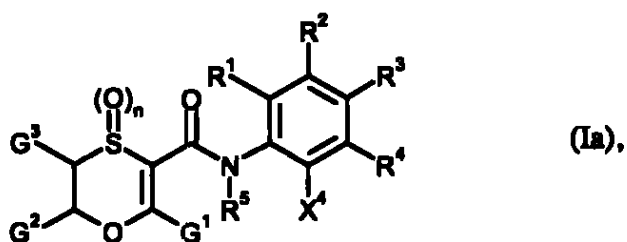


en la que

Z^1 tiene los significados anteriormente indicados y

- 10 X^3 significa cloro, bromo, yodo o sulfonato de trifluórmétilo,
en presencia de un catalizador de paladio o de níquel y en presencia de
4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano, en caso dado en
presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un
diluyente, o

- 15 e) se hacen reaccionar oxatiincaroamidias de la fórmula (Ia)



en la que

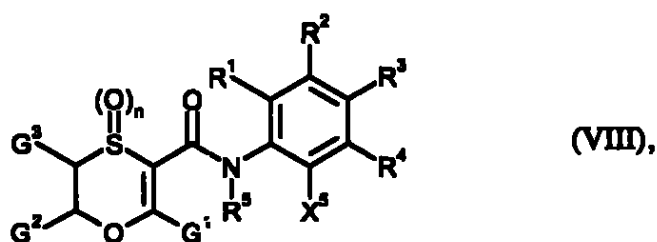
G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados anteriormente indicados,

- 9 -

X⁴ significa alquenilo con 2 a 20 átomos de carbono o alquinilo con 2 a 20 átomos de carbono substituidos respectivamente, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un catalizador, o

f) se deshidratan hidroxialquiloxtiincaboxamidas de la fórmula (VIII)



en la que

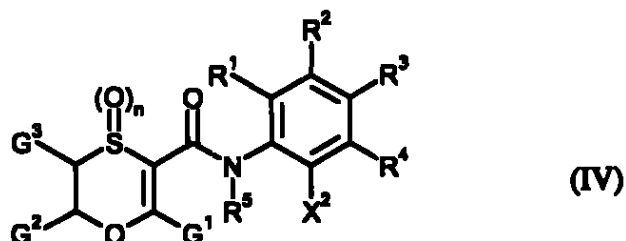
G¹, G², G³, n, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ tienen los significados anteriormente indicados,

X³ significa hidroxialquilo con 2 a 20 átomos de carbono substituido, en caso dado, además una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un ácido, o

g) se hacen reaccionar halógenooxatiincaboxamidas de la fórmula (IV)

- 10 -



en la que

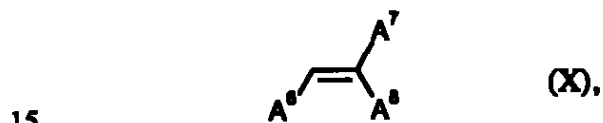
G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados anteriormente indicados,

5 X^2 significa bromo o yodo,
con un alquino de la fórmula (IX)



en la que

10 A^3 significa alquilo con 2 a 18 átomos de carbono sustituido respectivamente, en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar sustituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
o con un alqueno de la fórmula (X)



15

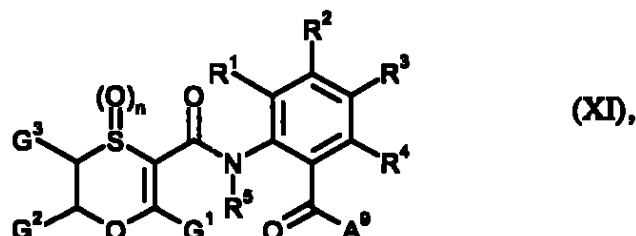
en la que

20 A^6 , A^7 y A^8 significan, independientemente entre sí, respectivamente, hidrógeno o alquilo sustituido, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar sustituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con

- 11 -

1 a 4 átomos de carbono y sin sobrepase de 20, el número total de los átomos de carbono de la parte de la molécula de cadena abierta, en caso dado en presencia de un diluyente, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y en presencia de uno o varios catalizadores, o

5 h) se hacen reaccionar cetonas de la fórmula (XI)



en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados anteriormente indicados,

10 A^9 significa hidrógeno o alquilo con 1 a 18 átomos de carbono sustituido, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

15 con un compuesto del fósforo de la fórmula general (XII)



en la que

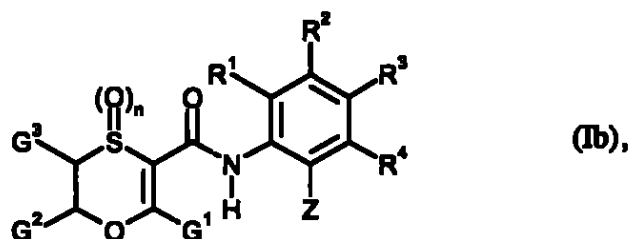
20 A^{10} significa alquilo con 1 a 18 átomos de carbono sustituido, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

- 12 -

Px significa un agrupamiento $-P^+(C_6H_5)_3 Cl^-$, $-P^+(C_6H_5)_3 Br^-$, $-P^+(C_6H_5)_3 I^-$,
 $-P(=O)(OCH_3)_3$ o $-P(=O)(OC_2H_5)_3$,

en caso dado en presencia de un diluyente, o

i) se hacen reaccionar oxatiincarboxamidas de la fórmula (Ib)



en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y Z tienen los significados anteriormente
 indicados,

con halogenuros de la fórmula (XIII)



en la que

R^{5-1} significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6
 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi
 con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
 cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6
 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono,
 halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono,
 halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi
 con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
 halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente,
 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, formil-alquilo con 1 a
 3 átomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-

- 13 -

alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; (halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 7 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, (halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; $-\text{COR}^6$, $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ o $-\text{CH}_2\text{NR}^9\text{R}^{10}$,

R^6 , R^7 , R^8 , R^9 y R^{10} tienen los significados anteriormente indicados,

X^6 significa cloro, bromo o yodo,

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

Finalmente, se ha encontrado que las nuevas oxatiincaboxamidas de la fórmula (I) tienen propiedades microbidas muy buenas y que pueden ser empleadas para la lucha contra los microorganismos indeseados tanto en la protección de las plantas como, también, en la protección de los materiales.

Sorprendentemente las oxatiincaboxamidas, según la invención, de la fórmula (I) una actividad fungicida sensiblemente mejor que la de los compuestos, conocidos con anterioridad, similares desde el punto de vista de su constitución, con la misma dirección de actividad.

- 14 -

Los compuestos, según la invención, pueden presentarse, en caso dado, como mezclas de las diversas formas isómeras posibles, especialmente en forma de los estereoisómeros, tales como, por ejemplo, los isómeros E y Z, treo y eritro, así como de los isómeros ópticos, en caso dado también en forma de los tautómeros. Se reivindican tanto los isómeros E como, también, los isómeros Z, así como también los isómeros treo y eritro, igual que los isómeros ópticos, mezclas arbitrarias de estos isómeros, así como las formas tautómeras posibles.

Las oxatiincaboxamidas, según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (I). A continuación se dan las definiciones preferentes de los restos de las fórmulas indicadas precedentemente y que se indicarán a continuación. Estas definiciones son válidas para los productos finales de la fórmula (I) así como, de manera equivalente, para todos los productos intermedios.

- G¹ preferentemente significa flúor, cloro, bromo, yodo, trifluórmétilo, difluórmétilo o ciclopropilo.
- 15 G¹ de manera especialmente preferente significa cloro, bromo, yodo, trifluórmétilo, difluórmétilo o ciclopropilo.
- G¹ de manera muy especialmente preferente significa trifluórmétilo.
- G¹ también de manera muy especialmente preferente significa difluórmétilo.
- G¹ también de manera muy especialmente preferente significa ciclopropilo.
- 20 G² preferentemente significa hidrógeno.
- G² también preferentemente significa metilo.
- G³ preferentemente significa hidrógeno.
- G³ también preferentemente significa metilo.
- G² y G³ de manera especialmente preferente significan, simultáneamente, hidrógeno.
- 25 n preferentemente 0 o 2.

- 15 -

- n de manera especialmente preferente significa 0.
- n también de manera especialmente preferente significa 2.
- R¹ preferentemente significa hidrógeno, flúor, cloro o metilo.
- R¹ de manera especialmente preferente significa hidrógeno, flúor o cloro.
- 5 R¹ de manera muy especialmente preferente significa hidrógeno.
- R¹ también de manera muy especialmente preferente significa flúor.
- R² preferentemente significa hidrógeno, flúor, cloro, iso-propilo o metiltio.
- R² de manera especialmente preferente significa hidrógeno, flúor, iso-propilo o metiltio.
- 10 R² de manera muy especialmente preferente significa hidrógeno.
- R³ preferentemente significa hidrógeno, flúor, cloro o metilo.
- R³ de manera especialmente preferente significa hidrógeno o flúor.
- R³ de manera muy especialmente preferente significa hidrógeno.
- R³ también de manera muy especialmente preferente significa flúor.
- 15 R⁴ preferentemente significa hidrógeno, flúor, cloro o metilo.
- R⁴ de manera especialmente preferente significa hidrógeno o metilo.
- R⁴ de manera muy especialmente preferente significa hidrógeno.
- R⁴ también de manera muy especialmente preferente significa metilo.
- R¹, R², R³ y R⁴ de manera muy especialmente preferente significan,
- 20 simultáneamente, hidrógeno.
- R⁵ preferentemente significa hidrógeno; alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4
- 25 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono,

- 16 -

halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, Formil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; (halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 7 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, (halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; -COR⁶, -CONR⁷R⁸ o -CH₂NR⁹R¹⁰.

R⁵ de manera especialmente preferente significa hidrógeno, 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, trifluórometilo, triclorometilo, trifluóretilo, difluórometiltio, difluorclorometiltio, trifluórometiltio, trifluórometilsulfinilo,

- 17 -

trifluórmethylsulfonilo, trifluórmethylmetoximetilo,

-CH₂-CHO, -CH₂CH₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂,
 -CH₂CH₂-CO-CH₃, -CH₂CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂CH₂-CO-CH(CH₃)₂,
 -CH₂-C(O)OCH₃, -CH₂-C(O)OCH₂CH₃, -CH₂-C(O)OCH(CH₃)₂,
 5 -CH₂CH₂-C(O)OCH₃, -CH₂CH₂-C(O)OCH₂CH₃, -CH₂CH₂-C(O)OCH(CH₃)₂,
 -CH₂-CO-CF₃, -CH₂-CO-CCl₃, -CH₂-CO-CH₂CF₃, -CH₂-CO-CH₂CCl₃,
 -CH₂CH₂-CO-CH₂CF₃, -CH₂CH₂-CO-CH₂CCl₃, -CH₂-C(O)OCH₂CF₃,
 -CH₂-C(O)OCF₂CF₃, -CH₂-C(O)OCH₂CCl₃, -CH₂-C(O)OCCl₂CCl₃,
 -CH₂CH₂-C(O)OCH₂CF₃, -CH₂CH₂-C(O)OCF₂CF₃, -CH₂CH₂-C(O)OCH₂CCl₃,
 10 -CH₂CH₂-C(O)O-CCl₂CCl₃; -COR⁶, -CONR⁷R⁸ o -CH₂NR⁹R¹⁰.

R⁵ de manera muy especialmente preferente significa hidrógeno; metilo, metoximetilo, -CH₂-CHO, -CH₂CH₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂ o -COR⁶.

R⁶ preferentemente significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, -COR¹¹.

R⁶ de manera especialmente preferente significa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, iso-propoxi, terc.-butoxi, ciclopropilo; trifluórmethyl, trifluórmethylmetoxi, -COR¹¹.

R⁶ de manera muy especialmente preferente significa hidrógeno, -COCH₃, -CHO, -COCH₂OCH₃, -COCO₂CH₃, -COCO₂CH₂CH₃.

- 18 -

R⁷ y R⁸ preferentemente significan, independientemente entre si, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

R⁷ y R⁸ forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, preferentemente un heterociclo con 5 a 8 átomos en el anillo, saturado, substituido en caso dado de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR¹².

R⁷ y R⁸ de manera especialmente preferente significan independientemente entre sí hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluórmethyl, triclorometilo, trifluoretilo, trifluórmethylmetoximetilo.

R⁷ y R⁸ forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, de manera especialmente preferente un heterociclo saturado, substituido, en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por bromo o por metilo, de la serie formada por morfolina, tiomorfolina o piperazina, pudiendo estar substituido la piperazina sobre el segundo átomo de nitrógeno por R¹².

R⁹ y R¹⁰ preferentemente significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono;

- 19 -

halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

- R⁹ y R¹⁰** forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados,
- 5 preferentemente un heterociclo con 5 a 8 átomos en el anillo, saturado, substituido en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR¹².
- 10 **R⁹ y R¹⁰** de manera especialmente preferente significan, independientemente entre sí, hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluórmethyl, triclorometilo, trifluóretilo, trifluórmethylmetoximetilo.
- R⁹ y R¹⁰** forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados,
- 15 de manera especialmente preferente un heterociclo saturado, substituido, en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por bromo o por metilo, de la serie formada por morfolina, tiomorfolina o piperazina, pudiendo esta substituida la piperazina sobre el segundo átomo de nitrógeno por R¹².
- 20 **R¹¹** preferentemente significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3
- 25 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con,

- 20 -

respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

- R¹¹ de manera especialmente preferente significa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, iso-propoxi, terc.-butoxi, ciclopropilo; trifluóormetilo, trifluóormetoxi.
- 5 R¹² preferentemente significa hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.
- R¹² de manera especialmente preferente significa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo.
- Z preferentemente significa Z¹.
- Z¹ preferentemente significa fenilo sustituido, en caso dado, de una a cinco
10 veces, de froma igual o de formas diferentes, eligiéndose los sustituyentes entre la lista W¹.
- Z¹ de manera especialmente preferente significa fenilo monosustituido, eligiéndose los sustituyentes entre la lista W¹.
- Z¹ también de manera especialmente preferente significa fenilo sustituido dos
15 veces, de froma igual o de formas diferentes, eligiéndose los sustituyentes entre la lista W¹.
- Z¹ también de manera especialmente preferente significa fenilo sustituido tres veces, de froma igual o de formas diferentes, eligiéndose los sustituyentes entre la lista W¹.
- 20 Z¹ de manera muy especialmente preferente significa fenilo monosustituido en la posición 4, eligiéndose los sustituyentes entre la lista W¹.
- Z¹ de manera muy especialmente preferente significa fenilo sustituido dos veces, de froma igual o de formas diferentes, en la posición 3,4, eligiéndose los sustituyentes entre la lista W¹.
- 25 Z¹ de manera muy especialmente preferente significa fenilo sustituido dos veces,

- 21 -

de forma igual o de formas diferentes, en la posición 2,4, eligiéndose los sustituyentes entre la lista W¹.

Z¹ de manera muy especialmente preferente significa fenilo sustituido dos veces, de forma igual o de formas diferentes, en la posición 3,5, eligiéndose los sustituyentes entre la lista W¹.

Z¹ de manera muy especialmente preferente significa fenilo sustituido tres veces, de forma igual o de formas diferentes, en la posición 2,4,6, eligiéndose los sustituyentes entre la lista W¹.

W¹ significa halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxi, carbamoilo, tiocarbamoilo;

alquilo, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada con, respectivamente, 1 hasta 8 átomos de carbono;

alquenoilo o alquenoiloxi respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada con, respectivamente, 2 hasta 6 átomos de carbono;

halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalquiltio, halógenoalquilsulfinilo o halógenoalquilsulfonilo respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono y 1 hasta 13 átomos de halógeno iguales o diferentes;

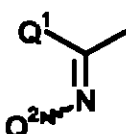
halógenoalquenoilo o halógenoalquenoiloxi respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada con, respectivamente, 2 hasta 6 átomos de carbono y 1 hasta 11 átomos de halógeno iguales o diferentes;

alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo,

- 22 -

dialquilaminocarboniloxi respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada con 1 hasta 6 átomos de carbono en las respectivas cadenas hidrocarbonadas, alquenilcarbonilo o alquinilcarbonilo, con 2 hasta 6 átomos de carbono en las respectivas cadenas hidrocarbonadas;

- 5 cicloalquilo o cicloalquiloxi con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono; alquilenos con 3 o 4 átomos de carbono, oxialquilenos con 2 o 3 átomos de carbono o dioxialquilenos con 1 o 2 átomos de carbono, respectivamente doblemente enlazados, substituidos respectivamente, en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por
- 10 oxo, por metilo, por trifluórmethyl o por etilo;

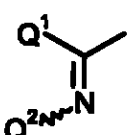
o un agrupamiento , donde

- Q¹ significa hidrógeno, hidroxilo o alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono y 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo o cicloalquilo con 1 hasta 6 átomos de
- 15 carbono und
- Q² significa hidroxilo, Amino, metilamino, fenilo, bencilo o significa alquilo o alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por hidroxilo, por alcoxi, por alquiltio, por alquilamino, por dialquilamino o por fenilo, o significa alquenilo o
- 20 alquiniilo con, respectivamente, 2 hasta 4 átomos de carbono, así como fenilo, fenoxilo, feniltio, benzoilo, benzoileténilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquilo, fenilalquiltio, o heterociclilalquilo, con, respectivamente, 1 hasta 3 átomos de carbono en las respectivas partes alquilo substituidos respectivamente, en caso dado, en la parte anular de una a

- 23 -

tres veces por halógeno, und/o por alquilo o por alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, de cadena lineal o de cadena ramificada.

W¹ preferentemente significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, n- o i-propilo, n-,
i-, s- o t-butilo, metoxi, etoxi, n- o i-propoxi, trifluórmétilo, trifluóretilo,
5 difluórmétoxi, trifluórmétoxi, difluórclorometoxi, trifluóretoxi,
difluórmétilendioxo o tetrafluóretilendioxo enlazados, respectivamente, dos
veces,

o un agrupamiento , donde

Q¹ significa hidrógeno, metilo, etilo o trifluórmétilo y

10 Q² significa hidroxilo, metoxi, etoxi, propoxi o isopropoxi.

Z también preferentemente significa Z².

Z² preferentemente significa cicloalquilo o bicicloalquilo con, respectivamente, 3
hasta 10 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, de una
a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por
15 alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Z² de manera especialmente preferente significa ciclopropilo, ciclopentilo,
ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, ciclononilo, biciclo[2.2.1]heptilo o
biciclo[2.2.2]octilo substituidos respectivamente, en caso dado, de una a cuatro
veces, de forma igual o de formas diferentes, por cloro y/o por metilo.

20 Z² de manera muy especialmente preferente significa ciclopropilo substituido por
cloro y por metilo.

Z también preferentemente significa Z³.

Z³ preferentemente significa alquilo con 2 a 20 átomos de carbono insubstituido o
significa alquilo con 1 a 20 átomos de carbono substituido una o varias veces,

- 24 -

de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por bromo, por yodo y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por bromo, por yodo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono y/o por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Z³ de manera especialmente preferente significa alquilo con 2 a 20 átomos de carbono insubstituido.

Z³ también de manera especialmente preferente significa alquilo con 1 a 20 átomos de carbono substituido por cloro, por ciclopropilo, por diclorociclopropilo, por ciclobutilo, por ciclopentilo o por ciclohexilo.

Z también preferentemente significa **Z⁴**.

Z⁴ preferentemente significa alqueno con 2 a 20 átomos de carbono o alquino con 2 a 20 átomos de carbono substituidos respectivamente, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por bromo, por yodo y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por bromo, por yodo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono y/o por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

Z⁴ de manera especialmente preferente significa alqueno con 2 a 20 átomos de carbono o alquino con 2 a 20 átomos de carbono.

Z y **R⁴** también preferentemente forman, junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, un anillo carbocíclico o heterocíclico, con 5 o 6 miembros, substituido, en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas

- 25 -

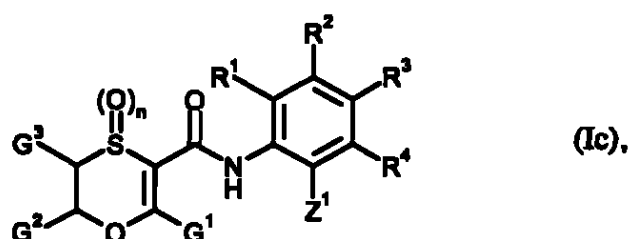
diferentes,.

Z y R⁴ también de manera especialmente preferente forman, junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, un anillo carbocíclico con 5 o 6 miembros substituido, en caso dado, una, dos o tres veces por metilo.

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

Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (I), en la que en la que todos los restos tienen, respectivamente, los significados anteriormente de manera
10 especialmente preferente.

Además, son preferentes los compuestos de la fórmula (Ic)



en la que

G¹, G², G³, n, R¹, R², R³, R⁴ y Z¹ tienen los significados anteriormente indicados.

- 15 Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Ic), en la que G¹ significa trifluórmétilo .

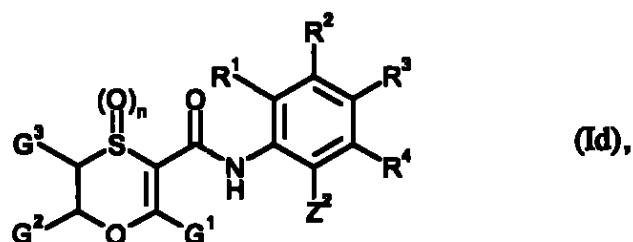
Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Ic), en la que G¹ significa difluórmétilo .

- 20 Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Ic), en la que R¹, R², R³ y R⁴ significan, respectivamente, hidrógeno.

Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Ic), en la que n significa 0.

- 26 -

Además, son preferentes los compuestos de la fórmula (Id)



en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y Z^2 tienen los significados anteriormente indicados.

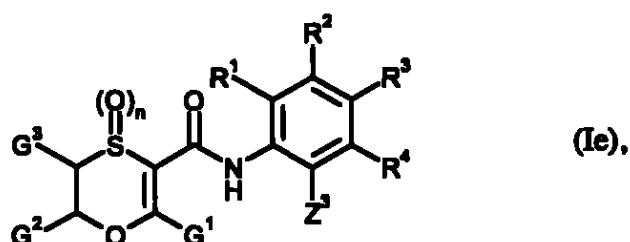
- 5 Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Id), en la que G^1 significa trifluórmétilo .

Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Id), en la que G^1 significa difluórmétilo .

- 10 Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Id), en la que R^1 , R^2 , R^3 y R^4 significan, respectivamente, hidrógeno .

Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Id), en la que n significa 0.

Además, son preferentes los compuestos de la fórmula (Ie)



- 15 en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y Z^3 tienen los significados anteriormente indicados.

Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Ie), en la que G^1 significa trifluórmétilo .

Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Ie), en la que G^1

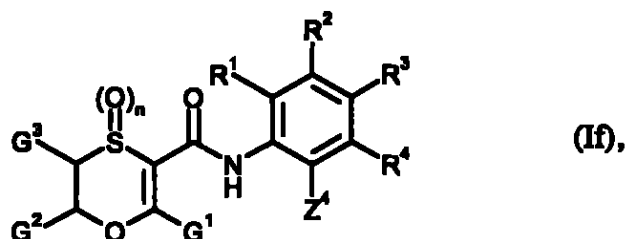
- 27 -

significa difluórmétilo.

Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Ie), en la que R^1 , R^2 , R^3 y R^4 significan, respectivamente, hidrógeno .

Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Ie), en la que n significa 0 .

Además, son preferentes los compuestos de la fórmula (If)



en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y Z^4 tienen los significados anteriormente indicados.

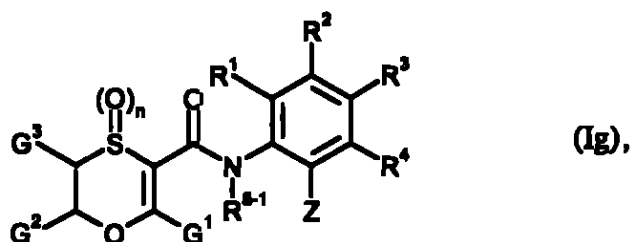
10 Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (If), en la que G^1 significa trifluórmétilo .

Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (If), en la que G^1 significa difluórmétilo.

15 Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (If), en la que R^1 , R^2 , R^3 y R^4 significan, respectivamente, hidrógeno.

Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (If), en la que n significa 0.

Además, son preferentes los compuestos de la fórmula (Ig)



en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{5-1} y Z tienen los significados anteriormente indicados.

R^{5-1} preferentemente significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro und/o de bromo, formil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; (halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 7 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, (halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; $-COR^6$, $-CONR^7R^8$ o $-CH_2NR^9R^{10}$.

- R⁵⁻¹** de manera especialmente preferente significa metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o isopropilsulfinilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o isopropilsulfonilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, trifluórmethyl, triclorometilo, trifluóretilo, difluórmethyl, difluorclorometil, trifluórmethyl, trifluórmethylsulfinilo, trifluórmethylsulfonilo, trifluórmethylmetoximetilo,
- 5 $-\text{CH}_2\text{-CHO}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CHO}$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCCl}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)O-CCl}_2\text{CCl}_3$; $-\text{COR}^6$, $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ o $-\text{CH}_2\text{NR}^9\text{R}^{10}$.
- 10 **R⁵⁻¹** de manera muy especialmente preferente significa metilo, metoximetilo, $-\text{CH}_2\text{-CHO}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CHO}$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}(\text{CH}_3)_2$ o $-\text{COR}^6$.
- 15
- 20

Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Ig), en la que G¹ significa trifluórmethyl.

Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Ig), en la que G¹ significa difluórmethyl.

- 25 Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Ig), en la que R¹,

- 30 -

R^2 , R^3 y R^4 significan, respectivamente, hidrógeno.

Son especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (Ig), en la que n significa 0.

Los restos hidrocarbonados saturados o insaturados tales como alquilo o alquenilo pueden ser, incluso en combinación con heteroátomos, tal como, por ejemplo, en alcoxi, respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada, en tanto en cuanto esto sea posible.

La definición de alquilo con 1 a 20 átomos de carbono corresponde al intervalo máximo, definido en este caso para un resto alquilo. En particular esta definición abarca los significados de metilo, etilo, n-, iso-propilo, n-, iso-, sec.-, terc.-butilo, así como, respectivamente, todos los isómeros de pentilo, de hexilo, de heptilo, de octilo, de nonilo, de decilo, de undecilo, de dodecilo, de tridecilo, de tetradecilo, de pentadecilo, de hexadecilo, de heptadecilo, de octadecilo, de nonadecilo y de eicosilo.

La definición de alquenilo con 2 a 20 átomos de carbono corresponde al intervalo máximo definido en este caso para un resto alquenilo. En particular esta definición abarca los significados de etenilo, n-, iso-propenilo, n-, iso-, sec.-, terc.-butenilo, así como, respectivamente, todos los isómeros de pentenilo, de hexenilo, de heptenilo, de octenilo, de nonenilo, de decenilo, de undecenilo, de dodecenilo, de tridecenilo, de tetradecenilo, de pentadecenilo, de hexadecenilo, de heptadecenilo, de octadecenilo, de nonadecenilo y de eicosenilo.

La definición de alquinilo con 2 a 20 átomos de carbono corresponde al intervalo máximo definido en este caso para un resto alquinilo. En particular esta definición abarca los significados de etinilo, n-, iso-propinilo, n-, iso-, sec.-, terc.-butinilo, así como, respectivamente, todos los isómeros de pentinilo, hexinilo, heptinilo, octinilo, noninilo, decinilo, undecinilo, dodecinilo, tridecinilo, tetradecinilo,

pentadecinilo, hexadecinilo, heptadecinilo, octadecinilo, nonadecinilo y eicosinilo.

Los restos, en caso dado substituidos, pueden estar substituidos una o varias veces, pudiendo ser iguales o diferentes los substituyentes en caso de polisustituciones.

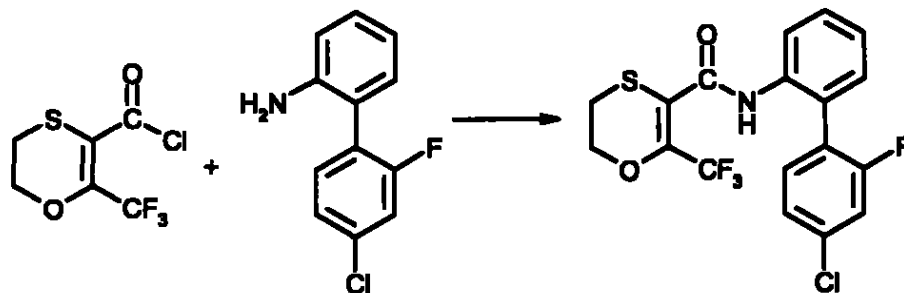
- 5 Los restos substituidos por halógeno, tales como, por ejemplo, halógenoalquilo, están halogenados una o varias veces. Los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes en el caso de polihalogenación. En este caso halógeno significa flúor, cloro, bromo y yodo, especialmente significa flúor, cloro y bromo.

- 10 Las definiciones de los restos o bien las definiciones indicadas anteriormente de manera general o en los intervalos preferentes pueden combinarse arbitrariamente entre los intervalos correspondientes y los intervalos preferentes. Estas son válidas para los productos finales así como, de manera correspondiente, para los productos de partida y para los productos intermedios.

Explicaciones de los procedimientos y productos intermedios

15 Procedimiento (a)

Si se emplean el cloruro de 6-trifluormetil-2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-carbonilo y la 4'-cloro-flúor-1,1'-bifenil-2-amina como productos de partida, podrá representarse del desarrollo del procedimiento (a) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



20

Los derivados del ácido oxatiincarboxílico, necesarios como productos de

- 32 -

partida para la realización del procedimiento (a) según la invención, están definidos en general por medio de la fórmula (II). En esta fórmula (II), G^1 , G^2 , G^3 y n tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido indicados como
5 preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para G^1 , G^2 , G^3 y n en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. Preferentemente X^1 significa cloro o hidroxilo.

Los productos de partida de la fórmula (II) son conocidos en su mayor parte y/o pueden prepararse según procedimientos conocidos (véase la publicación Han'guk
10 Nonghwa Hakhoechi 2001, 44, 191-196). Los nuevos compuestos de la fórmula (II) así como los procedimientos para su obtención pueden verse en los ejemplos de obtención.

Los compuestos de la fórmula (II), en la que n significa 1 o 2, se obtienen a partir de los compuestos correspondientes, en los cuales n significa 0, por medio de los
15 métodos usuales de la oxidación, por ejemplo mediante reacción con peróxido de hidrógeno (H_2O_2) en presencia de ácido fórmico y de un diluyente (por ejemplo la 4-metil-2-pentanona). El grado de oxidación puede controlarse respectivamente por medio de las condiciones de la reacción.

Del mismo modo es posible también oxidar los compuestos de la fórmula (I),
20 en la que n significa 0, para obtener, de este modo, los compuestos de la fórmula (I), en la que n significa 1 o 2. El grado de oxidación puede controlarse respectivamente por medio de las condiciones de la reacción.

Los derivados de anilina necesarios, además, como productos de partida para la realización del procedimiento (a) según la invención están definidos, en general, por
25 medio de la fórmula (III). En esta fórmula (III), R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y Z tienen

- 33 -

preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido indicados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos en relación con la descripción de los compuestos de la
5 fórmula (I) según la invención.

Los productos de partida de la fórmula (III) son conocidos en su mayor parte y/o pueden prepararse según procedimientos conocidos (véanse por ejemplo las publicaciones: Bull. Korean Chem. Soc. 2000, 21, 165-166; Chem. Pharm. Bull. 1992, 40, 240-244; Heterocycles 1989, 29, 1013-1016; J. Med. Chem. 1996, 39, 892-
10 903; Synthesis 1995, 713-16; Synth. Commum. 1994, 24, 267-272; Synthesis 1994, 142-144; DE-A 27 27 416; EP-A 0 824 099; WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301, EP-A 0 589 313 y WO 02/38542).

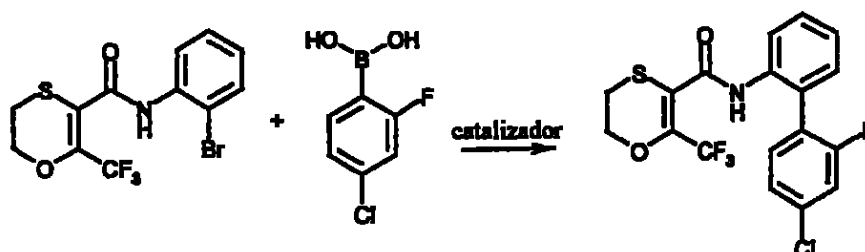
También es posible preparar en primer lugar los derivados de anilina de la fórmula (III) en la que R³ significa hidrógeno y derivatizar los compuestos, obtenidos
15 de este modo, a continuación según métodos usuales [por ejemplo de manera análoga a la del procedimiento según la invención (i)].

Los nuevos compuestos de la fórmula (III) así como los procedimientos para su obtención pueden verse en los ejemplos de obtención.

Procedimiento (b)

20 Si se emplea la N-(2-bromofenil)-6-trifluórmethyl-2,3-dihidro-1,4-oxatiazin-5-carboxamida y el ácido 4-cloro-2-fluorfenilborónico como productos de partida así como un catalizador, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (b) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.

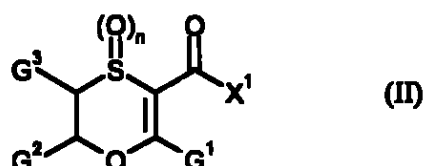
- 34 -



Las halógenooxatiincarboxamidas, necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento (b) según la invención están definidas, en general, por medio de la fórmula (IV). En esta fórmula (IV), G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 ,
 5 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos y estos índices en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. X^2 significa bromo o yodo.

10 Las halógenooxatiincarboxamidas de la fórmula (IV) no son conocidas todavía. Éstas constituyen, a modo de nuevos compuestos químicos, igualmente un objeto de la presente solicitud. Éstas se obtienen, si

j) se hacen reaccionar derivados del ácido oxatiincarboxílico de la fórmula (II)



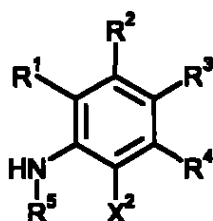
15 en la que

G^1 , G^2 , G^3 y n tienen los significados anteriormente indicados y

X^1 significa halógeno o hidroxilo,

con halógenoanilinas de la fórmula (XIV),

- 35 -



(XIV)

en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵ y X² tienen los significados anteriormente indicados,

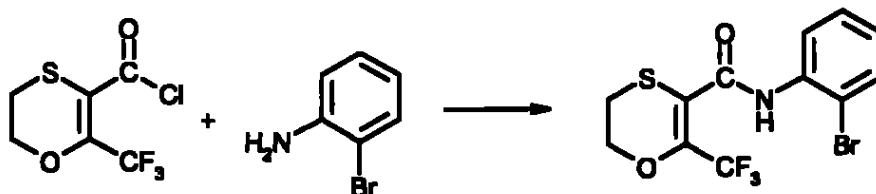
en caso dado en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un

5 agente de condensación, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente.

Procedimiento (j)

Si se emplean el cloruro de 6-trifluórmetil-2,3-dihidro-1,4-oxatín-5-carbonilo y la bromoanilina como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del

10 procedimiento (j) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.



Los halogenuros del ácido oxatíncarboxílico de la fórmula (II), necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento (j) según la invención, han sido descritos ya anteriormente en relación con el procedimiento (a) según la

15 invención.

Las halógenoanilinas necesarias, además, como productos de partida para la realización del procedimiento (j) según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (XIV). En esta fórmula (XIV), R¹, R², R³, R⁴, R⁵ y X² tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy

20 especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados como

- 36 -

preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención, o bien de los productos de partida de la fórmula (III).

Las halógenoanilinas de la fórmula (XIV) son productos químicos para síntesis
5 usuales en el comercio o pueden obtenerse según procedimientos conocidos. En el caso en que R^j no signifique hidrógeno, podrá transformarse el resto R^j en la etapa de los compuestos de la fórmula (XIV) con ayuda de métodos usuales para la derivatización. También es posible preparar, en primer lugar, compuestos de la fórmula (IV), en los cuales R^j signifique hidrógeno y efectuar la derivatización de los productos obtenidos,
10 a continuación, según métodos usuales [véase el procedimiento según la invención (i)].

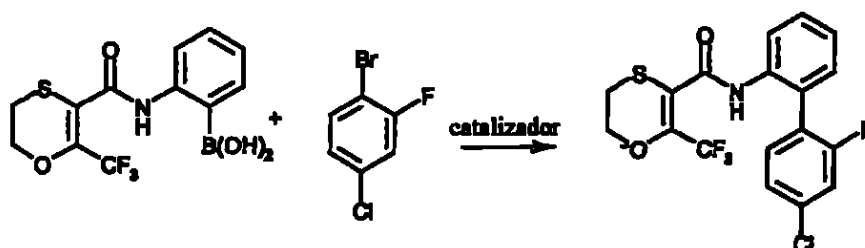
Los derivados del ácido borónico necesarios, además, como productos de partida para la realización del procedimiento (b) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (V). En esta fórmula (V), Z^1 tiene preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy
15 especialmente preferente aquellos significados que ya han sido indicados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para Z^1 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. Respectivamente A^1 y A^2 significan hidrógeno o en conjunto significan tetrametiletileno.

20 Los derivados del ácido borónico de la fórmula (V) son conocidos y/o pueden obtenerse según procedimientos conocidos (véanse por ejemplo las publicaciones WO 01/90084 y US 5,633,218).

Procedimiento c)

Si se emplean el ácido 2-[[6-(trifluórmethyl)-2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-
25 il]carbonilamino}fenil-borónico y el 1-bromo-4-cloro-3-fluorobenceno como productos

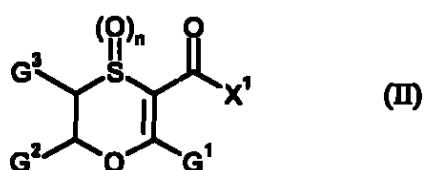
de partida así como un catalizador, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (c) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.



Los derivados de la oxatiincaboxamida del ácido borónico, necesarios como
 5 productos de partida para la realización del procedimiento (c) según la invención, están
 definidos, en general, por medio de la fórmula (VI). En esta fórmula (VI), G^1 , G^2 , G^3 ,
 n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 , tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o
 bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido
 citados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy
 10 especialmente preferentes para estos restos o bien para estos índices en relación con la
 descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. Respectivamente
 A^3 y A^4 significan hidrógeno o, conjuntamente, significan tetrametiletileno.

Los derivados de la oxatiincaboxamida del ácido borónico de la fórmula (VI)
 no son conocidos todavía. Estos son compuestos químicos nuevos y constituyen,
 15 igualmente, un objeto de la presente solicitud. Éstos se obtienen, si

k) se hacen reaccionar derivados del ácido oxatiincaboxílico de la fórmula (II)



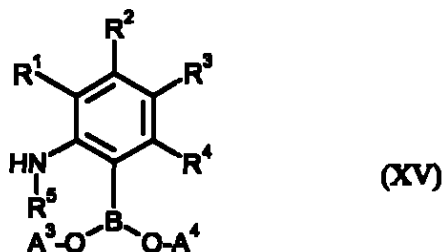
en la que

G^1 , G^2 , G^3 y n tienen los significados anteriormente indicados y

- 38 -

X^1 significa halógeno o hidroxilo,

con un derivado del ácido anilino-borónico de la fórmula (XV),

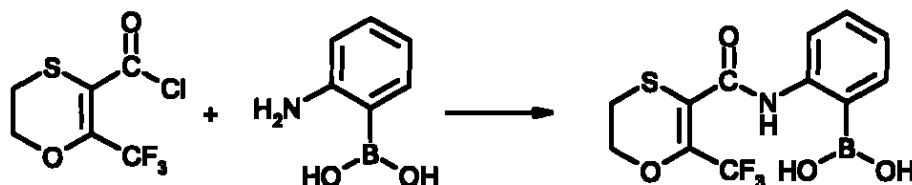


en la que

- 5 R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , A^3 y A^4 tienen los significados anteriormente indicados, en caso dado en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente de condensación, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente.

Procedimiento (k)

- 10 Si se emplean el cloruro de 6-trifluorometil-2,3-dihidro-1,4-oxatien-5-carbonilo y el ácido 2-aminofenilborónico como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (k) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.



- 15 Los derivados del ácido oxatiincarbónico de la fórmula (II), necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento (k) según la invención, han sido descritos ya anteriormente en relación con el procedimiento (a) según la invención.

- 20 Los derivados del ácido anilino-borónico necesarios, además, como productos de partida para la realización del procedimiento (k) según la invención, están

definidos, en general, por medio de la fórmula (XV). En esta fórmula (XV), R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. Respectivamente A^3 y A^4 significan hidrógeno o, conjuntamente, significan tetrametiletileno.

Los derivados del ácido anilino-borónico de la fórmula (XV) son productos químicos para síntesis conocidos o pueden obtenerse según procedimientos conocidos.

10 Cuando R^5 no signifique hidrógeno, podrá transformarse el resto R^5 en la etapa de los compuestos de la fórmula (XV) mediante métodos usuales para la derivatización. También es posible preparar, en primer lugar, compuestos de la fórmula (VI), en los cuales R^5 signifique hidrógeno y llevar a cabo a continuación la derivatización según métodos usuales en los productos obtenidos [véase el procedimiento según la invención

15 (i)].

Los derivados de fenilo, necesarios, además, como productos de partida para la realización del procedimiento (c) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (VII). En esta fórmula (VII), Z^1 tiene preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos

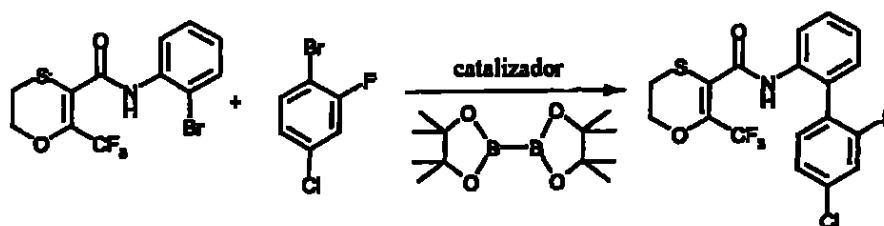
20 significados que ya han sido citados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para Z^1 en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. X^3 significa cloro, bromo, yodo o sulfonato de trifluórmethyl.

Los derivados de fenilo de la fórmula (VII) son productos químicos para

25 síntesis conocidos.

Procedimiento d)

Si se emplean la *N*-(2-bromofenil)-6-trifluormetil-2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-carboxamida y el 1-bromo-4-cloro-2-flúorbenceno como productos de partida, así como un catalizador y 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (d) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.



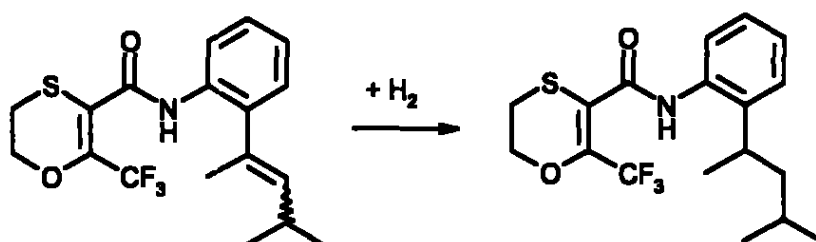
Las halógenooxatiincarboxamidas de la fórmula (IV), necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento (d) según la invención, así como los derivados de fenilo de la fórmula (VII) han sido descritos ya anteriormente en relación con los procedimientos (b) y (c) según la invención.

El 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano necesario, además, para la realización del procedimiento (d) según la invención, es un producto químico para síntesis usual en el comercio.

Procedimiento e)

Si se hidrogena, por ejemplo, la *N*-[2-(1,3-dimetilbut-1-enil)fenil][6-(trifluormetil)(2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-il)]carboxamida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (e) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.

- 41 -



Las oxatiincarboxamidas, necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento (e) según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (Ia). En esta fórmula (Ia), G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen
 5 preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos o bien para estos índices en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

10 Preferentemente,

X^4 significa alquenilo con 2 a 20 átomos de carbono o alquinilo con 2 a 20 átomos de carbono substituidos respectivamente, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por bromo, por yodo y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la
 15 parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo, por yodo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono y/o por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

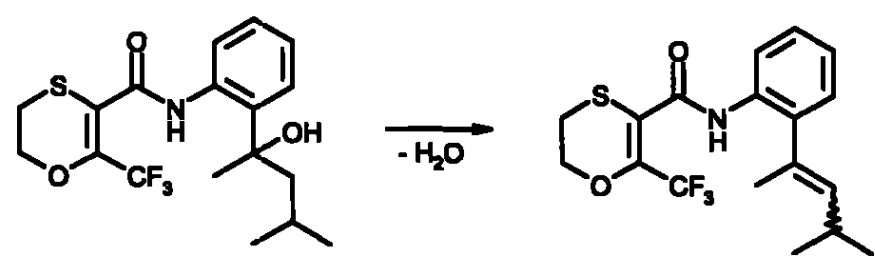
20 X^4 significa alquenilo con 2 a 20 átomos de carbono o alquinilo con 2 a 20 átomos de carbono.

Los compuestos de la fórmula (Ia) son compuestos según la invención y pueden

prepararse según los procedimientos (a), (f), (g) o (h).

Procedimiento f)

Si se deshidrata, por ejemplo, la *N*-[2-(1-hidroxi-1,3-dimetilbutil)fenil][6-(trifluormetil)(2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-il)]carboxamida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (f) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.



Las hidroxialquiloxtiincarboxamidas, necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento (f) según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (VIII). En esta fórmula (VIII), G¹, G², G³, n, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido indicados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos o bien para estos índices en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Preferentemente,

X⁵ significa hidroxialquilo con 2 a 12 átomos de carbono substituido en caso dado adicionalmente de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por cloro, por flúor, por bromo y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

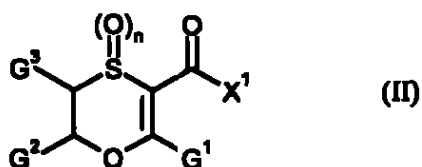
X^2 significa hidroxietilo, hidroxipropilo, hidroxibutilo, hidroxipentilo, hidroxihexilo, hidroxihexilo, hidroxioctilo, hidroxinonilo o hidroxidecilo enlazados, respectivamente, en cualquier punto, respectivamente, de cadena lineal o de cadena ramificada, substituidos, en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por ciclopropilo, por difluorciclopropilo, por ciclobutilo, por ciclopentilo y/o por ciclohexilo.

Los compuestos de la fórmula (VIII) no son conocidos todavía y constituyen, a modo de nuevos compuestos, igualmente, un objeto de la presente solicitud.

Se ha encontrado ahora que las hidroxialquilpirazolilcarboxamidas de la fórmula (VIII) tienen propiedades microbidas muy buenas y que pueden emplearse para la lucha contra los microorganismos indeseados tanto en la protección de las plantas como también en la protección de los materiales.

Las hidroxialquilpirazolilcarboxamidas de la fórmula (VIII), se obtienen si

1) se hacen reaccionar derivados del ácido oxatiincarcófilico de la fórmula (II)

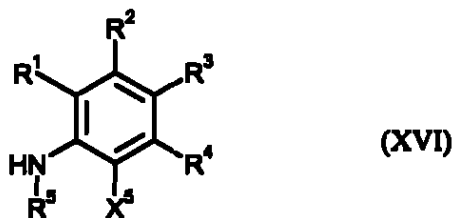


en la que

G^1 , G^2 , G^3 y n tienen los significados anteriormente indicados y

X^1 significa halógeno o hidroxilo,

con un derivado de hidroxialquilanilina de la fórmula (XVI)



en la que

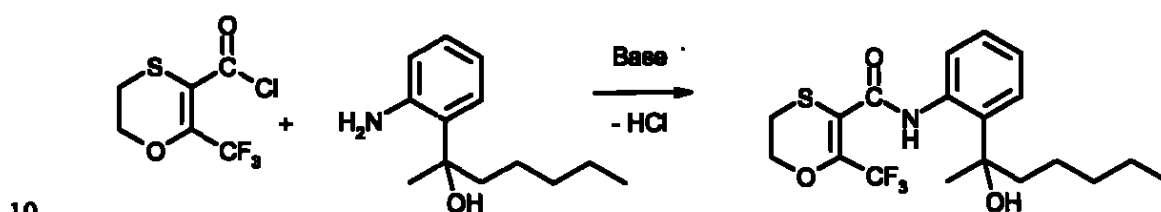
- 44 -

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y X^3 tienen los significados anteriormente indicados,

en caso dado en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente de condensación, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente.

5 Procedimiento (I)

Si se emplea, por ejemplo, el cloruro de 6-trifluórmethyl-2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-carbonilo y el 2-(2-aminofenil)-2-heptanol como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (I) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Los derivados del ácido oxatiincarboxílico de la fórmula (II), necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento (I) según la invención, han sido descritos ya anteriormente en relación con el procedimiento (a) según la invención.

15 Los derivados de hidroxialquilanilina necesarios, además, como productos de partida para la realización del procedimiento (I) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (XVI). En esta fórmula (XVI), R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y X^3 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido indicados como

20 preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos en relación con la descripción de los compuestos según la invención de las fórmulas (I) o bien (VIII).

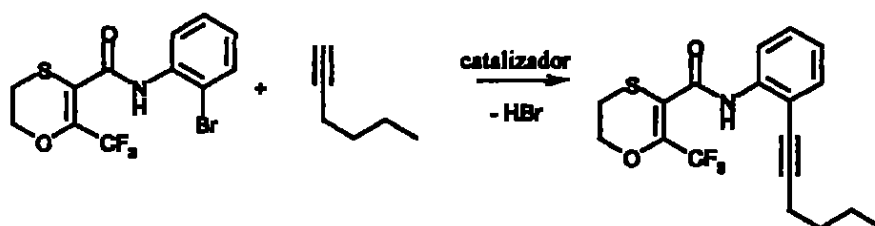
Los derivados de hidroxialquilanilina de la fórmula (XVI) son conocidos y/o

- 45 -

pueden prepararse según métodos conocidos (véanse por ejemplo las publicaciones US 3,917,592 o EP-A 0 824 099). En el caso en que R^3 no signifique hidrógeno, podrá transformarse R^3 en la etapa de los compuestos de la fórmula (XVI) según métodos usuales para la derivatización. También es posible preparar en primer lugar
 5 compuestos de la fórmula (VIII), en los cuales R^3 signifique hidrógeno y llevar a cabo la derivatización a continuación, en los productos obtenidos de este modo, según métodos usuales [véase por ejemplo el procedimiento según la invención (i)].

Procedimiento (g)

Si se emplea, por ejemplo, la *N*-(2-bromofenil)-6-trifluormetil-2,3-dihidro-1,4-oxatiazin-5-carboxamida y el 1-hexino como productos de partida, así como un
 10 catalizador, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (g) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.



Las halógenooxatiincarboxamidas de la fórmula (IV), necesarias como
 15 productos de partida para la realización del procedimiento (g) según la invención, han sido descritas ya anteriormente en relación con el procedimiento (c) según la invención.

Los alquinos, necesarios además como productos de partida para la realización del procedimiento (g) según la invención, están definidos, en general, por medio de la
 20 fórmula (IX).

Preferentemente,

A^3 significa alquilo con 2 a 10 átomos de carbono sustituido, en caso dado, de

- 46 -

una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

5 De forma especialmente preferente,

A⁵ significa etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo u octilo enlazados respectivamente en cualquier punto, respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada, substituidos, en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por ciclopropilo, por difluorciclopropilo, por ciclobutilo, por ciclopentilo y/o por ciclohexilo.

Los alquinos de la fórmula (VI) son productos químicos para síntesis conocidos.

Los alquenos, necesarios, además, alternativamente, como productos de partida para la realización del procedimiento (g) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (X).

Preferentemente,

A⁶, A⁷ y A⁸ significan, independientemente entre sí, hidrógeno o alquilo substituido en caso dado de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado, por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono y sin que sobrepase de 12 el número total de los átomos de carbono de la parte de la molécula de cadena abierta.

De forma especialmente preferente,

25 A⁶, A⁷ y A⁸ significan, independientemente entre sí, respectivamente hidrógeno o

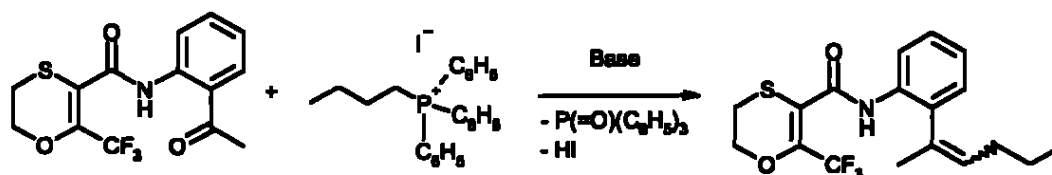
- 47 -

etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo u octilo enlazados respectivamente en cualquier punto, respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada, substituidos, en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por ciclopropilo, por difluorciclopropilo, por ciclobutilo, por ciclopentilo y/o por ciclohexilo, no debiendo sobrepasar de 12 el número

total de los átomos de carbono de la parte de la molécula de cadena abierta. Los alquenos de la fórmula (VII) son productos químicos para síntesis conocidos.

Procedimiento (h)

Si se emplean la *N*-(2-acetilfenil)[6-(trifluormetil)(2,3-dihidro-1,4-oxatien-5-il)]-carboxamida y el yoduro de butil(trifenil)-fosfonio como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (h) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Las cetonas, necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento (h) según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (XI). En esta fórmula, G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos o bien para estos índices en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Preferentemente,

- 48 -

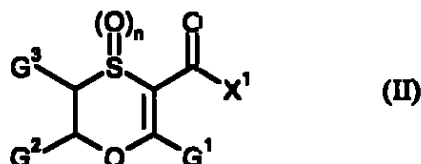
A⁹ significa alquilo con 2 a 10 átomos de carbono sustituido, en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

A⁹ significa etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo u octilo enlazados respectivamente, en cualquier punto, respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada, sustituidos en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por ciclopropilo, por difluorciclopropilo, por ciclobutilo, por ciclopentilo y/o por ciclohexilo.

Las cetonas de la fórmula (XI) no son conocidas todavía. Éstas constituyen, a modo de compuestos químicos nuevos, igualmente un objeto de la presente solicitud. Éstas se obtienen, si

m) se hacen reaccionar derivados del ácido oxadiincarboxílico de la fórmula (II)



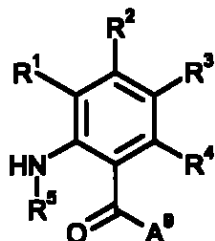
en la que

G¹, G², G³ y n tienen los significados anteriormente indicados y

X¹ significa halógeno o hidroxilo,

con cetoanilinas de la fórmula (XVII)

- 49 -



(XVII),

en la que

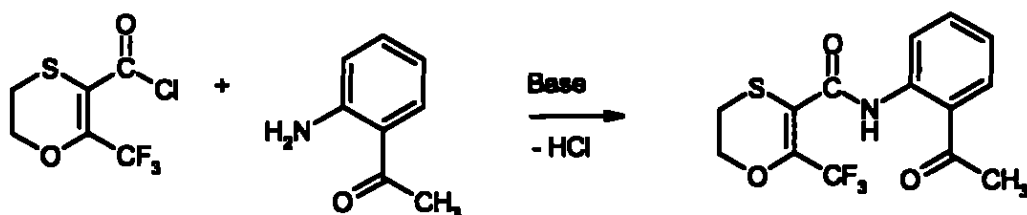
R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y A^9 tienen los significados anteriormente indicados,

en caso dado en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un

5 agente de condensación, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente.

Procedimiento (m)

Si se emplean el cloruro de 6-trifluorometil-2,3-dihidro-1,4-oxatiazin-5-carbonilo y la 1-(2-aminofenil)-etanona como productos de partida, podrá representarse el
10 desarrollo del procedimiento (m) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.



Los derivados del ácido oxatiincarboxílico de la fórmula (II), necesarios como
productos de partida para la realización del procedimiento (m) según la invención, han
15 sido descritos ya en relación con el procedimiento a) según la invención.

Las cetoanilinas, necesarias además como productos de partida para la
realización del procedimiento (m) según la invención, están definidas, en general, por
medio de la fórmula (XVII). En esta fórmula (XVII) R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y A^9 tienen
preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy

- 50 -

especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos en relación con la descripción de los compuestos según la invención de las fórmulas (I) o bien (XI).

5 Las cetoanilinas de la fórmula (XII) son productos químicos para síntesis usuales en general (véanse por ejemplo las publicaciones J. Am. Chem. Soc. 1978, 100, 4842-4857 o US 4,032,573). En el caso en que R³ no signifique hidrógeno, podrá introducirse el resto R³ en la etapa de los compuestos de la fórmula (XVII) por medio de métodos usuales para la derivatización. También es posible preparar, en primer
10 lugar, compuestos de la fórmula (XI), en los cuales R³ signifique hidrógeno y someter a los productos obtenidos, a continuación, a una derivatización según métodos usuales [véase el procedimiento según la invención (i)].

Los compuestos del fósforo, necesarios además como productos de partida para la realización del procedimiento (h) según la invención, están definidos, en general,
15 por medio de la fórmula (XII).

Preferentemente,

A¹⁰ significa alquilo con 2 a 10 átomos de carbono substituido, en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por cloro, por flúor, por bromo y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar
20 substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

De forma especialmente preferente,

A¹⁰ significa etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo, heptilo u octilo enlazados, respectivamente, en cualquier punto, respectivamente de cadena lineal o de
25 cadena ramificada, substituidos en caso dado, de una a cuatro veces, de forma

- 51 -

igual o de formas diferentes por flúor, por ciclopropilo, por difluorciclopropilo, por ciclobutilo, por ciclopentilo y/o por ciclohexilo.

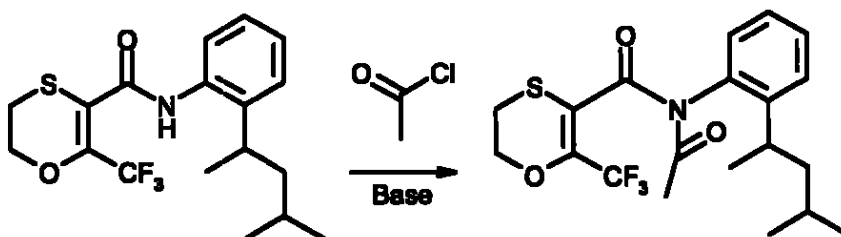
Preferentemente,

Px significa un agrupamiento $-P^+(C_6H_5)_3Cl^-$, $-P^+(C_6H_5)_3Br^-$, $-P^+(C_6H_5)_3I^-$,
5 $-P(=O)(OCH_3)_3$ o $-P(=O)(OC_2H_5)_3$.

Los compuestos del fósforo de la fórmula (XII) son conocidos y/o pueden prepararse según procedimientos conocidos (véanse por ejemplo las publicaciones Justus Liebigs Ann. Chem. 1953, 580, 44-57 o Pure Appl. Chem. 1964, 9, 307-335).

Procedimiento (i)

10 Si se emplean la *N*[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-2-(trifluormetil)-5,6-dihidro-1,4-oxatiin-3-carboxamida y el cloruro de acetilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (i) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



15 Las yodopirazolilcarboxanilidas, necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento (i) según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (Ib). En esta fórmula (Ib), G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y Z tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados como
20 preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos o bien para estos índices en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los compuestos de la fórmula (Ib) son compuestos según la invención y pueden prepararse según los procedimientos (a) hasta (h).

Los halogenuros, necesarios además como productos de partida para la realización del procedimiento (i) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (XIII). En esta fórmula (XIII), R^{3-1} tiene preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados anteriormente de manera preferente, de manera especialmente preferente o bien de manera muy especialmente preferente para estos restos en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (Ig). X^6 significa cloro, bromo o yodo.

Los halogenuros de la fórmula (XIII) son conocidos.

Condiciones de la reacción

Como diluyentes para la realización de los procedimientos (a), (j), (k), (l) y (m), según la invención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen, preferentemente, los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como por ejemplo el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno o la decalina; los hidrocarburos halogenados, tales como por ejemplo el clorobenceno, el diclorobenceno, el diclorometano, el cloroformo, el tetraclorometano, el dicloroetano o el tricloroetano; los éteres tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-t-butiléter, el metil-t-amiléter, el dioxano, el tetrahydrofurano, el 1,2-dimetoxietano, el 1,2-dietoxietano o el anisol; las cetonas, tales como la acetona, la butanona, la metil-isobutilcetona o la ciclohexanona; los nitrilos, tales como el acetonitrilo, el propionitrilo, el n- o i-butanitrilo o el benzonitrilo; las amidas, tales como la N,N-dimetilformamida, la N,N-dimetilacetamida, la N-metilformanilida, la N-

metilpirrolidona o la hexametilfósforotriamida; sus mezclas con agua o el agua pura.

Los procedimientos (a), (j), (k), (l) y (m), según la invención, se llevan a cabo, en caso dado, en presencia de un aceptor de ácido adecuado. Como tales entran en consideración todas las bases inorgánicas u orgánicas usuales. A estas pertenecen, 5 preferentemente, los hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos tales como, por ejemplo, el hidruro de sodio, la amida de sodio, la diisopropilamida de litio, el metilato de sodio, el etilato de sodio, el terc.-butilato de potasio, el hidróxido de sodio, el hidróxido de potasio, el acetato de sodio, el carbonato de sodio, el carbonato de 10 potasio, el bicarbonato de potasio, el bicarbonato de sodio o el carbonato de amonio, así como las aminas terciarias tales como la trimetilamina, la trietilamina, la tributilamina, la N,N-dimetilanilina, la N,N-dimetil-bencilamina, la piridina, la N-metilpiperidina, la N-metilmorfolina, la N,N-dimetilaminopiridina, el diazabicyclooctano (DABCO), el diazabicyclononeno (DBN) o el diazabicycloundeceno 15 (DBU).

Los procedimientos (a), (j), (k), (l) y (m), según la invención, se llevan a cabo, en caso dado, en presencia de un agente de condensación adecuado. Como tales entran en consideración todos los agentes de condensación empleables usualmente para este tipo de reacciones de amidación. De manera ejemplificativa pueden citarse los 20 formadores de halogenuro de acilo tales como el fosgeno, el tribromuro de fósforo, el tricloruro de fósforo, el pentacloruro de fósforo, el oxiclورو de fósforo o el cloruro de tionilo; los formadores de anhídridos tales como el cloroformiato de etilo, el cloroformiato de metilo, el cloroformiato de isopropilo, el cloroformiato de isobutilo o el cloruro de metanosulfonilo; las carbodiimidas, tales como la N,N'- 25 dicitclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes de condensación usuales, como el

- 54 -

pentóxido de fósforo, el ácido polifosfórico, el N,N'-carbonildiimidazol, la 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), la trifenilfosfina/tetracloruro de carbono o el hexaflúorofosfato de bromo-tripirrolidinofosfonio.

Los procedimientos (a), (j), (k), (l) y (m), según la invención, se llevan a cabo, 5 en caso dado, en presencia de un catalizador. De manera ejemplificativa pueden citarse la 4-dimetilaminopiridina, el 1-hidroxi-benzotriazol o la dimetilformamida.

Las temperaturas de la reacción en la realización de los procedimientos (a), (j), (k), (l) y (m), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas desde 0°C hasta 150°C, preferentemente a temperaturas 10 desde 0°C hasta 80°C.

Para la realización del procedimiento (a), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), se emplean, por mol del derivado de ácido oxatiincaroxfílico de la fórmula (II), en general, desde 0,8 hasta 15 moles, preferentemente desde 0,8 hasta 8 moles de derivado de anilina de la fórmula (III).

15 Para la realización del procedimiento (j), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (IV), se emplean, por mol del derivado de ácido oxatiincaroxfílico de la fórmula (II), en general, desde 0,8 hasta 15 moles, preferentemente desde 0,8 hasta 8 moles de halógenoanilina de la fórmula (XIV).

Para la realización del procedimiento (k), según la invención, para la obtención 20 de los compuestos de la fórmula (VI), se emplean, por mol del derivado de ácido oxatiincaroxfílico de la fórmula (II), en general, desde 0,8 hasta 15 moles, preferentemente desde 0,8 hasta 8 moles de derivado del ácido anilino-borónico de la fórmula (XV).

Para la realización del procedimiento (l), según la invención, para la obtención 25 de los compuestos de la fórmula (VIII), se emplean, por mol del derivado de ácido

- 55 -

oxatiincarboxílico de la fórmula (II), en general, desde 0,8 hasta 15 moles, preferentemente desde 0,8 hasta 8 moles de derivado de hidroxialquilanilina de la fórmula (XVI).

Para la realización del procedimiento (m), según la invención, para la obtención
5 de los compuestos de la fórmula (IX), se emplean, por mol del derivado de ácido oxatiincarboxílico de la fórmula (II), en general, desde 0,8 hasta 15 moles, preferentemente desde 0,8 hasta 8 moles de cetoanilina de la fórmula (XVII).

Como diluyentes para la realización de los procedimientos (b), (c) y (d), según la invención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos
10 pertenecen, preferentemente, los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como por ejemplo el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno o la decalina; éteres tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-t-butiléter, el metil-t-amiléter, el dioxano, el tetrahidrofurano, el 1,2-dimetoxietano, el 1,2-dietoxietano o el anisol; los nitrilos,
15 tales como el acetonitrilo, el propionitrilo, el n- o i-butironitrilo o el benzonitrilo; las amidas, tales como la N,N-dimetilformamida, la N,N-dimetilacetamida, la N-metilformanilida, la N-metilpirrolidona o la hexametilfósforotriamida; los ésteres tales como el acetato de metilo o el acetato de etilo; los sulfóxidos, tal como el dimetilsulfóxido; las sulfonas, tal como el sulfolano; los alcoholes, tales como el
20 metanol, el etanol, el n- o i-propanol, el n-, i-, sec.- o terc.-butanol, el etanodiol, el propano-1,2-diol, el etoxietanol, el metoxietanol, el dietilenglicolmonometiléter, el dietilenglicolmonoetiléter, sus mezclas con agua o el agua pura.

Las temperaturas de la reacción en la realización de los procedimientos (b), (c) y (d), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se
25 trabaja a temperaturas desde 0°C hasta 180°C, preferentemente a temperaturas desde

- 56 -

20°C hasta 150°C.

Los procedimientos (b), (c) y (d), según la invención, se llevan a cabo, en caso dado, en presencia de un aceptor de ácido adecuado. Como tales entran en consideración todas las bases inorgánicas u orgánicas usuales. A éstas pertenecen, preferentemente, los hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, fluoruros, fosfatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, tales como por ejemplo el hidruro de sodio, la amida de sodio, la diisopropilamida de litio, el metilato de sodio, el etilato de sodio, el terc.-butilato de potasio, el hidróxido de sodio, el hidróxido de potasio, el acetato de sodio, el fosfato de sodio, el fosfato de potasio, el fluoruro de potasio, el fluoruro de cesio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el bicarbonato de potasio, el bicarbonato de sodio o el carbonato de cesio, así como las aminas terciarias, tales como la trimetilamina, la trietilamina, la tributilamina, la N,N-dimetilanilina, la N,N-dimetil-bencilamina, la piridina, la N-metilpiperidina, la N-metilmorfolina, la N,N-dimetilaminopiridina, el diazabicyclooctano (DABCO), el diazabicyclononeno (DBN) o el diazabicycloundeceno (DBU).

Los procedimientos (b), (c) y (d), según la invención, se llevan a cabo en presencia de un catalizador, tal como por ejemplo de una sal o de un complejo de paladio. En este caso entran en consideración, preferentemente, el cloruro de paladio, el acetato de paladio, el tetraquis-(trifenilfosfina)-paladio, el dicloruro de bis-(trifenilfosfina)-paladio o el cloruro de (1,1'-bis(difenilfosfino)ferrocenopaladio(II)).

Igualmente pueden formarse un complejo de paladio en la mezcla de la reacción si se añade a la reacción, por separado, una sal de paladio y un ligando complejo, tal como, por ejemplo, el trietilfosfano, el tri-terc.-butilfosfano, el triciclohexilfosfano, el 2-(dicyclohexilfosfano)-bifenilo, el 2-(di-terc.-butilfosfano)-bifenilo, el 2-

- 57 -

(diciclohexilfosfano)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, el trifenilfosfano, el tris-(o-tolil)-fosfano, el 3-(difenilfosfino)benzosulfonato de sodio, el tris-2-(metoxifenil)-fosfano, el 2,2'-bis-(difenilfosfano)-1,1'-binaftilo, el 1,4-bis-(difenilfosfano)-butano, el 1,2-bis-(difenilfosfano)-etano, el 1,4-bis-(diciclohexilfosfano)-butano, el 1,2-bis-
5 (diciclohexilfosfano)-etano, el 2-(diciclohexilfosfano)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, el bis(difenilfosfino)ferroceno o el tris-(2,4-terc.-butilfenil)-fosfito.

Para la realización del procedimiento (b), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) se emplean, por mol de la halógenoxatiincaboxamida de la fórmula (IV), en general, desde 1 hasta 15 moles,
10 preferentemente desde 2 hasta 8 moles de derivado del ácido borónico de la fórmula (V).

Para la realización del procedimiento (c), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) se emplean, por mol de derivado de la oxatiincaboxamida del ácido borónico de la fórmula (VI), en general, desde 0,8 hasta
15 15 moles, preferentemente desde 0,8 hasta 8 moles de derivado de fenilo de la fórmula (VII).

Para la realización del procedimiento (d), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I) se emplean, por mol de la halógenoxatiincaboxamida de la fórmula (IV), en general, desde 0,8 hasta 15 moles,
20 preferentemente desde 0,8 hasta 8 moles de derivado de fenilo de la fórmula (VII) y desde 0,8 hasta 15 moles, preferentemente desde 0,8 hasta 8 moles del 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano.

Como diluyentes para la realización del procedimiento (e), según la invención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen los
25 hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como por ejemplo el éter de

- 58 -

petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano o la decalina; los éteres tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-t-butiléter, el metil-t-amiléter, el dioxano, el tetrahidrofurano, el 1,2-dimetoxietano o el 1,2-dietoxietano; los alcoholes, tales como el metanol, el etanol, el n- o i-propanol, el n-, i- sec.- o terc.-
5 butanol, el etanodiol, el propano-1,2-diol, el etoxietanol, el metoxietanol, el dietilenglicolmonometiléter, el dietilenglicolmonoetiléter, sus mezclas con agua o el agua pura.

El procedimiento (e), según la invención, se lleva a cabo en presencia de una base. Como tales entran en consideración todos los catalizadores que se emplean
10 usualmente para las hidrogenaciones. De manera ejemplificativa pueden citarse: níquel Raney, paladio o platino, en caso dado sobre un material de soporte, tal como, por ejemplo, el carbón activo.

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento (e), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a
15 temperaturas desde 0°C hasta 150°C, preferentemente a temperaturas desde 20°C hasta 110°C.

Como diluyentes para la realización del procedimiento (f), según la invención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen, preferentemente, los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como por
20 ejemplo el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno o la decalina; los hidrocarburos halogenados, tales como, por ejemplo, el clorobenceno, el diclorobenceno, el diclorometano, el cloroformo, el tetraclorometano, el dicloroetano o el triclorometano; los éteres tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-t-butiléter, el metil-t-amiléter, el
25 dioxano, el tetrahidrofurano, el 1,2-dimetoxietano, el 1,2-dietoxietano o el anisol; las

- 59 -

cetonas, tales como la acetona, la butanona, la metilisobutilcetona o la ciclohexanona; los nitrilos, tales como el acetonitrilo, el propionitrilo, el n- o i-butironitrilo o el benzonitrilo; las amidas, tales como la N,N-dimetilformamida, la N,N-dimetilacetamida, la N-metilformanilida, la N-metilpirrolidona o la
5 hexametilfósforotriamida; los ésteres tales como el acetato de metilo o el acetato de etilo; los sulfóxidos, tal como el dimetilsulfóxido; las sulfonas, tal como el sulfolano; los alcoholes, tales como el metanol, el etanol, el n- o i-propanol, el n-, i-, sec.- o terc.-butanol, el etanodiol, el propano-1,2-diol, el etoxietanol, el metoxietanol, el dietilenglicolmonometiléter, el dietilenglicolmonoetiléter, sus mezclas con agua o el
10 agua pura.

El procedimiento (f), según la invención, se llevará a cabo, en caso dado, en presencia de un ácido. Como tales entran en consideración todos los ácidos protónicos inorgánicos y orgánicos así como los ácidos de Lewis, igual que todos los ácidos polímeros. A estos pertenecen, por ejemplo, el ácido clorhídrico, el ácido sulfúrico, el
15 ácido fosfórico, el ácido fórmico, el ácido acético, el ácido trifluoracético, el ácido metanosulfónico, el ácido trifluormetanosulfónico, el ácido toluenosulfónico, el trifluoruro de boro (también en forma de eterato), el tribromuro de boro, el tricloruro de aluminio, el tetracloruro de titanio, el ortotitanato de tetrabutilo, el cloruro de cinc, el cloruro férrico-III, el pentacloruro de amonio, los intercambiadores de iones ácidos,
20 las arcillas ácidas y el gel de sílice ácido.

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento (f), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas desde 0°C hasta 150°C, preferentemente a temperaturas desde 20°C hasta 100°C.

25 Como diluyentes para la realización del procedimiento (g), según la invención,

- 60 -

entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen, preferentemente, los nitrilos, tales como el acetonitrilo, el propionitrilo, el n- o i-butironitrilo o el benzonitrilo o las amidas, tales como la N,N-dimetilformamida, la N,N-dimetilacetamida, la N-metilformanilida, la N-metilpirrolidona o la
5 hexametilfósforotriamida.

El procedimiento (g), según la invención, se lleva a cabo, en caso dado, en presencia de un aceptor de ácido adecuado. Como tales entran en consideración todas las bases inorgánicas u orgánicas usuales. A éstas pertenecen, preferentemente, los hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de
10 metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, tales como por ejemplo el hidruro de sodio, la amida de sodio, el metilato de sodio, el etilato de sodio, el terc.-butilato de potasio, el hidróxido de sodio, el hidróxido de potasio, el hidróxido de amonio, el acetato de sodio, el acetato de potasio, el acetato de calcio, el acetato de amonio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el bicarbonato de potasio, el bicarbonato
15 de sodio o el carbonato de amonio, así como las aminas terciarias, tales como la trimetilamina, la trietilamina, la tributilamina, la N,N-dimetilanilina, la N,N-dimetilbencilamina, la piridina, la N-metilpiperidina, la N-metilmorfolina, la N,N-dimetilaminopiridina, el diazabicyclooctano (DABCO), el diazabicyclononeno (DBN) o el diazabicycloundeceno (DBU).

20 El procedimiento (g), según la invención, se lleva a cabo en presencia de un catalizador.

Parece ello son adecuados, especialmente, las sales o los complejos de paladio. En este caso entran en consideración, preferentemente, el cloruro de paladio, el acetato de paladio, el tetraquis-(trifenilfosfina)-paladio. Igualmente puede formarse un
25 complejo de paladio en la mezcla de la reacción, cuando se añadan, separadamente, a

- 61 -

la reacción una sal de paladio y un ligando complejo

Como ligandos entran en consideración, preferentemente, compuestos organofosforados. De manera ejemplificativa pueden citarse: la trifenilfosfina, la tri-*o*-tolilfosfina, el 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo, el dicitclohexilfosfinabifenilo, el
5 1,4-bis(difenilfosfino)butano, el bisdifenilfosfinoferroceno, el di(terc.-butilfosfino)bifenilo, el di(ciclohexilfosfino)bifenilo, el 2-dicitclohexilfosfino-2'-N,N-dimetilaminobifenilo, la triciclohexilfosfina, la tri-terc.-butilfosfina. No obstante también puede desistirse de los ligandos.

El procedimiento (g), según la invención se llevará a cabo, además, en caso
10 dado en presencia de otra sal metálica, tales como sales de cobre, por ejemplo yoduro cuproso-(I).

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento (g), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas desde 20°C hasta 180°C, preferentemente a temperaturas desde 50°C
15 hasta 150°C.

Para la realización del procedimiento (g), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), se emplean, por mol de la halógenoxatiincaboxamida de la fórmula (IV), en general, desde 1 hasta 5 moles, preferentemente desde 1 hasta 2 moles de alquino de la fórmula (IX) o de alqueno de
20 la fórmula (X).

Como diluyentes para la realización del procedimiento (h), según la invención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen, preferentemente, los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como por ejemplo el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano,
25 el benceno, el tolueno, el xileno o la decalina; los hidrocarburos halogenados, tales

- 62 -

como, por ejemplo, el clorobenceno, el diclorobenceno, el diclorometano, el cloroformo, el tetraclorometano, el dicloroetano o el triclorometano; los éteres tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-t-butiléter, el metil-t-amiléter, el dioxano, el tetrahidrofurano, el 1,2-dimetoxietano, el 1,2-dietoxietano o el anisol; los
5 nitrilos, tales como el acetonitrilo, el propionitrilo, el n- o i-butironitrilo o el benzonitrilo; las amidas, tales como la N,N-dimetilformamida, la N,N-dimetilacetamida, la N-metilformanilida, la N-metilpirrolidona o la hexametilfósforotriamida; los ésteres tales como el acetato de metilo o el acetato de etilo; los sulfóxidos, tal como el dimetilsulfóxido; las sulfonas, tal como el sulfolano;
10 los alcoholes, tales como el metanol, el etanol, el n- o i-propanol, el n-, i-, sec.- o terc.-butanol, el etanodiol, el propano-1,2-diol, el etoxietanol, el metoxietanol, el dietilenglicolmonometiléter, el dietilenglicolmonoetiléter.

El procedimiento (h), según la invención, se lleva a cabo, en caso dado, en presencia de un aceptor de ácido adecuado. Como tales entran en consideración todas
15 las bases inorgánicas u orgánicas usuales. A éstas pertenecen, preferentemente, los hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos o los compuestos hidrocarbonados de los metales alcalinos, tales como, por ejemplo, el hidruro de sodio, el hidróxido de sodio, el hidróxido de potasio, la amida de sodio, la diisopropilamida de litio, el metilato de sodio, el etilato de sodio, el
20 terc.-butilato de potasio el metil-litio, el fenil-litio o el butil-litio.

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento (h), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas desde -80°C hasta 150°C, preferentemente a temperaturas desde
30°C hasta 80°C.

25 Para la realización del procedimiento (h), según la invención, para la obtención

de los compuestos de la fórmula (I), se emplean, por mol de la cetona de la fórmula (XI), en general, desde 1 hasta 5 moles, preferentemente desde 1 hasta 2 moles de compuesto del fósforo de la fórmula (XII).

Como diluyentes para la realización del procedimiento (i), según la invención, 5 entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen, preferentemente, los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como por ejemplo el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno o la decalina; los hidrocarburos halogenados, tales como por ejemplo el clorobenceno, el diclorobenceno, el diclorometano, el 10 cloroformo, el tetraclorometano, el dicloroetano o el tricloroetano; éteres tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-t-butiléter, el metil-t-amiléter, el dioxano, el tetrahidrofurano, el 1,2-dimetoxietano, el 1,2-dietoxietano o el anisol o amidas, tales como la N,N-dimetilformamida, la N,N-dimetilacetamida, la N-metilformanilida, la N-metilpirrolidona o la hexametilfósforotriamida.

15 El procedimiento (i), según la invención, se llevan a cabo en presencia de una base. Como tales entran en consideración todas las bases inorgánicas u orgánicas usuales. A estas pertenecen, preferentemente, los hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos tales como, por ejemplo, el hidruro de sodio, la amida de sodio, el 20 metilato de sodio, el etilato de sodio, el terc.-butilato de potasio, el hidróxido de sodio, el hidróxido de potasio, el hidróxido de amonio, el acetato de sodio, el acetato de potasio, el acetato de calcio, el acetato de amonio, el carbonato de sodio, el carbonato de potasio, el bicarbonato de potasio, el bicarbonato de sodio o el carbonato de cesio, así como aminas terciarias tales como la trimetilamina, la trietilamina, la tributilamina, 25 la N,N-dimetilanilina, la N,N-dimetil-bencilamina, la piridina, la N-metilpiperidina, la

N-metilmorfolina, la N,N-dimetilaminopiridina, el diazabicyclooctano (DABCO), el diazabicyclononeno (DBN) o el diazabicycloundeceno (DBU).

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento (i), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a
5 temperaturas desde 0°C hasta 150°C, preferentemente a temperaturas desde 20°C hasta 110°C.

Para la realización del procedimiento (i), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), se emplean, por mol de la oxatiincaboxamida de la fórmula (Ib), en general, desde 0,2 hasta 5 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 2
10 moles del halogenuro de la fórmula (XIII).

Todos los procedimientos según la invención se llevarán a cabo, en general, bajo presión normal. No obstante es posible, también, trabajar bajo presión mas elevada o a presión mas reducida - en general comprendida entre 0,1 bar y 10 bares-.

Los productos según la invención presentan un potente efecto microbiciida y
15 pueden emplearse en la práctica para combatir microorganismos indeseados, tales como hongos y bacterias, en la protección de las plantas y en la protección de los materiales.

Los agentes fungicidas se emplean en la protección de las plantas para la lucha contra los plasmodioforomicetes, oomicetes, quitridiomicetes, zigomicetes, ascomicetes, basidiomicetes y deuteromicetes.

20 Los agentes bactericidas se emplean en la protección de las plantas para combatir pseudomonadaceos, rizobiaceos, enterobacteriaceos, corinebacteriaceos y estreptomicetaceos.

Pueden citarse a modo de ejemplo, pero sin ningún carácter limitativo, algunos patógenos de enfermedades fúngicas y bacterianas, que entran dentro de las definiciones
25 generales anteriormente enumeradas:

- 65 -

- tipos de *Xanthomonas*, tales como por ejemplo *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;
- tipos *Pseudomonas*, tales como por ejemplo *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
- tipos de *Erwinia*, tales como por ejemplo *Erwinia amylovora*;
- tipos de *Pythium*, tal como por ejemplo *Pythium ultimum*;
- 5 tipos de *Phytophthora*, tal como por ejemplo *Phytophthora infestans*;
- tipos de *Pseudoperonospora*, tales como por ejemplo *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*;
- tipos de *Plasmopara*, tal como por ejemplo *Plasmopara viticola*;
- tipos de *Bremia*, tal como por ejemplo *Bremia lactucae*;
- 10 tipos de *Peronospora*, tales como por ejemplo *Peronospora pisi* o *P. brassicae*;
- tipos de *Erysiphe*, tal como por ejemplo *Erysiphe graminis*;
- tipos de *Sphaerotheca*, tal como por ejemplo *Sphaerotheca fuliginea*;
- tipos de *Podosphaera*, tal como por ejemplo *Podosphaera leucotricha*;
- tipos de *Venturia*, tal como por ejemplo *Venturia inaequalis*;
- 15 tipos de pirenofora, tal como por ejemplo *Pyrenophora teres* o *P. graminea*;
- (forma de conidios, *Drechslera*, sinónimo: *Helminthosporium*);
- tipos de *Cochliobolus*, tal como por ejemplo *Cochliobolus sativus*
- (forma de conidios, *Drechslera*, sinónimo: *Helminthosporium*);
- tipos de *Uromyces*, tal como por ejemplo *Uromyces appendiculatus*;
- 20 tipos de *Puccinia*, tal como por ejemplo *Puccinia recondita*;
- tipos de *Sclerotinia*, tal como por ejemplo *Sclerotinia sclerotiorum*;
- tipos de *Tilletia*, tal como por ejemplo *Tilletia caries*;
- tipos de *Ustilago*, tal como por ejemplo *Ustilago nuda* o *Ustilago avenae*;
- tipos de *Pellicularia*, tal como por ejemplo *Pellicularia sasakii*;
- 25 tipos de *Pyricularia*, tal como por ejemplo *Pyricularia oryzae*;

- 66 -

tipos de *Fusarium*, tal como por ejemplo *Fusarium culmorum*;

tipos de *Botrytis*, tal como por ejemplo *Botrytis cinerea*;

tipos de *Septoria*, tal como por ejemplo *Septoria nodorum*;

tipos de *Leptosphaeria*, tal como por ejemplo *Leptosphaeria nodorum*;

5 tipos de *Cercospora*, tal como por ejemplo *Cercospora canescens*;

tipos de *Alternaria*, tal como por ejemplo *Alternaria brassicae*;

tipos de *Pseudocercospora*, tal como por ejemplo *Pseudocercospora herpotrichoides*.

Los productos activos según la invención presentan también un potente efecto reforzador en las plantas. Estos son adecuados, por lo tanto, para movilizar las fuerzas de
10 resistencia propias de las plantas contra el ataque de los microorganismos indeseables.

Se entenderán, en este contexto, por productos reforzadores de las plantas (inductores de resistencia) aquellas sustancias que sean capaces de estimular el sistema inmunológico de las plantas de tal manera que, las plantas tratadas desarrollen una amplia resistencia contra los microorganismos cuando se produzca una inoculación ulterior con
15 estos microorganismos indeseados.

Debe entenderse por microorganismos indeseados, en el caso presente, hongos fitopatógenos, bacterias y virus. Los productos según la invención pueden emplearse, por lo tanto, para generar resistencia en las plantas, dentro de un lapso de tiempo determinado a partir del tratamiento, contra el ataque debido a los patógenos citados. El
20 lapso de tiempo, dentro del cual se provoca su resistencia, se extiende, en general, desde 1 hasta 10 días, preferentemente desde 1 hasta 7 días desde el tratamiento de las plantas con los productos activos.

La buena compatibilidad con las plantas y los productos activos a las concentraciones necesarias para la lucha contra las enfermedades de las plantas permite
25 un tratamiento de las partes aéreas de las plantas, de plantones y semillas y del suelo.

En este caso pueden emplearse los productos activos, según la invención, con un éxito especialmente bueno para la lucha contra las enfermedades de los cereales, tales como, por ejemplo, contra tipos de Puccinia y de las enfermedades de las plantaciones de viñedos, de frutales y de hortalizas, tal como, por ejemplo, contra tipos de Botrytis, de

5 Venturia o de Alternaria.

Los productos activos según la invención son adecuados también para aumentar el rendimiento de las cosechas. Además tiene una baja toxicidad y presentan una buena compatibilidad para con las plantas.

Los productos activos, según la invención, pueden emplearse, en caso dado, en

10 determinadas concentraciones y cantidades de aplicación, también como herbicidas, para influenciar el crecimiento de las plantas, así como para la lucha contra las plagas animales. Estos pueden emplearse en caso dado, también, a modo de productos intermedios y de producto de partida para la síntesis de otros productos activos.

Según la invención pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas.

15 Por plantas se entenderán en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los métodos convencionales y cultivo y de optimación o por medio de métodos biotecnológicos y de ingeniería genética, con inclusión de las plantas transgénicas y con

20 inclusión de las variedades de plantas que pueden ser protegidas o no por medio del derecho de protección de variedades vegetales. Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y

25 rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también las cosechas así como material de

reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento según la invención de plantas y partes de las plantas con los productos activos se lleva a cabo de manera directa o por acción sobre el medio ambiente, el biotopo o el recinto de almacenamiento según los métodos de tratamientos usuales, por ejemplo mediante inmersión, pulverizado, evaporación, nebulizado, esparcido, aplicación a brocha y, en el caso del material de reproducción, especialmente en el caso de las semillas, además por recubrimiento con una o varias capas.

Los productos según la invención pueden emplearse en la protección de los materiales industriales contra el ataque y la destrucción debidos a los microorganismos indeseables.

Se entenderán por materiales industriales en el presente contexto los materiales no vivos, que hayan sido elaborados para el empleo en la técnica. A modo de ejemplo los materiales técnicos, que quedarían protegidos contra las modificaciones o destrucciones microbianas por medio de los productos activos según la invención, son pegamentos, colas, papel y cartón, textiles, cuero, madera, pinturas y artículos de material sintético, lubricantes en frío y otros materiales. En el ámbito de los materiales a ser protegidos pueden citarse también partes de instalaciones de producción, por ejemplo circuitos cerrados de agua de refrigeración, que puedan quedar perjudicados por la multiplicación de los microorganismos. En el ámbito de la presente invención pueden citarse a modo de materiales técnicos preferentemente pegamentos, colas, papel y cartones, cuero, madera, pinturas, lubricantes en frío y líquidos caloportadores, de manera especialmente preferente la madera.

Como microorganismos, que pueden provocar la descomposición o la modificación de los materiales técnicos, pueden citarse a modo de ejemplos bacterias,

- 69 -

hongos, levaduras, algas y organismos mucilaginosos. Preferentemente los productos activos según la invención actúan contra hongos, especialmente contra mohos, hongos coloreadores y destructores de la madera (Basidiomycetes) así como contra organismos mucilaginosos y algas.

5 A modo de ejemplo pueden citarse los microorganismos de los tipos siguientes:

Alternaria, tal como *Alternaria tenuis*,

Aspergillus, tal como *Aspergillus niger*,

Chaetomium, tal como *Chaetomium globosum*,

Coniophora, tal como *Coniophora puetana*,

10 Lentinus, tal como *Lentinus tigrinus*,

Penicillium, tal como *Penicillium glaucum*,

Polyporus, tal como *Polyporus versicolor*,

Aureobasidium, tal como *Aureobasidium pullulans*,

Sclerophoma, tal como *Sclerophoma pityophila*,

15 Trichoderma, tal como *Trichoderma viride*,

Escherichia, tal como *Escherichia coli*,

Pseudomonas, tal como *Pseudomonas aeruginosa*,

Staphylococcus, tal como *Staphylococcus aureus*.

Los productos activos pueden transformarse, en función de sus respectivas
20 propiedades físicas y/o químicas, en las formulaciones usuales tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, pastas, granulados, aerosoles, microencapsulados en materiales polímeros y en masas de recubrimiento para semillas, así como formulaciones de nebulizado en frío y en caliente en volumen ultra-bajo (ULV).

Estas formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo por mezclado
25 de los productos activos con agentes extendedores, es decir disolventes líquidos, gases

licuados, que se encuentran a presión y/o materiales de soporte sólidos, en caso dado con empleo de agentes tensioactivos, es decir emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes generadores de espuma. En el caso del empleo de agua como agente extendedor pueden emplearse también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes

5 líquidos entran en consideración fundamentalmente: hidrocarburos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalinas, hidrocarburos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo fracciones de petróleo, alcoholes, tales como butanol o glicol, así como éteres y ésteres,

10 cetonas tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutylcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares, tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido así como agua. Por agentes extendedores o materiales de soporte gaseosos licuados se quieren indicar aquellos que son gaseosos a temperatura normal y bajo presión normal, por ejemplo gases propulsores para aerosol, tales como los hidrocarburos halogenados así

15 como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono. Como materiales de soporte sólidos entran en consideración, por ejemplo, harinas minerales naturales, tales como caolines, arcillas, talco, cretas, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y harinas minerales sintéticas, tales como ácido silícico altamente dispersado, óxido de aluminio y silicatos. Como materiales de soporte sólido para granulados entran en

20 consideración: por ejemplo minerales quebrados y fracciones tal como calcita, mármol, pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos constituidos a partir de harinas inorgánicas y orgánicas así como granulados constituidos a partir de material orgánico tales como serrín, cáscaras de nueces de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco. Como agentes emulsionantes y/o generadores de espuma entran en consideración: por

25 ejemplo emulsionantes no iónicos y aniónicos, tales como ésteres de ácidos grasos

polioxietilenados, éteres de alcoholes grasos polioxietilenados, por ejemplo alquilaril-poliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como hidrolizados de albúmina. Como dispersantes entran en consideración, por ejemplo lejías sulfíticas de lignina y metilcelulosa.

5 Pueden emplearse en las formulaciones adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulares o en forma de látex, tales como goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo así como fosfolípidos naturales, tales como cefalina y lecitina y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

10 Pueden emplearse colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrocianuro y colorantes orgánicos tales como colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálicos y materiales nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, de manganeso, de boro, de cobre, de cobalto, de molibdeno, de cinc.

15 Las formulaciones contienen en general entre 0,1 y 95 % en peso de producto activo, preferentemente entre 0,5 y 90 %.

Los productos activos según la invención puede presentarse como tales o en sus formulaciones también en mezcla den fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas o insecticidas conocidos, para ampliar, de este modo, por ejemplo el espectro de actividad
20 o el desarrollo de la resistencia. En muchos casos se obtienen efectos sinérgicos, es decir que la actividad de la mezcla es mayor que la actividad de los componentes individuales.

Como componentes de mezcla entran en consideración, por ejemplo, los compuestos siguientes:

Fungicidas:

25 2-fenilfenol; sulfato de 8-hidroxiquinolina; Acibenzolar-S-metilo; Aldimorph;

- Amidoflumet; Ampropyfos; Ampropyfos-potasio; Andoprim; Anilazine; Azaconazole;
 Azoxystrobin; Benalaxyl; Benalaxyl-M; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropilo;
 Benzamacril; Benzamacril-isobutilo; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol;
 Blasticidin-S; Boscalid; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamine; polisulfuro
 5 de calcio; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid;
 Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazone; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil;
 Chlozolate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole;
 Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofluand; Dichlone; Dichlorophen;
 Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenconazole; Difumetorim;
 10 Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap;
 Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon; Edifenphos;
 Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil;
 Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil;
 Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil;
 15 Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol;
 Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium;
 Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Furmecyclox; Guazatine;
 Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine
 triacetato; Iminoctadine tris(albesilato); Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione;
 20 Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-metilo;
 Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M;
 Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax;
 Mildiomycin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropilo;
 Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; ácido oxolónico;
 25 Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin; Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole;

- 73 -

- Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propanosine-sodio; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenox; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxifen;
- 5 Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabenzazazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-metilo; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-metilo; Tolyfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram;
- 10 Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanoamida; 1-(1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona; 2,3,5,6-tetracoloro-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-piridindicarbonitrilo; Actinovate; cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol;
- 15 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo; carbonato monopotásico; N-(6-metoxi-3-piridinil)-ciclopropanocarboxamida; N-butil-8-(1,1-dimetiletil)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amina; tetratiocarbonato de sodio; así como sales y preparaciones de cobre, tales como mezcla de Bordeaux; hidróxido de cobre; naftenato de cobre; oxiclouro de cobre; sulfato de cobre; Cufraneb; óxido cuproso; Mancopper; oxina de cobre.
- 20

Bactericidas:

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, dimetilditiocarbamato de níquel, Kasugamycin, Othilinson, ácido furanocarboxílico, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

- 25 **Insecticidas / acaricidas / nematocidas:**

- Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin, Allethrin isómero 1R, Alpha-Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflumet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-metilo,
- 5 Azinphos-etilo, Azocyclotin, *Bacillus popilliae*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* cepa EG-2348, *Bacillus thuringiensis* cepa GC-91, *Bacillus thuringiensis* cepa NCTC-11821, Baculovirus, *Beauveria bassiana*, *Beauveria tenella*, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bioallethrin, Bioallethrin-S-
- 10 ciclopentilo-isómero, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophos-etilo, Bromopropylate, Bromfenvinfos (-metilo), BTG-504, BTG-505, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Butylpyridaben, Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform,
- 15 Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-metilo, Chlorpyrifos (-etilo), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin, Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cycloprene,
- 20 Cycloprothrin, *Cydia pomonella*, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (isómero 1R-trans), Cyromazine, DDT, Deltamethrin, Demeton-S-metilo, Demeton-S-metilsulfona, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Diflubenzuron, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dinobuton, Dinocap, Dinotefuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-
- 25 sodio, Dofenapyn, DOWCO-439, Eflusilanate, Enamectin, Enamectin-benzoato,

- 75 -

- Empenthrin (isómero 1R), Endosulfan, Entomophthora spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos, Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin óxido, Fenfluthrin, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad,
- 5 Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipronil, Flonicamid, Fluacrypyrim, Fluazuron, Flubenzimine, Flubrocycythrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenerim, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Flupyrzofos, Flutenzin (Flufenzine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox (Fluproxyfen), Furathiocarb, Gamma-HCH,
- 10 Gossyplure, Grandlure, granulovirus, Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydramethylnone, Hydroprene, IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin, Japonilure, Kadethrin, poliedrovirus nucleares, Kinoprene, Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron, Malathion, Mecarbam,
- 15 Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodio, Methacrifos, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoprene, Methoxychlor, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazone, Mevinphos, Milbemectin, Milbemycin, MKI-245, MON-45700, Monocrotophos, Moxidectin, MTI-800, Naled, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, Niclosamide, Nicotine,
- 20 Nitenpyram, Nithiazine, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Noviflumuron, OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxydemeton-metilo, Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-metilo, Parathion (-etilo), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-6045, Phenothrin (isómero 1R-trans), Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon,
- 25 Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butóxido, Pirimicarb, Pirimiphos-metilo, Pirimiphos-

- 76 -

- etilo, Prallethrin, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propargite, Propetamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen, Quinalphos, Resmethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Spiromesifen, Sulfluramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121, Tau-Fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temiviphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin, Tetramethrin (isómero 1R), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hidrógeno oxalato, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodio, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralocythrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, Xylcarb, ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901, el compuesto carbamato de 3-metil-fenil-propilo (Tsumacide Z), el compuesto 3-(5-cloro-3-piridinil)-8-(2,2,2-trifluoretil)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitrilo (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) y el correspondiente isómero 3-endo (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (véanse las publicaciones WO-96/37494, WO-98/25923), así como preparados, que contengan extractos vegetales con acción insecticida, con nematodos, con hongos o con virus.

También es posible una mezcla con otros productos activos conocidos, tales como herbicidas, o con abonos y reguladores del crecimiento.

- Además, los compuestos según la invención de la fórmula (I) presentan también efectos antimicóticos muy buenos. Tienen un espectro de actividad antimicótica muy

amplio, especialmente contra dermatofitos y blastomicetos, contra mohos y contra hongos difásicos (por ejemplo contra especies de *Candida*, tal como *Candida albicans*, *Candida glabrata*) así como *Epidermophyton floccosum*, especies de *Aspergillus*, tales como *Aspergillus niger* y *Aspergillus fumigatus*, especies de *Trichophyton*, tal como *Trichophyton mentagrophytes*, especies de microesporas, tal como *Microsporon canis* y *audouinii*. La enumeración de estos hongos no representa en modo alguno una limitación del espectro micótico a ser considerado sino que tiene únicamente un carácter orientativo.

Los productos activos se pueden emplear en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de las mismas tales como soluciones, suspensiones, polvos pulverizables, pastas, polvos solubles, agentes de empolvado y granulados listos para su utilización. La aplicación se efectúa de manera usual, por ejemplo mediante regado, pulverizado, empolvado, esparcido, espolvoreado, espumado, aplicación a brocha etc. Además es posible aplicar los productos activos según el procedimiento de volumen ultrabajo o inyectar en el suelo la preparación del producto activo o el propio producto activo. Igualmente pueden tratarse las semillas de las plantas.

Cuando se emplean los productos activos según la invención como fungicidas las cantidades de aplicación pueden variar dentro de amplios límites según el tipo de la aplicación. Cuando se tratan las partes de las plantas, las cantidades de aplicación de producto activo se encuentran, en general, entre 0,1 y 10.000 g/ha, preferentemente entre 10 y 1.000 g/ha. En el caso del tratamiento de las semillas las cantidades de aplicación del producto activo se encuentran, 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 caso del tratamiento del terreno, las cantidades de aplicación de producto activo se encuentran, en general, entre 0,1 y 10.000 g/ha, preferentemente entre 1 y 5.000g

/ha.

Tal como ya se ha indicado anteriormente, pueden tratarse según la invención todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente se tratan plantas y variedades de plantas así como sus partes de origen silvestre o que se obtienen por métodos de cultivos biológicos convencionales, tales como cruzamiento o fusión de protoplastos. En otra forma preferente de realización se tratan plantas y variedades de plantas transgénicas, que hayan sido obtenidas según métodos de ingeniería genética en caso dado en combinación con métodos convencionales (organismos genéticamente modificados) y sus partes. La expresión "partes" o bien "partes de plantas" o "componentes de plantas" ha sido anteriormente explicada

De manera especialmente preferente se tratan plantas, según la invención, de las variedades de plantas usuales en el mercado o que se encuentran en utilización. Por variedades de plantas se entienden plantas con nuevas propiedades ("características"), que se han cultivado tanto por medio de cultivo convencional, como por mutagenesis o por técnicas recombinantes de DNA. Estas pueden ser variedades, biotipos o genotipos.

Según los tipos de plantas o bien las variedades de las plantas, de su localización y de las condiciones de crecimiento (terreno, clima, periodo de vegetación, alimentación) pueden presentarse también por medio del tratamiento según la invención efectos sobreaditivos ("sinérgicos"). De este modo son posibles, por ejemplo, menores cantidades de aplicación y/o ampliaciones del espectro de actividad y/o un reforzamiento del efecto de los, productos empleables según la invención, mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas elevadas o bajas, mayor tolerancia contra la sequía o contra el contenido en sal del agua o bien del terreno, mayor rendimiento floral, recolección más fácil, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de las cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor

- 79 -

capacidad de almacenamiento y/o de transformación de los productos recolectados, que van mas allá del efecto esperable propiamente dicho.

A las plantas o bien variedades de plantas transgénicas (obtenidas mediante ingeniería genética) a ser tratadas, preferentemente, según la invención, pertenecen

5 todas las plantas, que han adquirido material genético mediante modificación por ingeniería genética, que proporcionan a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("características"). Ejemplos de tales propiedades son, un mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas altas o bajas, mayor tolerancia frente a la sequía o contra el contenido en sal del agua o bien del

10 terreno, mayor rendimiento floral, recolección más fácil, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de las cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor capacidad de almacenamiento y/o de transformación de los productos recolectados. Otros ejemplos, especialmente señalables para tales propiedades son la mayor resistencia de las plantas frente a las

15 pestes animales y microbianas, tal como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus así como una mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas se citaran las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, algodón, colza así como plantaciones de frutales (con los frutos manzana,

20 pera, cítricos y uva), debiéndose señalar especialmente maíz, soja, patata, algodón y colza. Como propiedades ("características") se señalará especialmente la mayor resistencia de las plantas frente a los insectos por medio de las toxinas generadas en las plantas, especialmente aquellas que se generan en las plantas por el material genético procedente de *Bacillus Thuringiensis* (por ejemplo por medio de los genes CryIA(a),

25 CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF así

- 80 -

como por sus combinaciones), (denominadas a continuación "plantas Bt"). Como propiedades ("características") deben señalarse además, especialmente, la mayor resistencia de las plantas frente a los hongos, las bacterias y los virus mediante resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexina, elicitores así como genes

5 de resistencia y proteínas y toxinas expresadas correspondientes. Como propiedades ("características") deben señalarse además, especialmente, la mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, Glyphosate o Phosphinotricin (por ejemplo gen "PAT"). Los genes que proporcionan las respectivas propiedades ("características")

10 deseadas pueden estar presentes también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas Bt" pueden citarse variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata, que se comercializan bajo las marcas registradas YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón),

15 Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes de los herbicidas pueden citarse variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja, que se comercializan bajo las marcas registradas Roundup Ready® (tolerancia contra Glyphosate, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia contra Phosphinothricin, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia contra imidazolinonas) y

20 STS® (tolerancia contra sulfonilureas por ejemplo maíz). Como plantas resistentes a los herbicidas (cultivadas convencionalmente con relación a la tolerancia a los herbicidas) pueden citarse también las variedades comercializadas para la denominación Clearfield® (por ejemplo maíz). Evidentemente estas manifestaciones son válidas también para las variedades de plantas desarrolladas en el futuro o bien que

25 se comercialicen o se desarrollen en el futuro con estas propiedades genéticas

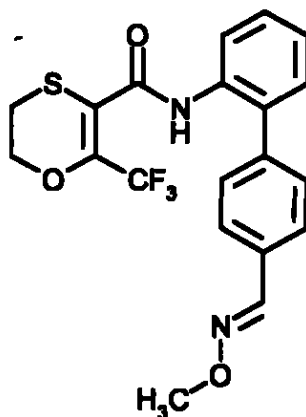
("características").

Las plantas indicadas pueden tratarse de manera especialmente ventajosa según la invención con los compuestos de la fórmula general (I) o bien de las mezclas de los productos activos según la invención. Los sectores preferentes, anteriormente citados, en el caso de los productos activos o bien de las mezclas, son válidos también para el tratamiento de estas plantas. Debe señalarse de manera especial el tratamiento de las plantas con los compuestos o bien con las mezclas indicadas especialmente en el presente texto.

La obtención y el empleo de los productos activos según la invención se desprenden de los ejemplos siguientes.

Ejemplos de obtención

Ejemplo 1



Procedimiento a)

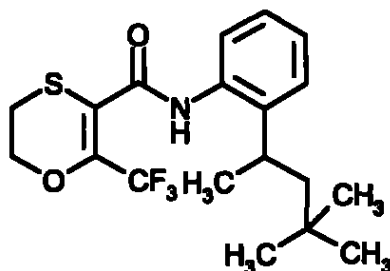
Se agita durante 2 días a temperatura ambiente una mezcla formada por 6 ml de diclorometano, 100 mg (0,467 mmoles) del ácido 6-trifluórmetil-2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-carboxílico, 88 mg (0,389 mmoles) de la O-metil-oxima del 2'-amino-bifenil-4-carbaldehído, 100,6 mg (0,778 mmoles) de la N,N-diisopropiletilamina y 272 mg (0,584 mmoles) de hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidinofosfonio. A continuación se

- 82 -

combina la mezcla de la reacción con 10 ml de agua, la fase orgánica se separa y, en primer lugar, se lava con 10 ml de solución saturada de cloruro de amonio y a continuación con 10 ml de agua, se seca sobre sulfato de sodio y se concentra por evaporación. El producto en bruto se purifica mediante HPLC preparativa (gel de sílice fase inversa (C₁₈), eluyente: agua/acetonitrilo 34:66).

Se obtienen: 35 mg (21 % de la teoría) de la [4'-(metoxiimino-metil)-bifenil-2-il]-amida del ácido 6-trifluormetil-2,3-dihidro-1,4-oxatiazin-5-carboxílico con el logP (pH 2,3) = 3,51.

Ejemplo 2



10

Procedimiento a)

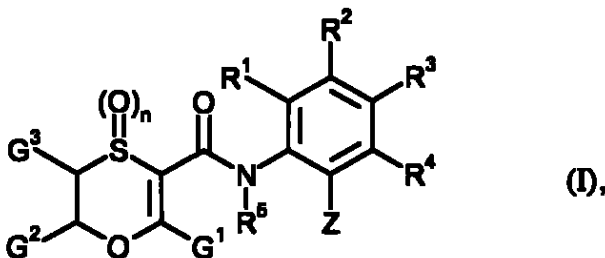
Se agitan 300 mg (1,7 mmoles) del cloruro 6-trifluormetil-2,3-dihidro-1,4-oxatiazin-5-carbonilo y 220 mg (1,1 mmoles) de la 2-(1,3,3-trimetil-butil)-fenilamina en 5 ml de acetonitrilo durante 4 días a temperatura ambiente en recipiente cerrado. A continuación se combina la mezcla de la reacción con 10 ml de agua, la fase orgánica se separa y se lava, en primer lugar, con 10 ml de solución saturada de cloruro de amonio, a continuación con 10 ml de agua, se seca sobre sulfato de sodio y se concentra por evaporación. El producto en bruto se purifica mediante HPLC preparativa (gel de sílice fase inversa (C₁₈), eluyente: ácido acético al 2 %/acetonitrilo 25:75).

Se obtienen: 200 mg (37 % de la teoría) de la [2-(1,3,3-trimetil-butil)-fenil]-amida del ácido 6-trifluormetil-2,3-dihidro-1,4-oxatiazin-5-carboxílico con el logP (pH 2,3) = 4,18.

20

De manera análoga a la de los ejemplos 1 y 2, así como de acuerdo con las indicaciones en la descripción general de los procedimientos de obtención (a) hasta (h), según la invención, se obtuvieron también los compuestos de la fórmula (I) indicados en la tabla 1 siguiente.

5 Tabla 1



Nr.	Z	R ⁴	R ³	R ²	R ¹	R ⁵	n	G ²	G ³	G ¹	logP Pf.
3	1,3-dimetil-butilo	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	4,24
4	1,3,3-trimetil-butilo	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	4,53
5	4-flúor-3-metilfenilo	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	3,98
6	3,4-diclorofenilo	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	4,26
7	4-cloro-3-trifluórmetil- fenilo	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	4,30
8	4-isopropoxiiminometil- fenilo	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	4,57
9	4-trifluórmetilfenilo	H	H	H	H	H	0	H	CH ₃	CF ₃	4,06
10	cicloheptilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	137°C
11	ciclopentilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	159°C
12	-CH(CH ₃)-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	165°C
13	ciclohexilo	H	F	H	H	H	0	H	H	CF ₃	204-

Nr.	Z	R ⁴	R ³	R ²	R ¹	R ⁵	n	G ²	G ³	G ¹	logP Pf.
											205°C
14	ciclohexilo	H	Cl	H	H	H	0	H	H	CF ₃	169- 171°C
15	biciclo[2.2.1]hept-2-ilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	149°C
16	ciclooctilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	102°C
17	3,4-diclorofenilo	H	F	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,95
18	1,3-dimetil-butilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,92
19	3,4-diclorofenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,91
20	4-trifluormetilfenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,73
21	4-isopropoxiiminometil- fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,22
22	4-propoxiiminometilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,25
23	4-cloro-3-flúorfenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,62
24	3-cloro-4-flúorfenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,60
25	3-flúor-4-propoxiimino- metil-fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,42
26	4-cloro-2-metilfenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,00
27	4-bromofenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,70
28	ciclohexilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,69
29	3-flúor-4- trifluormetilfenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,75 114- 116°C

Nr.	Z	R ⁴	R ³	R ²	R ¹	R ^j	n	G ²	G ³	G ¹	logP Pf.
30	4-cloro-3-trifluórmetil-fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,03
31	(2-ciclohexil)-1-metil-etilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,71
32	3,5-difluórfenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,35 167°C
33	4-yodofenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,85
34	1-metil-3-butenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,33
35	4-flúor-3-metilfenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,65
36	3-flúor-4-metilfenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,62
37	(2-ciclopentilo)-1-metil-etilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,38
38	3-cloro-4-metilfenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,89
39	1-metil-butilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,63
40	4-(1-(3-propiniloxi-imino)-etil)-fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,76 125- 127°C
41	4-(1-amino-1-metoxi-imino-metil)-fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	1,96
42	1-metil-nonilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	5,48
43	4-bromo-2-flúorfenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,57
44	3-cloro-5-flúor-fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,60

Nr.	Z	R ⁴	R ³	R ²	R ¹	R ⁵	n	G ²	G ³	G ¹	logP Pf.
45	3-cloro-4-(1-metoxi- imino-etil)-fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,45
46	3-flúor-4-(1-metoxi- imino-etil)-fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,69
47	biciclo[2.2.1]hept-2-ilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,32
48	1-metil-hexilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,34
49	1-ciclohexiletilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,31
50	1,3-dimetil-butilo	H	F	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,94
51	1-etil-propilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,62
52	1-metil-butilo	H	F	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,67
53	3-cloro-4- trifluormetilfenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,98 100- 102°C
54	1,3-dimetil-pentilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,25
55	2-(2,2-diclorociclo- propil)-1-metil-etilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,92
56	4-(1-metoxiimino- propil)-fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,08
57	4-bromo-3-flúor-fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,69
58	1,3,3-trimetil-pentilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,48
59	biciclo[2.2.1]hept-2-ilo	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	5,36
60	-CH(CH ₃)-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -		H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,18

- 87 -

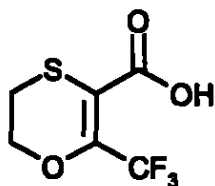
Nr.	Z	R ⁴	R ³	R ²	R ¹	R ⁵	n	G ²	G ³	G ¹	logP Pf.
61	4-trifluórmetilfenilo	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,08
62	4-metoxiiminometil- fenilo	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	3,81
63	1,3-dimetil-butilo	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,27
64	4-isopropoxiiminometil- fenilo	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,56
65	3,4-diclorofenilo	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,27
66	1,3,3-trimetil-butilo	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,51
67	3,4-diclorofenilo	H	F	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,32
68	3-flúor-4- propoxiiminometil-fenilo	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,77
69	3-flúor-4-metilfenilo	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	3,99
70	4-flúor-3-metilfenilo	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	3,99
71	3-flúor-4-trifluórmetil- fenilo	H	H	H	H	H	0	CH ₃	H	CF ₃	4,08
72	2-cloro-4-metoxiimino- fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,81
73	3,5-difluórfenilo	H	F	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,49
74	3,5-difluórfenilo	H	H	H	F	H	0	H	H	CF ₃	3,20
75	3,5-difluórfenilo	H	H	F	H	H	0	H	H	CF ₃	3,70
76	n-hexilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,25
77	1-etil-butilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,07

Nr.	Z	R ⁴	R ³	R ²	R ¹	R ⁵	n	G ²	G ³	G ¹	logP Pf.
78	4-cianofenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	2,87
79	2,4-diclorofenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,82
80	3,4-diclorofenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	ciclop ro- pilo	3,53
81	1,3,3-trimetil-butilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CHF ₂	4,29
82	1,3-dimetil-butilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CHF ₂	4,03
83	-CH(CH ₃)-CH ₂ -C(CH ₃) ₂ -	H	H	H	H	H	0	H	H	CHF ₂	4,00
84	3,4-diclorofenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CHF ₂	3,92
85	3-flúor-4-propoxiimino- metil-fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CHF ₂	4,52
86	4-metoxiiminometil- fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CHF ₂	
87	3-metil-1-propil-butilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,65
88	3-metil-1-etil-butilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,30
89	1,3-dimetil-1-butenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,32
90	1,3-dimetil-butilo	H	H	H	H	H	2	H	H	CF ₃	3,53
91	4-bromofenilo	H	H	H	H	H	2	H	H	CF ₃	3,35
92	4-cloro-2-metilfenilo	H	H	H	H	H	2	H	H	CF ₃	3,66
93	3,4-diclorofenilo	H	H	H	H	H	2	H	H	CF ₃	3,57
94	1,2-dimetil-butilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,88
95	4-cloro-3-flúorfenilo	H	H	H	H	H	2	H	H	CF ₃	3,28

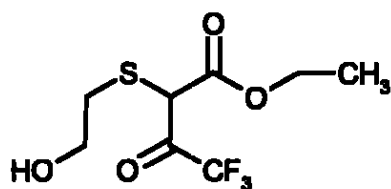
Nr.	Z	R ⁴	R ³	R ²	R ¹	R ⁵	n	G ²	G ³	G ¹	logP Pf.
96	(2-ciclopropilo)-1-metil- etilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,72
97	3,3-dimetil-1-butinilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,42
98	4-bromo-3-metilfenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	4,06
99	1,3-dimetil-butilo	H	H	H	H	-COCH ₃	0	H	H	CF ₃	4,56
100	4-(2,2,2-trifluor-N- metoxietanimidoil)fenilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	2,53
101	2,2-dicloro-1-metil- ciclopropilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,66
102	3-metilbutilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,72
103	3,3-dimetilbutilo	H	H	H	H	H	0	H	H	CF ₃	3,98

Obtención de los productos de partida de la fórmula (II)

Ejemplo (II-1)



Primera etapa (II-1a):



5

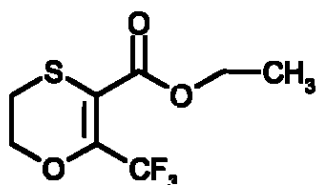
Se añaden, gota a gota, a una solución de 20,0 g (0,092 moles) de 2-cloro-3-ceto-4,4,4-trifluorobutirato de etilo en 100 ml de tolueno, aproximadamente a 5°C, 10,17 g (0,09 moles) de trietilamina. A continuación se añade gota a gota, en el transcurso de 1

- 90 -

hora una solución de 7,0 g (0,09 moles) de 2-mercaptoetanol en 5 ml de tolueno y se continua agitando durante 2 horas a 5°C aproximadamente. La suspensión se separa por filtración y se lava ulteriormente con un poco de tolueno. El filtrado se lava, en primer lugar, con 50 ml de ácido clorhídrico 1N, a continuación dos veces con 50 ml de solución saturada de bicarbonato de sodio, finalmente con 50 ml de agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se concentra por evaporación.

Se obtienen: 18,8 g (62 % de la teoría) del 4,4,4-trifluor-2-(2-hidroxi-etilsulfanil)-3-oxo-butirato de etilo (véase la publicación Heterocycles, 1998, 48, 2253-2262).

10 Segunda etapa (II-1b):

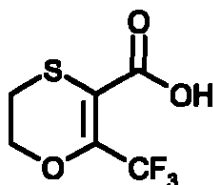


Se añaden a una solución de 18,7 g (0,071 moles) de 4,4,4-trifluor-2-(2-hidroxi-etilsulfanil)-3-oxo-butirato de etilo (II-1a), en 60 ml de tolueno, en primer lugar 6,25 g (0,079 moles) de piridina y a continuación se añaden, gota a gota, en el transcurso de 30 minutos, a 20°C, 4 g (0,079 moles) de cloruro de tionilo. Debido a que la reacción es exotérmica tiene que refrigerarse la temperatura de la mezcla de la reacción con agua helada. Tras el final de la reacción viva se continúa agitando durante otras 5 horas a temperatura ambiente. La mezcla se filtra y el residuo se lava con 10 ml de tolueno. Se añaden al filtrado, gota a gota, aproximadamente a 10°C, en el transcurso de 1 hora, 10,9 g (0,108 moles) de trietilamina y se agita durante 16 horas a temperatura ambiente. La mezcla de la reacción se lava, en primer lugar, dos veces con 50 ml de ácido clorhídrico 1N, a continuación dos veces con 50 ml de solución saturada de bicarbonato de sodio, finalmente con 50 ml de agua, se seca sobre sulfato de magnesio y se concentra por evaporación. El residuo se cromatografía con éter de petróleo/acetato de etilo (10:1 hasta

1:1) sobre gel de sílice.

Se obtienen: 12,6 g (59,4 % de la teoría) del 6-trifluórmetil-2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-carboxilato de etilo (véase la publicación Heterocycles 1998, 48, 2253-2262).

Tercera etapa:



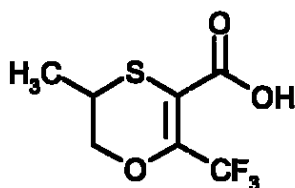
5

Se hierven 12,6 g (0,05 moles) del 6-trifluórmetil-2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-carboxilato de etilo (II-1b) y 3,14 g (0,08 moles) de hidróxido de sodio en 50 ml de agua durante 1 hora bajo reflujo. La mezcla de la reacción se refrigera y se extrae dos veces con diclorometano. La fase acuosa se acidifica a pH 2 con ácido clorhídrico 6 N,
10 a continuación se extrae 5 veces con dietiléter. Los extractos orgánicos, reunidos, se secan sobre sulfato de sodio y se concentran por evaporación.

Se obtienen: 9,2 g (82 % de la teoría) del ácido 6-trifluórmetil-2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-carboxílico.

De manera análoga a la del ejemplo (II-1) se obtuvieron también los
15 compuestos citados a continuación de la fórmula (II):

Ejemplo (II-2)

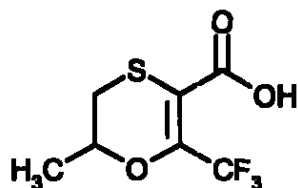


HPLC: logP = 1,69

Este compuesto es nuevo y constituye, igualmente, un objeto de la presente
20 solicitud.

Ejemplo (II-3)

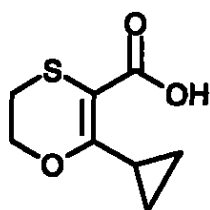
- 92 -



HPLC: logP = 1,72

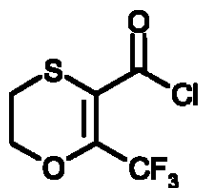
Este compuesto es nuevo y constituye, igualmente, un objeto de la presente solicitud.

5 Ejemplo (II-4)



Este compuesto es nuevo y constituye, igualmente, un objeto de la presente solicitud.

Ejemplo (II-5)



10

Se agitan 4,5 g (21 mmoles) del ácido 6-trifluórmethyl-2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-carboxílico (II-1) y 21 g de cloruro de tionilo en 10 ml de tolueno durante 4 horas a 80°C. El final de la reacción se determina por medio de la toma regular de muestras a partir de la solución de la reacción y se combinan con metanol, preparándose con las mismas a continuación cromatogramas de capa delgada.

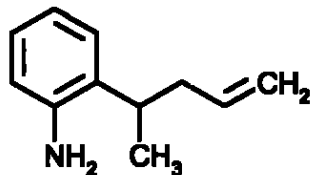
Tras el final de la reacción se eliminan por destilación los componentes volátiles. El residuo se agita tres veces con 20 ml, cada vez, de diclorometano y se vuelve a evaporar.

Se obtienen 4,5 g (80 % de la teoría) del cloruro de 6-trifluórmethyl-2,3-dihidro-

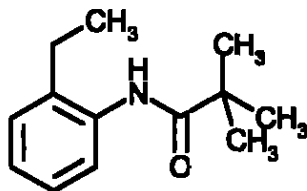
1,4-oxatiin-5-carbonilo. El producto se caracterizó por ebullición de una muestra del mismo durante 2 horas con metanol y se determinó por medio de GC/MS en 6-trifluórmetil-2,3-dihidro-1,4-oxatiin-5-carboxilato de metilo obtenido de este modo.

Obtención de los productos de partida de la fórmula (III)

5 Ejemplo (III-1)

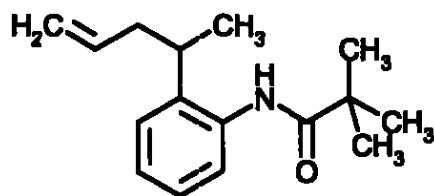


Primera etapa (III-1a)



- Se añaden, gota a gota, a una solución de 15 g (124 mmoles) de 2-etilanilina,
- 10 25 g (248 mmoles) de trietilamina en 150 ml de diclorometano a 0°C, 15 g (124 mmoles) de cloruro de pivaloilo y se agita durante 2 horas a 0°C y, a continuación, durante otras 16 horas sin refrigeración. La mezcla se diluye con diclorometano, en primer lugar se lava con agua y a continuación con solución de cloruro de amonio, la fase orgánica se separa, se seca sobre sulfato de sodio y se concentra por evaporación.
- 15 Se obtienen 25 g (98 % de la teoría) de la *N*-(2-etil-fenil)-2,2-dimetil-propionamida.

Segunda etapa (III-1b)



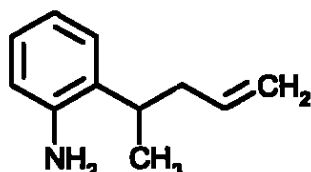
Se añaden a una solución formada por 5,6 g (0,0275 moles) de *N*-(2-etil-fenil)-

- 94 -

2,2-dimetil-propionamida (III-1a) en 150 ml de n-pentano/metil-t-butiléter (1:1), bajo argón, a -25°C, en primer lugar 3,7 g (0,03 moles) de diazabicyclo[2.2.2]octano (DABCO), a continuación 44,5 ml (0,058 moles) de solución de sec.-butil-litio (1,3 molar en hexano) y se agita durante otras 2 horas a la misma temperatura. Ahora se
 5 refrigera la mezcla a -78°C, se añaden, gota a gota, 3,33 g (0,0275 moles) de bromuro de alilo y se agita durante 60 minutos a -60 hasta -78°C. Los restos del sec.-butil-litio se descomponen mediante la adición de 30 ml de metanol. La mezcla se calienta hasta la temperatura ambiente, se sacude con 50 ml de ácido fosfórico al 5 %. La fase orgánica se separa, se filtra a través de gel de sílice y se purifica por medio de HPLC
 10 preparativa (gel de sílice fase inversa (C₁₈), eluyente: agua/acetonitrilo 38:62).

Se obtienen 1,8 g (26 % de la teoría) de la 2,2-dimetil-N[2-(1-metil-but-3-enil)-fenil]-propionamida.

Tercera etapa (III-1)



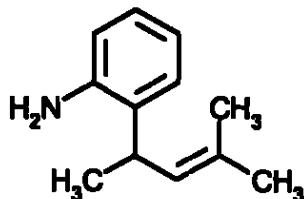
15 Se agitan 1,5 g (6,1 mmoles) de la 2,2-dimetil-N[2-(1-metil-but-3-enil)-fenil]-propionamida (III-1b) y 1,2 g (12,2 mmoles) de ácido clorhídrico concentrado en 24,5 ml de dioxano durante 12 horas a 80°C. La mezcla de la reacción se combina con 10 ml de agua y se alcaliniza con lejía diluida de hidróxido de sodio y se extrae 5 veces con acetato de etilo. Los extractos orgánicos, reunidos, se secan sobre sulfato de sodio
 20 y se concentran por evaporación, se filtra a través de gel de sílice (acetato de etilo/metanol 5:1) y se purifican mediante HPLC preparativa (gel de sílice de fase inversa (C₁₈), eluyente: ácido acético al 2 %/acetonitrilo 70:30).

Se obtienen 0,3 g (30 % de la teoría) de la 2-(1-metil-but-3-enil)-fenilamina.

- 95 -

De manera análoga a la del ejemplo (III-1) se obtuvieron también los compuestos de la fórmula (III) indicados a continuación.

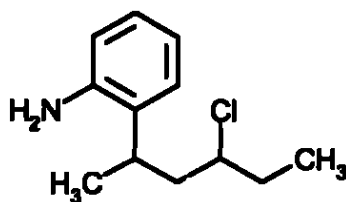
Ejemplo (III-2)



5 HPLC: logP = 1,19

Este compuesto es nuevo y constituye, igualmente, un objeto de la presente solicitud.

Ejemplo (III-3)



10 HPLC: logP = 2,3

Se obtiene la 2-(3-cloro-1-metilpentil)fenilamina (III-3) mediante la preparación, en primer lugar, de la *N*-[2-(2-ciclopropil-isopropil)fenil]-2,2-dimetilpropanoamida de manera análoga a la de los ejemplos (III-1a) y (III-1b). En la tercera etapa se hace reaccionar con ácido clorhídrico, con lo que se obtiene, además

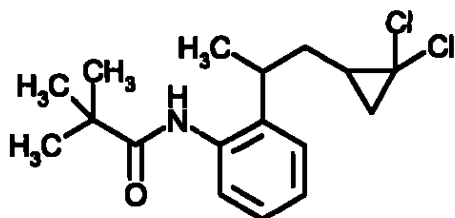
15 de la 2-(2-ciclopropil-isopropil)fenilamina, también el compuesto (III-3).

Ejemplo (III-4)

Primera etapa (III-4a)

204
203

- 96 -

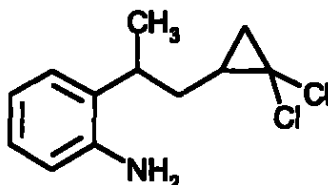


Se añaden, a una solución de la 2,2-dimetil-N-[2-(1-metil-but-3-enil)-fenil]-propionamida (III-1b), 900 mg (3,7 mmoles) en 5 ml de cloroformo/agua (1:1), sucesivamente, a temperatura ambiente, 100 mg de cloruro de benciltriethylamonio y 1
5 ml de lejía de hidróxido de sodio al 50 % y se agita durante 5 días. La mezcla de la reacción se diluye adicionalmente con 20 ml de cloroformo, se lava con 50 ml de solución de cloruro de sodio, se separa la fase orgánica, se seca sobre sulfato de sodio y se concentra por evaporación.

Se obtienen 800 mg (37 % de la teoría) de la *N*-{2-[2-(2,2-diclorociclopropil)-1-metiletil]-fenil}-2,2-dimetil-propionamida con el logP (pH 2,3) = 3,77.
10

Este compuesto es nuevo y constituye, igualmente, un objeto de la presente solicitud.

Segunda etapa (III-4b)



Se disuelven 800 mg (1,34 mmoles) de la *N*-{2-[2-(2,2-diclorociclopropil)-1-metiletil]-fenil}-2,2-dimetil-propionamida (III-4a) en 25 ml de dioxano y se combinan con 0,1 ml de ácido clorhídrico concentrado, se agitan durante 72 horas a temperatura ambiente y durante 24 horas a 80°C. La mezcla se diluye con agua helada, se alcaliniza con lejía concentrada de hidróxido de sodio y se extrae con 50 ml de acetato de etilo. La
20 fase orgánica se seca sobre sulfato de sodio y se concentra por evaporación a presión reducida. El residuo se filtra a través de gel de sílice con metanol y se purifica por medio

205
204

- 97 -

de HPLC preparativa (gel de sílice de fase inversa (C₁₈), eluyente: ácido fosfórico al 2 %/acetonitrilo 52:48).

Se obtienen 0,8 g (60 % de la teoría) de la 2-[2-(2,2-diclorociclopropil)-1-metiletil]-fenilamina con el logP (pH 2,3) = 2,52.

5 Este compuesto es nuevo y constituye, igualmente, un objeto de la presente solicitud.

La determinación de los valores logP indicados se lleva a cabo según la directiva EEC 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en una columna con inversión de fases (C 18). Temperatura: 43°C.

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

La calibración se llevó a cabo con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 hasta 16 átomos de carbono), cuyos valores de logP son conocidos (determinación de los valores logP por medio de los tiempos de retención mediante interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los valores lambda-máximos se determinaron por medio de los espectros UV desde 200 nm hasta 400 nm en los máximos de las señales cromatográficas.

Ejemplos de aplicación:

20 **Ejemplo A**

Ensayo con Venturia (manzano) / protector

Disolvente: 24,5 Partes en peso de acetona.

24,5 Partes en peso de dimetilacetamida.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquil-aril-poliglicoléter.

25 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de

emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

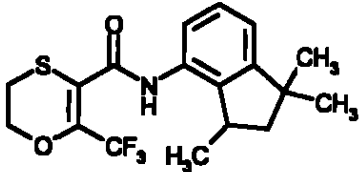
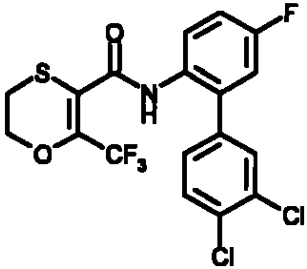
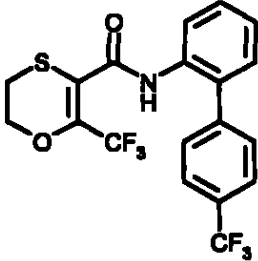
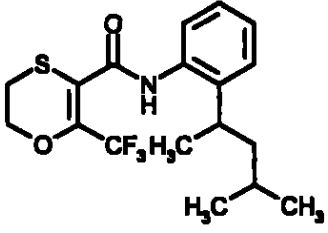
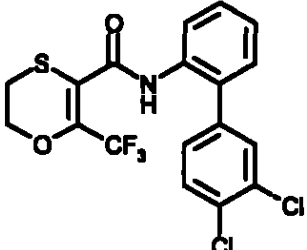
Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Tras el secado del recubrimiento, aplicado por pulverización, se inoculan las plantas con una
5 suspensión acuosa de conidios de la antracnosis del manzano *Venturia inaequalis* y permanecen 1 día a 20°C aproximadamente y con una humedad relativa del aire del 100 % en una cabina de incubación.

Las plantas se disponen, a continuación, en el invernadero aproximadamente a 21°C y con una humedad relativa del aire de aproximadamente el 90 %.

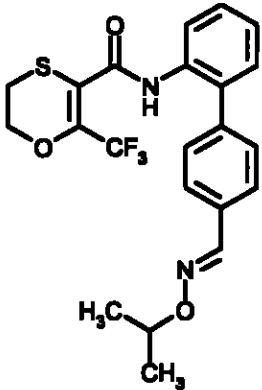
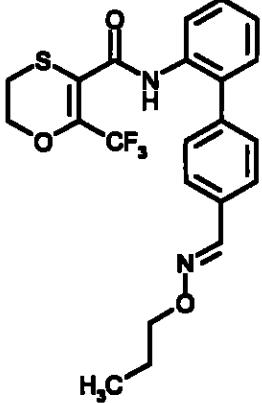
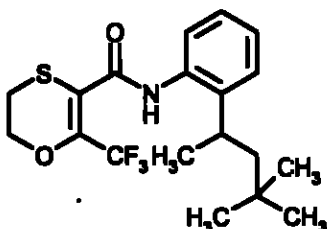
10 La evaluación se lleva a cabo a los 10 días desde la inoculación. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se ha observado ataque.

Los productos activos, las cantidades de aplicación y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla siguiente.

207
206

Tabla A: Ensayo con Venturia (manzano) / protector			
Ejem.	Producto activo	Cantidad empleada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
12		100	100
17		100	100
20		100	88
18		100	100
19		100	100

208
207

Tabla A: Ensayo con Venturia (manzano) / protector			
Ejem.	Producto activo	Cantidad empleada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
21		100	100
22		100	100
2		100	98

Ejemplo B**Ensayo con *Botrytis* (judías) / protector**

Disolvente: 24,5 Partes en peso de acetona.

24,5 Partes en peso de dimetilacetamida.

5 **Emulsionante:** 1 Parte en peso de alquil-aril-poliglicoléter.

Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

10 Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Tras el secado del recubrimiento, aplicado por pulverización, se disponen, sobre cada hoja, 2 trocitos de agar recubiertos con *Botrytis cinerea*. Las plantas inoculadas se disponen en una cámara oscurecida aproximadamente a 20°C y con una humedad relativa del aire del 100 %.

15 La evaluación se lleva a cabo a los 2 días desde la inoculación por medio de la magnitud de las manchas producidas por el ataque. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se ha observado ataque.

20 Los productos activos, las cantidades de aplicación y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla siguiente.

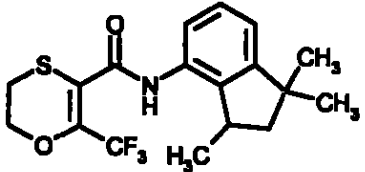
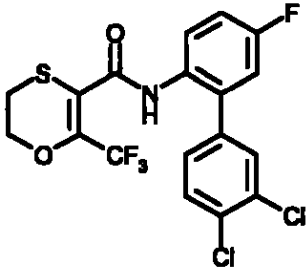
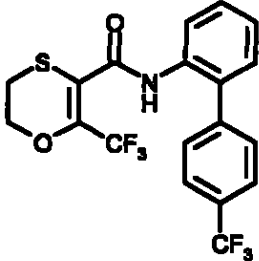
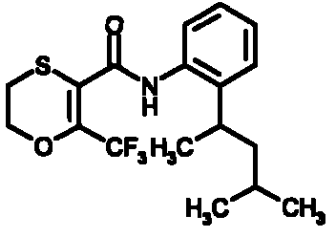
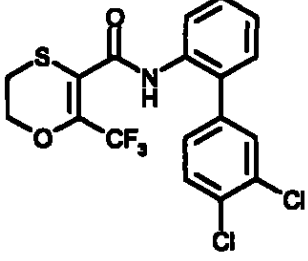
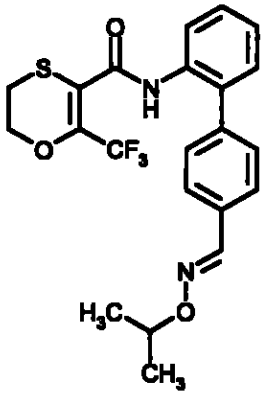
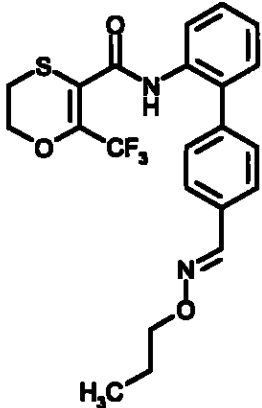
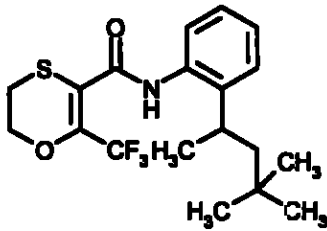
Tabla B: Ensayo con Botrytis (judías) / protector			
Ejem.	Producto activo	Cantidad empleada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
12		500	97
17		500	96
20		500	100
18		500	100
19		500	100

Tabla B: Ensayo con Botrytis (judías) / protector			
Ejem.	Producto activo	Cantidad empleada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
21		500	100
22		500	100
2		500	100

Ejemplo C**Ensayo con *Alternaria* (tomate) / protector**

Disolvente: 49 Partes en peso de N,N-dimetilformamida.

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

- 5 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla
1 parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de
emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

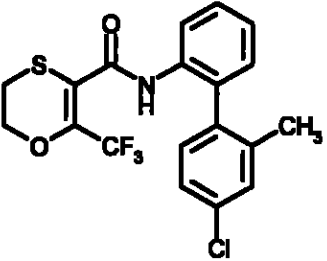
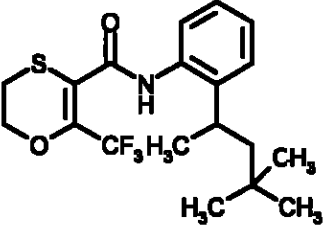
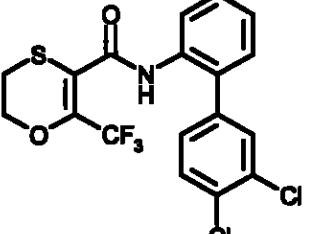
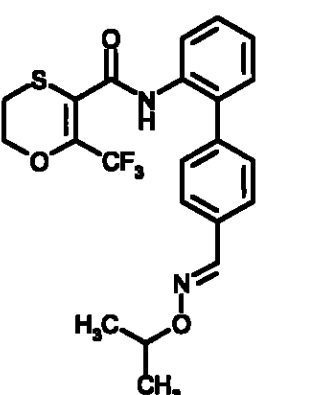
- Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes de tomate con
la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Al cabo de 1
10 día, desde el tratamiento, se inoculan las plantas con una suspensión de esporas de
Alternaria solani y se dejan reposar a continuación durante 24 horas con una humedad
relativa del aire del 100 % y a 20°C. A continuación se dejan reposar las plantas con
una humedad relativa del aire del 96 % y a una temperatura de 20°C.

- La evaluación se lleva a cabo a los 7 días desde la inoculación. En este caso 0
15 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que
un grado de actividad del 100 % significa que no se ha observado ataque.

 Los productos activos, las cantidades de aplicación y los resultados de los
ensayos pueden verse en la tabla siguiente.

213

212

Tabla C: Ensayo con Alternaria (tomate) / protector			
Ejem.	Producto activo	Cantidad empleada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
26		750	100
2		750	100
19		750	100
21		750	100

Ejemplo D**Ensayo con *Puccinia* (trigo) / protector**

Disolvente: N,N-dimetilformamida.

Emulsionante: Alquilarilpoliglicoléter.

5 Para la obtención de una preparación conveniente de producto activo, se mezcla 1 parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

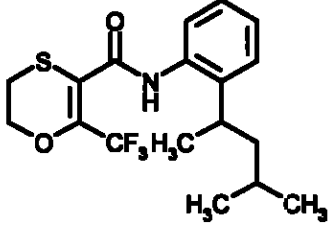
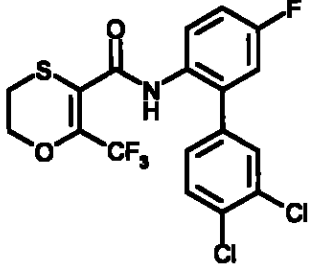
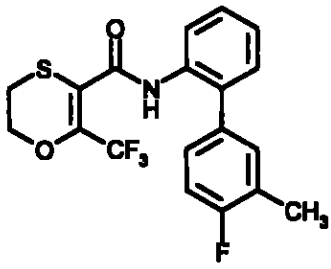
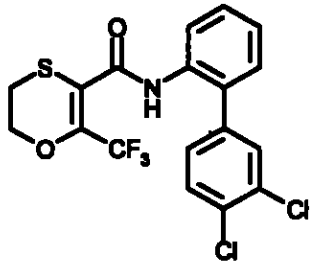
 Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Tras el secado
10 del recubrimiento, aplicado por pulverización, se pulverizan las plantas con una suspensión de conidios de *Puccinia recondita*. Las plantas permanecen durante 48 horas a 20°C y con una humedad relativa del aire del 100 % en una cabina de incubación.

 A continuación se disponen las plantas en un invernadero a una temperatura de
15 20°C aproximadamente y con una humedad relativa del aire del 80 % para favorecer el desarrollo de las pústulas de la roya

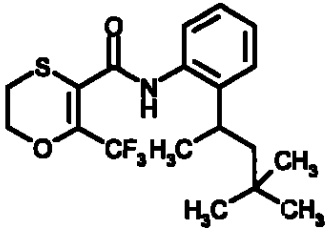
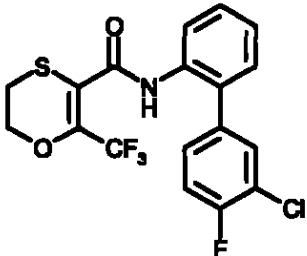
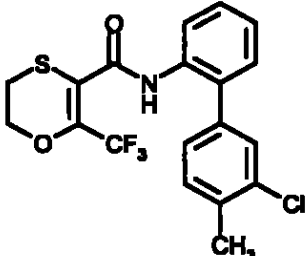
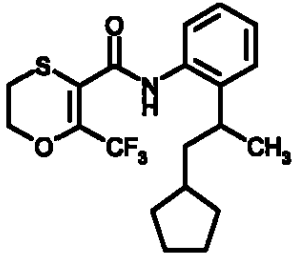
 La evaluación se lleva a cabo a los 10 días desde la inoculación. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se ha observado ataque.

20 Los productos activos, las cantidades de aplicación y los resultados de los ensayos pueden verse en la tabla siguiente.

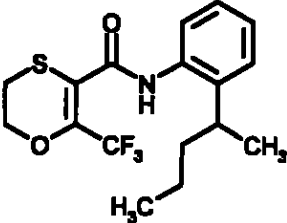
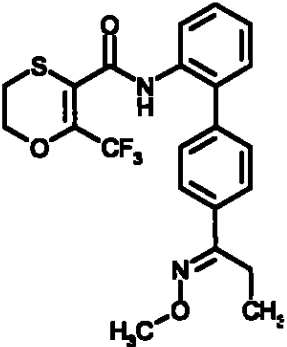
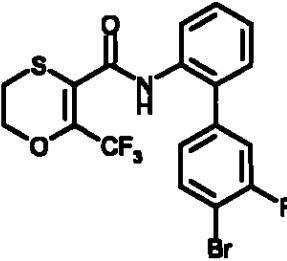
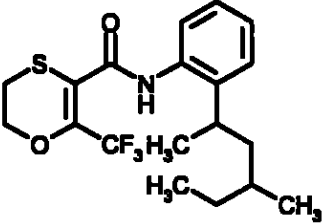
215
214

Tabla D: Ensayo con Puccinia (trigo) / protector				
Ejem.	Producto activo	Cantidad empleada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %	Partes en peso Disolvente/ Emulsionante
18		500	100	25/0.6
17		500	86	25/0.6
35		500	88	25/0.6
19		500	100	25/0.6

216
215

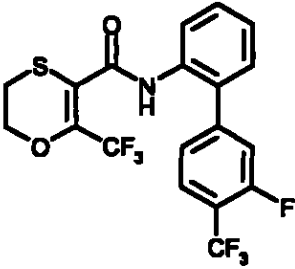
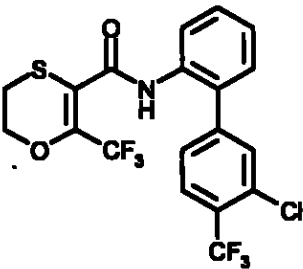
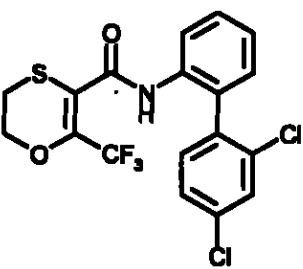
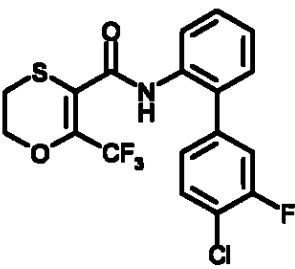
Tabla D: Ensayo con Puccinia (trigo) / protector				
Ejem.	Producto activo	Cantidad empleada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %	Partes en peso Disolvente/ Emulsionante
2		500	100	25/0.6
24		500	100	25/0.6
38		500	88	25/0.6
37		500	93	25/0.6

217
216

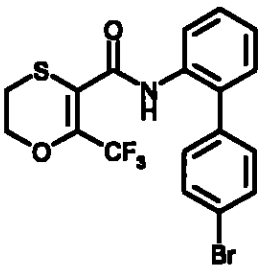
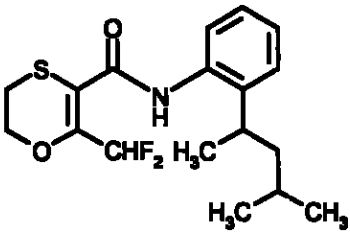
Tabla D: Ensayo con Puccinia (trigo) / protector				
Ejem.	Producto activo	Cantidad empleada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %	Partes en peso Disolvente/ Emulsionante
36		500	100	25/0.6
56		500	88	25/0.6
57		500	88	25/0.6
54		500	100	50/1.0

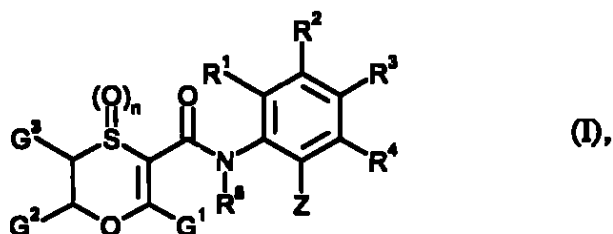
218

217

Tabla D: Ensayo con Puccinia (trigo) / protector				
Ejem.	Producto activo	Cantidad empleada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %	Partes en peso Disolvente/ Emulsionante
29		500	94	50/1.0
53		500	100	50/1.0
79		500	86	50/1.0
23		500	89	50/1.0

219
218

Tabla D: Ensayo con Puccinia (trigo) / protector				
Ejem.	Producto activo	Cantidad empleada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %	Partes en peso Disolvente/ Emulsionante
27		500	88	50/1.0
82		500	100	50/1.0

REIVINDICACIONES**1.- Oxatiincarboxamidas de la fórmula (I)**

en la que

- 5 **G¹** significa halógeno, trifluórmétilo, difluórmétilo o ciclopropilo,
 G² y G³ significan, independientemente entre sí, hidrógeno o metilo,
 n significa 0, 1 o 2,
 R¹, R², R³ y R⁴ significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro,
 metilo, iso-propilo o metiltio,
- 10 **R⁵** significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfínilo con 1 a
 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1
 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3
 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono,
 halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfínilo con 1 a
15 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,
 halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de
 carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con,
 respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, Formil-
 alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de
20 carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos
 de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; (halógenoalquilo con
 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono,

- (halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 7 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, (halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; $-\text{COR}^6$, $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ o $-\text{CH}_2\text{NR}^9\text{R}^{10}$,
- R^6 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; $-\text{COR}^{11}$,
- R^7 y R^8 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,
- R^7 y R^8 significan, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo con 5 hasta 8 átomos en el anillo, saturado,

substituido, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR¹²,

- 5 R⁹ y R¹⁰ significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

- 10 R⁹ y R¹⁰ significan, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo con 5 hasta 8 átomos en el anillo, saturado, substituido, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR¹².

- 15 R¹¹ significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de
20 carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R¹² significa hidrógeno o alquilo con 1 a 6 átomos de carbono,

Z significa Z¹, Z², Z³ o Z⁴, donde

- 25 Z¹ significa fenilo substituido, en caso dado, de una hasta cinco veces, de forma igual o de formas diferentes,

- Z²** significa cicloalquilo o bicicloalquilo substituidos, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes,
- Z³** significa alquilo con 2 a 20 átomos de carbono, insubstituido, o significa alquilo con 1 a 20 átomos de carbono substituido una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- Z⁴** significa alquenilo con 2 a 20 átomos de carbono o alquinilo con 2 a 20 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- o
- R¹, R² y R³** significan, independientemente entre sí, hidrógeno o flúor y
- Z y R⁴** forman, junto con los átomos de carbono, con los que están enlazados, un anillo carbocíclico o heterocíclico con 5 o 6 miembros, en caso dado substituido.
- 2.- Oxatiincarboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que**
- G¹** significa flúor, cloro, bromo, yodo, trifluórmétilo, difluórmétilo o ciclopropilo,
- G² y G³** significan, independientemente entre sí, hidrógeno o metilo,

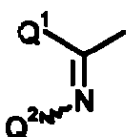
- n significa 0 o 2.
- 3.- Oxatiincarboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que
- R⁵ significa hidrógeno.
- 4.- Oxatiincarboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que
- 5 R¹ significa hidrógeno, flúor, cloro o metilo,
- R² significa hidrógeno, flúor, cloro, iso-propilo o metiltio,
- R³ significa hidrógeno, flúor, cloro o metilo,
- R⁴ significa hidrógeno, flúor, cloro o metilo.
- 5.- Oxatiincarboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que
- 10 Z significa Z¹,
- Z¹ significa fenilo substituido, en caso dado, de una a cinco veces, de
 forma igual o de formas diferentes, eligiéndose los substituyentes entre
 la lista W¹,
- W¹ significa halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxi, carbamoilo,
- 15 tiocarbamoilo;
- alquilo, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo,
 dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo respectivamente de
 cadena lineal o de cadena ramificada con, respectivamente, 1 hasta 8 átomos de
 carbono;
- 20 alquenoilo o alquenoilo respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada
 con, respectivamente, 2 hasta 6 átomos de carbono;
- halógenoalquilo, halógenoalcoxi, halógenoalquiltio, halógenoalquilsulfinilo o
 halógenoalquilsulfonilo respectivamente de cadena lineal o de cadena
 ramificada con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de carbono y 1 hasta 13
- 25 átomos de halógeno iguales o diferentes;

halógenoalqueno o halógenoalquenilo respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada con, respectivamente, 2 hasta 6 átomos de carbono y 1 hasta 11 átomos de halógeno iguales o diferentes;

5 alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada con 1 hasta 6 átomos de carbono en las respectivas cadenas hidrocarbonadas, alquenilcarbonilo o alquinilcarbonilo, con 2 hasta 6 átomos de carbono en las respectivas cadenas hidrocarbonadas;

10 cicloalquilo o cicloalquiloxi con, respectivamente, 3 hasta 6 átomos de carbono; alquileo con 3 o 4 átomos de carbono, oxialquileo con 2 o 3 átomos de carbono o dioxialquileo con 1 o 2 átomos de carbono, respectivamente doblemente enlazados, substituidos respectivamente, en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por oxo, por metilo, por trifluormetilo o por etilo;

15

o un agrupamiento  , donde

20

Q¹ significa hidrógeno, hidroxilo o alquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 hasta 4 átomos de carbono y 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo o cicloalquilo con 1 hasta 6 átomos de carbono y

Q² significa hidroxilo, Amino, metilamino, fenilo, bencilo o significa alquilo o alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, por ciano, por hidroxilo, por alcoxi, por alquiltio, por alquilamino, por dialquilamino o por fenilo, o significa alquenilo o

alquiniloxi con, respectivamente, 2 hasta 4 átomos de carbono, así como fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoileténilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquiloxi, fenilalquiltio, o heterociclilalquilo, con, respectivamente, 1 hasta 3 átomos de carbono en las respectivas partes alquilo substituidos respectivamente, en caso dado, en la parte anular de una a tres veces por halógeno, und/o por alquilo o por alcoxi con 1 hasta 4 átomos de carbono, de cadena lineal o de cadena ramificada.

5

6.- Oxatiincaboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

Z significa Z²,

10 Z² significa cicloalquilo o bicicloalquilo con, respectivamente, 3 hasta 10 átomos de carbono, substituidos respectivamente, en caso dado, de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

7.- Oxatiincaboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

15 Z significa Z³,

Z³ significa alquilo con 2 a 20 átomos de carbono insubstituido o significa alquilo con 1 a 20 átomos de carbono substituido una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo, por yodo y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por bromo, por yodo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono y/o por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

20

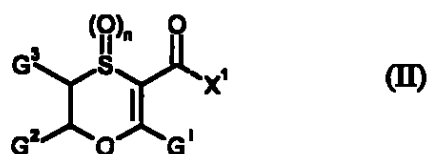
8.- Oxatiincaboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

25 Z significa Z⁴,

Z⁴ significa alquenilo con 2 a 20 átomos de carbono o alquinilo con 2 a 20 átomos de carbono substituidos respectivamente, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo, por yodo y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por flúor, por cloro, por bromo, por yodo, por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono y/o por halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

9.- Procedimiento para la obtención de las oxatiincarboxamidas de la fórmula (I), según la reivindicación 1, caracterizado porque

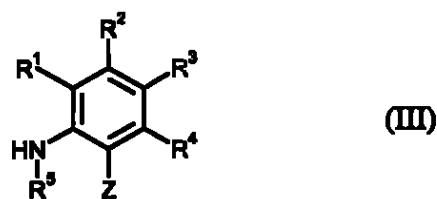
a) se hacen reaccionar derivados del ácido oxatiincarboxílico de la fórmula (II)



en la que

G¹, G², G³ y n tienen los significados indicados en la reivindicación 1 y

X¹ significa halógeno o hidroxilo, con derivados de anilina de la fórmula (III)



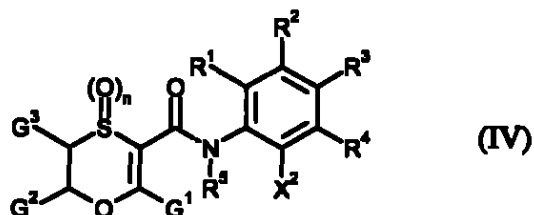
en la que

R¹, R², R³, R⁴, R⁵ y Z tienen los significados indicados en la reivindicación 1, en caso dado en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente de condensación, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido

228
227

y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o

- b) se hacen reaccionar halógenooxatiincarboxamidas de la fórmula (IV)

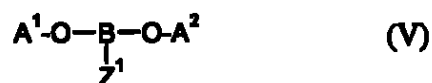


en la que

- 5 G¹, G², G³, n, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

X² significa bromo o yodo,

con derivados del ácido borónico de la fórmula (V)



- 10 en la que

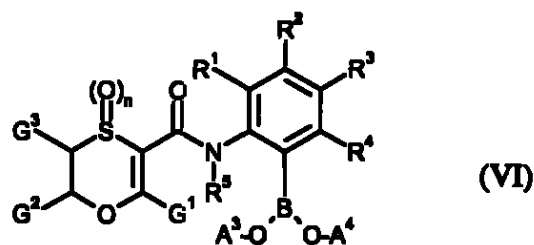
Z¹ tiene los significados indicados en la reivindicación 1 y

A¹ y A² significan, respectivamente, hidrógeno o conjuntamente significan tetrametiletileno,

en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente aceptor de

- 15 ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o

- c) se hacen reaccionar derivados de oxatiincarboxamida del ácido borónico de la fórmula (VI)



229
228

en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

A^3 y A^4 significan, respectivamente, hidrógeno o conjuntamente significan tetrametiletileno,

con derivados de fenilo de la fórmula (VII)



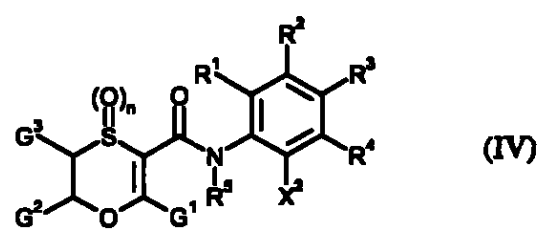
en la que

Z^1 tiene los significados indicados en la reivindicación 1 y

X^3 significa cloro, bromo, yodo o sulfonato de trifluórmethyl,

en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o

d) se hacen reaccionar halógenooxatiincarboxamidas de la fórmula (IV)

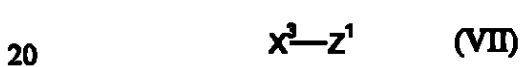


en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

X^2 significa bromo o yodo,

con derivados de fenilo de la fórmula (VII)

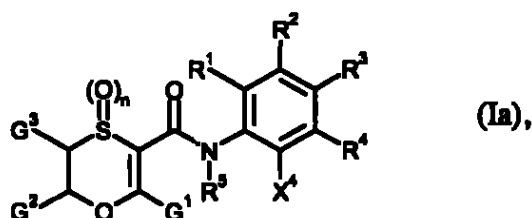


en la que

Z^1 tiene los significados indicados en la reivindicación 1 y

X^3 significa cloro, bromo, yodo o sulfonato de trifluórmétilo, en presencia de un catalizador de paladio o de níquel y en presencia de 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente, o

e) se hacen reaccionar oxatiincarboxamidas de la fórmula (Ia)



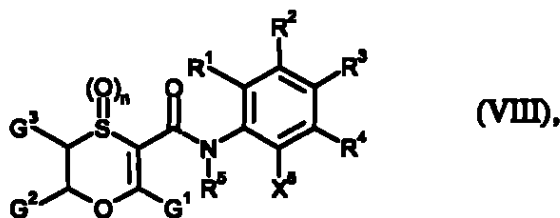
en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

X^4 significa alquénilo con 2 a 20 átomos de carbono o alquinilo con 2 a 20 átomos de carbono substituidos respectivamente, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un catalizador, o

f) se deshidratan hidroxialquiloxatiincarboxamidas de la fórmula (VIII)

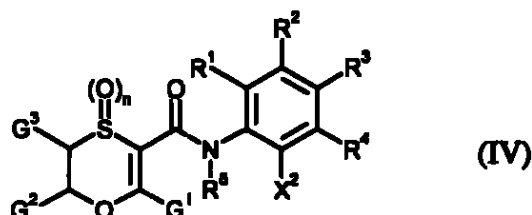


en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

5 X^3 significa hidroxialquilo con 2 a 20 átomos de carbono sustituido, en caso dado, además una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, en caso dado en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de un
10 ácido, o

g) se hacen reaccionar halógenooxatiincarboxamidas de la fórmula (IV)



en la que

15 G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

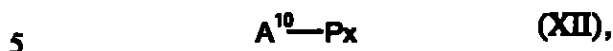
X^2 significa bromo o yodo,
con un alquino de la fórmula (IX)



en la que

20 A^5 significa alquilo con 2 a 18 átomos de carbono sustituido respectivamente, en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de

por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, con un compuesto del fósforo de la fórmula general (XII)



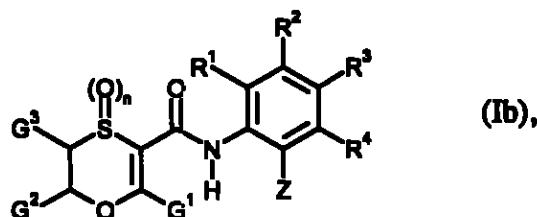
en la que

10 A^{10} significa alquilo con 1 a 18 átomos de carbono substituido, en caso dado, una o varias veces, de froma igual o de formas diferentes, por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

P_x significa un agrupamiento $-P^+(C_6H_5)_3 Cl^-$, $-P^+(C_6H_5)_3 Br^-$, $-P^+(C_6H_5)_3 I^-$, $-P(=O)(OCH_3)_3$ o $-P(=O)(OC_2H_5)_3$,

en caso dado en presencia de un diluyente, o

15 i) se hacen reaccionar oxatiincarboxamidas de la fórmula (Ib)



en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y Z tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

20 con halogenuros de la fórmula (XIII)



en la que

- R^{2.1}** significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, formil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; (halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 7 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 6 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, (halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (halógenoalcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-halógenoalquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; -COR⁶, -CONR⁷R⁸ o -CH₂NR⁹R¹⁰,

R^6, R^7, R^8, R^9 y R^{10} tienen los significados anteriormente indicados,

X^6 significa cloro, bromo o yodo,

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

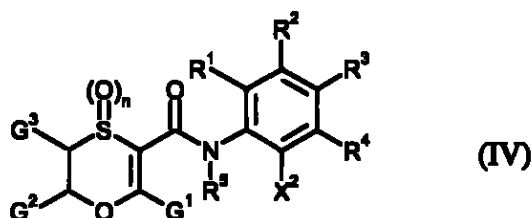
10.-Agentes para la lucha contra los microorganismos indeseados,
5 caracterizados por un contenido en, al menos, una oxatiincaboxamida de la fórmula (I), según la reivindicación 1, además de agentes extendedores y/o productos tensioactivos.

11.- Empleo de las oxatiincaboxamidas de la fórmula (I), según la reivindicación 1, para la lucha contra los microorganismos indeseados.

10 12.- Procedimiento para la lucha contra los microorganismos indeseados, caracterizado porque se aplican las oxatiincaboxamidas de la fórmula (I), según la reivindicación 1, sobre los microorganismos y/o sobre su medio ambiente.

13.- Procedimiento para la obtención de agentes para la lucha contra los microorganismos indeseados, caracterizado porque se mezclan oxatiincaboxamidas de
15 la fórmula (I), según la reivindicación 1, con agentes extendedores y/o con productos tensioactivos.

14.- Halógenooxatiincaboxamidas de la fórmula (IV)

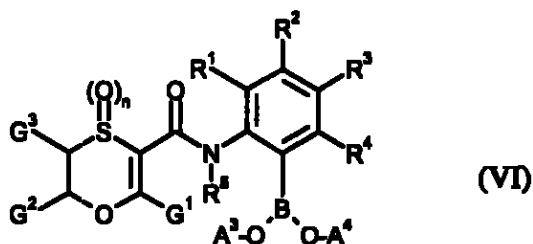


en la que

20 $G^1, G^2, G^3, n, R^1, R^2, R^3, R^4$ y R^5 tienen los significados indicados en la reivindicación 1, y

X^2 significa bromo o yodo.

15.- Derivados de la oxatiincarboxamida del ácido borónico de la fórmula (VI)

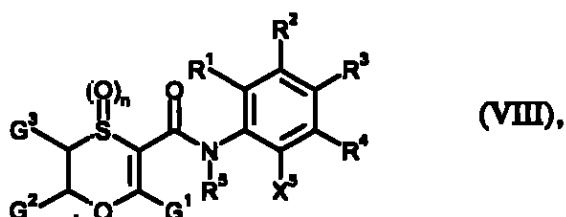


en la que

5 G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados indicados en la reivindicación 1, y

A^3 y A^4 significan, respectivamente, hidrógeno o, conjuntamente significan tetrametiletileno.

16.- Hidroxialquioxatiincarboxamidas de la fórmula (VIII)



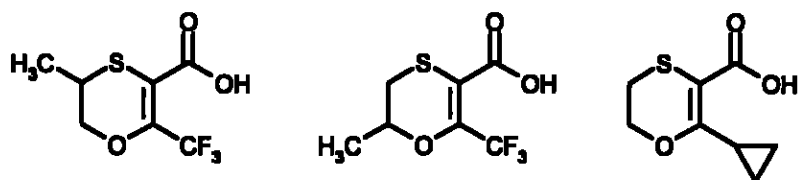
10 en la que

G^1 , G^2 , G^3 , n , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 tienen los significados indicados en la reivindicación 1, y

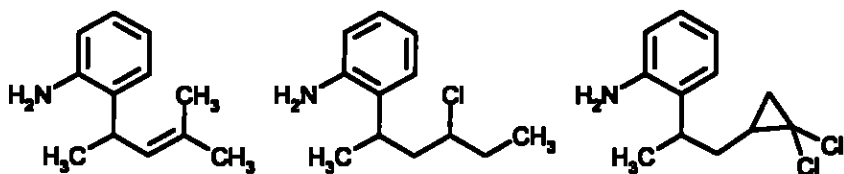
15 X^3 significa hidroxialquilo con 2 a 20 átomos de carbono substituido adicionalmente, en caso dado, una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno y/o por cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, pudiendo estar substituida la parte cicloalquilo, por su lado, en caso dado por halógeno y/o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

17.- Derivados del ácido oxatiincarboxílico de la fórmula (II) elegidos entre

- 129 -



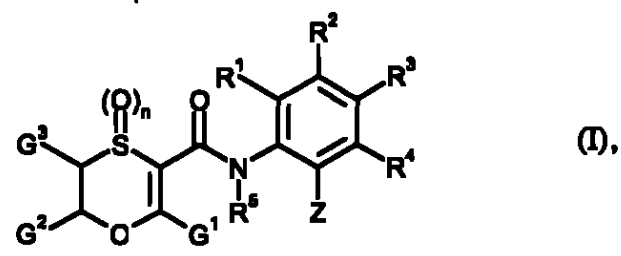
18.- Derivados de anilina de la fórmula (III) elegidos entre



258
237

RESUMEN

Nuevas oxatiincarboxamidas de la fórmula (I)



5 en la que

$G^1, G^2, G^3, n, R^1, R^2, R^3, R^4, R^5$ y Z tienen los significados indicados en la descripción, varios procedimientos para la obtención de estos productos y su empleo para la lucha contra los microorganismos indeseados, así como nuevos productos intermedios y su obtención.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.

PCT/EP2004/001053

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D327/06 A01N43/84

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC.

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A01N C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	HAHN, HOH-GYU ET AL: "Synthesis of trifluoromethylated dihydro-1,4-oxathiincarboxanilides and their fungicidal activity" HAN'GUK NONGHWA HAKHOECHI, 44(3), 191-196 CODEN: JKACA7; ISSN: 0368-2897, 2001, XP009038028 examples 18,19,40,41,52,53; table 1	1
X	Abstract	1-16
X	HAHN, HOH-GYU ET AL: "Synthesis of trifluoromethylated dihydro-1,4-oxathiin-3-carboxanilides through polymer-bound activated ester" HETEROCYCLES, 48(11), 2253-2261 CODEN: HTCYAM; ISSN: 0385-5414, 1998, XP009038022 page 2253, last paragraph; example 2 ----- -/--	1

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the international filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principles or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"A" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

13 October 2004

Date of mailing of the international search report

11.01.05

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.O. 5818 Patentplan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel: (+31-70) 340-2040, Tx: 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Goss, I

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/001053

240
239

C. (Continued) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 3 657 449 A (DAVIS ROBERT A ET AL) 18 April 1972 (1972-04-18) cited in the application the whole document	1-16
X	EP 0 545 899 A (BASF AG) 9 June 1993 (1993-06-09) page 28 - page 31; table 8	1-16

24T
240

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/EP2004/001053

Box II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

- ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
- ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful International Search can be carried out, specifically:
- ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this International application, as follows:

see additional sheet

- ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers all searchable claims.
- ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
- ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
- ☒ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

1-16

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

242
241

FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/ISA/ 210

This International Searching Authority found multiple (groups of) inventions in this international application, as follows:

1. claims: 1-16

Oxathiincarboxamide der Formel (I), Verfahren zu deren Herstellung und Verwendung zur Bekämpfung von Mikroorganismen

1.1. claim: 17

Oxathiincarbonsäurederivate der Formel (II) als Zwischenprodukte

2. claim: 18

Anilin-Derivaten der Formel (III) als Zwischenprodukte

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PC7/EP2004/001053

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 3657449	A	18-04-1972	CA 942189 A1	19-02-1974
EP 0545099	A	09-06-1993	AT 149487 T	15-03-1997
			AU 656243 B2	27-01-1995
			AU 2855492 A	27-05-1993
			CA 2081935 A1	23-05-1993
			CZ 9203448 A3	13-10-1993
			CZ 289478 B6	16-01-2002
			DE 59208113 D1	10-04-1997
			DK 545099 T3	24-03-1997
			EP 0545099 A2	09-06-1993
			ES 2098421 T3	01-05-1997
			GR 3023336 T3	29-08-1997
			HU 62861 A2	28-06-1993
			IL 183614 A	24-09-1998
			JP 3202079 B2	27-08-2001
			JP 5221994 A	31-08-1993
			JP 2001253802 A	18-09-2001
			JP 2001316210 A	13-11-2001
			KR 267518 B1	16-10-2000
			NZ 245194 A	27-02-1996
			PL 296677 A1	18-10-1993
			SK 344892 A3	08-03-1995
			US 5480897 A	02-01-1996
			US 5556988 A	17-09-1996
			US 5589493 A	31-12-1996
			US 5330995 A	19-07-1994
			ZA 9208977 A	19-05-1994

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/001053A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07D327/06 A01N43/84

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 A01N C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	HAHN, HOH-GYU ET AL: "Synthesis of trifluoromethylated dihydro-1,4-oxathiincarboxanilides and their fungicidal activity" HAN'GUK NONGHWA HAKHOECHI, 44(3), 191-196 CODEN: JKACA7; ISSN: 0368-2897, 2001, XP009038028 Beispiele 18,19,40,41,52,53; Tabelle 1	1
X	Abstract	1-16
X	HAHN, HOH-GYU ET AL: "Synthesis of trifluoromethylated dihydro-1,4-oxathiin-3-carboxanilides through polymer-bound activated ester" HETEROCYCLES, 48(11), 2253-2261 CODEN: HTCYAM; ISSN: 0385-5414, 1998, XP009038022 Seite 2253, letzter Absatz; Beispiel 2 ----- -/-	1

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen:

A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E Älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der Internationalen Recherche

13. Oktober 2004

Absenddatum des Internationalen Recherchenberichts

11.01.2005

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Beauftragter

Goss, I

245
244

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Seit. Anspruch Nr.
X	US 3 657 449 A (DAVIS ROBERT A ET AL) 18. April 1972 (1972-04-18) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument	1-16
X	EP 0 545 099 A (BASF AG) 9. Juni 1993 (1993-06-09) Seite 28 - Seite 31; Tabelle 8	1-16

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

internationales Aktenzeichen
PCT/EP2004/001053

Feld II Bemerkungen zu den Ansprüchen, die sich als nicht recherchierbar erwiesen haben (Fortsetzung von Punkt 2 auf Blatt 1)

Gemäß Artikel 17(2)a) wurde aus folgenden Gründen für bestimmte Ansprüche kein Recherchenbericht erstellt:

1. ☐ Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Gegenstände beziehen, zu deren Recherche die Behörde nicht verpflichtet ist, nämlich
2. ☐ Ansprüche Nr.
weil sie sich auf Teile der internationalen Anmeldung beziehen, die den vorgeschriebenen Anforderungen so wenig entsprechen, daß eine sinnvolle internationale Recherche nicht durchgeführt werden kann, nämlich
3. ☐ Ansprüche Nr.
weil es sich dabei um abhängige Ansprüche handelt, die nicht entsprechend Satz 2 und 3 der Regel 6.4 a) abgefaßt sind.

Feld III Bemerkungen bei mangelnder Einheitlichkeit der Erfindung (Fortsetzung von Punkt 3 auf Blatt 1)

Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, daß diese internationale Anmeldung mehrere Erfindungen enthält:

siehe Zusatzblatt

1. ☐ Da der Anmelder alle erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht auf alle recherchierbaren Ansprüche.
2. ☐ Da für alle recherchierbaren Ansprüche die Recherche ohne einen Arbeitsaufwand durchgeführt werden konnte, der eine zusätzliche Recherchegebühr gerechtfertigt hätte, hat die Behörde nicht zur Zahlung einer solchen Gebühr aufgefordert.
3. ☐ Da der Anmelder nur einige der erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren rechtzeitig entrichtet hat, erstreckt sich dieser internationale Recherchenbericht nur auf die Ansprüche, für die Gebühren entrichtet worden sind, nämlich auf die Ansprüche Nr.
4. ☒ Der Anmelder hat die erforderlichen zusätzlichen Recherchegebühren nicht rechtzeitig entrichtet. Der internationale Recherchenbericht beschränkt sich daher auf die in den Ansprüchen zuerst erwähnte Erfindung; diese ist in folgenden Ansprüchen erfaßt:
1-16

Bemerkungen hinsichtlich eines Widerspruchs

☐ Die zusätzlichen Gebühren wurden vom Anmelder unter Widerspruch gezahlt.

☐ Die Zahlung zusätzlicher Recherchegebühren erfolgte ohne Widerspruch.

227
246

WEITERE ANGABEN	PCT/ISA/ 210
Die internationale Recherchenbehörde hat festgestellt, dass diese internationale Anmeldung mehrere (Gruppen von) Erfindungen enthält, nämlich:	
1. Ansprüche: 1-16	
Oxathiincarboxamide der Formel (I), Verfahren zu deren Herstellung und Verwendung zur Bekämpfung von Mikroorganismen	
1.1. Anspruch: 17	
Oxathiincarbonsäurederivate der Formel (II) als Zwischenprodukte ---	
2. Anspruch: 18	
Anilin-Derivaten der Formel (III) als Zwischenprodukte ---	

INTERNATIONAL RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/001053

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument		Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 3657449	A	18-04-1972	CA 942189 A1	19-02-1974
EP 0545099	A	09-06-1993	AT 149487 T	15-03-1997
			AU 656243 B2	27-01-1995
			AU 2855492 A	27-05-1993
			CA 2081935 A1	23-05-1993
			CZ 9203448 A3	13-10-1993
			CZ 289478 B6	16-01-2002
			DE 59208113 D1	10-04-1997
			DK 545099 T3	24-03-1997
			EP 0545099 A2	09-06-1993
			ES 2098421 T3	01-05-1997
			GR 3023336 T3	29-08-1997
			HU 62861 A2	28-06-1993
			IL 103614 A	24-09-1998
			JP 3202079 B2	27-08-2001
			JP 5221994 A	31-08-1993
			JP 2001253802 A	18-09-2001
			JP 2001316210 A	13-11-2001
			KR 267518 B1	16-10-2000
			NZ 245194 A	27-02-1996
			PL 296677 A1	18-10-1993
			SK 344892 A3	08-03-1995
			US 5480897 A	02-01-1996
			US 5556988 A	17-09-1996
			US 5589493 A	31-12-1996
			US 5330995 A	19-07-1994
			ZA 9208977 A	19-05-1994

PCT-ANTRAG

1/6

LeA 36354-WO

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 02.02.2004 02:41:59 PM

0	Vom Anmeldeamt auszufüllen	
0-1	Internationales Aktenzeichen.	
0-2	Internationales Anmeldedatum	
0-3	Name des Anmeldeamts und "PCT International Application"	
0-4	Formular - PCT/RO/101 PCT-Antrag	
0-4-1	erstellt durch Benutzung von	PCT-EASY Version 2.92 (aktualisiert 01.11.2003)
0-5	Antragssersuchen Der Unterzeichnete beantragt, daß die vorliegende internationale Anmeldung nach dem Vertrag über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens behandelt wird	
0-6	(Vom Anmelder gewähltes) Anmeldeamt	Europäisches Patentamt (EPA) (RO/EP)
0-7	Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts	LeA 36354-WO
I.	Bezeichnung der Erfindung	OXATHIINCARBOXAMIDE
II	Anmelder	
II-1	Diese Person ist	nur Anmelder
II-2	Anmelder für	Alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US
II-4	Name	BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT
II-5	Anschrift:	Alfred-Nobel-Str. 50 D-40789 Monheim Deutschland
II-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
II-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
II-8	Telefonnr.	0214 30 29033
II-9	Telefaxnr.	0214 30 53482
III-1	Anmelder und/oder Erfinder	
III-1-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-1-2	Anmelder für	Nur US
III-1-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	DUNKEL, Ralf
III-1-5	Anschrift:	Krischer Str. 22 D-40789 Monheim Deutschland
III-1-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-1-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

0	Vom Anmeldeamt auszufüllen	
0-1	Internationales Aktenzeichen.	
0-2	Internationales Anmeldedatum	
0-3	Name des Anmeldeamts und "PCT International Application"	
0-4	Formular - PCT/RO/101 PCT-Antrag	
0-4-1	erstellt durch Benutzung von	PCT-EASY Version 2.92 (aktualisiert 01.11.2003)
0-5	Antragsersuchen Der Unterzeichnete beantragt, daß die vorliegende internationale Anmeldung nach dem Vertrag über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens behandelt wird	
0-6	(Vom Anmelder gewähltes) Anmeldeamt	Europäisches Patentamt (EPA) (RO/EP)
0-7	Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts	LeA 36354-WO
I	Bezeichnung der Erfindung	OXATHIINCARBOXAMIDE
II	Anmelder	
II-1	Diese Person ist	nur Anmelder
II-2	Anmelder für	Alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US
II-4	Name	BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT
II-5	Anschrift:	Alfred-Nobel-Str. 50 D-40789 Monheim Deutschland
II-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
II-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
II-8	Telefonnr.	0214 30 29033
II-9	Telefaxnr.	0214 30 53482
III-1	Anmelder und/oder Erfinder	
III-1-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-1-2	Anmelder für	Nur US
III-1-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	DUNKEL, Ralf
III-1-5	Anschrift:	Krischer Str. 22 D-40789 Monheim Deutschland
III-1-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-1-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

III-2	Anmelder und/oder Erfinder	
III-2-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-2-2	Anmelder für	Nur US
III-2-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	ELBE, Hans-Ludwig
III-2-5	Anschrift:	Dasnöckel 59 D-42329 Wuppertal Deutschland
III-2-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-2-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-3	Anmelder und/oder Erfinder	
III-3-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-3-2	Anmelder für	Nur US
III-3-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	RIECK, Heiko
III-3-5	Anschrift:	9 rue Claude Monet F-69110 Ste Foy les Lyon Frankreich
III-3-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-3-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	FR
III-4	Anmelder und/oder Erfinder	
III-4-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-4-2	Anmelder für	Nur US
III-4-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	GREUL, Nico, Jörg
III-4-5	Anschrift:	Am Sandberg 30 a D-42799 Leichlingen Deutschland
III-4-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-4-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-5	Anmelder und/oder Erfinder	
III-5-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-5-2	Anmelder für	Nur US
III-5-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike
III-5-5	Anschrift:	Oberer Markenweg 85 D-56566 Neuwied Deutschland
III-5-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-5-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-6	Anmelder und/oder Erfinder	
III-6-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-6-2	Anmelder für	Nur US
III-6-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	DAHMEN, Peter
III-6-5	Anschrift:	Altebrückerstr. 61 D-41470 Neuss Deutschland
III-6-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-6-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

252

251

PCT-ANTRAG

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 02.02.2004 02:41:59 PM

III-7	Anmelder und/oder Erfinder	
III-7-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-7-2	Anmelder für	Nur US
III-7-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	KUCK, Karl-Heinz
III-7-5	Anschrift:	Pastor-Löh-Str. 30a D-40764 Langenfeld Deutschland
III-7-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-7-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-8	Anmelder und/oder Erfinder	
III-8-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-8-2	Anmelder für	Nur US
III-8-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	HARTMANN, Benoit
III-8-5	Anschrift:	Färberstr. 1 D- 40223 Langenfeld * 40764 Deutschland
III-8-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	FR
III-8-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
IV-1	Anwalt oder gemeinsamer Vertreter; oder besondere Zustellanschrift:- Die unten bezeichnete Person ist/wird hiermit bestellt, um den (die) Anmelder vor den internationalen Behörden zu vertreten, und zwar als:	gemeinsamer Vertreter
IV-1-1	Name	BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT
IV-1-2	Anschrift:	Law and Patents, Patents and Licensing Kaiser-Wilhelm-Allee D-51368 Leverkusen Deutschland
IV-1-3	Telefonnr.	0214 30 29033

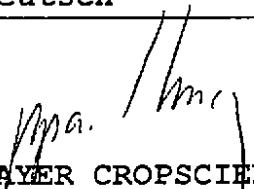
V	Bestimmung von Staaten	
V-1	Regionales Patent (andere Schutzrechtsarten oder Verfahren sind ggf. in Klammern nach der (den) betreffenden Bestimmung(en) angegeben)	AP: BW GH GM KE LS MW MZ SD SL SZ TZ UG ZM ZW und jeder weitere Staat, der Mitgliedstaat des Harare-Protokolls und Vertragsstaat des PCT ist EA: AM AZ BY KG KZ MD RU TJ TM und jeder weitere Staat, der Mitgliedsstaat des Eurasischen Patentübereinkommens und Vertragsstaat des PCT ist EP: AT BE BG CH&LI CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HU IE IT LU MC NL PT RO SE SI SK TR und jeder weitere Staat, der Mitgliedsstaat des Europäischen Patentübereinkommens und Vertragsstaat des PCT ist OA: BF BJ CF CG CI CM GA GN GQ GW ML MR NE SN TD TG und jeder weitere Staat, der Mitgliedstaat der OAPI und Vertragsstaat des PCT ist
V-2	Nationales Patent (andere Schutzrechtsarten oder Verfahren sind ggf. in Klammern nach der (den) betreffenden Bestimmung(en) angegeben)	AE AG AL AM AT AU AZ BA BB BG BR BW BY BZ CA CH&LI CN CO CR CU CZ DE DK DM DZ EC EE EG ES FI GB GD GE GH GM HR HU ID IL IN IS JP KE KG KP KR KZ LC LK LR LS LT LU LV MA MD MG MK MN MW MX MZ NA NI NO NZ OM PG PH PL PT RO RU SC SD SE SG SK SL SY TJ TM TN TR TT TZ UA UG US UZ VC VN YU ZA ZM ZW
V-3	Nationales Patent (Staaten, die dem PCT nach Veröffentlichung dieser PCT-EASY-Version beigetreten sind.)	und alle weiteren Staaten, die am Anmeldetag dem PCT angehören.
V-5	Erklärung bzgl. vorsorglicher Bestimmungen Zusätzlich zu den unter Punkten V-1, V-2 and V-3 vorgenommenen Bestimmungen nimmt der Anmelder nach Regel 4.9 Absatz b auch alle anderen nach dem PCT zulässigen Bestimmungen vor mit Ausnahme der nachstehend unter Punkt V-6 angegebenen Staaten. Der Anmelder erklärt, daß diese zusätzlichen Bestimmungen unter dem Vorbehalt einer Bestätigung stehen und jede zusätzliche Bestimmung, die vor Ablauf von 15 Monaten ab dem Prioritätsdatum nicht bestätigt wurde, nach Ablauf dieser Frist als vom Anmelder zurückgenommen gilt.	
V-6	Staaten, die von der Erklärung über vorsorgliche Bestimmungen ausgenommen werden	KEINE

254

253

PCT-ANTRAG

Original (für EINREICHUNG) - gedruckt am 02.02.2004 02:41:59 PM

VI-1	Priorität einer früheren nationalen Anmeldung beansprucht		
VI-1-1	Anmeldedatum	14 Februar 2003 (14.02.2003)	
VI-1-2	Nummer	10306244.0	
VI-1-3	Staat	DE	
VI-2	Priorität einer früheren nationalen Anmeldung beansprucht		
VI-2-1	Anmeldedatum	13 Mai 2003 (13.05.2003)	
VI-2-2	Nummer	10321270.1	
VI-2-3	Staat	DE	
VII-1	Gewählte internationale Recherchenbehörde	Europäisches Patentamt (EPA) (ISA/EP)	
VIII	Erklärungen	Anzahl der Erklärungen	
VIII-1	Erklärung hinsichtlich der Identität des Erfinders	-	
VIII-2	Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, ein Patent zu beantragen und zu erhalten	-	
VIII-3	Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen	-	
VIII-4	Erfindererklärung (nur im Hinblick auf die Bestimmung der Vereinigten Staaten von Amerika)	-	
VIII-5	Erklärung hinsichtlich unschädlicher Offenbarungen oder Ausnahmen von der Neuheitsschädlichkeit	-	
IX	Kontrolliste	Anzahl der Blätter	Elektronische Datei(en) beigelegt
IX-1	Antrag (inklusive Erklärungsblätter)	6	-
IX-2	Beschreibung	80	-
IX-3	Ansprüche	13	-
IX-4	Zusammenfassung	1	EZABST00.TXT
IX-5	Zeichnung(en)	0	-
IX-7	INSGESAMT	100	
	Beigelegte Unterlagen	Unterlage(n) in Papierform beigelegt	Elektronische Datei(en) beigelegt
IX-8	Blatt für die Gebührenberechnung	✓	-
IX-9	Original einer gesonderten Vollmacht		-
IX-13	Prioritätsbeleg(e)	Unterlage(n) VI-1, VI-2	-
IX-17	PCT-EASY-Diskette	-	Diskette
IX-19	Nr. der Abb. der Zeichn., die mit der Zusammenf. veröffentlicht werden soll		
IX-20	Sprache der int. Anmeldung	Deutsch	
X-1	Unterschrift des Anmelders, des Anwalts oder des Gemeinsamen Vertreters	 	
X-1-1	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESSELLSCHAFT	

ppa.Dr.Robert Krieg, i.V.Dr.Alexander Nowak

a

255
254

VOM ANMELDEAMT AUSZUFÜLLEN

10-1	Datum des tatsächlichen Eingangs dieser internationalen Anmeldung	
10-2	Zeichnung(en):	
10-2-1	Eingegangen	
10-2-2	Nicht eingegangen	
10-3	Geändertes Eingangsdatum aufgrund nachträglich, jedoch fristgerecht eingeg. Unterlage(n) oder Zeichnung(en) zur Vervollständigung dieser int. Anmeldung	
10-4	Datum des fristgerechten Eingangs der Berichtigung nach PCT Artikel 11(2)	
10-5	Internationale Recherchenbehörde	ISA/EP
10-6	Übermittlung des Recherchenexemplars bis zur Zahlung der Recherchegebühr aufgeschoben	

VOM INTERNATIONALEN BÜRO AUSZUFÜLLEN

11-1	Datum des Eingangs des Aktenexemplars beim Internationalen Büro	
------	---	--

Extract publications
folio 236



F RMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS



Reyni
Technologies S.A.
Calle 100 No. 100-100

255

Expediente No		250 91401	No de Follo
Item		No de unidades	✓
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMANO CARTA		
9	SOBRE BLANCO TAMANO OFICIO		
10	OTROS: X	1	✓

Observaciones:

un sobre q1 contiene
arte final

258
256

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

MIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 05 - 67,461
FECHA : SEPTIEMBRE 5 DE 2005

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicación : 80051461 00000000
Fecha (APO): 2005-09-09 17:27:18
Trámite : 011 PCI-PATENT 378 FASE NUCI 411 PRESENTAL
Dependencia: 2000 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

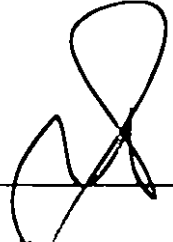
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	36494405	05/09/2005	48,923.640.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	443,000.00
		TOTAL :	\$ 443,000.00

SON: CUATROCIENTOS CUARENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

060 13549-841-023-5

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION ✓	()	()
MODELO DE UTILIDAD	()	()
- Indicación de que se solicita la concesión de una patente.	()	()
- Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	()	()
- Descripción de la invención.	()	()
- Dibujos de ser estos pertinentes.	()	()
- Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	()	()

COMPLETA () **INCOMPLETA** ()

DISEÑO INDUSTRIAL ()

- | | | |
|--|-----|-----|
| - Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial | () | () |
| - Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud. | () | () |
| - Representación gráfica o fotográfica del Diseño Industrial o muestra del Material que incorpora el diseño. | () | () |
| - Comprobante de pago de las tasas establecidas | () | () |

COMPLETA () **INCOMPLETA** ()

ESQUEMA DE TRAZADO ()

- | | | |
|--|-----|-----|
| - Indicación de que solicita el registro de un Esquema de trazado. | () | () |
| - Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta La solicitud. | () | () |
| - Representación gráfica del esquema de trazado | () | () |
| - Comprobante de pago de las tasas establecidas. | () | () |

COMPLETA () **INCOMPLETA** ()

Firma Responsable:

Fecha:

260
258

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BAYER CROPSCIENCE AG

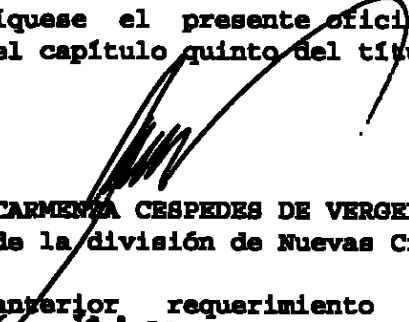
REFERENCIA	Radicación No.	5 91401
	Solicitud internacional	EP2004/001053
	Fecha inicio fase nacional	14/09/2005
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	9506

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No.10 de 2001.


ALIX CARMEN CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de
fecha 14 OCT. 2020
adpa11

PK
14/005

1