

OP



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

[Handwritten signature]

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

06-1324

21 **EXPEDIENTE No.** _____

54 **TÍTULO** _____

51 **CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL** _____

71 **SOLICITANTE** _____

DOMICILIO _____

74 **APODERADO** _____

22 **BOGOTÁ, D. C.,** _____


Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO

Radicación : 06001324 00000000

Folios: 238

Fecha (AMD): 2005-01-06 16:59:29

Trámite : 011 PCT-PATENT 376 FASE NACI 411 PRESENTAC

Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

**FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL**
SOLICITUD DE:

1

☒ Patente de Invención.

☐ Patente de Modelo de Utilidad.

☒ Capítulo I.

☐ Capítulo II.

2

**SOLICITANTE
(71)**

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

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

 Domicilio: Monheim
República Federal de Alemania

IDENTIFICACIÓN

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

3

**REPRESENTANTE
APODERADO**

 Nombre: **EMILIO FERRERO**
Dirección: Carrera 4ª. No. 72-35
Teléfono: 347 36 11
Fax: 211 86 50
E-mail: clientes@camvp.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**
9/11 Rue Pierre Du Pont,
Lyon- 69001
Francia

 3. **Benolt HARTMANN**
Färberstr. 1,
Langenfeld 40764
República Federal de Alemania

 5. **Ulrike WACHENDORFF-NEUMANN**
Oberer Markenweg 85,
Neuwied 56566
República Federal de Alemania

 7. **Karl-Heinz KUCK**
Pastor-Löh-Str. 30a,
Langenfeld 40764
República Federal de Alemania

 9. **Pierre-Yves COQUERON**
36, Rue de la Tête d'Or
Lyon-69007
Francia

 11. **Philippe DESBORDES**
30, Rue Bancel
Lyon-69004
Francia

 2. **Hans-Ludwig ELBE**
Dasnöckel 59,
Wuppertal 42329
República Federal de Alemania

 4. **Jörg Nico GREUL**
Am Sandberg 30 a,
Leichlingen 42799
República Federal de Alemania

 6. **Peter DAHMEN**
Alterbückenstr. 61,
Neuss 41470
República Federal de Alemania

 8. **Darren James MANSFIELD**
25, Montee Bonafous
Lyon-69004
Francia

 10. **Helko RIECK**
29 Allee Buffon,
Ste Foy les Lyon- 69110
Francia

5

PCT (86)

 Solicitud Internacional No. PCT/EP2004/007323

 Fecha: 5 de Julio 2004

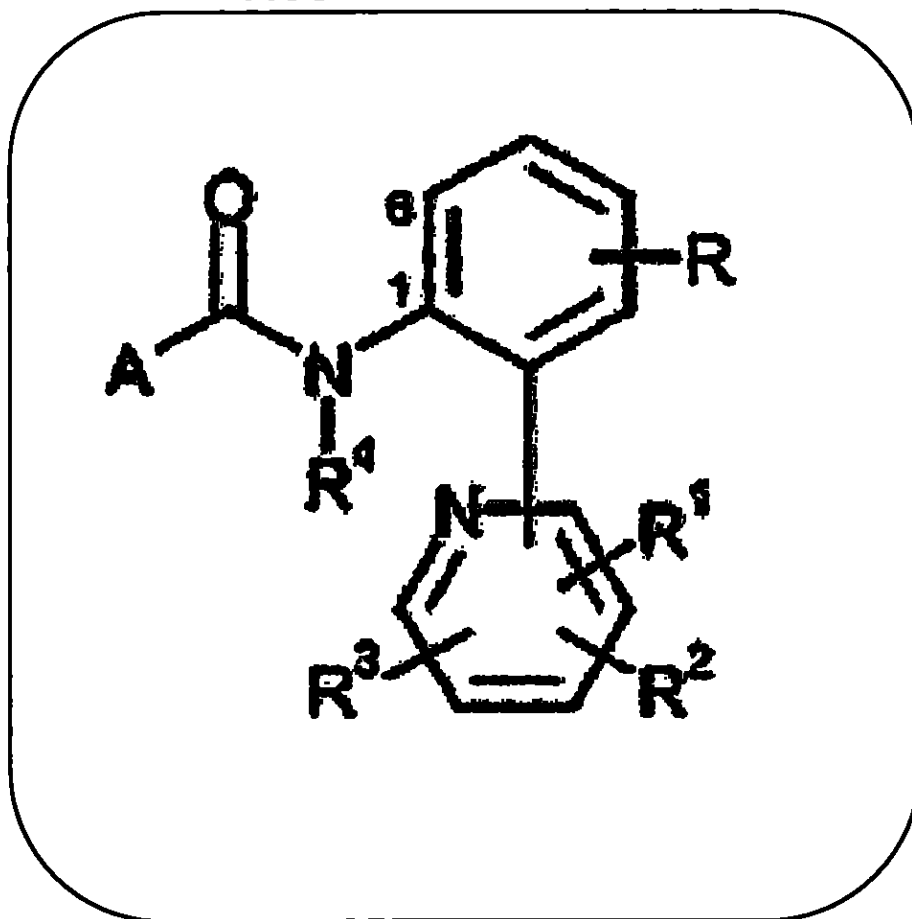
 Publicación Internacional No. WO2005/004606 A3

 Fecha: 20 de Enero 2005

6 Título (54) PIRIDINILANILIDAS			
7 Clasificación Internacional (51) <u>A01N 43/08</u>			
8 Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>EP</u>	(32) Fecha <u>10 de Julio 2003</u>	(31) Número de Solicitud <u>03015733.3</u>
9 Comprobante de pago No.: <u>06-268</u> Fecha: <u>3 de Enero 2006</u>			
10 Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por \$ 463.000.00. ☐ 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 DE DOCUMENTOS ANEXOS			

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

EMILIO FERRERO

FIRMA :

Emilio Ferrero

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

FCC

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ **Publicación Internacional WO 2005/004606 A3.**

Descripción:

Páginas 82 en el idioma original

Páginas 107 en español

Reivindicaciones: Número (s) 21

Figuras: Número (s)

2. ☒ **Forma PCT/ISA/210. Informe de Búsqueda Internacional.**
3. ☒ **Extracto de publicación.**

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
20 January 2005 (20.01.2005)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2005/004606 A2 not Sk

(51) International Patent Classification⁷: A01N 43/08,
43/10, 43/40, 43/54, 43/56, 43/58, 43/60, 43/76, 43/78,
C07D 213/61, 401/12, 417/12, 405/12, 411/12, 409/12

Claude Monet, F-69110 Ste Foy les LYON (FR). DES-
BORDES, Philippe (FR/FR); 30, Rue Bancel, F-69004
Lyon (FR).

(21) International Application Number:
PCT/EP2004/007323

(74) Common Representative: BAYER CROPSCIENCE
AG; Law and Patents, Patents and Licensing, 51368
Leverkusen (DE).

(22) International Filing Date: 5 July 2004 (05.07.2004)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
03015733.3 10 July 2003 (10.07.2003) EP

(71) Applicant (for all designated States except US): BAYER
CROPSCIENCE AG (DE/DE); Alfred-Nobel-Str. 50,
40789 Monheim (DE).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): DUNKEL, Ralf
[DE/DE]; Krischer Str. 22, 40789 Monheim (DE).
ELBE, Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329
Wuppertal (DE). HARTMANN, Benoit [FR/DE]; Für-
berstr. 1, 40764 Langenfeld (DE). GRELL, Jörg, Nico
[DE/DE]; Am Sandberg 30 a, 42799 Leichlingen (DE).
WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE];
Oberer Markweg 85, 56566 Neuwied (DE). DAHMEN,
Peter [DE/DE]; Altebrückerstr. 61, 41470 Neuss (DE).
KUCK, Karl-Helm [DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30a,
40764 Langenfeld (DE). MANSELD, Darren, James
[GB/FR]; 25, Montee Bonafous, F-69004 Lyon (FR).
COQUERON, Pierre-Yves [FR/FR]; 36, Rue de la Tete
d'Or, F-69007 Lyon (FR). BIECK, Helko [DE/FR]; 9 rue

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of national protection available): 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.

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI,
SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

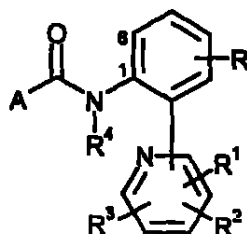
Published:

— without international search report and to be republished
upon receipt of that report

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette.

WO 2005/004606 A2

(54) Title: PYRIDINYLANILIDES



(1)

(57) Abstract: Novel pyridinylanilides of the formula (I) in which R, R¹, R², R³, R⁴
and A are as defined in the description, a plurality of processes for preparing these
substances and their use for controlling unwanted microorganisms, and also novel
intermediates and their preparation.

PCS 03 3007

B 8

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property
Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
20 January 2005 (20.01.2005)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2005/004606 A3

(51) International Patent Classification⁷: A01N 43/08,
43/10, 43/40, 43/54, 43/56, 43/58, 43/60, 43/76, 43/78,
C07D 213/61, 401/12, 417/12, 405/12, 411/12, 409/12

(74) Common Representative: BAYER CROPSCIENCE
AG; Law and Patents, Patents and Licensing, 51368
Leverkusen (DE).

(21) International Application Number:
PCT/EP2004/007323

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of national protection available): 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.

(22) International Filing Date: 5 July 2004 (05.07.2004)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
03015733.3 10 July 2003 (10.07.2003) EP

(71) Applicant (for all designated States except US): BAYER
CROPSCIENCE AG [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50,
40789 Monheim (DE).

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI,
SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): DUNKEL, Ralf
[DE/DE]; Krischer-Str. 22, 40789 Monheim (DE).
ELBE, Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329
Wuppertal (DE). HARTMANN, Benoit [FR/DE]; Ffir-
berstr. 1, 40764 Langenfeld (DE). GREUL, Jörg, Nico
[DE/DE]; Am Sandberg 30 a, 42799 Leichlingen (DE).
WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE];
Oberer Markweg 85, 56566 Neuwied (DE). DAHMEN,
Peter [DE/DE]; Altebrückenstr. 61, 41470 Neuss (DE).
KUCK, Karl-Helmut [DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30a,
40764 Langenfeld (DE). MANSFIELD, Darren, James
[GB/FR]; 25, Montee Bonafous, F-69004 Lyon (FR).
COQUERON, Pierre-Yves [FR/FR]; 36, Rue de la Tete
d'Or, F-69007 Lyon (FR). RIECK, Helko [DE/FR]; 9 rue
Claude-Monet, F-69110 Ste-Foy-les-LYON (FR). DES-
BORDES, Philippe [FR/FR]; 30, Rue Bancel, F-69004
Lyon (FR).

Published:

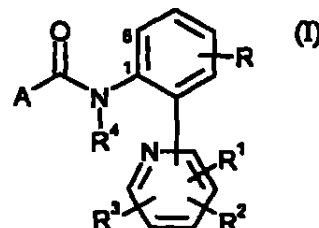
— with international search report
— before the expiration of the time limit for amending the
claims and to be republished in the event of receipt of
amendments

(88) Date of publication of the international search report:
21 April 2005

For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-
ning of each regular issue of the PCT Gazette.

WO 2005/004606 A3

(54) Title: PYRIDINYLANILIDES



(57) Abstract: Novel pyridinylanilides of the formula (I) in which R, R¹, R², R³, R⁴ and A are as defined in the description, a plurality of processes for preparing these substances and their use for controlling unwanted microorganisms, and also novel intermediates and their preparation.

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-¹³⁵⁴⁹
ATTORNEY ¹⁰⁴⁶⁶

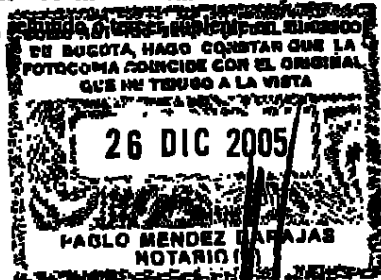
Yo (nosotros), abajo firmado (s)/I (we), the undersigned
Bayer CropScience AG

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

40789 Monheim, 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 párrafo 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.



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 (autorizo) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera entidades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden

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 or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

In addition, we grant a 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,

strativo, contencioso administrativo y judicial, así como los
arbitrajes de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes
asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, y
diseños 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, desistír, 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

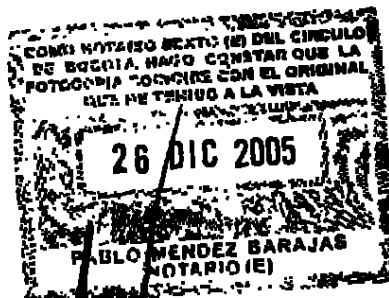
Firma

Signature

Bayer CropScience AG

Handwritten signature: H. B. C.

Handwritten signature: R. R. J.



NOTARIAL AUTHENTICATION (COMPANY)

NOTARIAL AUTHENTICATION (COMPANY)

ascribo Notario Certifica: Que la firma que antecede de
Dr. Axel Bader y Dr. Ralf-Rüdiger Jasse
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

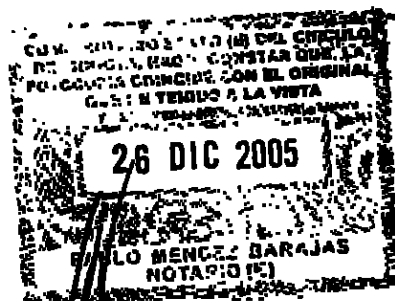
The undersigned Notary certifies: That the preceding signature
of
Dr. Axel Bader and Dr. Ralf-Rüdiger Jasse
is authentic, that the signatory currently acts in the position of
secretaries
of the company Bayer CropScience AG
a company currently existing and organized under the laws of
Germany
that the 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)



9
10
URNr. 242/2003

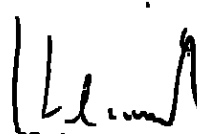
Ich beglaube die vor mir vollzogenen Unterschriften :

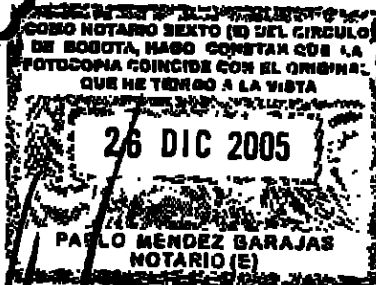
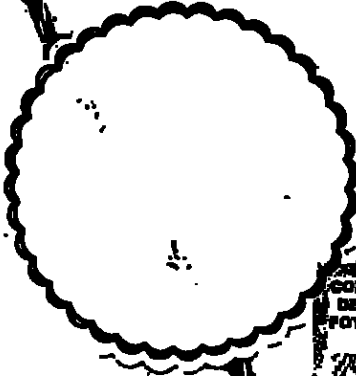
1. des Herrn Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,
2. des Herrn Dr. Axel Bader, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,

- 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 12. Februar 2003


Notar



APOSTILLE

(Convention de La Haye 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

6. am 17. FEB. 2003

5. in Köln

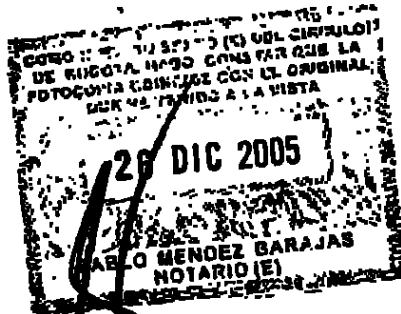
7. durch den Vizepräsidenten des Landgerichts Köln

8. unter Nr. 482103

9. Stempel/Siegel

10. Unterschrift

Lavin Caliebe



Kostenrechnung

	10,-
	10,-
GebS 100	EUR 13,-
	528
	68,08

Notar

10
✓

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.

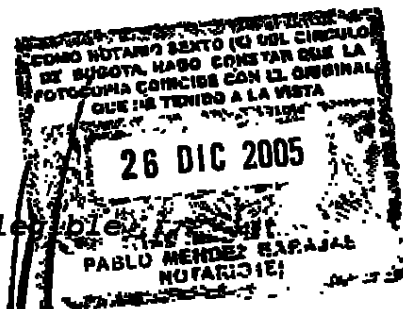
A continuación se traducen los sellos y legalizaciones de un documento escrito en inglés y español por medio del cual Bayer CropScience AG, domiciliado en Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Alemania, por el presente ratifica la solicitud de patente No. 03.005.574, presentada por EMILIO FERRERO el 28 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 19991
MINISTERIO DE JUSTICIA

12 #
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.

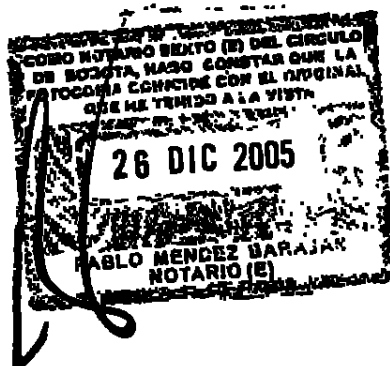
Respaldo:

Apostilla expedida por Alemania y certificado el 17 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

SDP 806
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
2003 MAR 18 P 12:24
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTA D.C.

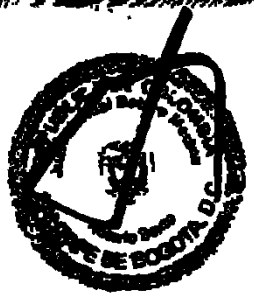
MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES.

208992
D.F. VARGAS
COTA-FIRMA AGARCE EN EL
DOCUMENTO DESEMPENA
LAS FUNCIONES INDICADAS

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

IDENTIFICADOS CON C.E. No.(s) _____
ES(SON) AUTENTICA(S)
SANTAFE DE BOGOTA, 18 MAR 2007

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA CONCORDA CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
26 DIC 2005
PABLO MENDEZ BARAJAS
NOTARIO (E)



13 ~~12~~

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.-

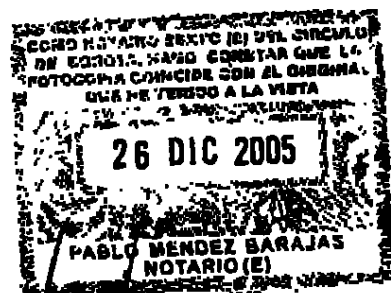
Traducción de los sellos y autenticaciones que aparecen en el documento de representación y poder, escrito en español e inglés, por medio del cual la firma Bayer CropScience AG, domiciliada en Alfred-Nobel-Str. 50, D 40789 Monheim, Alemania, otorga poder a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO, 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
Resolución 599 del 6 de marzo 1978

13
14

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)

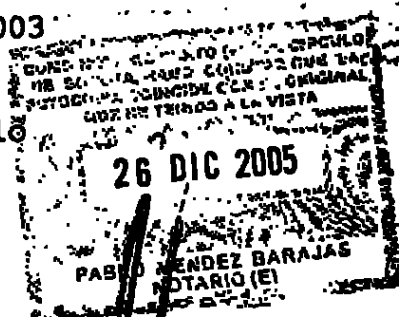
Fdo.: firma ilegible, Notario

Costas

Art. 141, 154 KostO

Valor EUROS 3.000,-

Derechos Art. 32,45 .. EUROS 10,-



LUZ APRIAGA DE HERBER
TRADUCCION E INTERPRETE OFICIAL
Resolucion No 444 Justicia

14
15

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. Pais: 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

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

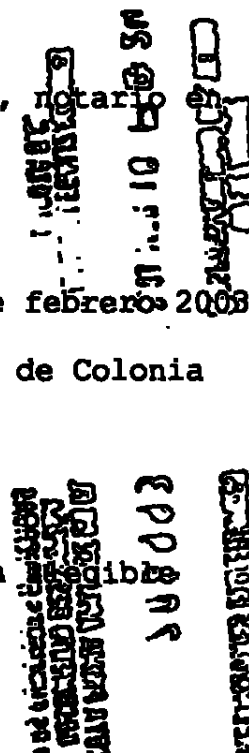
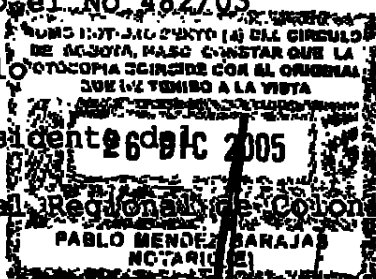
10. Firma

El Presidente

Fdo.: firma

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.

Luz Arriaga de Hember
LUZ ARRIAGA DE HEMBER
 TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL
 Resolución No. 593 Minjusticia

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208993

Andrés de la
COTA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2003 MAR 18 12:24

JEFES DE SECCIONES
DIPLOMATICA

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTA FE DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LOS ANTERIORES FIR-
MAS PUESTAS POR *Andrés de la*
Feijó
IDENTIFICADOS CON C.C. No. (s)
ES(SON) AUTÉNTICOS
SANTA FE DE BOGOTÁ, 18 MAR 2003



COMO NOTARIO SEXTO (S) DEL CIRCULO
DE BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE ME TIENGO A LA VISTA
28 DIC 2005
PABLO MENDEZ BANAÑAS
NOTARIO (S)

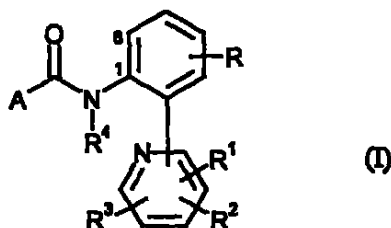
18

Pyridinylanilides

The present invention relates to novel pyridinylanilides, to several processes for their preparation and to their use for controlling unwanted microorganisms.

It is already known that certain pyridinylanilides have fungicidal properties (cf. WO 01/53259 and JP-A 8-92223). Thus, for example, the pyridinylanilides N-[2-(2-chloro-3-pyridinyl)phenyl]-1,4-dimethyl-1H-pyrrole-3-carboxamide and 1,4-dimethyl-N-[2-[2-(trifluoromethyl)-4-pyridinyl]phenyl]-1H-pyrrole-3-carboxamide (WO 01/53259) or 1-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide and 2-chloro-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)nicotinamide (JP-A 8-92223) can be used for the control of fungi. The activity of such compounds, however, is not always satisfactory, particularly if they are applied at low dosages. Other pyridinylanilides, e.g. N-[2-(6-bromo-2-pyridinyl)-4-methylphenyl]-2,2-dimethylpropanamide, N-[4-methyl-2-[6-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]phenyl]cyclopropanecarboxamide and N-[4-methyl-2-[6-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]phenyl]benzamide, are known as herbicides and plant growth regulators (cf. WO 95/09846).

This invention is directed to novel pyridinylanilides of the formula (I)



in which

R represents hydrogen, fluorine, chlorine, methyl or trifluoromethyl;

R¹, R² and R³ independently of one another each represents hydrogen, halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thiocarbamoyl;
 or represents in each case straight-chain or branched alkyl, hydroxyalkyl, oxoalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, dialkoxyalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkylsulfonyl having in each case 1 to 8 carbon atoms in the respective alkyl moiety;
 or represents in each case straight-chain or branched alkenyl or alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms;
 or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 13 identical or different halogen atoms;
 or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkenyl or halogenoalkenyloxy

having in each case 2 to 6 carbon atoms and 1 to 11 identical or different halogen atoms;
 or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkylcarbo-
 nyl, alkylcarbonyloxy, alkoxycarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, arylalkyl-
 aminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 6 carbon atoms in the respective
 5 hydrocarbon chain, alkenylcarbonyl or alkynylcarbonyl having 2 to 6 carbon atoms in the re-
 spective hydrocarbon chain;

or represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

or represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

10 Q^1 represents hydrogen, hydroxyl or C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -halogenoalkyl having 1 to 9
 identical or different halogen atoms, or C_3-C_6 -cycloalkyl and

Q^2 represents hydroxyl, amino, methylamino, phenyl, benzyl; or represents C_1-C_4 -alkyl
 or C_1-C_4 -alkoxy, each of which is optionally substituted by halogen, cyano, hydroxyl,
 C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -alkylthio, C_1-C_4 -alkylamino, di(C_1-C_4 -alkyl)amino or phenyl; or
 represents C_2-C_4 -alkenyloxy or C_2-C_4 -alkynyloxy,

15 represents phenyl, phenoxy, phenylthio, benzoyl, benzoylethenyl, cinnamoyl, heterocyclyl or
 phenylalkyl, phenylalkyloxy, phenylalkylthio or heterocyclylalkyl having in each case 1 to 3
 carbon atoms in the respective alkyl moieties, each of which is optionally mono- to tri-substi-
 tuted, identically or differently, in the ring moiety by halogen, in each case straight-chain or
 branched C_1-C_4 -alkyl and C_1-C_4 -alkoxy,

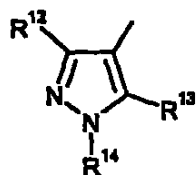
20 or

R^2 and R^3 , if attached to the pyridinyl moiety in ortho position to each other, furthermore together
 represent C_3-C_4 -alkylene, C_3-C_4 -alkenylene, C_2-C_3 -oxyalkylene or C_1-C_2 -dioxoalkylene, in
 each case optionally mono- to tetra-substituted, identically or differently, by fluorine,
 chlorine, oxo, methyl, ethyl, trifluoromethyl;

25

30 R^4 represents hydrogen, C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -alkylsulfinyl, C_1-C_4 -alkylsulfonyl, C_1-C_4 -alkoxy- C_1 -
 C_4 -alkyl, C_3-C_4 -cycloalkyl; C_1-C_4 -halogenoalkyl, C_1-C_4 -halogenoalkylthio, C_1-C_4 -halogeno-
 alkylsulfinyl, C_1-C_4 -halogenoalkylsulfonyl, halogeno- C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_4 -halo-
 genocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; 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 -
 halogenoalkyl)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl, (C_1-C_3 -halogenoalkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -alkyl having in
 each case 1 to 7 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms, (C_1-C_3 -alkyl)carbonyl- C_1-C_3 -halo-
 genoalkyl, (C_1-C_3 -alkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -halogenoalkyl having in each case 1 to 6 fluorine-,
 chlorine- and/or bromine atoms, (C_1-C_3 -halogenoalkyl)carbonyl- C_1-C_3 -halogenoalkyl, (C_1-C_3 -
 halogenoalkoxy)carbonyl- C_1-C_3 -halogenoalkyl having in each case 1 to 13 fluorine-,
 35 chlorine- and/or bromine atoms; $-COR^5$, $-CONR^6R^7$ or $-CH_2NR^8R^9$.

- R^5 represents hydrogen, C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -cycloalkyl, C_1-C_6 -halogenoalkyl, C_1-C_6 -halogenoalkoxy, halogeno- C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; or $-COR^{10}$,
- R^6 and R^7 independently of one another each represent hydrogen, C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -cycloalkyl, C_1-C_6 -halogenoalkyl, halogeno- C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -halogenocycloalkyl having in each case 1 bis 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms,
- R^6 and R^7 furthermore together with the nitrogen atom to which they are attached, represent a saturated 5- to 8-membered heterocycle, which heterocycle may have 1 or 2 additional, non-adjacent heteroatoms selected from the group consisting of oxygen, sulphur and NR^{11} , and which heterocycle may optionally be mono- to poly-substituted, identically or differently, by halogen or C_1-C_4 -alkyl,
- R^8 and R^9 independently of one another each represent hydrogen, C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -cycloalkyl, C_1-C_6 -halogenoalkyl, C_3-C_6 -halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms,
- R^8 and R^9 furthermore together with the nitrogen atom to which they are attached, represent a saturated 5- to 8-membered heterocycle, which heterocycle may have 1 or 2 additional, non-adjacent heteroatoms selected from the group consisting of oxygen, sulphur and NR^{11} , and which heterocycle may optionally be mono- to poly-substituted, identically or differently, by halogen or C_1-C_4 -alkyl,
- R^{10} represents hydrogen, C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -cycloalkyl, C_1-C_6 -halogenoalkyl, C_1-C_6 -halogenoalkoxy, halogeno- C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_3-C_6 -halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms,
- R^{11} represents hydrogen or C_1-C_4 -alkyl,
- A represents a radical of the formula (A1)



(A1), wherein

- R^{12} represents hydrogen, cyano, halogen, nitro, C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -alkylthio, C_3-C_6 -cycloalkyl, C_1-C_6 -halogenoalkyl, C_1-C_6 -halogenoalkoxy or C_1-C_6 -halogenoalkylthio each having 1 to 5 halogen atoms, aminocarbonyl or aminocarbonyl- C_1-C_4 -alkyl and
- R^{13} represents hydrogen, halogen, cyano, C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -alkoxy or C_1-C_4 -alkylthio and
- R^{14} represents hydrogen, C_1-C_4 -alkyl, hydroxy- C_1-C_4 -alkyl, C_2-C_6 -alkenyl, C_3-C_6 -cycloalkyl, C_1-C_4 -alkylthio- C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -alkoxy- C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_6 -halogenoalkyl,

C₁-C₄-halogenoalkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkoxy-C₁-C₄-alkyl each having 1 to 5 halogen atoms, or phenyl,

or

A represents a radical of the formula (A2)



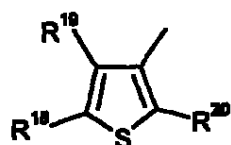
(A2), wherein

R¹⁵ and R¹⁶ independently of one another each represent hydrogen, halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and

R¹⁷ represents halogen, cyano or C₁-C₄-alkyl, or C₁-C₄-halogenoalkyl or C₁-C₄-halogenoalkoxy each having 1 to 5 halogen atoms,

10 or

A represents a radical of the formula (A3)



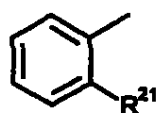
(A3), wherein

R¹⁸ and R¹⁹ independently of one another each represent hydrogen, halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and

15 R²⁰ represents hydrogen, halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A4)

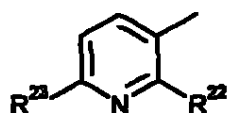


(A4), wherein

20 R²¹ represents hydrogen, halogen, hydroxyl, cyano, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-halogenoalkoxy or C₁-C₄-halogenoalkylthio each having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A5)



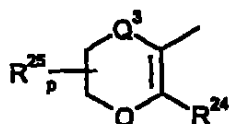
(A5), wherein

25 R²² represents halogen, hydroxyl, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-halogenoalkylthio or C₁-C₄-halogenoalkoxy each having 1 to 5 halogen atoms and

R^{23} represents hydrogen, halogen, cyano, C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -alkylthio, C_1-C_4 -halogenoalkyl, C_1-C_4 -halogenoalkoxy each having 1 to 5 halogen atoms, C_1-C_4 -alkylsulphinyl or C_1-C_4 -alkylsulphonyl,

or

5 A represents a radical of the formula (A6)



(A6), wherein

R^{24} represents C_1-C_4 -alkyl or C_1-C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and

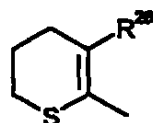
R^{25} represents C_1-C_4 -alkyl,

Q^3 represents a sulphur or oxygen atom, represents SO , SO_2 or CH_2 ,

10 p represents 0, 1 or 2, where R^{25} represents identical or different radicals if p represents 2,

or

A represents a radical of the formula (A7)

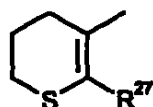


(A7), wherein

R^{26} represents C_1-C_4 -alkyl or C_1-C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

15 or

A represents a radical of the formula (A8)

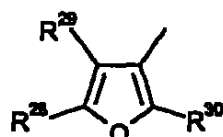


(A8), wherein

R^{27} represents C_1-C_4 -alkyl or C_1-C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

20 A represents a radical of the formula (A9)



(A9), wherein

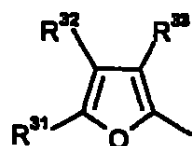
R^{28} and R^{29} independently of one another each represent hydrogen, halogen, amino, C_1-C_4 -alkyl or C_1-C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and

R^{30} represents hydrogen, halogen, C_1-C_4 -alkyl or C_1-C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

25

or

A represents a radical of the formula (A10)



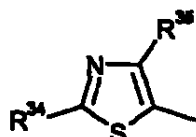
(A10), wherein

R³¹ and R³² independently of one another each represent hydrogen, halogen, amino, nitro, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and

R³³ represents hydrogen, halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A11)



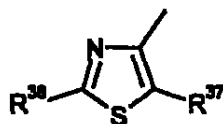
(A11), wherein

R³⁴ represents hydrogen, halogen, amino, C₁-C₄-alkylamino, di-(C₁-C₄-alkyl)amino, cyano, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and

R³⁵ represents halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A12)



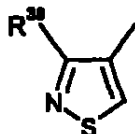
(A12), wherein

R³⁶ represents hydrogen, halogen, amino, C₁-C₄-alkylamino, di-(C₁-C₄-alkyl)amino, cyano, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and

R³⁷ represents halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A13)

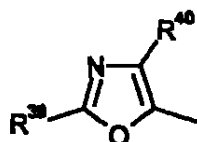


(A13), wherein

R³⁸ represents halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A14)



(A14), wherein

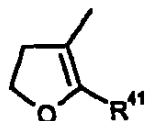
R³⁹ represents hydrogen or C₁-C₄-alkyl and

18
19

R^{40} represents halogen or C_1 - C_4 -alkyl,

or

A represents a radical of the formula (A15)

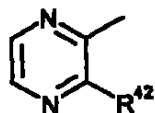


(A15), wherein

5 R^{41} represents C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A16)

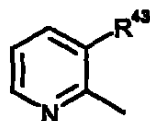


(A16), wherein

10 R^{42} represents hydrogen, halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A17)



(A17), wherein

15 R^{43} represents halogen, hydroxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_1 - C_4 -halogenoalkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkylthio or C_1 - C_4 -halogenoalkoxy each having 1 to 5 halogen atoms,

excluded compounds of the formula (I), in which

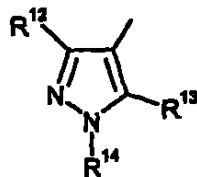
R represents hydrogen and

20 R^1 , R^2 and R^3 independently of one another each represents hydrogen, halogen; or straight-chain or branched alkyl having 1 to 4 carbon atoms; or straight-chain or branched halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms; and

R^4 represents hydrogen

and

25 A represents a radical of the formula (A1)



(A1), wherein

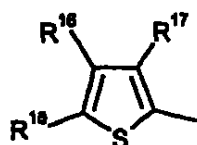
R^{12} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkyl and

R^{13} represents hydrogen and

R^{14} represents methyl,

or

A represents a radical of the formula (A2)



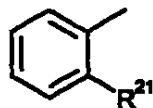
(A2), wherein

R^{15} and R^{16} independently of one another each represent hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl and

R^{17} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl,

or

A represents a radical of the formula (A4)

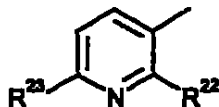


(A4), wherein

R^{21} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl,

or

A represents a radical of the formula (A5)



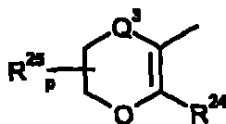
(A5), wherein

R^{23} represents halogen and

R^{22} represents hydrogen,

or

A represents a radical of the formula (A6)



(A6), wherein

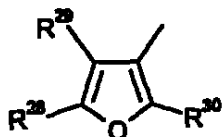
R^{24} represents methyl and

Q^3 represents a sulphur or CH_2 ,

p represents 0,

or

A represents a radical of the formula (A9)



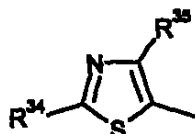
(A9), wherein

R^{28} and R^{29} independently of one another each represent hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl and

R^{30} represents methyl,

or

A represents a radical of the formula (A11)



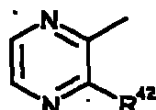
(A11), wherein

5 R^{34} represents hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl and

R^{35} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl,

or

A represents a radical of the formula (A16)



(A16), wherein

10 R^{42} represents halogen.

The excluded compounds are known from JP-A 8-92223.

In each case the following single compounds known from JP-A 8-92223 are explicitly excluded from the scope of protection:

- 15 2-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-4-(trifluoromethyl)-1,3-thiazole-5-carboxamide;
N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-4-(trifluoromethyl)-1,3-thiazole-5-carboxamide;
4-iodo-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-1,3-thiazole-5-carboxamide;
1-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide;
3-iodo-1-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide;
- 20 2-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-3-furamide;
3-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)thiophene-2-carboxamide;
2-chloro-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)benzamide;
2-chloro-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)nicotinamide;
3-chloro-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)pyrazine-2-carboxamide;
- 25 2-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-5,6-dihydro-1,4-oxathine-3-carboxamide;
2-chloro-N-(2-pyridin-3-ylphenyl)nicotinamide;
2-chloro-N-(2-pyridin-4-ylphenyl)nicotinamide;
2-methyl-N-[2-(6-methylpyridin-2-yl)phenyl]-4-(trifluoromethyl)-1,3-thiazole-5-carboxamide;
1-methyl-N-[2-(6-methylpyridin-2-yl)phenyl]-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide.

30

The compounds according to the invention may exist in different isomeric forms, in particular in form of stereoisomers, such as for example E- and Z-, threo- and erythro-, optical isomers and optionally in

form of tautomers. The invention relates to all the use of the pure isomers as well as the E- and Z-isomers, the threo- and erythro-isomers, the optical isomers, optional mixtures of these isomers and the possible tautomeric forms.

- 5 Furthermore, it has been found that pyridinylanilides of the formula (I) are obtained when
a) carboxylic acid derivatives of the formula (II)

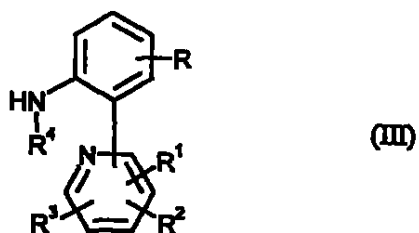


in which

X¹ represents halogen or hydroxyl and

10 A is as defined above,

are reacted with amines of the formula (III)

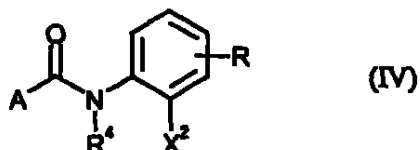


in which R, R¹, R², R³ and R⁴ are as defined above,

- 15 if appropriate in the presence of a catalyst, if appropriate in the presence of a condensing agent, if appropriate in the presence of an acid binder and if appropriate in the presence of a diluent,

or

- b) halogeno-carboxamides of the formula (IV)



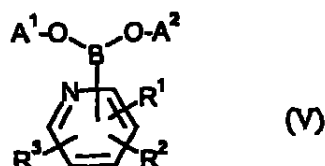
20

in which

R, R⁴ and A are as defined above, and

X² represents bromine or iodine,

- 25 are reacted with boronic acid derivatives of the formula (V)



in which

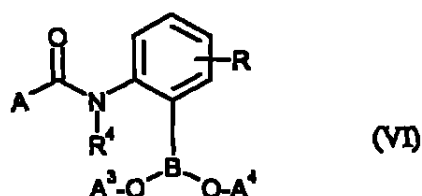
R^1 , R^2 and R^3 are as defined above, and

A^1 and A^2 each represent hydrogen or together represent tetramethylethylene,

5 in the presence of a catalyst, if appropriate in the presence of an acid binder and if appropriate in the presence of a diluent,

or

c) carboxamide boronic acid derivatives of the formula (VI)

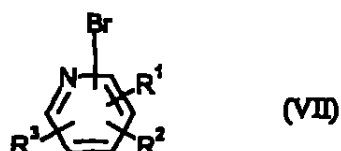


10 in which

R , R^4 and A are as defined above, and

A^3 and A^4 each represent hydrogen or together represent tetramethylethylene,

are reacted with pyridinyl derivatives of the formula (VII)



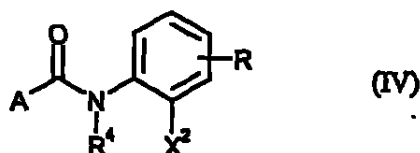
15

in which R^1 , R^2 and R^3 are as defined above,

in the presence of a catalyst, if appropriate in the presence of an acid binder and if appropriate in the presence of a diluent,

or

20 d) halogeno-carboxamides of the formula (IV)

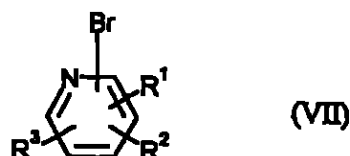


in which

R , R^4 and A are as defined above, and

X^2 represents bromine or iodine,

are reacted with pyridinyl derivatives of the formula (VII)

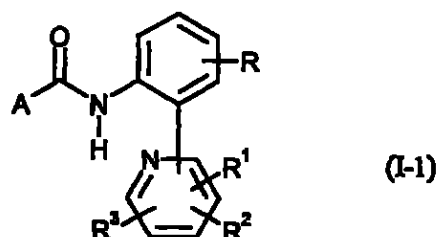


in which R¹, R² and R³ are as defined above,

in the presence of a palladium or platinum catalyst and in the presence of 4,4',4',5,5,5',5'-octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolane [bis(pinacolato)diboron], if appropriate in the presence of an acid binder and if appropriate in the presence of a diluent,

or

e) pyridinylanilides of the formula (I-1)



in which R, R¹, R², R³ and A are as defined above,

are reacted with halogenides of the formula (VIII)



in which

X³ represents chlorine, bromine or iodine,

R⁴ᵃ represents C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkylsulfinyl, C₁-C₆-alkylsulfonyl, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl; C₁-C₆-halogenoalkyl, C₁-C₆-halogenoalkylthio, C₁-C₆-halogenoalkylsulfinyl, C₁-C₆-halogenoalkylsulfonyl, halogeno-C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; (C₁-C₃-halogenoalkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-halogenoalkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl having in each case 1 to 7 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms, (C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl, (C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl having in each case 1 to 6 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms, (C₁-C₃-halogenoalkyl)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl, (C₁-C₃-halogenoalkoxy)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl having in each case 1 to 13 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; -COR⁵, -CONR⁶R⁷ or -CH₂NR⁸R⁹,

R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ and R⁹ are as defined above,

in the presence of a base and in the presence of a diluent.

Finally, it has been found that the novel pyridinylanilides of the formula (I) have very good microbicidal properties and can be used for controlling unwanted microorganisms both in crop protection and in the protection of materials.

- 5 Surprisingly, the pyridinylanilides of the formula (I) according to the invention have considerably better fungicidal activity than the constitutionally most similar active compounds of the prior art having the same direction of action.

The formula (I) provides a general definition of the pyridinylanilides according to the invention.

- 10 Preferred definitions of the radicals of the above and/or below mentioned formulae are given in the following. These definitions apply in the same way to the final products of the formula (I) as well as to all intermediates.

R preferably represents hydrogen.

- 15 R furthermore preferably represents fluorine, which fluorine particularly preferably is placed in 4-, 5- or 6-position, very particularly preferably in 4- or 6-position of the anilide moiety [cf. formula (I) above].

R furthermore preferably represents chlorine, which chlorine particularly preferably is placed in 5-position of the anilide moiety [cf. formula (I) above].

- 20 R furthermore preferably represents methyl, which methyl particularly preferably is placed in 3-position of the anilide moiety [cf. formula (I) above].

R furthermore preferably represents trifluoromethyl, which trifluoromethyl particularly preferably is placed in 4- or 5-position of the anilide moiety [cf. formula (I) above].

- 25 R¹, R² and R³ independently of one another each preferably represents hydrogen, halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thiocarbamoyl;
or preferably represents in each case straight-chain or branched alkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms;
or preferably represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogeno-
30 alkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 4 carbon atoms and 1 to 9 identical or different halogen atoms;
or preferably represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkylcarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxycarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 4 carbon atoms in the
35 respective hydrocarbon chain;
or preferably represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

or preferably represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 preferably represents hydrogen, hydroxyl or C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms or C_3 - C_6 -cycloalkyl and

Q^2 preferably represents hydroxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -halogenoalkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkoxy each having 1 to 9 identical or different halogen atoms.

R^2 and R^3 , if attached to the pyridinyl moiety in ortho position to each other, furthermore together preferably represent $-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_4-$, $-CH=CH-CH=CH-$, $-O(CH_2)_2-$, $-O(CH_2)_3-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$, in each case optionally mono- to tetra-substituted, identically or differently, by fluorine, chlorine, oxo, methyl, ethyl, trifluoromethyl.

R^1 , R^2 and R^3 independently of one another each particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, cyano; methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, methoxy, ethoxy, n- or iso-propoxy, n-, iso-, sec- or tert-butoxy, methylthio, ethylthio, n- or iso-propylthio, n-, iso-, sec- or tert-butylthio, trifluoromethyl, trifluoroethyl, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, difluorochloromethoxy, trifluoroethoxy, cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl,

or particularly preferably represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 particularly preferably represents hydrogen, methyl, ethyl, trifluoromethyl or cyclopropyl, and

Q^2 particularly preferably represents hydroxyl, methoxy, ethoxy, n-propoxy or isopropoxy.

R^2 and R^3 , if attached to the pyridinyl moiety in ortho position to each other, furthermore together particularly preferably represent $-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_4-$, $-CH=CH-CH=CH-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$, $-OCF_2O-$, $-O(CF_2)_2O-$.

R^1 , R^2 and R^3 independently of one another each very particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, methoxy, ethoxy, n- or iso-propoxy, trifluoromethyl, trifluoroethyl, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, difluorochloromethoxy, trifluoroethoxy,

or very particularly preferably represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 very particularly preferably represents hydrogen, methyl or ethyl and

Q^2 very particularly preferably represents hydroxyl, methoxy, ethoxy, n-propoxy or isopropoxy.

R^2 and R^3 , if attached to the pyridinyl moiety in ortho position to each other, furthermore together very particularly preferably represent $-CH=CH-CH=CH-$, $-OCF_2O-$, $-O(CF_2)_2O-$.

- R^4 preferably represents hydrogen; 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 -halogenoalkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkylthio, C_1 - C_4 -halogenoalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -halogenoalkylsulfonyl, halogeno- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; 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 -halogenoalkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, (C_1 - C_3 -halogenoalkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl having in each case 1 to 7 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms, (C_1 - C_3 -alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenoalkyl, (C_1 - C_3 -alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenoalkyl having in each case 1 to 6 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms, (C_1 - C_3 -halogenoalkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenoalkyl, (C_1 - C_3 -halogenoalkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenoalkyl having in each case 1 to 13 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; $-COR^5$, $-CONR^6R^7$ or $-CH_2NR^8R^9$.
- R^4 particularly preferably represents hydrogen, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, pentyl or hexyl, methylsulfinyl, ethylsulfinyl, n- or iso-propylsulfinyl, n-, iso-, sec- or tert-butylsulfinyl, methylsulfonyl, ethylsulfonyl, n- or iso-propylsulfonyl, n-, iso-, sec- or tert-butylsulfonyl, methoxymethyl, methoxyethyl, ethoxymethyl, ethoxyethyl, cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, trifluoroethyl, difluoromethylthio, difluorochloromethylthio, trifluoromethylthio, trifluoromethylsulfinyl, trifluoromethylsulfonyl, trifluoromethoxymethyl; $-CH_2-CHO$, $-CH_2CH_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2-C(O)OCH_3$, $-CH_2-C(O)OCH_2CH_3$, $-CH_2-C(O)OCH(CH_3)_2$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH_2CH_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO-CF_3$, $-CH_2-CO-CCl_3$, $-CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-CH_2CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-CH_2-C(O)OCH_2CF_3$, $-CH_2-C(O)OCF_2CF_3$, $-CH_2-C(O)OCH_2CCl_3$, $-CH_2-C(O)OCCl_2CCl_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH_2CF_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCF_2CF_3$, $-CH_2CH_2-C(O)OCH_2CCl_3$, $-CH_2CH_2-C(O)O-CCl_2CCl_3$; $-COR^5$, $-CONR^6R^7$ or $-CH_2NR^8R^9$.
- R^4 very particularly preferably represents hydrogen; methyl, methoxymethyl, $-CH_2-CHO$, $-CH_2CH_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$ or $-COR^5$.
- R^5 preferably represents hydrogen, 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 -halogenoalkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkoxy, halogeno- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; or $-COR^{10}$.
- R^5 particularly preferably represents hydrogen, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, tert-butyl, methoxy, ethoxy, tert-butoxy, cyclopropyl; trifluoromethyl, trifluoromethoxy; or $-COR^{10}$.
- R^5 very particularly preferably represents hydrogen, $-COCH_3$, $-CHO$, $-COCH_2OCH_3$, $-COCO_2CH_3$, $-COCO_2CH_2CH_3$; or $-COR^{10}$.

- R^6 and R^7 independently of one another each preferably represent hydrogen, C_1-C_6 -alkyl, C_1-C_3 -alkoxy- C_1-C_3 -alkyl, C_3-C_6 -cycloalkyl; C_1-C_6 -halogenoalkyl, halogeno- C_1-C_3 -alkoxy- C_1-C_3 -alkyl, C_3-C_6 -halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms.
- 5 R^6 and R^7 furthermore together with the nitrogen atom to which they are attached, preferably represent a saturated 5- to 8-membered heterocycle, which heterocycle may have 1 or 2 additional, non-adjacent heteroatoms selected from the group consisting of oxygen, sulphur and NR^{11} , and which heterocycle may optionally be mono- to tetra-substituted, identically or differently, by halogen or C_1-C_6 -alkyl.
- 10 R^6 and R^7 independently of one another each particularly preferably represent hydrogen, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, methoxymethyl, methoxyethyl, ethoxymethyl, ethoxyethyl, cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl; trifluoromethyl, trichloromethyl, trifluoroethyl, trifluoromethoxymethyl.
- R^6 and R^7 furthermore together with the nitrogen atom to which they are attached, particularly
- 15 preferably represent a saturated heterocycle selected from the group consisting of morpholine, thiomorpholine and piperazine, which heterocycle may optionally be mono- to tetra-substituted, identically or differently, by fluorine, chlorine, bromine or methyl and where the piperazine additionally at the second nitrogen atom may be substituted by R^{11} .
- 20 R^8 and R^9 independently of one another each preferably represent hydrogen, C_1-C_6 -alkyl, C_3-C_6 -cycloalkyl; C_1-C_6 -halogenoalkyl, C_3-C_6 -halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms.
- R^8 and R^9 furthermore together with the nitrogen atom to which they are attached, preferably represent a saturated 5- to 8-membered heterocycle, which heterocycle may have 1 or 2 additional,
- 25 non-adjacent heteroatoms selected from the group consisting of oxygen, sulphur and NR^{11} , and which heterocycle may optionally be mono- to tetra-substituted, identically or differently, by halogen or C_1-C_6 -alkyl.
- R^8 and R^9 independently of one another each particularly preferably represent hydrogen, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, methoxymethyl, methoxyethyl, ethoxymethyl, ethoxyethyl, cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl; trifluoromethyl, trichloromethyl,
- 30 trifluoroethyl, trifluoromethoxymethyl.
- R^8 and R^9 furthermore together with the nitrogen atom to which they are attached, particularly
- preferably represent a saturated heterocycle selected from the group consisting of morpholine, thiomorpholine and piperazine, which heterocycle may optionally be mono- to
- 35 tetra-substituted, identically or differently, by fluorine, chlorine, bromine or methyl and where the piperazine additionally at the second nitrogen atom may be substituted by R^{11} .

27
29

- R¹⁰ preferably represents hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₆-alkoxy, C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl; C₁-C₆-halogenoalkyl, C₁-C₆-halogenoalkoxy, halogeno-C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms.
- 5 R¹⁰ particularly preferably represents hydrogen, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, tert-butyl, methoxy, ethoxy, n- or iso-propoxy, tert-butoxy, cyclopropyl; trifluoromethyl, trifluoromethoxy.
- R¹¹ preferably represents hydrogen or C₁-C₄-alkyl.
- R¹¹ particularly preferably represents hydrogen, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl.
- 10 A preferably represents one of the radicals A1, A2, A3, A4, A5, A6, A9, A10, A11, A12 or A17.
- A particularly preferably represents one of the radicals A1, A2, A4, A5, A6, A9, A11, A17.
- 15 A very particularly preferably represents the radical A1.
- A furthermore very particularly preferably represents the radical A2.
- A furthermore very particularly preferably represents the radical A4.
- A furthermore very particularly preferably represents the radical A5.
- A furthermore very particularly preferably represents the radical A6.
- 20 A furthermore very particularly preferably represents the radical A9.
- A furthermore very particularly preferably represents the radical A11.
- A furthermore very particularly preferably represents the radical A17.
- R¹² preferably represents hydrogen, cyano, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, iso-propyl, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio, cyclopropyl, C₁-C₂-halogenoalkyl, C₁-C₂-halogenoalkoxy each having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, trifluoromethylthio, difluoromethylthio, aminocarbonyl, aminocarbonylmethyl or aminocarbonylethyl.
- 25 R¹² particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, iso-propyl, monofluoromethyl, monofluoroethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, difluorochloromethyl, trichloromethyl, dichloromethyl, cyclopropyl, methoxy, ethoxy, trifluoromethoxy, trichloromethoxy, methylthio, ethylthio, trifluoromethylthio or difluoromethylthio and
- 30 R¹² very particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, iso-propyl, monofluoromethyl, monofluoroethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.
- 35

- R¹² especially preferably represents methyl, monofluoromethyl, difluoromethyl or trifluoromethyl.
- R¹³ preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, methoxy, ethoxy, methylthio or ethylthio.
- 5 R¹³ particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine or methyl.
- R¹³ very particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine or methyl.
- R¹⁴ preferably represents hydrogen, methyl, ethyl, n-propyl, iso-propyl, C₁-C₂-halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, hydroxymethyl, hydroxyethyl, cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl or phenyl.
- 10 R¹⁴ particularly preferably represents hydrogen, methyl, ethyl, iso-propyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, hydroxymethyl, hydroxyethyl or phenyl.
- R¹⁴ very particularly preferably represents hydrogen, methyl, trifluoromethyl or phenyl.
- 15 R¹⁴ especially preferably represents methyl.
- R¹⁵ and R¹⁶ independently of one another each preferably represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C₁-C₂-halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.
- 20 R¹⁵ and R¹⁶ independently of one another each particularly preferably represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.
- R¹⁵ and R¹⁶ independently of one another each very particularly preferably represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl or trichloromethyl.
- 25 R¹⁵ and R¹⁶ especially preferably each represent hydrogen.
- R¹⁷ preferably represents fluorine, chlorine, bromine, cyano, methyl, ethyl, C₁-C₂-halogenoalkyl or C₁-C₂-halogenoalkoxy each having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.
- R¹⁷ particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, cyano, methyl, trifluoromethyl, trifluoromethoxy, difluoromethoxy, difluorochloromethoxy or trichloromethoxy.
- 30 R¹⁷ very particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, trifluoromethyl or trifluoromethoxy.
- R¹⁷ especially preferably represents methyl.

25/2A

R¹⁸ and R¹⁹ independently of one another each preferably represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C₁-C₂-halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

5 R¹⁸ and R¹⁹ independently of one another each particularly preferably represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.

R¹⁸ and R¹⁹ independently of one another each very particularly preferably represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl or trichloromethyl.

R¹⁸ and R¹⁹ especially preferably each represent hydrogen.

10

R²⁰ preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C₁-C₂-halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

R²⁰ particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl or trifluoromethyl.

15 R²⁰ very particularly preferably represents methyl.

R²¹ preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, hydroxyl, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₂-halogenoalkyl, C₁-C₂-halogenoalkoxy or C₁-C₂-halogenoalkylthio each having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

20 R²¹ particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, hydroxyl, cyano, methyl, ethyl, n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, difluorochloromethyl, trichloromethyl, trifluoromethoxy, difluoromethoxy, difluorochloromethoxy, trichloromethoxy, trifluoromethylthio, difluoromethylthio, difluorochloromethylthio or trichloromethylthio.

25 R²¹ very particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, difluoromethyl, trifluoromethyl or trichloromethyl.

R²¹ especially preferably represents iodine, methyl, difluoromethyl or trifluoromethyl.

30 R²² preferably represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, hydroxyl, cyano, C₁-C₄-alkyl, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio, difluoromethylthio, trifluoromethylthio, C₁-C₂-halogenoalkyl or C₁-C₂-halogenoalkoxy each having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

35 R²² particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, hydroxyl, cyano, methyl, ethyl, n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl, trichloromethyl, methoxy, ethoxy, methylthio,

ethylthio, difluoromethylthio, trifluoromethylthio, trifluoromethoxy, difluoromethoxy, difluorochloromethoxy or trichloromethoxy.

R^{22} very particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.

5

R^{23} preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, cyano, C_1 - C_4 -alkyl, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio, C_1 - C_2 -halogenoalkyl or C_1 - C_2 -halogenoalkoxy each having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, C_1 - C_2 -alkylsulphinyl or C_1 - C_2 -alkylsulphonyl.

10 R^{23} particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, cyano, n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl, trichloromethyl, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio, trifluoromethoxy, difluoromethoxy, difluorochloromethoxy, trichloromethoxy, methylsulphinyl or methylsulphonyl.

15 R^{23} very particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, trichloromethyl, methylsulphinyl or methylsulphonyl.

R^{23} especially preferably represents hydrogen.

20 R^{24} preferably represents methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

R^{24} particularly preferably represents methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.

25 R^{25} preferably represents methyl or ethyl.

R^{25} particularly preferably represents methyl.

Q^3 preferably represents a sulphur atom, SO_2 or CH_2 .

Q^3 particularly preferably represents a sulphur atom or CH_2 .

30 Q^3 very particularly preferably represents a sulphur atom.

p preferably represents 0 or 1.

p particularly preferably represents 0.

35 R^{26} preferably represents methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

- R^{24} particularly preferably represents methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.
- R^{25} very particularly preferably represents methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.
- 5 R^{27} preferably represents methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.
- R^{27} particularly preferably represents methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.
- 10 R^{27} very particularly preferably represents methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.
- R^{28} and R^{29} independently of one another each preferably represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, amino, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.
- 15 R^{28} and R^{29} independently of one another each particularly preferably represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.
- R^{28} and R^{29} independently of one another each very particularly preferably represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.
- 20 R^{28} and R^{29} especially preferably each represent hydrogen.
- R^{30} preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.
- 25 R^{30} particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.
- R^{30} very particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.
- R^{30} especially preferably represents methyl.
- 30 R^{31} and R^{32} independently of one another each preferably represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, amino, nitro, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.
- R^{31} and R^{32} independently of one another each particularly preferably represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, nitro, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.
- 35

R³¹ and R³² independently of one another each very particularly preferably represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.

R³¹ and R³² especially preferably each represent hydrogen.

5 R³³ preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C₁-C₂-halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms,

R³³ particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.

10 R³³ very particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.

R³³ especially preferably represents methyl.

15 R³⁴ preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, amino, C₁-C₄-alkylamino, di(C₁-C₄-alkyl)amino, cyano, methyl, ethyl or C₁-C₂-halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

R³⁴ particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, amino, methylamino, dimethylamino, cyano, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.

20 R³⁴ very particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, amino, methylamino, dimethylamino, methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.

R³⁴ especially preferably represents amino, methylamino, dimethylamino, methyl or trifluoromethyl.

25 R³⁵ preferably represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C₁-C₂-halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

R³⁵ particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.

R³⁵ very particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.

30 R³⁵ especially preferably represents methyl, trifluoromethyl or difluoromethyl.

R³⁶ preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, amino, C₁-C₄-alkylamino, di(C₁-C₄-alkyl)amino, cyano, methyl, ethyl or C₁-C₂-halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

27 26

- R³⁶ particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, amino, methyl-amino, dimethylamino, cyano, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.
- 5 R³⁶ very particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, amino, methyl-amino, dimethylamino, methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.
- R³⁶ especially preferably represents amino, methylamino, dimethylamino, methyl or trifluoromethyl.
- 10 R³⁷ preferably represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C₁-C₂-halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.
- R³⁷ particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.
- R³⁷ very particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.
- 15 R³⁷ especially preferably represents methyl, trifluoromethyl or difluoromethyl.
- R³⁸ preferably represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C₁-C₂-halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.
- R³⁸ particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.
- 20 R³⁸ very particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.
- R³⁹ preferably represents hydrogen, methyl or ethyl.
- 25 R³⁹ particularly preferably represents methyl.
- R⁴⁰ preferably represents fluorine, chlorine, bromine, methyl or ethyl.
- R⁴⁰ particularly preferably represents fluorine, chlorine or methyl.
- 30 R⁴¹ preferably represents methyl, ethyl or C₁-C₂-halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.
- R⁴¹ particularly preferably represents methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.
- R⁴¹ very particularly preferably represents methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.
- 35 R⁴¹ especially preferably represents methyl or trifluoromethyl.

R^a preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

R^a particularly preferably represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl or trifluoromethyl.

5

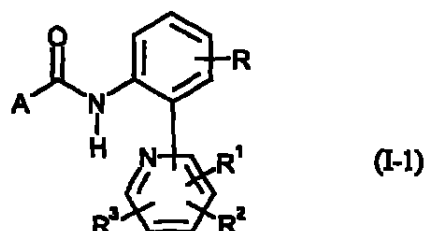
R^b preferably represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, hydroxyl, C_1 - C_4 -alkyl, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio, difluoromethylthio, trifluoromethylthio, C_1 - C_2 -halogenoalkyl or C_1 - C_2 -halogenoalkoxy each having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms.

R^b particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl, trichloromethyl.

10

R^b very particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, trifluoromethyl, difluoromethyl or trichloromethyl.

15 Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-1)



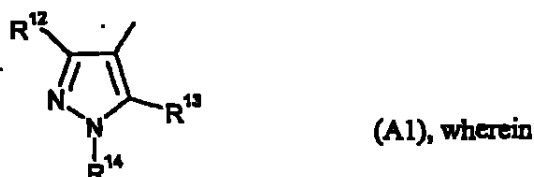
in which R, R^1 , R^2 , R^3 and A are as defined above,
excluded compounds of the formula (I-1), in which

R represents hydrogen and

20 R^1 , R^2 and R^3 independently of one another each represents hydrogen, halogen;
or represents straight-chain or branched alkyl having 1 to 4 carbon atoms;
or represents straight-chain or branched halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms;

and

A represents a radical of the formula (A1)



25

R^{12} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkyl and

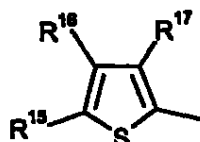
R^{13} represents hydrogen and

R^{14} represents methyl,

or

28/21

A represents a radical of the formula (A2)

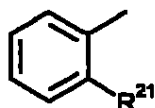


(A2), wherein

R^{15} and R^{16} independently of one another each represent hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl and R^{17} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl,

5 or

A represents a radical of the formula (A4)

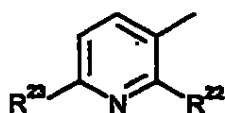


(A4), wherein

R^{21} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl,

or

10 A represents a radical of the formula (A5)



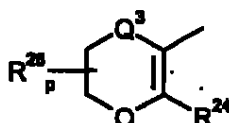
(A5), wherein

R^{22} represents halogen and

R^{23} represents hydrogen,

or

15 A represents a radical of the formula (A6)



(A6), wherein

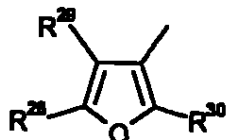
R^{24} represents methyl and

Q^3 represents a sulphur or CH_2 ,

P represents O,

20 or

A represents a radical of the formula (A9)



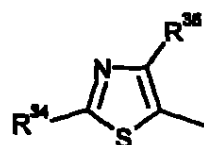
(A9), wherein

R^{28} and R^{30} independently of one another each represent hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl and

R^{30} represents methyl,

25 or

A represents a radical of the formula (A11)



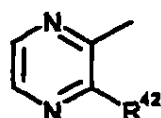
(A11), wherein

R^{34} represents hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl and

R^{35} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl,

or

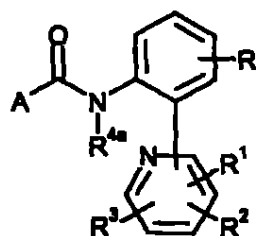
5 A represents a radical of the formula (A16)



(A16), wherein

R^{42} represents halogen.

Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (1-2)



(1-2)

10

in which R , R^1 , R^2 , R^3 , R^{4a} and A are as defined above.

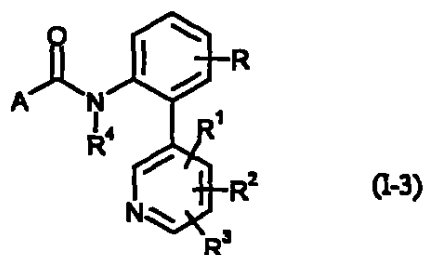
R^{4a} preferably represents C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_4 -alkylsulfinyl, C_1 - C_4 -alkylsulfonyl, C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl; C_1 - C_4 -halogenoalkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkylthio, C_1 - C_4 -halogenoalkylsulfinyl, C_1 - C_4 -halogenoalkylsulfonyl, halogeno- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -halogenocycloalkyl each having 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; 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 -halogenoalkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, (C_1 - C_3 -halogenoalkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl having in each case 1 to 7 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms, (C_1 - C_3 -alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenoalkyl, (C_1 - C_3 -alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenoalkyl having in each case 1 to 6 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms, (C_1 - C_3 -halogenoalkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenoalkyl, (C_1 - C_3 -halogenoalkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -halogenoalkyl having in each case 1 to 13 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; $-COR^5$, $-CONR^6R^7$ or $-CH_2NR^8R^9$, where R^5 , R^6 , R^7 , R^8 and R^9 are as defined above.

25 R^{4a} particularly preferably represents methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, pentyl or hexyl, methylsulfinyl, ethylsulfinyl, n- or iso-propylsulfinyl, n-, iso-, sec- or tert-butylsulfinyl, methylsulfonyl, ethylsulfonyl, n- or iso-propylsulfonyl, n-, iso-, sec- or tert-butylsulfonyl, methoxymethyl, methoxyethyl, ethoxymethyl, ethoxyethyl, cyclopropyl, cyclo-

pentyl, cyclohexyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, trifluoroethyl, difluoromethylthio, difluorochloromethylthio, trifluoromethylthio, trifluoromethylsulfinyl, trifluoromethylsulfonyl, trifluoromethoxymethyl; $-\text{CH}_2-\text{CHO}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CHO}$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$, $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCCl}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCCl}_2\text{CCl}_3$; $-\text{COR}^5$, $-\text{CONR}^6\text{R}^7$ or $-\text{CH}_2\text{NR}^8\text{R}^9$, where R^5 , R^6 , R^7 , R^8 and R^9 are as defined above.

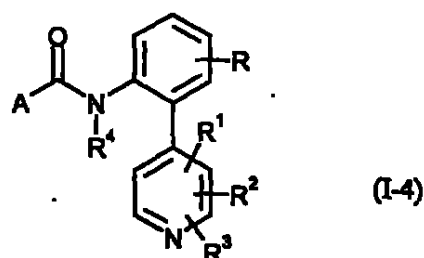
R^{4a} very particularly preferably represents methyl, methoxymethyl, $-\text{CH}_2-\text{CHO}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CHO}$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ or $-\text{COR}^5$, where R^5 is as defined above.

Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-3)



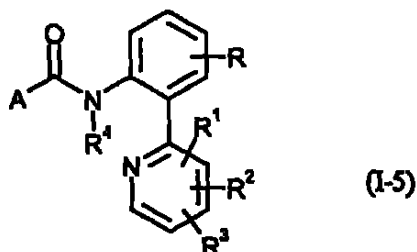
in which R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 and A are as defined above,
where 2-chloro-N-(2-pyridin-3-ylphenyl)nicotinamide is excluded.

Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-4)



in which R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 and A are as defined above,
where 2-chloro-N-(2-pyridin-4-ylphenyl)nicotinamide is excluded.

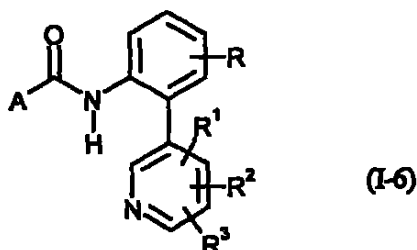
Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-5)



in which R, R¹, R², R³, R⁴ and A are as defined above,

where 2-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-4-(trifluoromethyl)-1,3-thiazole-5-carboxamide; N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-4-(trifluoromethyl)-1,3-thiazole-5-carboxamide; 4-iodo-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-1,3-thiazole-5-carboxamide; 1-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide; 3-iodo-1-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide; 2-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-3-furamide; 3-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)thiophene-2-carboxamide; 2-chloro-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)benzamide; 2-chloro-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)nicotinamide; 3-chloro-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)pyrazine-2-carboxamide; 2-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-5,6-dihydro-1,4-oxathine-3-carboxamide; 2-methyl-N-[2-(6-methylpyridin-2-yl)phenyl]-4-(trifluoromethyl)-1,3-thiazole-5-carboxamide; 1-methyl-N-[2-(6-methylpyridin-2-yl)phenyl]-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide are excluded.

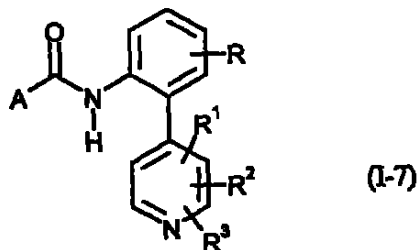
Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-6)



in which R, R¹, R², R³ and A are as defined above,

where 2-chloro-N-(2-pyridin-3-ylphenyl)nicotinamide is excluded.

Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-7)

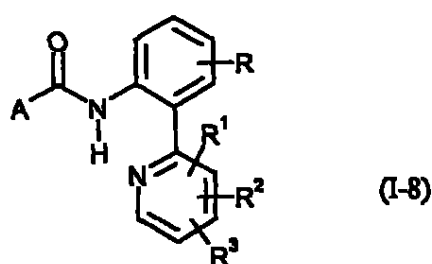


in which R, R¹, R², R³ and A are as defined above,

where 2-chloro-N-(2-pyridin-4-ylphenyl)nicotinamide is excluded.

30 29

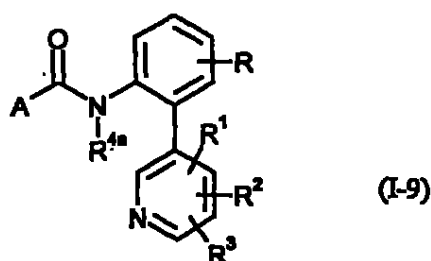
Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-8)



in which R, R¹, R², R³ and A are as defined above,

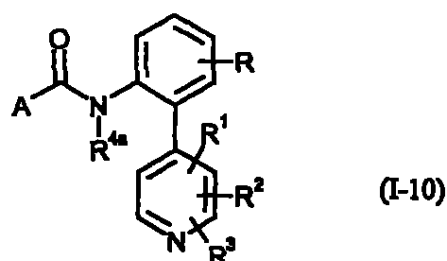
- where 2-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-4-(trifluoromethyl)-1,3-thiazole-5-carboxamide; N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-4-(trifluoromethyl)-1,3-thiazole-5-carboxamide; 4-iodo-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-1,3-thiazole-5-carboxamide; 1-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide; 3-iodo-1-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide; 2-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-3-furamide; 3-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)thiophene-2-carboxamide; 2-chloro-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)benzamide; 2-chloro-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)nicotinamide; 3-chloro-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)pyrazine-2-carboxamide; 2-methyl-N-(2-pyridin-2-ylphenyl)-5,6-dihydro-1,4-oxathine-3-carboxamide; 2-methyl-N-[2-(6-methylpyridin-2-yl)phenyl]-4-(trifluoromethyl)-1,3-thiazole-5-carboxamide; 1-methyl-N-[2-(6-methylpyridin-2-yl)phenyl]-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide are excluded.

- Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-9)



in which R, R¹, R², R³, R^{4a} and A are as defined above.

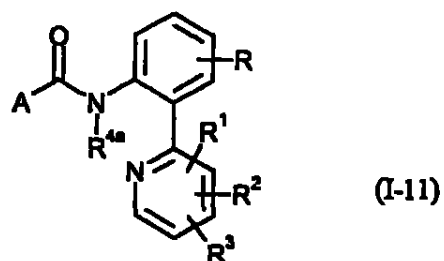
Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-10)



20

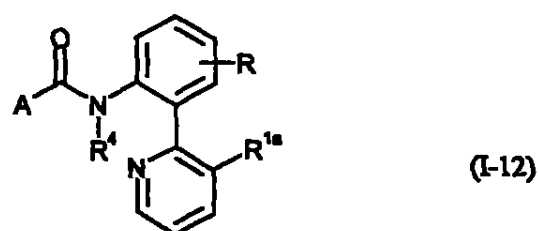
in which R, R¹, R², R³, R^{4a} and A are as defined above.

Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-11)



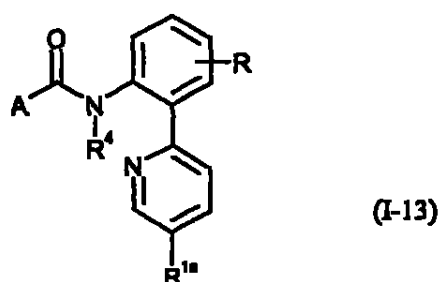
in which R, R¹, R², R³, R^{4a} and A are as defined above.

5 Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-12)



in which R, R⁴ and A are as defined above, and R^{1a} is as defined below.

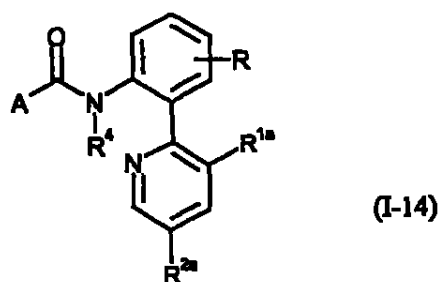
Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-13)



10

in which R, R⁴ and A are as defined above, and R^{1a} is as defined below.

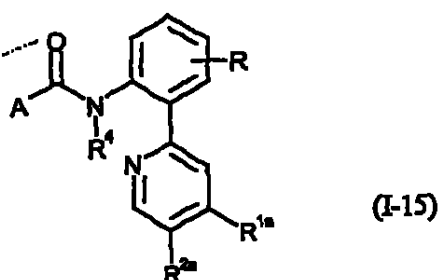
Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-14)



15 in which R, R⁴ and A are as defined above, and R^{1a} and R^{2a} are as defined below.

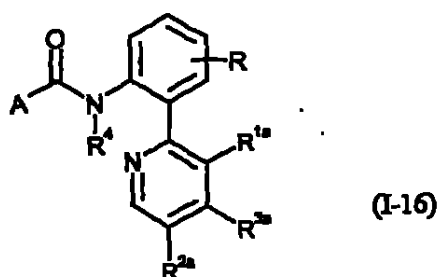
31 28

Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-15)



in which R, R⁴ and A are as defined above, and R^{1a} and R^{2a} are as defined below.

5 Moreover, emphasis is given to compounds of the formula (I-16)



in which R, R⁴ and A are as defined above, and R^{1a}, R^{2a} and R^{3a} are as defined below.

- R^{1a}, R^{2a} and R^{3a} independently of one another each represents halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thiocarbamoyl;
- 10 or represents in each case straight-chain or branched alkyl, hydroxyalkyl, oxoalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, dialkoxyalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkylsulfonyl having in each case 1 to 8 carbon atoms in the respective alkyl moiety;
- or represents in each case straight-chain or branched alkenyl or alkenyloxy having in each
- 15 case 2 to 6 carbon atoms;
- or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 13 identical or different halogen atoms;
- or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkenyl or halogenoalkenyloxy
- 20 having in each case 2 to 6 carbon atoms and 1 to 11 identical or different halogen atoms;
- or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkylcarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxy carbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain, alkenylcarbonyl or alkynylcarbonyl having 2 to 6 carbon atoms in the
- 25 respective hydrocarbon chain;
- or represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

or represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 represents hydrogen, hydroxyl or C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms, or C_3-C_6 -cycloalkyl and

Q^2 represents hydroxyl, amino, methylamino, phenyl, benzyl; or represents C_1-C_4 -alkyl or C_1-C_4 -alkoxy, each of which is optionally substituted by halogen, cyano, hydroxyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -alkylthio, C_1-C_4 -alkylamino, di(C_1-C_4 -alkyl)amino or phenyl; or represents C_2-C_4 -alkenylloxy or C_2-C_4 -alkynylloxy,

represents phenyl, phenoxy, phenylthio, benzoyl, benzoylethenyl, cinnamoyl, heterocyclyl or phenylalkyl, phenylalkyloxy, phenylalkylthio or heterocyclalkyl having in each case 1 to 3 carbon atoms in the respective alkyl moieties, each of which is optionally mono- to tri-substituted, identically or differently, in the ring moiety by halogen, in each case straight-chain or branched C_1-C_4 -alkyl and C_1-C_4 -alkoxy.

R^{1a} , R^{2a} and R^{3a} independently of one another each preferably represents halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thiocarbamoyl;

or preferably represents in each case straight-chain or branched alkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms;

or preferably represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 4 carbon atoms and 1 to 9 identical or different halogen atoms;

or preferably represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkylcarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxycarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 4 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain;

or preferably represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

or preferably represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 preferably represents hydrogen, hydroxyl or C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms or C_3-C_6 -cycloalkyl and

Q^2 preferably represents hydroxyl, C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -halogenoalkyl or C_1-C_4 -halogenoalkoxy each having 1 to 9 identical or different halogen atoms.

R^{1a} , R^{2a} and R^{3a} independently of one another each particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, cyano; methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, methoxy, ethoxy, n- or iso-propoxy, n-, iso-, sec- or tert-butoxy, methylthio, ethylthio, n- or iso-propylthio, n-, iso-, sec- or tert-butylthio, trifluoromethyl, trifluoroethyl, difluoromethoxy, trifluor-

omethoxy, difluorochloromethoxy, trifluoroethoxy, cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl, or particularly preferably represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 particularly preferably represents hydrogen, methyl, ethyl, trifluoromethyl or cyclopropyl, and

5 Q^2 particularly preferably represents hydroxyl, methoxy, ethoxy, n-propoxy or isopropoxy.

R^{1a} , R^{2a} and R^{3a} independently of one another each very particularly preferably represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, methoxy, ethoxy, n- or iso-propoxy, trifluoromethyl, trifluoroethyl, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, difluorochloromethoxy, trifluoroethoxy,

10 or very particularly preferably represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 very particularly preferably represents hydrogen, methyl or ethyl and

15 Q^2 very particularly preferably represents hydroxyl, methoxy, ethoxy, n-propoxy or isopropoxy.

Saturated or unsaturated hydrocarbon radicals, such as alkyl or alkenyl, can in each case be straight-chain or branched as far as this is possible, even in combination with heteroatoms, such as, for example, in alkoxy.

20 Optionally substituted radicals can be mono- or poly-substituted, where in the case of poly-substitutions the substituents can be identical or different.

Halogen-substituted radicals, such as, for example, halogenoalkyl, are mono- or poly-halogenated. In the case of poly-halogenation, the halogen atoms can be identical or different. Here, halogen represents fluorine, chlorine, bromine and iodine, in particular fluorine, chlorine and bromine.

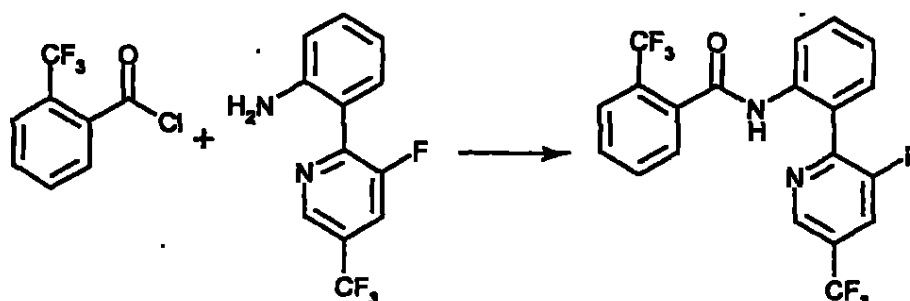
25 However, the general or preferred radical definitions or illustrations listed above can also be combined with one another as desired, i.e. including combinations between the respective ranges and preferred ranges. They apply to the end products and, correspondingly, to precursors and intermediates. Moreover, individual definitions may not apply.

30

Detailed Description of the Processes and Intermediates

Process (a)

35 Using 2-(trifluoromethyl)benzoyl chloride and 2-[3-fluoro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]phenylamine as starting materials, the course of the process (a) according to the invention can be illustrated by the formula scheme below.



The formula (II) provides a general definition of the carboxylic acid derivatives required as starting materials for carrying out the process (a) according to the invention. In this formula, A preferably has those meanings which have already been mentioned in connection with the description of the compounds of the formula (I) according to the invention as being preferred, particularly preferred or very particularly preferred for these radicals. X^1 preferably represents chlorine, bromine or hydroxyl, particularly preferably chlorine or hydroxyl.

The carboxylic acid derivatives of the formula (II) are known or can be prepared by known processes (cf. WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 and EP-A 0 589 313).

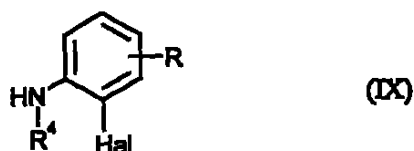
The formula (III) provides a general definition of the amines required as reaction components for carrying out the process (a) according to the invention. In this formula, R, R^1 , R^2 and R^3 preferably have those meanings which have already been mentioned in connection with the description of the compounds of the formula (I) according to the invention as being preferred, particularly preferred or very particularly preferred for these radicals.

The amines of the formula (III) excluded compounds of the formula (III), in which R represents hydrogen and R^1 , R^2 and R^3 independently of one another each represents hydrogen, halogen, straight-chain or branched alkyl having 1 to 4 carbon atoms or straight-chain or branched halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms; and R^4 represents hydrogen are novel (cf. JP-A 8-92223). Amines of the formula (III) employed for the production of compounds of the formulae (I-12), (I-13), (I-14), (I-15) and (I-16) are novel as well. Some of them can be prepared by known methods (Heterocycles 1989, 29, 1013-1016; J. Med. Chem. 1996, 39, 892-903; Synthesis 1995, 713-16; Synth. Commun. 1994, 24, 267-272; DE-A 27 27 416; Synthesis 1994, 142-144; EP-A 0 824 099; WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301, EP-A 0 589 313 and WO 02/38542).

Moreover, aniline derivatives of the formula (III) are obtained by

f) reacting 2-halo-amines of the general formula (IX)

33 3



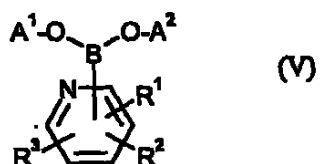
in which

R and R⁴ are as defined above and

Hal represents halogen,

5

with boronic acid derivatives of the formula (V)



in which R¹, R², R³, A¹ and A² are as defined above,

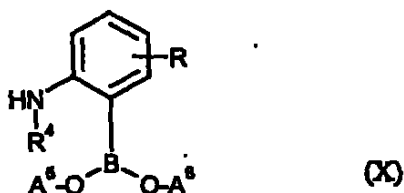
if appropriate in the presence of an acid binder, and if appropriate in the presence of an inert

10

organic diluent, and if appropriate in the presence of a catalyst,

or

g) reacting boronic acid derivatives of the formula (X)



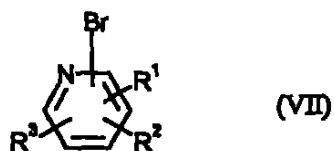
in which

15

R and R⁴ are as defined above, and

A⁵ and A⁶ each represent hydrogen or together represent tetramethylethylene,

with pyridinyl derivatives of the formula (VII)



20

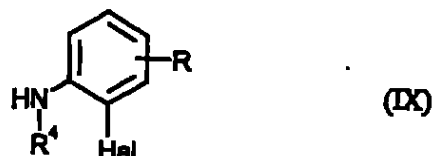
in which R¹, R² and R³ are as defined above,

if appropriate in the presence of an acid binder, and if appropriate in the presence of an inert

organic diluent, and if appropriate in the presence of a catalyst,

or

h) reacting 2-halo-amines of the general formula (IX)



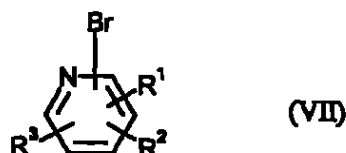
in which

R and R⁴ are as defined above and

Hal represents halogen,

5

with pyridinyl derivatives of the formula (VII)



in which R¹, R² and R³ are as defined above,

10 in the presence of a palladium or platinum catalyst and in the presence of 4,4,4',4',5,5,5',5'-octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolane, if appropriate in the presence of an acid binder and if appropriate in the presence of a diluent.

The formula (IX) provides a general definition of the 2-halo-amines required as reaction components for carrying out the processes (f) and (h) according to the invention. In this formula R and R⁴ preferably have those meanings which have already been mentioned in connection with the description of the compounds of the formula (I) according to the invention as being preferred, particularly preferred or very particularly preferred for these radicals. Hal preferably represents chlorine, bromine or iodine, particularly preferably bromine or iodine.

20 2-Halo-amines of the formula (IX) are known and/or can be prepared by known methods from the corresponding nitro compounds by reduction. In the case, that R⁴ does not represent hydrogen, the compounds of formula (IX) can be obtained by known derivatizations of the resulting aniline derivatives.

25 The boronic acid derivatives of the formula (V) furthermore required as starting materials for carrying out the process (f) according to the invention are described in more detail below in connection with the process (b) according to the invention.

30 The formula (X) provides a general definition of the boronic acid derivatives required as reaction components for carrying out the process (g) according to the invention. In this formula R and R⁴ preferably have those meanings which have already been mentioned in connection with the description of the compounds of the formula (I) according to the invention as being preferred,

34 33

particularly preferred or very particularly preferred for these radicals. A⁵ and A⁶ preferably each represent hydrogen or together represent tetramethylethylene.

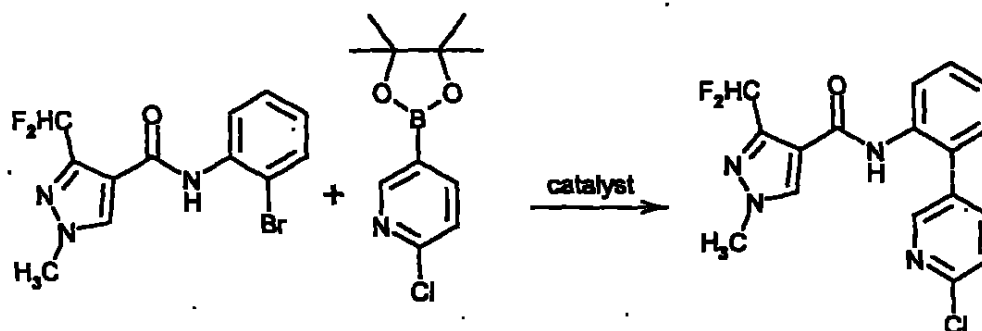
The boronic acid derivatives of the formula (X) are known and/or can be obtained by known methods.

The phenyl derivatives of the formula (VII) furthermore required as starting materials for carrying out the processes (g) and (h) according to the invention are illustrated in more detail below, in connection with the process (c) according to the invention.

10

Process (b)

Using *N*-(2-bromophenyl)-3-(difluoromethyl)-1-methyl-1*H*-pyrazole-4-carboxamide and 2-chloro-5-(4,4,5,5-tetramethyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)pyridine as starting materials and a catalyst, the course of the process (b) according to the invention can be illustrated by the formula scheme below.



15

The formula (IV) provides a general definition of the halogeno-carboxamides required as starting materials for carrying out the process (b) according to the invention. In this formula R, R⁴ and A preferably have those meanings which have already been mentioned in connection with the description of the compounds of the formula (I) according to the invention as being preferred, particularly preferred or very particularly preferred for these radicals.

20

The carboxamide derivatives of the formula (IV) are known or can be prepared by known processes (cf. WO 91/01311, EP-A 0 371 950). They are obtained, for example, by

i) reacting carboxylic acid derivatives of the formula (II)



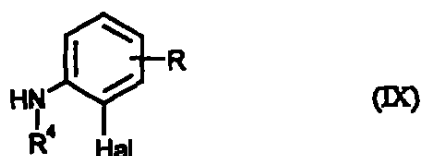
25

in which

X¹ represents halogen or hydroxyl and

A is as defined above,

with 2-halo-amines of the general formula (IX)



in which

R and R⁴ are as defined above and

5 Hal represents halogen,

if appropriate in the presence of a catalyst, if appropriate in the presence of a condensing agent, if appropriate in the presence of an acid binder and if appropriate in the presence of a diluent.

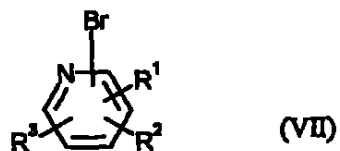
10 The carboxylic acid derivatives of the formula (III) required as starting materials for carrying out the process (i) according to the invention are illustrated in more detail above, in connection with the process (a) according to the invention.

The 2-halo-amines of the formula (IX) furthermore required as starting materials for carrying out the
15 process (i) according to the invention are illustrated in more detail above, in connection with the process (f) according to the invention.

The formula (V) provides a general definition of the boronic acid derivatives furthermore required as starting materials for carrying out the process (b) according to the invention. In this formula R¹, R²
20 and R³ preferably have those meanings which have already been mentioned in connection with the description of the compounds of the formula (I) according to the invention as being preferred, particularly preferred or very particularly preferred for these radicals. A¹ and A² preferably each represent hydrogen or together represent tetramethylethylene.

25 The boronic acid derivatives of the formula (V) are known and/or can be prepared by known processes (cf. WO 01/90084 and US 5,633,218). They are obtained, for example, by

k) reacting pyridinyl derivatives of the formula (VII)



in which R¹, R² and R³ are as defined above,

30

with boric acid esters of the formula (XI)



in which Alk represents $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-alkyl}$,

- 5 or with 4,4,4',4',5,5,5',5'-octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolane
in the presence of magnesium or alkyllithium, if appropriate in the presence of a diluent (for
example tetrahydrofuran).

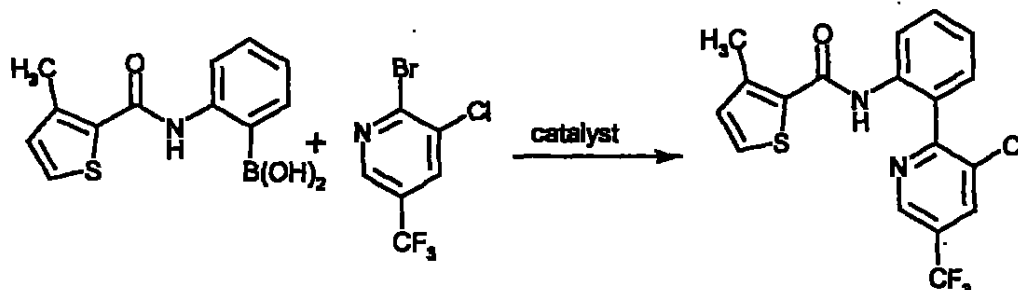
The formula (XI) provides a general definition of the boric acid esters required as reaction
10 components for carrying out the process (h) according to the invention. In this formula, Alk
preferably represents methyl, ethyl, n- or iso-propyl, particularly preferably methyl or ethyl.

The boric acid esters of the formula (XI) are known chemicals for synthesis.

- 15 The pyridinyl derivatives of the formula (VII) furthermore required as starting materials for carrying
out the process (h) according to the invention are illustrated in more detail below, in connection with
the process (c) according to the invention.

Process (c)

- 20 Using 2-[[[(3-methyl-2-thienyl)carbonyl]amino]phenyl]boronic acid and 2-bromo-3-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridine as starting materials and a catalyst, the course of the process (c) according
to the invention can be illustrated by the formula scheme below.



- The formula (VI) provides a general definition of the carboxamide boronic acid derivatives required
25 as reaction components for carrying out the process (c) according to the invention. In this formula R ,
 R^4 and A preferably have those meanings which have already been mentioned in connection with the
description of the compounds of the formula (I) according to the invention as being preferred, parti-
cularly preferred or very particularly preferred for these radicals. A^3 and A^4 preferably each represent
hydrogen or together represent tetramethylethylene.

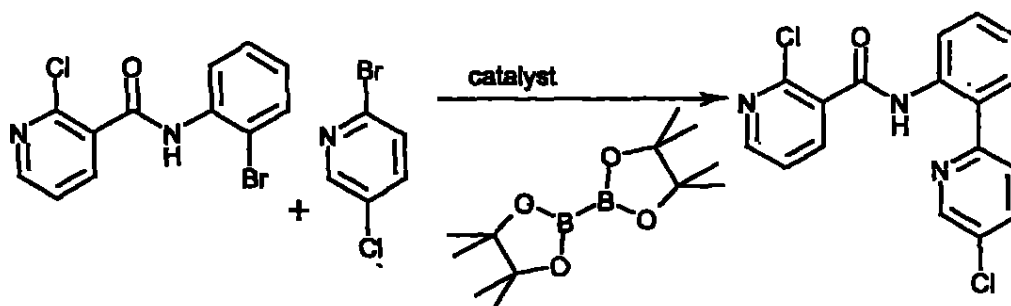
The carboxamide boronic acid derivatives of the formula (VI) are known and/or can be prepared by known processes.

The formula (VII) provides a general definition of the pyridinyl derivatives required as starting materials for carrying out the process (c) according to the invention. In this formula R^1 , R^2 and R^3 preferably have those meanings which have already been mentioned in connection with the description of the compounds of the formula (I) according to the invention as being preferred, particularly preferred or very particularly preferred for these radicals.

The pyridinyl derivatives of the formula (VII) are known or can be prepared by known processes (cf. Synth. Commun. 2000, 30, 665-669, Synth. Commun. 1999, 29, 1697-1701, and cf. also the examples below).

Process (d)

Using *N*-(2-bromophenyl)-2-chloronicotinamide and 2-bromo-5-chloropyridine as starting materials and a catalyst and 4,4,4',4',5,5,5',5'-octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolane, the course of the process (d) according to the invention can be illustrated by the formula scheme below.

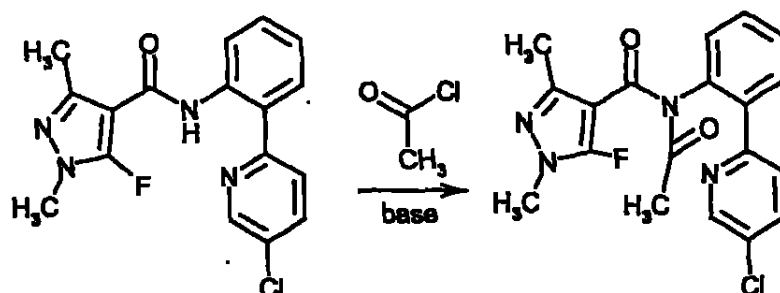


The halogeno-carboxamides of the formula (IV) and the pyridinyl derivatives of the formula (VII) required as starting materials for carrying out the process (d) according to the invention are already described above in connection with the processes (b) and (c) according to the invention.

4,4,4',4',5,5,5',5'-Octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolane furthermore required for carrying out process (d) according to the invention is a known chemical substance.

Process (e)

Using *N*-[2-(5-chloro-2-pyridinyl)phenyl]-5-fluoro-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-4-carboxamide and acetyl chloride as starting materials, the course of the process (e) according to the invention can be illustrated by the formula scheme below.



The formula (I-1) provides a general definition of the pyridinylamides required as starting materials for carrying out the process (e) according to the invention. In this formula R, R¹, R², R³ and A preferably have those meanings which have already been mentioned in connection with the description of the compounds of the formula (I) according to the invention as being preferred, particularly preferred or very particularly preferred for these radicals.

The compounds of the formula (I-1) are compounds according to the invention and can be obtained according to any of the processes (a) to (d).

10

The formula (VIII) provides a general definition of the halogenides required as starting materials for carrying out the process (e) according to the invention. In this formula R⁴ preferably has those meanings which have already been mentioned in connection with the description of the compounds of the formula (I-2) according to the invention as being preferred, particularly preferred or very particularly preferred for these radicals. X³ represents chlorine, bromine or iodine.

15

Halogenides of the formula (VIII) are widely known.

Reaction Conditions

Suitable diluents for carrying out the processes (a) and (i) according to the invention are all customary inert organic solvents. Preference is given to using aliphatic, alicyclic or aromatic hydrocarbons, such as petroleum ether, hexane, heptane, cyclohexane, methylcyclohexane, benzene, toluene, xylene or decalin; halogenated hydrocarbons, such as chlorobenzene, dichlorobenzene, dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride, dichloroethane or trichloroethane; ethers, such as diethyl ether, diisopropyl ether, methyl tert-butyl ether, methyl tert-amyl ether, dioxane, tetrahydrofuran, 1,2-dimethoxyethane, 1,2-diethoxyethane or anisole; nitriles, such as acetonitrile, propionitrile, n- or iso-butyronitrile or benzonitrile; amides, such as N,N-dimethylformamide, N,N-dimethylacetamide, N-methylformanilide, N-methylpyrrolidone or hexamethylphosphoric triamide; mixtures thereof with water or pure water.

Suitable diluents for carrying out the processes (b), (c), (d), (f), (g) and (h) according to the invention are in each case all customary inert organic solvents. Preference is given to using aliphatic, alicyclic

30

or aromatic hydrocarbons, such as petroleum ether, hexane, heptane, cyclohexane, methylcyclohexane; benzene, toluene, xylene or decalin; ethers, such as diethyl ether, diisopropyl ether, methyl tert-butyl ether, methyl tert-amyl ether, dioxane, tetrahydrofuran, 1,2-dimethoxyethane, 1,2-diethoxyethane or anisole; nitriles, such as acetonitrile, propionitrile, n- or iso-butyronitrile or benzonitrile; amides, such as N,N-dimethylformamide, N,N-dimethylacetamide, N-methylformanilide, N-methylpyrrolidone or hexamethylphosphoric triamide; esters, such as methyl acetate or ethyl acetate; sulphoxides, such as dimethylsulphoxide; or sulphones, such as sulfolane; alcohols, such as methanol, ethanol, n- or iso-propanol, n-, iso-, sec- or tert-butanol, ethanediol, propane-1,2-diol, ethoxyethanol, methoxyethanol, diethyleneglycolmonomethylether, diethyleneglycolmonoethylether; mixtures thereof with water or pure water.

Suitable diluents for carrying out the process (e) according to the invention are all customary inert organic solvents. Preference is given to using aliphatic, alicyclic or aromatic hydrocarbons, such as petroleum ether, hexane, heptane, cyclohexane, methylcyclohexane, benzene, toluene, xylene or decalin; halogenated hydrocarbons, such as chlorobenzene, dichlorobenzene, dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride, dichloroethane or trichloroethane; ethers, such as diethyl ether, diisopropyl ether, methyl tert-butyl ether, methyl tert-amyl ether, dioxane, tetrahydrofuran, 1,2-dimethoxyethane, 1,2-diethoxyethane or anisole; amides, such as N,N-dimethylformamide, N,N-dimethylacetamide, N-methylformanilide, N-methylpyrrolidone or hexamethylphosphoric triamide.

20

Suitable acid binders for carrying out the processes (a) and (i) according to the invention are all inorganic and organic bases customary for such reactions. Preference is given to using alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium amide, lithium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or di-azabicycloundecene (DBU).

30

Suitable acid binders for carrying out the processes (b), (c), (d), (f), (g) and (h) according to the invention are in each case all inorganic and organic bases customary for such reactions. Preference is given to using alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, fluorides, phosphates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium amide, lithium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium

35

37 96

hydroxide, potassium hydroxide, sodium acetate, sodium phosphate, potassium phosphate, potassium fluoride, caesium fluoride, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium hydrogencarbonate, sodium hydrogencarbonate or caesium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU).

Suitable acid binders for carrying out the process (e) according to the invention are all inorganic and organic bases customary for such reactions. Preference is given to using alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium amide, lithium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, ammonium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, ammonium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, or caesium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethylbenzylamine, pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU).

Suitable condensing agents for carrying out the processes (a) and (i) according to the invention are all condensing agents customary for such amidation reactions. Preference is given to using acid halide former, such as phosgene, phosphorous tribromide, phosphorous trichloride, phosphorous pentachloride, phosphorous trichloride oxide or thionyl chloride; anhydride former, such as ethyl chloroformate, methyl chloroformate, isopropyl chloroformate, isobutyl chloroformate or methanesulfonyl chloride; carbodiimides, such as N,N'-dicyclohexylcarbodiimide (DCC) or other customary condensing agents, such as phosphorous pentoxide, polyphosphoric acid, N,N'-carbonyldiimidazole, 2-ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydroquinoline (EEDQ), triphenylphosphine/tetrachloromethane or bromo-tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphate.

The processes (a) and (i) according to the invention is optionally carried out in the presence of a catalyst. Preference is given to 4-dimethylaminopyridine, 1-hydroxy-benzotriazole or dimethylformamide.

The processes (b), (c), (d), (f), (g) and (h) according to the invention are carried out in the presence of a catalyst. Preference is given to palladium salts or complexes, such as palladium chloride, palladium acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium, bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride or 1,1'-Bis(diphenylphosphino)ferrocenepalladium(II)chloride.

It is also possible to generate a palladium complex directly in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand, such as triethylphosphane, tri-tert-butylphosphane, tricyclohexylphosphane, 2-(dicyclohexylphosphane)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphan)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphane)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphane, tris-(o-tolyl)phosphane, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphane, 2,2'-bis-(diphenylphosphane)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphane)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphane)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphane)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphane)ethane, 2-(dicyclohexylphosphane)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene or tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite.

10

When carrying out the processes (a) and (i) according to the invention, the reaction temperature can be varied within a relatively wide range. In general, the process is carried out at temperatures between 0°C and 150°C, preferably between 0°C and 120°C, particularly preferably between 10°C and 80°C.

15 When carrying out the processes (b), (c), (d), (f), (g) and (h) according to the invention, the reaction temperatures can in each case be varied within a relatively wide range. In general, the processes are carried out at temperatures between 0°C and 180°C, preferably between 10°C and 150°C, particularly preferably between 20°C and 120°C

20 When carrying out the process (e) according to the invention, the reaction temperature can be varied within a relatively wide range. In general, the process is carried out at temperatures between 0°C and 150°C, preferably between 20°C and 110°C.

When carrying out the process (a) according to the invention, in general between 0.8 and 15 mole, preferably of between 0.8 and 8 mole, of amine of the formula (III) and from 1 to 3 mole of acid binder are employed per mole of carboxylic acid derivative of the formula (II). However, it is also possible to employ the reaction components in other ratios. Work-up is carried out by customary methods. In general, water is added to the reaction mixture and the organic phase is separated off and, after drying, concentrated under reduced pressure. The residue that remains may, if appropriate, be freed of any impurities that may still be present using customary methods, such as chromatography or recrystallization.

30

When carrying out the process (b) according to the invention, in general 1 to 15 mole, preferably from 2 to 8 mole, of boronic acid derivative of the formula (V) and from 1 to 5 mol of acid binder are employed per mole of halogeno-carboxamide of the formula (IV). However, it is also possible to employ the reaction components in other ratios. Work-up is carried out by customary methods. In general, water is added to the reaction mixture and the precipitate is separated off and dried. The

35

residue that remains may, if appropriate, be freed of any impurities that may still be present using customary methods, such as chromatography or recrystallization.

When carrying out the process (c) according to the invention, in general 0.8 to 15 mole, preferably
5 from 0.8 to 8 mole, of pyridinyl derivative of the formula (VII) and from 1 to 10 mol of acid binder
and from 0.5 to 5 mole% of a catalyst are employed per mole of carboxamide boronic acid derivative
of the formula (VI). However, it is also possible to employ the reaction components in other ratios.
Work-up is carried out by customary methods. In general, water is added to the reaction mixture and
the precipitate is separated off and dried. The residue that remains may, if appropriate, be freed of any
10 impurities that may still be present using customary methods, such as chromatography or
recrystallization.

When carrying out the process (d) according to the invention, in general 0.8 to 15 mole, preferably from
0.8 to 8 mole, of pyridinyl derivative of the formula (VII) and from 0.8 to 15 mole, preferably from 0.8
15 to 8 mole, of 4,4,4',4',5,5,5'-octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolane and from 1 to 5 mol of acid binder
and from 1 to 5 mol of a catalyst are employed per mole of carboxamide derivative of the formula (IV).
However, it is also possible to employ the reaction components in other ratios. Work-up is carried out by
customary methods. In general, water is added to the reaction mixture and the precipitate is separated off
and dried. The residue that remains may, if appropriate, be freed of any impurities that may still be
20 present using customary methods, such as chromatography or recrystallization.

When carrying out process (e) according to the invention, per mole of the pyridinylanilide of the
formula (I-1) in general 0.2 to 5 mole, preferably 0.5 to 2 mole of an halogenide of the formula (VIII)
are employed. However, it is also possible to employ the reaction components in other ratios. Work-
25 up is carried out by customary methods.

All processes according to the invention are generally each carried out under atmospheric pressure.
However, in each case it is also possible to operate under elevated or reduced pressure – in general
between 0,1 bar and 10 bar.
30

The substances according to the invention have potent microbicidal activity and can be employed for
controlling unwanted micro-organisms, such as fungi and bacteria, in crop protection and in the
protection of materials.

35 Fungicides can be employed in crop protection for controlling Plasmodiophoromycetes, Oomycetes,
Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes and Deuteromycetes.

Bactericides can be employed in crop protection for controlling Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae and Streptomycetaceae.

- Some pathogens causing fungal and bacterial diseases which come under the generic names listed above may be mentioned as examples, but not by way of limitation:
- 5 Xanthomonas species, such as, for example, Xanthomonas campestris pv. oryzae;
Pseudomonas species, such as, for example, Pseudomonas syringae pv. lachrymans;
Erwinia species, such as, for example, Erwinia amylovora;
Pythium species, such as, for example, Pythium ultimum;
- 10 Phytophthora species, such as, for example, Phytophthora infestans;
Pseudoperonospora species, such as, for example, Pseudoperonospora humuli or Pseudoperonospora cubensis;
Plasmopara species, such as, for example, Plasmopara viticola;
Bremia species, such as, for example, Bremia lactucae;
- 15 Peronospora species, such as, for example, Peronospora pisi or P. brassicae;
Erysiphe species, such as, for example, Erysiphe graminis;
Sphaerotheca species, such as, for example, Sphaerotheca fuliginea;
Podosphaera species, such as, for example, Podosphaera leucotricha;
Venturia species, such as, for example, Venturia inaequalis;
- 20 Pyrenophora species, such as, for example, Pyrenophora teres or P. graminea
(conidia form: Drechslera, syn: Helminthosporium);
Cochliobolus species, such as, for example, Cochliobolus sativus
(conidia form: Drechslera, syn: Helminthosporium);
Uromyces species, such as, for example, Uromyces appendiculatus;
- 25 Puccinia species, such as, for example, Puccinia recondita;
Sclerotinia species, such as, for example, Sclerotinia sclerotiorum;
Tilletia species, such as, for example, Tilletia caries;
Ustilago species, such as, for example, Ustilago nuda or Ustilago avenae;
Pellicularia species, such as, for example, Pellicularia sasakii;
- 30 Pyricularia species, such as, for example, Pyricularia oryzae;
Fusarium species, such as, for example, Fusarium culmorum;
Botrytis species, such as, for example, Botrytis cinerea;
Septoria species, such as, for example, Septoria nodorum;
Leptosphaeria species, such as, for example, Leptosphaeria nodorum;
- 35 Cercospora species, such as, for example, Cercospora canescens;
Alternaria species, such as, for example, Alternaria brassicae; and

39 38

Pseudocercospora species, such as, for example, *Pseudocercospora herpotrichoides*.

The active compounds according to the invention also have very good fortifying action in plants. Accordingly, they can be used for mobilizing the defences of the plant against attack by unwanted
5 micro-organisms.

In the present context, plant-fortifying (resistance-inducing) substances are to be understood as meaning those substances which are capable of stimulating the defence system of plants such that, when the treated plants are subsequently inoculated with unwanted micro-organisms, they show
10 substantial resistance against these micro-organisms.

In the present case, unwanted micro-organisms are to be understood as meaning phytopathogenic fungi, bacteria and viruses. Accordingly, the substances according to the invention can be used to protect plants for a certain period after the treatment against attack by the pathogens mentioned. The
15 period for which protection is provided generally extends over 1 to 10 days, preferably 1 to 7 days, after the treatment of the plants with the active compounds.

The fact that the active compounds are well tolerated by plants at the concentrations required for controlling plant diseases permits the treatment of above-ground parts of plants, of propagation stock
20 and seeds, and of the soil.

The active compounds according to the invention are also suitable for increasing the yield of crops. In addition, they show reduced toxicity and are well tolerated by plants.

25 At certain concentrations and application rates, the active compounds according to the invention can also be used as herbicides, for influencing plant growth and for controlling animal pests. They can also be used as intermediates and precursors for the synthesis of further active compounds.

The active compounds according to the invention can be used to treat all plants and parts of plants.
30 By plants are understood here all plants and plant populations such as desired and undesired wild plants or crop plants (including naturally occurring crop plants). Crop plants can be plants which can be obtained by conventional breeding and optimization methods or by biotechnological and genetic engineering methods or combinations of these methods, including the transgenic plants and including the plant varieties which can or cannot be protected by plant varieties property rights. Parts of plants
35 are to be understood as meaning all above-ground and below-ground parts and organs of plants, such as shoot, leaf, flower and root, examples which may be mentioned being leaves, needles, stems,

trunks, flowers, fruit-bodies, fruits and seeds and also roots, tubers and rhizomes. Parts of plants also include harvested plants and vegetative and generative propagation material, for example seedlings, tubers, rhizomes, cuttings and seeds.

- 5 The treatment of the plants and the parts of plants with the active compounds according to the invention is carried out directly or by action on their surroundings, habitat or storage space, according to customary treatment methods, for example by dipping, spraying, evaporating, atomizing, broadcasting, spreading-on and, in the case of propagation material, in particular in the case of seeds, furthermore by one- or multi-layer coating.

10

In the protection of materials, the compounds according to the invention can be employed for protecting industrial materials against infection with, and destruction by, undesired micro-organisms.

- Industrial materials in the present context are understood as meaning non-living materials which have
15 been prepared for use in industry. For example, industrial materials which are intended to be protected by active compounds according to the invention from microbial change or destruction can be adhesives, sizes, paper and board, textiles, leather, wood, paints and plastic articles, cooling lubricants and other materials which can be infected with, or destroyed by, micro-organisms. Parts of production plants, for example cooling-water circuits, which may be impaired by the proliferation of
20 micro-organisms may also be mentioned within the scope of the materials to be protected. Industrial materials which may be mentioned within the scope of the present invention are preferably adhesives, sizes, paper and board, leather, wood, paints, cooling lubricants and heat-transfer liquids, particularly preferably wood.

- 25 Micro-organisms capable of degrading or changing the industrial materials which may be mentioned are, for example, bacteria, fungi, yeasts, algae and slime organisms. The active compounds according to the invention preferably act against fungi, in particular moulds, wood-discolouring and wood-destroying fungi (Basidiomycetes), and against slime organisms and algae.

- 30 Micro-organisms of the following genera may be mentioned as examples:

Alternaria, such as *Alternaria tenuis*,

Aspergillus, such as *Aspergillus niger*,

Chaetomium, such as *Chaetomium globosum*,

Coniophora, such as *Coniophora puetana*,

- 35 *Lentinus*, such as *Lentinus tigrinus*,

Penicillium, such as *Penicillium glaucum*.

40 38

- Polyporus, such as *Polyporus versicolor*,
Aureobasidium, such as *Aureobasidium pullulans*,
Sclerophoma, such as *Sclerophoma pityophila*,
Trichoderma, such as *Trichoderma viride*,
5 *Escherichia*, such as *Escherichia coli*,
Pseudomonas, such as *Pseudomonas aeruginosa*, and
Staphylococcus, such as *Staphylococcus aureus*.

Depending on their particular physical and/or chemical properties, the active compounds can be
10 converted to the customary formulations, such as solutions, emulsions, suspensions, powders, foams,
pastes, granules, aerosols and microencapsulations in polymeric substances and in coating
compositions for seeds, and ULV cool and warm fogging formulations.

These formulations are produced in a known manner, for example by mixing the active compounds
15 with extenders, that is, liquid solvents, liquefied gases under pressure, and/or solid carriers, optionally
with the use of surfactants, that is emulsifiers and/or dispersants, and/or foam formers. If the extender
used is water, it is also possible to employ, for example, organic solvents as auxiliary solvents.
Essentially, suitable liquid solvents are: aromatics such as xylene, toluene or alkylnaphthalenes,
chlorinated aromatics or chlorinated aliphatic hydrocarbons such as chlorobenzenes, chloroethylenes
20 or methylene chloride, aliphatic hydrocarbons such as cyclohexane or paraffins, for example
petroleum fractions, alcohols such as butanol or glycol and their ethers and esters, ketones such as
acetone, methyl ethyl ketone, methyl isobutyl ketone or cyclohexanone, strongly polar solvents such
as dimethylformamide or dimethyl sulphoxide, or else water. Liquefied gaseous extenders or carriers
are to be understood as meaning liquids which are gaseous at standard temperature and under
25 atmospheric pressure, for example aerosol propellants such as halogenated hydrocarbons, or else
butane, propane, nitrogen and carbon dioxide. Suitable solid carriers are: for example ground natural
minerals such as kaolins, clays, talc, chalk, quartz, attapulgite, montmorillonite or diatomaceous
earth, and ground synthetic minerals such as finely divided silica, alumina and silicates. Suitable solid
carriers for granules are: for example crushed and fractionated natural rocks such as calcite, marble,
30 pumice, sepiolite and dolomite, or else synthetic granules of inorganic and organic meals, and
granules of organic material such as sawdust, coconut shells, maize cobs and tobacco stalks. Suitable
emulsifiers and/or foam formers are: for example nonionic and anionic emulsifiers, such as
polyoxyethylene fatty acid esters, polyoxyethylene fatty alcohol ethers, for example alkylaryl
polyglycol ethers, alkylsulphonates, alkyl sulphates, arylsulphonates, or else protein hydrolysates.
35 Suitable dispersants are: for example liginosulphite waste liquors and methylcellulose.

Tackifiers such as carboxymethylcellulose and natural and synthetic polymers in the form of powders, granules or latices, such as gum arabic, polyvinyl alcohol and polyvinyl acetate, or else natural phospholipids such as cephalins and lecithins and synthetic phospholipids can be used in the formulations. Other possible additives are mineral and vegetable oils.

5

It is possible to use colorants such as inorganic pigments, for example iron oxide, titanium oxide and Prussian Blue, and organic dyestuffs such as alizarin dyestuffs, azo dyestuffs and metal phthalocyanine dyestuffs, and trace nutrients such as salts of iron, manganese, boron, copper, cobalt, molybdenum and zinc.

10

The formulations generally comprise between 0.1 and 95 percent by weight of active compound, preferably between 0.5 and 90%.

The active compounds according to the invention can be used as such or in their formulations, also in a mixture with known fungicides, bactericides, acaricides, nematocides or insecticides, to broaden, for example, the activity spectrum or to prevent development of resistance. In many cases, synergistic effects are obtained, i.e. the activity of the mixture is greater than the activity of the individual components.

20 Examples of suitable mixing components are the following:

Fungicides:

2-phenylphenol; 8-hydroxyquinolinsulfat; acibenzolar-S-methyl; aldimorph; amidoflumet; ampropylfos; ampropylfos-potassium; andoprim; anilazine; azaconazole; azoxystrobin; benalaxyl; benodanil; benomyl; benfthiavalicarb-isopropyl; benzamacril; benzamacril-isobutyl; bilanafos; binapacryl; biphenyl; bitertanol; blasticidin-S; bromuconazole; bupirimate; buthiobate; butylamin; calcium polysulfide; capsimycin; captan; captan; carbendazim; carboxin; carpropamid; carvone; chinomethionat; chloden-thiazone; chlorfenazole; chloroneb; chlorothalonil; chlozolinate; clozylacon; cyazofamid; cyflufenamid; cymoxanil; cyproconazole; cyprodinil; cyprofuram; Dagger G; debacarb; dichlofluanid; dichlone; dichlorophen; diclocymet; diclomezine; dicloran; diethofencarb; difenoconazole; diflumetoxim; dimethi-rimol; dimethomorph; dimoxystrobin; diniconazole; diniconazole-M; dinocap; diphenylamine; dipyri-thione; 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; flumetover; flumorph; fluoromide; fluoxastrobin; fluquinconazole; flurprimidol; flusilazole; flusulfamide; flutolanil; flutriafol; folpet; fosetyl-Al; fosetyl-sodium; fuberidazole; furalaxyl; fura-metpyr; furcarbanil; furmecyclox; guazatine; hexachlorobenzene; hexaconazole; hymexazol; imazalil;

35

41 90

imibenconazole; iminoctadine triacetate; iminoctadine tris(albesil; iodocarb; ipconazole; iprobenfos;
 iprodione; iprovalicarb; irumamycin; isoprothiolane; isovalledione; kasugamycin; kresoxim-methyl;
 mancozeb; maneb; mefenimzone; mepanipyrin; mepronil; metalaxyl; metalaxyl-m; metconazole; metha-
 sulfocarb; methfuroxam; metiram; metominostrobin; metsulfovax; mildiomycin; myclobutanil; myclo-
 5 zolin; natamycin; nicobifen; nitrothal-isopropyl; noviflumuron; nuarimol; ofurace; orysastrobin;
 oxadixyl; oxolinic acid; oxpoconazole; oxycarboxin; oxyfenthin; paclobutrazol; pefurazate; pencon-
 azole; pencycuron; phosdiphen; phthalide; picoxystrobin; piperalin; polyoxins; polyoxorim; proben-
 azole; prochloraz; procymidone; propamocarb; propanosine-sodium; propiconazole; propineb; pro-
 quinazid; prothioconazole; pyraclostrobin; pyrazophos; pyrifenoxy; pyrimethanil; pyroquilon; pyroxyfur;
 10 pyrrolnitrine; quinconazole; quinoxifen; quintozone; simeconazole; spiroxamine; sulfur; tebuconazole;
 tecloftalam; tecnazene; tetracyclacis; tetraconazole; thiabendazole; thicyofen; thifluzamide; thiophanate-
 methyl; thiram; tioxyimid; tolclofos-methyl; tolylfluanid; triadimefon; triadimenol; triazbutil; triazoxide;
 tricyclamide; tricyclazole; tridemorph; trifloxystrobin; triflumizole; triforine; triticonazole; uniconazole;
 validamycin a; vinclozolin; zineb; ziram; zoxamide; (2S)-N-[2-{4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propynyl]oxy]-
 15 3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulphonyl)amino]butanamide; 1-(1-naphthalenyl)-1H-pyr-
 role-2,5-dione; 2,3,5,6-tetrachloro-4-(methylsulphonyl)pyridine; 2-amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazole-
 carboxamide; 2-chloro-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridinecarboxamide; 3,4,5-
 trichloro-2,6-pyridinedicarbonitrile; actinovate; cis-1-(4-chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)cyclo-
 heptanol; methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazole-5-carboxylate; monopotas-
 20 sium carbonate; N-(6-methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropanecarboxamide; N-butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1-
 oxaspiro[4.5]decane-3-amine; sodium tetrathiocarbonate; and copper salts and preparations, such as
 Bordeaux mixture; copper hydroxide; copper naphthenate; copper oxychloride; copper sulphate;
 cufraneb; copper oxide; mancopper; oxine-copper.

25 Bactericides:

bronopol, dichlorophen, nitrapyrin, nickel dimethyldithiocarbamate, kasugamycin, othilinone,
 furancarboxylic acid, oxytetracyclin, probenazole, streptomycin, tecloftalam, copper sulphate and
 other copper preparations.

30 Insecticides / acaricides / nematocides:

abamectin, ABG-9008, acephate, acequinocyl, acetamiprid, acetoprole, acrinathrin, AKD-1022, AKD-
 3059, AKD-3088, alanycarb, aldicarb, aldoxycarb, allethrin, allethrin 1R-isomers, alpha-cypermethrin
 (alphamethrin), amidoflume, aminocarb, amitraz, avermectin, AZ-60541, azadirachtin, azamethiphos,
 azinphos-methyl, azinphos-ethyl, azocyclotin, Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis,
 35 Bacillus thuringiensis, Bacillus thuringiensis strain EG-2348, Bacillus thuringiensis strain GC-91,
 Bacillus thuringiensis strain NCTC-11821, baculoviruses, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, ben-

diocarb, benfuracarb, bensultap, benzoximate, beta-cyfluthrin, beta-cypermethrin, bifenazate, bifenthrin,
 binapacryl, bioallethrin, bioallethrin-S-cyclopentyl-isomer, bioethanomethrin, biopermethrin, biores-
 methrin, bistrifluron, BPMC, brofenprox, bromophos-ethyl, bromopropylate, bromfenvinfos (-methyl),
 BTG-504, BTG-505, bufencarb, buprofezin, butathiofos, butocarb, butoxycarb, butoxycarboxim, butyl-
 5 pyridaben, cadusafos, camphechlor, carbaryl, carbofuran, carbophenothion, carbosulphan, cartap, CGA-
 50439, chinomethionat, chlordane, chlordimeform, chloethocarb, chlorethoxyfos, chlorfenapyr, chlor-
 fenvinphos, chlorfluazuron, chlormephos, chlorobenzilate, chloropicrin, chlorproxyfen, chlorpyrifos-
 methyl, chlorpyrifos (-ethyl), chlovaporthrin, chromafenozide, cis-cypermethrin, cis-resmethrin, cis-per-
 methrin, clocythr, cloethocarb, clofentezine, clothianidin, clothiazoben, codlemone, coumaphos,
 10 cyanofenphos, cyanophos, cycloprene, cycloprothrin, *Cydia pomonella*, cyfluthrin, cyhalothrin, cyhexa-
 tin, cypermethrin, cyphenothrin (1R-trans-isomer), cyromazine, DDT, deltamethrin, demeton-S-methyl,
 demeton-S-methylsulphone, diafenthiuron, dialifos, diazinon, dichlofenthion, dichlorvos, dicofol, di-
 crotophos, dicyclanil, diflubenzuron, dimethoate, dimethylvinphos, dinobuton, dinocap, dinotefuran,
 diofenolan, disulphoton, docusat-sodium, dofenapyn, DOWCO-439, eflusilanate, emamectin, ema-
 15 mectin-benzoate, empenthrin (1R-isomer), endosulphan, *Entomophthora* spp., EPN, esfenvalerate, ethio-
 fencarb, ethiprole, ethion, ethoprophos, etofenprox, etoxazole, etrimfos, famphur, fenamiphos, fenaza-
 quin, fenbutatin oxide, fenfluthrin, fenitrothion, fenobucarb, fenothiocarb, fenoxacrim, fenoxycarb, fen-
 propathrin, fenpyrad, fenpyrithrin, fenpyroximate, fensulphothion, fenthion, fentrianiil, fenvalerate,
 fipronil, flonicamid, fluacrypyrim, fluazuron, flubenzimine, flubrocycrin, flucycloxuron, flu-
 20 cythrin, flufenerim, flufenoxuron, flufenprox, flumethrin, flupyrzofos, flutenzin (flufenzine), flu-
 valinate, fonofos, formetanate, formothion, foamethilan, fosthiazate, fubfenprox (fluproxyfen), furathio-
 carb, gamma-HCH, gossypure, grandlure, granulosis viruses, halfenprox, halofenozide, HCH, HCN-
 801, heptenophos, hexaflumuron, hexythiazox, hydramethylnone, hydroprene, IKA-2002, imidacloprid,
 imiprothrin, indoxacarb, iodofenphos, iprobenfos, isazofos, isofenphos, isoprocarb, isoxathion,
 25 ivermectin, japonilure, kadethrin, nuclear polyhedrosis viruses, kinoprene, lambda-cyhalothrin, lindane,
 lufenuron, malathion, mecarbam, mesulphenfos, metaldehyde, metam-sodium, methacrifos, methamido-
 phos, *Metharhizium anisopliae*, *Metharhizium flavoviride*, methidathion, methiocarb, methomyl, metho-
 prene, methoxychlor, methoxyfenozide, metolcarb, metoxadiazone, mevinphos, milbemectin, milbe-
 mycin, MKI-245, MON-45700, monocrotophos, moxidectin, MTI-800, naled, NC-104, NC-170, NC-
 30 184, NC-194, NC-196, niclosamide, nicotine, mitepyram, 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, *Paecilomyces fumosoroseus*, parathion-methyl, parathion (-
 ethyl), permethrin (cis-, trans-), petroleum, PH-6045, phenothrin (1R-trans isomer), phenthoate, phorate,
 phosalone, phosmet, phosphamidon, phosphocarb, phoxim, piperonyl butoxide, pirimicarb, pirimiphos-
 35 methyl, pirimiphos-ethyl, prallethrin, profenofos, promecarb, propaphos, propargite, propetamphos, pro-
 poxur, prothiofos, prothoate, protrifenbut, pymetrozine, pyraclofos, pyresmethrin, pyrethrum,

42 AT

pyridaben, pyridalyl, pyridaphenthion, pyridathion, pyrimidifen, pyriproxifen, quinalphos, resmethrin, RH-5849, ribavirin, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, salithion, acebos, SI-0009, silafluofen, spinosad, spiroticlofen, spiromesifen, sulphuramid, sulphotep, sulprofos, SZI-121, tau-fluvalinate, tebufenozide, tebufenpyrad, tebupirimfos, teflubenzuron, tefluthrin, temephos, temvinphos, terbam, terbufos, tetrachlorvinphos, tetradifon, tetramethrin, tetramethrin (1R-isomer), tetrasul, theta-cypermethrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiapronil, thiatrithos, thiocyclam hydrogenoxalate, thiodicarb, thiofanox, thiometon, thiosultap-sodium, thuringiensin, tolfenpyrad, talocythrin, talomethrin, transfluthrin, triarathene, triazamate, triazophos, triazuron, trichlophenidine, trichlorfon, triflumuron, trimethacarb, vanidothion, vaniliprole, verbutin, *Verticillium lecanii*, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, xylylcarb, ZA-3274, zeta-cypermethrin, zolaprofos, ZXI-8901, the compound 3-methylphenyl propylcarbamate (tsumacide Z), the compound 3-(5-chloro-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluoroethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octane-3-carbonitrile (CAS-Reg. No. 185982-80-3) and the corresponding 3-endo-isomer (CAS-Reg. No. 185984-60-5) (cf. WO-96/37494, WO-98/25923), and preparations which comprise insecticidally active plant extracts, nematodes, fungi or viruses.

15

A mixture with other known active compounds, such as herbicides, or with fertilizers and growth regulators, safeners and/or semiochemicals is also possible.

20

In addition, the compounds of the formula (I) according to the invention also have very good antimycotic activity. They have a very broad antimycotic activity spectrum in particular against dermatophytes and yeasts, moulds and diphasic fungi (for example against *Candida* species such as *Candida albicans*, *Candida glabrata*) and Epidermophyton floccosum, *Aspergillus* species such as *Aspergillus niger* and *Aspergillus fumigatus*, Trichophyton species such as Trichophyton mentagrophytes, Microsporon species such as Microsporon canis and audouinii. The list of these

25

fungi does by no means limit the mycotic spectrum which can be covered, but is only for illustration.

The active compounds can be used as such, in the form of their formulations or the use forms prepared therefrom, such as ready-to-use solutions, suspensions, wettable powders, pastes, soluble powders, dusts and granules. Application is carried out in a customary manner, for example by

30

watering, spraying, atomizing, broadcasting, dusting, foaming, spreading, etc. It is furthermore possible to apply the active compounds by the ultra-low volume method, or to inject the active compound preparation or the active compound itself into the soil. It is also possible to treat the seeds of the plants.

35

When using the active compounds according to the invention as fungicides, the application rates can be varied within a relatively wide range, depending on the kind of application. For the treatment of parts of plants, the active compound application rates are generally between 0.1 and 10,000 g/ha,

preferably between 10 and 1000 g/ha. For seed dressing, the active compound application rates are generally between 0.001 and 50 g per kilogram of seed, preferably between 0.01 and 10 g per kilogram of seed. For the treatment of the soil, the active compound application rates are generally between 0.1 and 10,000 g/ha, preferably between 1 and 5,000 g/ha.

5

As already mentioned above, it is possible to treat all plants and their parts according to the invention. In a preferred embodiment, wild plant species and plant cultivars, or those obtained by conventional biological breeding, such as crossing or protoplast fusion, and parts thereof, are treated. In a further preferred embodiment, transgenic plants and plant cultivars obtained by genetic engineering, if
10 appropriate in combination with conventional methods (Genetically Modified Organisms), and parts thereof, are treated. The term "parts" or "parts of plants" or "plant parts" has been explained above.

Particularly preferably, plants of the plant cultivars which are in each case commercially available or in use are treated according to the invention. Plant cultivars are to be understood as meaning plants
15 having new properties ("traits") and which have been obtained by conventional breeding, by mutagenesis or by recombinant DNA techniques. They can be cultivars, varieties, bio- or genotypes.

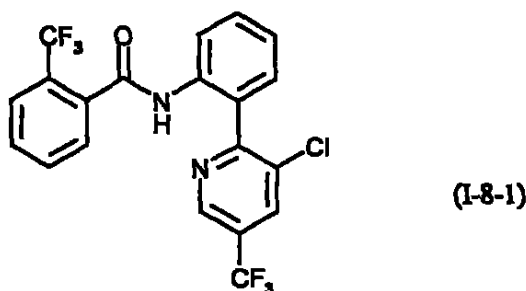
Depending on the plant species or plant cultivars, their location and growth conditions (soils, climate, vegetation period, diet), the treatment according to the invention may also result in superadditive
20 ("synergistic") effects. Thus, for example, reduced application rates and/or a widening of the activity spectrum and/or an increase in the activity of the substances and compositions which can be used according to the invention, better plant growth, increased tolerance to high or low temperatures, increased tolerance to drought or to water or soil salt content, increased flowering performance, easier harvesting, accelerated maturation, higher harvest yields, better quality and/or a higher
25 nutritional value of the harvested products, better storage stability and/or processability of the harvested products are possible which exceed the effects which were actually to be expected.

The transgenic plants or plant cultivars (i.e. those obtained by genetic engineering) which are preferably to be treated according to the invention include all plants which, in the genetic modification, received
30 genetic material which imparted particularly advantageous useful properties ("traits") to these plants. Examples of such properties are better plant growth, increased tolerance to high or low temperatures, increased tolerance to drought or to water or soil salt content, increased flowering performance, easier harvesting, accelerated maturation, higher harvest yields, better quality and/or a higher nutritional value of the harvested products, better storage stability and/or processability of the harvested products. Further
35 and particularly emphasized examples of such properties are a better defence of the plants against animal and microbial pests, such as against insects, mites, phytopathogenic fungi, bacteria and/or

viruses, and also increased tolerance of the plants to certain herbicidally active compounds. Examples of transgenic plants which may be mentioned are the important crop plants, such as cereals (wheat, rice), maize, soya beans, potatoes, cotton, tobacco, oilseed rape and also fruit plants (with the fruits apples, pears, citrus fruits and grapes), and particular emphasis is given to maize, soya beans, potatoes, cotton, tobacco and oilseed rape. Traits that are emphasized are in particular increased defence of the plants against insects by toxins formed in the plants, in particular those formed in the plants by the genetic material from *Bacillus thuringiensis* (for example by the genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb and CryIF and also combinations thereof) (hereinbelow referred to as "Bt plants"). Traits that are also particularly emphasized are the increased defence of the plants against fungi, bacteria and viruses by systemic acquired resistance (SAR), systemin, phytoalexins, elicitors and resistance genes and correspondingly expressed proteins and toxins. Traits that are furthermore particularly emphasized are the increased tolerance of the plants to certain herbicidally active compounds, for example imidazolinones, sulphonylureas, glyphosate or phosphinotricin (for example the "PAT" gene). The genes which impart the desired traits in question can also be present in combination with one another in the transgenic plants. Examples of "Bt plants" which may be mentioned are maize varieties, cotton varieties, soya bean varieties and potato varieties which are sold under the trade names YIELD GARD® (for example maize, cotton, soya beans), KnockOut® (for example maize), StarLink® (for example maize), Bollgard® (cotton), Nucoton® (cotton) and NewLeaf® (potato). Examples of herbicide-tolerant plants which may be mentioned are maize varieties, cotton varieties and soya bean varieties which are sold under the trade names Roundup Ready® (tolerance to glyphosate, for example maize, cotton, soya bean), Liberty Link® (tolerance to phosphinotricin, for example oilseed rape), IMI® (tolerance to imidazolinones) and STS® (tolerance to sulphonylureas, for example maize). Herbicide-resistant plants (plants bred in a conventional manner for herbicide tolerance) which may be mentioned also include the varieties sold under the name Clearfield® (for example maize). Of course, these statements also apply to plant cultivars which have these genetic traits or genetic traits still to be developed, and which will be developed and/or marketed in the future.

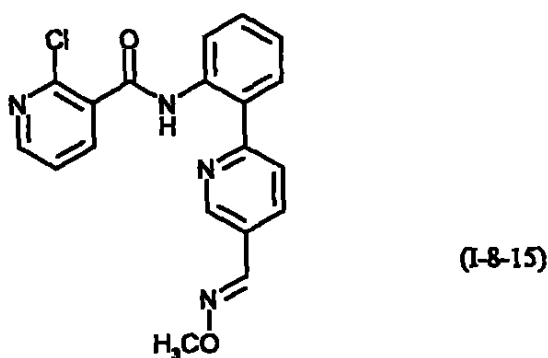
The plants listed can be treated according to the invention in a particularly advantageous manner with the compounds of the general formula (I) or the active compound mixtures according to the invention. The preferred ranges stated above for the active compounds or mixtures also apply to the treatment of these plants. Particular emphasis is given to the treatment of plants with the compounds or mixtures specifically mentioned in the present text.

The preparation and the use of the active compounds according to the invention is illustrated by the examples below.

Preparation examplesExample 1

- 5 A solution of 10.0 g (25.6 mmol) *N*-(2-iodophenyl)-2-(trifluoromethyl)benzamide, 8.0 g (31.5 mmol) bis(pinacolato)diboron, 7.4 g (75.4 mmol) potassium acetate and 0.18 g (0.25 mmol) 1,1'-bis-(diphenylphosphino)ferrocenepalladium(II)chloride in 120 ml dimethyl sulphoxide was heated under an inert gas atmosphere for 2 h at 90°C. At room temperature 6.5 g (25.0 mmol) 2-bromo-3-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridine, 70.0 ml of a 2 M sodium carbonate solution and 0.18 g (0.25 mmol) 1,1'-
- 10 bis(diphenylphosphino)ferrocenepalladium(II)chloride were added. The reaction mixture was heated for 16 h at 90°C. For work-up the mixture was poured into water, extracted with ethyl acetate, dried over sodium sulphate, filtrated and concentrated in vacuo. Column chromatography (cyclohexane/ethyl acetate 3:1) yielded 1.5 g (3.4 mmol, 13 %) of *N*-(2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]phenyl)-2-(trifluoromethyl)benzamide [log P (pH 2.3) = 3.58; compound No. I-8-1 in Table 3].

15

Example 2

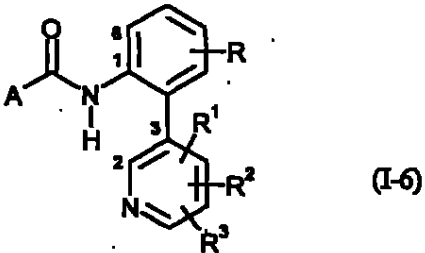
- 20 A mixture of 0.2 g (0.8 mmol) of 6-(2-amino-phenyl)-pyridine-3-carbaldehyde (*E*)-O-methyl-oxime (III-2), 0.155 mg (0.88 mmol) of 2-chloronicotinyl chloride, 122 mg (0.88 mmol) of potassium carbonate in 20 ml of acetonitrile was stirred for 15 hours at room temperature. For the work-up, the reaction mixture was poured into water, extracted with ethyl acetate, dried over sodium sulphate and concentrated under vacuum. The solid was triturated with petroleum ether and filtered, to give

44 43

150 mg (0.41 mmol, 41 %) of 2-chloro-*N*-{2-[5-((*E*)methoxyimino-methyl)-pyridin-2-yl]-phenyl}-nicotinamide as a white powder [log P (pH 2.3) = 2.95; compound No. I-8-15 in Table 3].

The pyridinylanilides of the formula (I) listed in the following tables below are likewise prepared analogously to Examples 1 and 2 described above and in accordance with the general descriptions of the processes.

Table 1



No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP
I-6-1	2-F	H	H	H		2.37
I-6-2	H	H	H	3-CH ₃		2.83
I-6-3	H	H	H	H		2.43
I-6-4	6-Cl	H	H	H		2.00
I-6-5	6-Cl	H	H	H		2.82
I-6-6	6-Cl	H	H	H		2.74
I-6-7	6-Cl	H	H	H		2.10

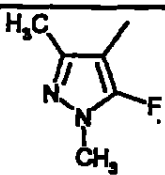
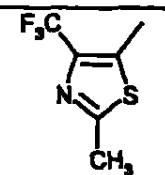
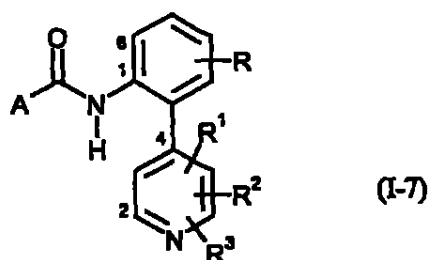
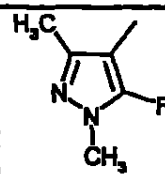
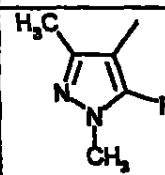
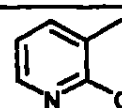
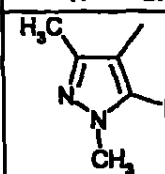
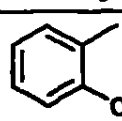
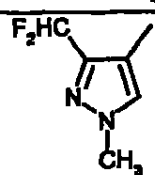
No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP
I-6-8	6-Cl	H	H	H		2.00
I-6-9	6-Cl	H	H	H		2.64

Table 2

No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP
I-7-1	H	H	H	4-CF ₃		3.83
I-7-2	H	H	H	H		
I-7-3	2-Br	H	H	H		2.04
I-7-4	2-Br	H	H	H		2.02
I-7-5	2-Br	H	H	H		2.85
I-7-6	2-Br	H	H	H		2.13

47
45

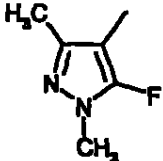
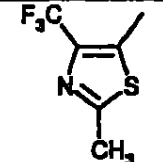
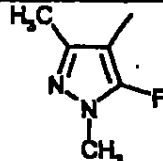
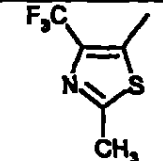
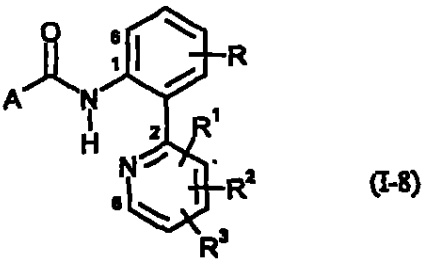
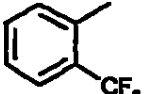
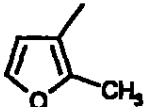
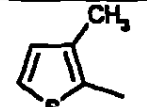
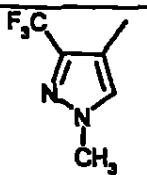
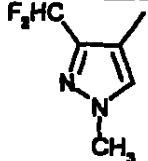
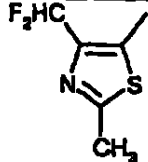
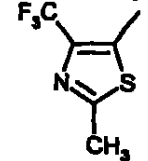
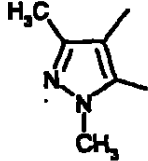
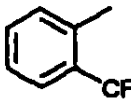
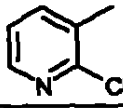
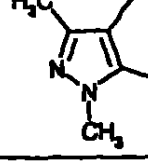
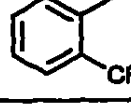
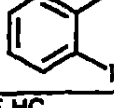
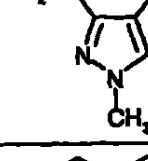
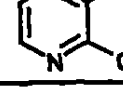
No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP
I-7-7	2-Cl	H	H	H		1.97
I-7-8	2-Cl	H	H	H		2.60
I-7-9	2-Cl	6-Cl	H	H		2.57
I-7-10	2-Cl	6-Cl	H	H		3.27

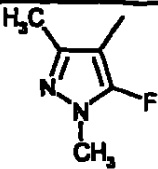
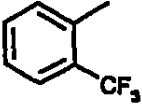
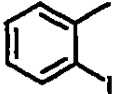
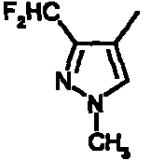
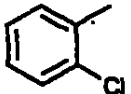
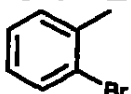
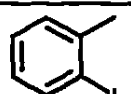
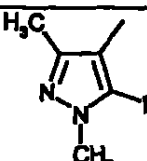
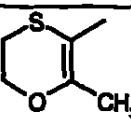
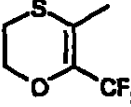
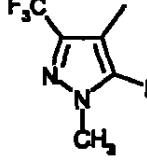
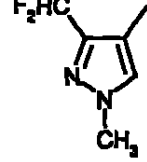
Table 3

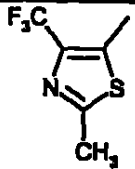
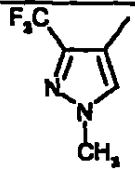
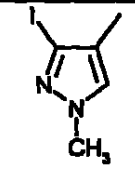
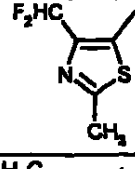
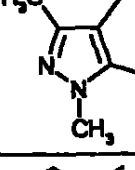
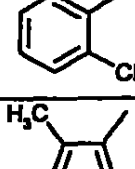
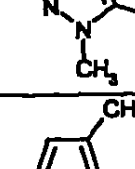
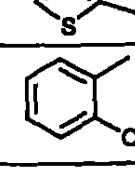
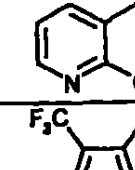
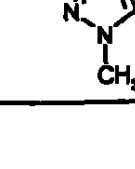


No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP m.p./°C
I-8-1	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3.59 139
I-8-2	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3.44
I-8-3	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3.83
I-8-4	4-CH ₃	5-CH=CH-CH=CH-6		H		2.79

No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP m.p./°C
I-8-5	4-CH ₃	5-CH=CH-CH=CH-6		H		2.39
I-8-6	4-CH ₃	5-CH=CH-CH=CH-6		H		3.97
I-8-7	H	H	H	5-Cl		3.49
I-8-8	H	H	H	3-CH ₃		2.86
I-8-9	5-CF ₃	H	H	H		4.13
I-8-10	5-Cl	H	H	H		2.95
I-8-11	5-Cl	H	H	H		3.06
I-8-12	5-Cl	H	H	H		4.00
I-8-13	5-Cl	H	H	H		4.13
I-8-14	5-Cl	H	H	H		3.05
I-8-15	5-CH=N-OCH ₃	H	H	H		2.95

AS
46

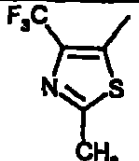
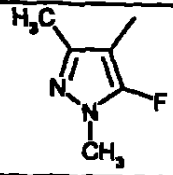
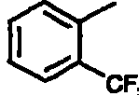
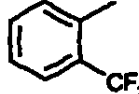
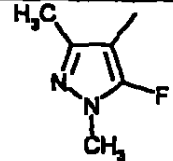
No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP m.p./°C
I-8-16	5-CH=N-OCH ₃	H	H	H		3.03
I-8-17	5-CH=N-OCH ₃	H	H	H		3.93
I-8-18	5-CH=N-OCH ₃	H	H	H		4.00
I-8-19	5-CH=N-OCH ₃	H	H	H		3.07
I-8-20	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3.45
I-8-21	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3.49
I-8-22	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3.61
I-8-23	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3.04
I-8-24	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3.58
I-8-25	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3.43
I-8-26	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3.55
I-8-27	3-Cl	5-CF ₃	H	H		2.91

No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP m.p./°C
I-8-28	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3.48
I-8-29	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3.13
I-8-30	3-Cl	5-CF ₃	H	H		2.92
I-8-31	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3.29
I-8-32	5-CH ₃	H	H	H		1.88
I-8-33	5-CH ₃	H	H	H		2.67
I-8-34	3-Cl	5-Cl	H	H		2.81
I-8-35	3-Cl	5-Cl	H	H		3.75
I-8-36	3-Cl	5-Cl	H	H		3.40
I-8-37	3-Cl	5-Cl	H	H		2.53
I-8-38	3-Cl	5-Cl	H	H		2.93

46

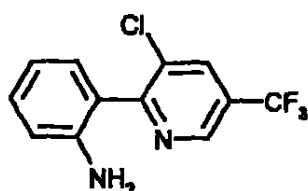
47

No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP m.p./°C
I-8-39	5-Br	H	H	H		3.95
I-8-40	5-Br	H	H	H		4.47
I-8-41	3-Cl	5-Cl	H	H		3.30
I-8-42	3-Cl	5-Cl	H	H		3.45
I-8-43	3-Cl	5-Cl	H	H		3.83
I-8-44	3-Cl	5-Cl	H	H		3.75
I-8-45	3-Cl	5-Cl	H	H		3.19
I-8-46	3-Cl	5-Cl	H	H		3.27
I-8-47	5-CH ₃	H	H	H		3.20
I-8-48	3-CH ₃	5-Br	H	H		3.21
I-8-49	3-Cl	5-Br	H	H		3.40
I-8-50	3-Cl	5-Br	H	H		3.27

No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP m.p./°C
I-8-51	3-CH ₃	5-Br	H	H		3.30
I-8-52	3-CH ₃	5-Br	H	H		2.71
I-8-53	3-Cl	5-Br	H	H		3.51
I-8-54	3-CH ₃	5-Br	H	H		3.37
I-8-55	3-Cl	5-Br	H	H		2.94

Preparation of starting materials of the formula (III)

Example (III-1)



(III-1)

5

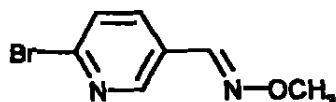
A solution of 0.67 g (3 mmol) 2-(4,4,5,5-tetramethyl-1,3,2-dioxaborolan-2-yl)aniline, 0.80 g (3 mmol) of 2-bromo-3-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridine and 0.05 g (0.68 mmol) of 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocenepalladium(II)chloride in 15 ml dimethyl sulfoxide and 9 ml of a 2 M sodium carbonate solution were heated under an inert gas atmosphere for 16 h. For the work-up the reaction mixture was poured into water, extracted with ethyl acetate, dried over sodium sulphate and concentrated in vacuo. Purification via column chromatography yielded 0.79 g (2.9 mmol, 95 %) of 2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)-2-pyridinyl]aniline [log P (pH 2.3) = 2.79].

10

48

Preparation of starting materials of the formula (VII)Example (VII-1)

(VII-1)



5 10 g of 2-bromopyridine-5-carboxaldehyde (54 mmol) and 5.84 g (70 mmol) of *O*-methyl - hydroxylamine hydrochloride were dissolved in 100 ml of methanol and 50 ml of water. The mixture was stirred for 20 hours at room temperature. Methanol was then evaporated under reduced pressure, water added to the solid residue that was then filtered to afford 7 g (32 mmol) of 6-bromo-pyridine-3-carbaldehyde (*E*)-*O*-methyl-oxime [$\log P$ (pH 2.3) = 2.16].

10

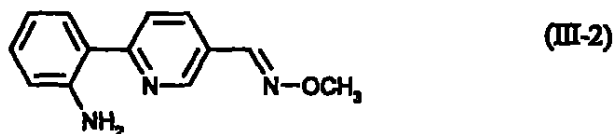
The $\log P$ values given in the Preparation Examples were determined in accordance with EEC Directive 79/831 Annex V.A8 by HPLC (High Performance Liquid Chromatography) using a reversed-phase column (C 18). Temperature: 43°C.

15

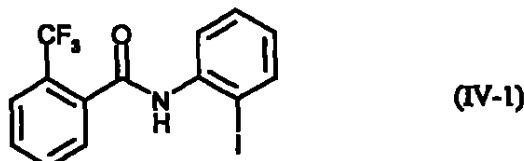
Mobile phases for the determination in the acidic range: 0.1% aqueous phosphoric acid, acetonitrile; linear gradient from 10% acetonitrile to 90% acetonitrile.

20 Calibration was carried out using straight-chain alkan-2-ones (having 3 to 16 carbon atoms), with known $\log P$ values (determination of the $\log P$ values by the retention times using linear interpolation between two successive alkanones).

The $\lambda_{\max}$ values were determined in the maxima of the chromatographic signals using the UV spectra from 200 nm to 400 nm.

Example (III-2)

A mixture of 2.852 g (13 mmol) of 2-iodoaniline, 4.298 g of (17 mmol) of bis(pinacolato)diboron, 3.834 g (39 mmol) of potassium acetate and 24 mg (0.065 mmol) of bis(diphenylphosphino)ferrocenepalladium(II)chloride were stirred in 200 ml of dimethyl formamide at 80°C under argon. After 4 hours, 7 g (33 mmol) of 6-bromo-pyridine-3-carbaldehyde (*E*)-O-methyl-oxime (VII-1), 8.28 g (78 mmol) of sodium carbonate, 100 ml of water and another 24 mg (0.065 mmol) of bis(diphenylphosphino)ferrocenepalladium(II)chloride were added and the mixture was stirred for 12 hours at 80°C. The reaction mixture was cooled down to room temperature, poured into water, extracted with ethyl acetate, dried over sodium sulphate and concentrated under vacuum. Purification via column chromatography yielded 0.9 g (4.2 mmol, 32 %) of 6-(2-amino-phenyl)-pyridine-3-carbaldehyde (*E*)-O-methyl-oxime [$\log P$ (pH 2.3) = 1.59].

15 Preparation of starting materials of the formula (IV)**Example (IV-1)**

To a solution of 13.1 g (0.06 mol) o-iodoaniline and 12.1 g (0.12 mol) triethylamine in 250 ml tetrahydrofuran was added a solution of 15.0 g (0.07 mol) o-trifluoromethyl benzoic acid chloride in 250 ml tetrahydrofuran at 0°C. The reaction mixture was stirred for 30 min at 0°C and for 16 h at room temperature. Concentration in vacuo and column chromatography (ethyl acetate) yielded 23 g (0.06 mmol, 96 %) of *N*-(2-iodophenyl)-2-(trifluoromethyl)benzamide [$\log P$ (pH 2.3) = 2.98].

~~48~~
49Use examplesExample A5 ***Podosphaera* test (apple) / protective**

Solvent: 24.5 parts by weight of acetone
 24.5 parts by weight of dimethylacetamide
Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

10

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

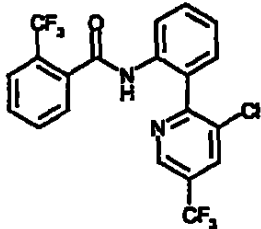
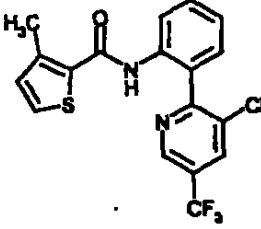
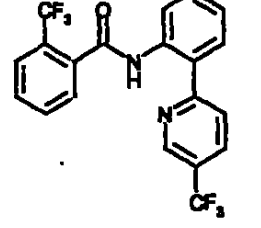
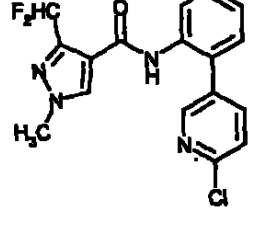
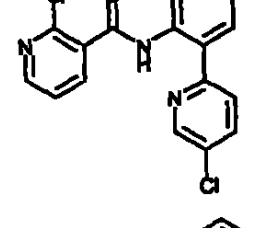
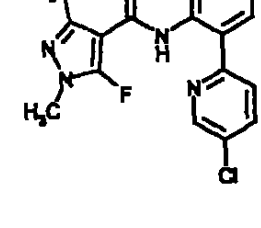
15 To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated application rate. After the spray coating has dried on, the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of the apple mildew pathogen *Podosphaera leucotricha*. The plants are then placed in a greenhouse at about 23°C and a relative atmospheric humidity of about 70 %.

20 Evaluation is carried out 10 days after the inoculation. 0 % means an efficacy which corresponds to that of the control, whereas an efficacy of 100 % means that no infection is observed.

Active compounds, application rates and test results are shown in the table below.

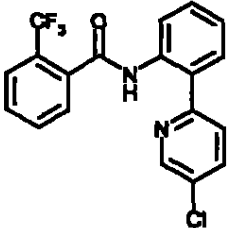
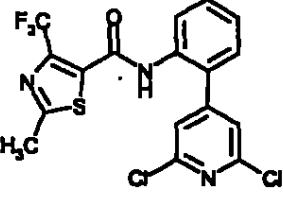
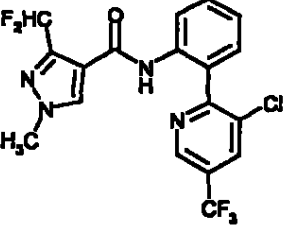
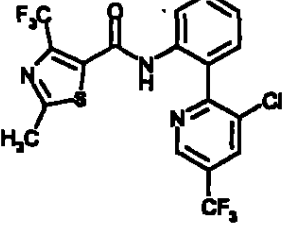
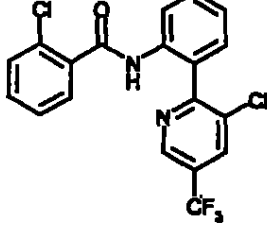
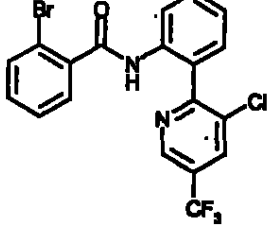
Table A

Podospaera test (apple) / protective

Active compound according to the invention	Application rate of active compound in g/ha	Efficacy in %
 (I-8-1)	100	100
 (I-8-3)	100	100
 (I-8-9)	100	97
 (I-6-7)	100	98
 (I-8-10)	100	100
 (I-8-11)	100	95

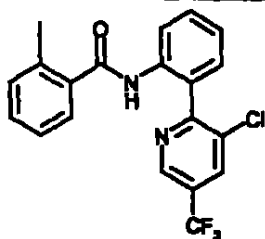
50

Podosphaera test (apple) / protective

Active compound according to the invention	Application rate of active compound in g/ha	Efficacy in %
 (I-8-12)	100	92
 (I-7-10)	100	100
 (I-8-27)	100	97
 (I-8-28)	100	96
 (I-8-20)	100	100
 (I-8-21)	100	100

Podosphaera test (apple) / protective

Active compound according to the invention	Application rate of active compound in g/ha	Efficacy in %
---	--	------------------



(I-8-22)

100

100

51

Example B**Venturia Test (Apple) / protective**

- 5 Solvents: 24.5 parts by weight acetone
 24.5 parts by weight dimethylacetamide
Emulsifier: 1.0 part by weight alkylaryl polyglycol ether

10 To produce a suitable preparation of the active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvents and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the desired concentration.

15 To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated application rate. After the spray coating has dried on, the plants are inoculated with an aqueous conidia suspension of the apple scab pathogen *Venturia inaequalis* and then remain in an incubation cabin at about 20°C and 100 % relative atmospheric humidity for 1 day.

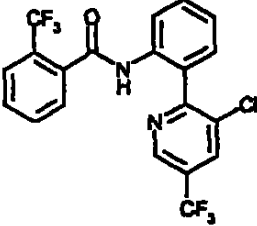
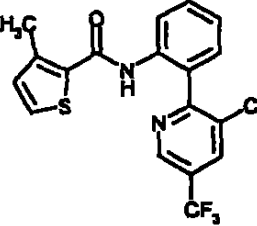
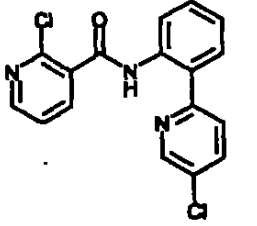
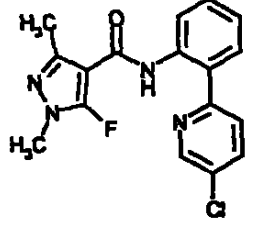
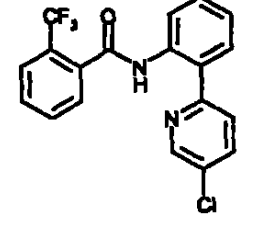
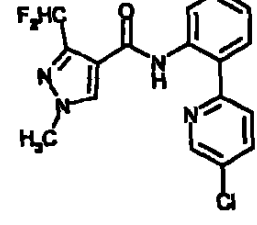
20 The plants are then placed in a greenhouse at about 21°C and a relative atmospheric humidity of about 90 %.

Evaluation is carried out 10 days after the inoculation. 0 % means an efficacy which corresponds to that of the control, whereas an efficacy of 100.% means that no infection is observed.

Active compounds, application rates and test results are shown in the table below.

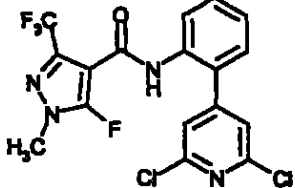
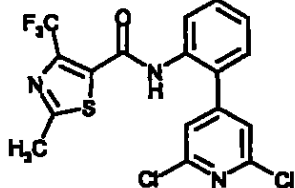
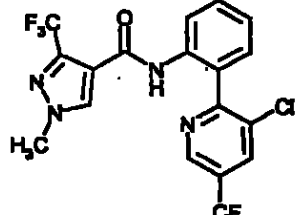
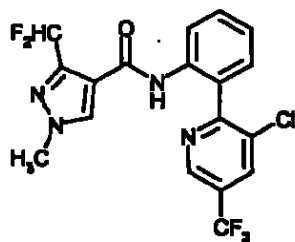
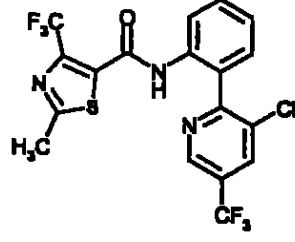
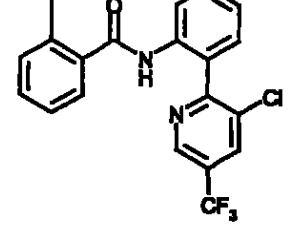
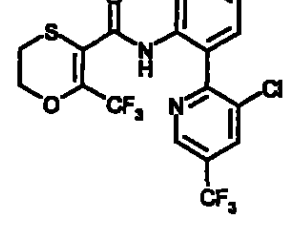
Table B

Venturia Test (Apple) / protective

Active compound according to the invention	Application rate of active compound in g/ha	Efficacy in %
 (I-8-1)	100	100
 (I-8-3)	100	100
 (I-8-10)	100	100
 (I-8-11)	100	100
 (I-8-12)	100	100
 (I-8-14)	100	100

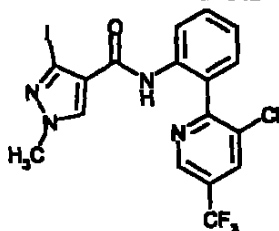
52 S

Venturia Test (Apple) / protective

Active compound according to the invention	Application rate of active compound in g/ha	Efficacy in %
 (I-7-9)	100	100
 (I-7-10)	100	100
 (I-8-29)	100	98
 (I-8-27)	100	100
 (I-8-28)	100	98
 (I-8-22)	100	99
 (I-8-25)	100	99

Venturia Test (Apple) / protective

Active compound according to the invention	Application rate of active compound in g/ha	Efficacy in %
---	--	------------------



(I-8-30)

100

92

Example C**Alternaria test (tomato) / protective**

- 5 Solvent: 49 parts by weight of N,N-dimethylformamide
 Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the
10 desired concentration.

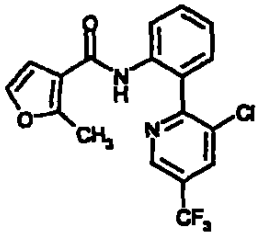
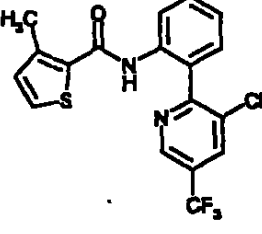
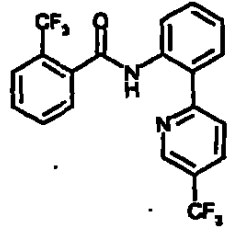
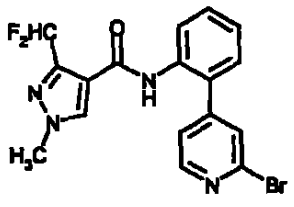
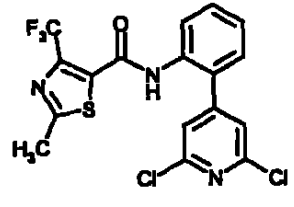
To test for protective activity, young tomato plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated application rate. 1 day after the treatment, the plants are inoculated with a spore suspension of *Alternaria solani* and then remain at 100 % rel. humidity and 20°C for 24 h. The
15 plants then remain at 96 % rel. atmospheric humidity and a temperature of 20°C.

Evaluation was carried out 7 days after the inoculation. 0 % means an efficacy which corresponds to that of the control, whereas an efficacy of 100 % means that no infection is observed.

20 Active compounds, application rates and test results are shown in the table below.

Table C

Alternaria test (tomato) / protective

Active compound according to the invention	Application rate of active compound in g/ha	Efficacy in %
 (I-8-2)	750	100
 (I-8-3)	750	95
 (I-8-9)	750	95
 (I-7-6)	750	95
 (I-7-10)	750	100

Example D**Pyrenophora teres test (barley) / protective**

- 5 Solvent: 50 parts by weight of N,N-dimethylacetamide
 Emulsifier: 1 parts by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amount of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the
10 desired concentration.

To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated application rate. After the spray coating has dried on, the plants are sprayed with a conidia suspension of *Pyrenophora teres*. The plants remain in an incubation cabin at 20°C and 100 %
15 relative atmospheric humidity for 48 hours.

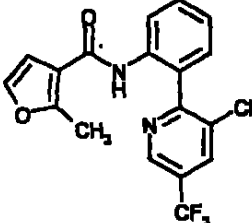
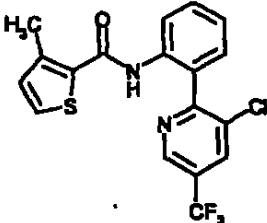
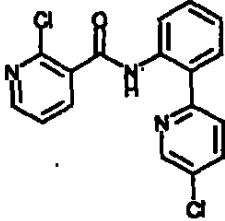
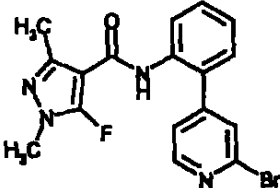
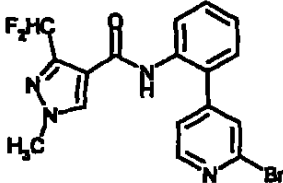
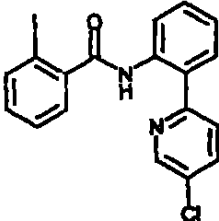
The plants are then placed in a greenhouse at a temperature of about 20°C and a relative atmospheric humidity of about 80 %.

20 Evaluation is carried out 8 days after the inoculation. 0 % means an efficacy which corresponds to that of the control, whereas an efficacy of 100 % means that no infection is observed.

Active compounds, application rates and test results are shown in the table below.

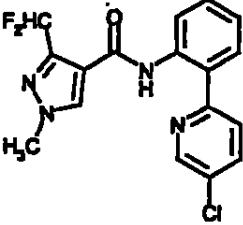
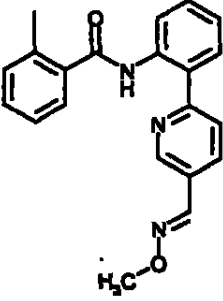
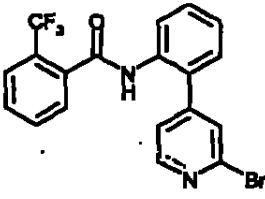
Table D

Pyrenophora teres test (barley) / protective

Active compound according to the invention	Application rate of active compound in g/ha	Efficacy in %
 (I-8-2)	500	100
 (I-8-3)	500	100
 (I-8-10)	500	100
 (I-7-4)	500	93
 (I-7-6)	500	93
 (I-8-13)	500	94

55 54

Pyrenophora teres test (barley) / protective

Active compound according to the invention	Application rate of active compound in g/ha	Efficacy in %
 (I-8-14)	500	94
 (I-8-18)	500	94
 (I-7-5)	500	93

Example E**Puccinia test (wheat) / protective**

- 5 Solvent: 50 parts by weight of N,N-dimethylacetamide
 Emulsifier: 1 part by weight of alkylaryl polyglycol ether

To produce a suitable preparation of active compound, 1 part by weight of active compound is mixed with the stated amounts of solvent and emulsifier, and the concentrate is diluted with water to the
10 desired concentration.

To test for protective activity, young plants are sprayed with the preparation of active compound at the stated application rate. After the spray coating has dried on, the plants are sprayed with a conidia suspension of *Puccinia recondita*. The plants remain in an incubation cabin at 20°C and 100 %
15 relative atmospheric humidity for 48 hours.

The plants are then placed in a greenhouse at a temperature of approximately 20°C and a relative atmospheric humidity of 80 % to promote the development of rust pustules.

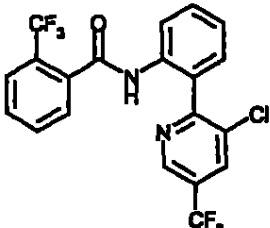
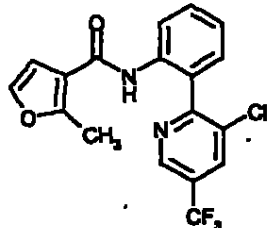
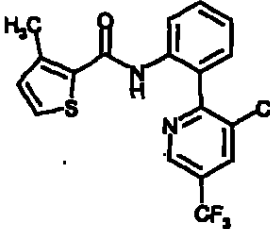
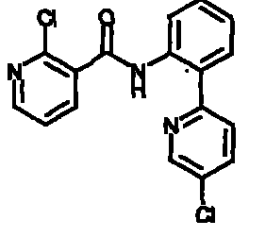
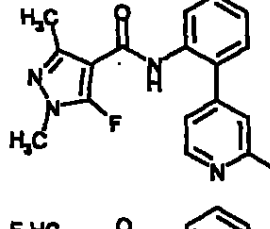
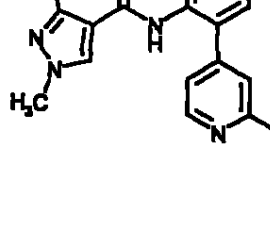
20 Evaluation is carried out 10 days after the inoculation. 0 % means an efficacy which corresponds to that of the control, whereas an efficacy of 100 % means that no infection is observed.

Active compounds, application rates and test results are shown in the table below.

56 58

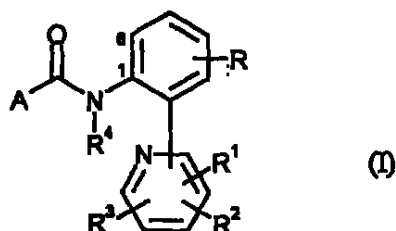
Table E

Puccinia test (wheat) / protective

Active compound according to the invention	Application rate of active compound in g/ha	Efficacy in %
 (I-8-1)	500	100
 (I-8-2)	500	100
 (I-8-3)	500	100
 (I-8-10)	500	94
 (I-7-4)	500	100
 (I-7-6)	500	100

Patent Claims

1. Pyridinylanilides of the formula (I)



5 in which

R represents hydrogen, fluorine, chlorine, methyl or trifluoromethyl;

R^1 , R^2 and R^3 independently of one another each represents hydrogen, halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thiocarbamoyl;

10 or represents in each case straight-chain or branched alkyl, hydroxyalkyl, oxoalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, dialkoxyalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkylsulfonyl having in each case 1 to 8 carbon atoms in the respective alkyl moiety; or represents in each case straight-chain or branched alkenyl or alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms;

15 or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 13 identical or different halogen atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkenyl or halogenoalkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms and 1 to 11 identical or different halogen atoms;

20 or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkylcarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxycarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain, alkenylcarbonyl or alkynylcarbonyl having 2 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain;

or represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

or represents in each case the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 represents hydrogen, hydroxyl or C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms, or C_3 - C_6 -cycloalkyl and

30 Q^2 represents hydroxyl, amino, methylamino, phenyl, benzyl; or represents C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -alkoxy, each of which is optionally substituted by halogen, cyano, hydroxyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_1 - C_4 -alkylamino, di(C_1 - C_4 -

alkyl)amino or phenyl; or represents C₂-C₄-alkenylloxy or C₂-C₄-alkynylloxy, represents phenyl, phenoxy, phenylthio, benzoyl, benzoylphenyl, cinnamoyl, heterocyclyl or phenylalkyl, phenylalkylloxy, phenylalkylthio or heterocyclalkyl having in each case 1 to 3 carbon atoms in the respective alkyl moieties, each of which is optionally mono- to tri-substituted, identically or differently, in the ring moiety by halogen, in each case straight-chain or branched C₁-C₄-alkyl and C₁-C₄-alkoxy;

or

R² and R³, if attached to the pyridinyl moiety in ortho position to each other, furthermore together represent C₃-C₄-alkylene, C₃-C₄-alkenylene, C₂-C₃-oxyalkylene or C₁-C₂-dioxoalkylene, in each case optionally mono- to tetra-substituted, identically or differently, by fluorine, chlorine, oxo, methyl, ethyl, trifluoromethyl;

R⁴ represents hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-alkylsulfinyl, C₁-C₈-alkylsulfonyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-cycloalkyl; C₁-C₈-halogenoalkyl, C₁-C₄-halogenoalkylthio, C₁-C₄-halogenoalkylsulfinyl, C₁-C₄-halogenoalkylsulfonyl, halogeno-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; (C₁-C₃-halogenoalkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-halogenoalkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl having in each case 1 to 7 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms, (C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl, (C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl having in each case 1 to 6 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms, (C₁-C₃-halogenoalkyl)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl, (C₁-C₃-halogenoalkoxy)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl having in each case 1 to 13 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; -COR⁵, -CONR⁶R⁷ or -CH₂NR⁸R⁹,

R⁵ represents hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-alkoxy, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-cycloalkyl; C₁-C₈-halogenoalkyl, C₁-C₄-halogenoalkoxy, halogeno-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; or -COR¹⁰,

R⁶ and R⁷ independently of one another each represent hydrogen, C₁-C₈-alkyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-cycloalkyl; C₁-C₈-halogenoalkyl, halogeno-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₈-halogenocycloalkyl having in each case 1 bis 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms,

R⁶ and R⁷ furthermore together with the nitrogen atom to which they are attached, represent a saturated 5- to 8-membered heterocycle, which heterocycle may have 1 or 2 additional, non-adjacent heteroatoms selected from the group consisting of oxygen, sulphur and NR¹¹, and which heterocycle may optionally be mono- to poly-substituted

ted, identically or differently, by halogen or C₁-C₄-alkyl,

R⁸ and R⁹ independently of one another each represent hydrogen, C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl; C₁-C₆-halogenoalkyl, C₃-C₆-halogenocycloalkyl having in each case 1 bis 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms,

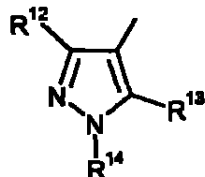
5 R⁸ and R⁹ furthermore together with the nitrogen atom to which they are attached, represent a saturated 5- to 8-membered heterocycle, which heterocycle may have 1 or 2 additional, non-adjacent heteroatoms selected from the group consisting of oxygen, sulphur and NR¹¹, and which heterocycle may optionally be mono- to poly-substituted, identically or differently, by halogen or C₁-C₄-alkyl,

10 R¹⁰ represents hydrogen, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl; C₁-C₆-halogenoalkyl, C₁-C₆-halogenoalkoxy, halogeno-C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₆-halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms,

R¹¹ represents hydrogen or C₁-C₆-alkyl,

15

A represents a radical of the formula (A1)



(A1), wherein

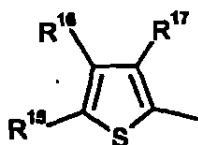
20 R¹² represents hydrogen, cyano, halogen, nitro, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-halogenoalkoxy or C₁-C₄-halogenoalkylthio each having 1 to 5 halogen atoms, aminocarbonyl or aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl and

R¹³ represents hydrogen, halogen, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy or C₁-C₄-alkylthio and

25 R¹⁴ represents hydrogen, C₁-C₄-alkyl, hydroxy-C₁-C₄-alkyl, C₂-C₆-alkenyl, C₃-C₆-cycloalkyl, C₁-C₄-alkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-halogenoalkylthio-C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkoxy-C₁-C₄-alkyl each having 1 to 5 halogen atoms, or phenyl,

or

A represents a radical of the formula (A2)



(A2), wherein

30

R¹⁵ and R¹⁶ independently of one another each represent hydrogen, halogen, C₁-C₄-

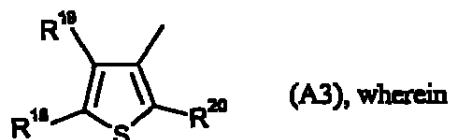
58
37

alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and

R¹⁷ represents halogen, cyano or C₁-C₄-alkyl, or C₁-C₄-halogenoalkyl or C₁-C₄-halogenoalkoxy each having 1 to 5 halogen atoms,

or

5 A represents a radical of the formula (A3)



R¹⁸ and R¹⁹ independently of one another each represent hydrogen, halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and

R²⁰ represents hydrogen, halogen, C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

10

or

A represents a radical of the formula (A4)



R²¹ represents hydrogen, halogen, hydroxyl, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-halogenoalkoxy or C₁-C₄-halogenoalkylthio each having 1 to 5 halogen atoms,

15

or

A represents a radical of the formula (A5)



20

R²² represents halogen, hydroxyl, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-halogenoalkylthio or C₁-C₄-halogenoalkoxy each having 1 to 5 halogen atoms and

R²³ represents hydrogen, halogen, cyano, C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-halogenoalkoxy each having 1 to 5 halogen atoms, C₁-C₄-alkylsulphinyl or C₁-C₄-alkylsulphonyl,

25

or

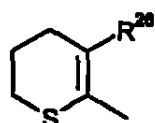
A represents a radical of the formula (A6)



- R^{24} represents C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and
 R^{25} represents C_1 - C_4 -alkyl,
 Q^3 represents a sulphur or oxygen atom, represents SO , SO_2 or CH_2 ,
 p represents 0, 1 or 2, where R^{25} represents identical or different radicals if p represents 2,

or

A represents a radical of the formula (A7)

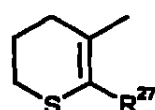


(A7), wherein

- R^{26} represents C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A8)

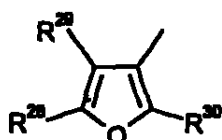


(A8), wherein

- R^{27} represents C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A9)

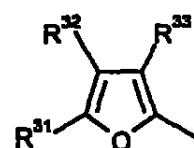


(A9), wherein

- R^{28} and R^{29} independently of one another each represent hydrogen, halogen, amino,
 C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and
 R^{30} represents hydrogen, halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1
 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A10)



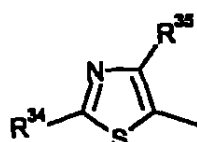
(A10), wherein

- R^{31} and R^{32} independently of one another each represent hydrogen, halogen, amino,
 nitro, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and
 R^{33} represents hydrogen, halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1
 to 5 halogen atoms,

or

59
58

A represents a radical of the formula (A11)



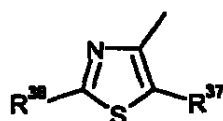
(A11), wherein

R^{34} represents hydrogen, halogen, amino, C_1 - C_4 -alkylamino, di- $(C_1$ - C_4 -alkyl)-amino, cyano, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and

R^{35} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A12)



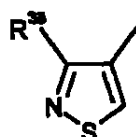
(A12), wherein

R^{36} represents hydrogen, halogen, amino, C_1 - C_4 -alkylamino, di- $(C_1$ - C_4 -alkyl)-amino, cyano, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms and

R^{37} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A13)

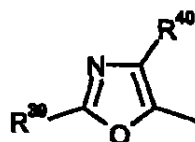


(A13), wherein

R^{38} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A14)



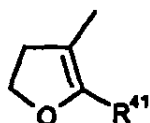
(A14), wherein

R^{39} represents hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl and

R^{40} represents halogen or C_1 - C_4 -alkyl,

or

A represents a radical of the formula (A15)

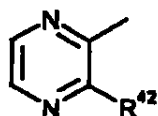


(A15), wherein

R^{41} represents C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A16)

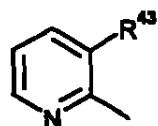


(A16), wherein

R^{42} represents hydrogen, halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms,

or

A represents a radical of the formula (A17)



(A17), wherein

R^{43} represents halogen, hydroxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_1 - C_4 -halogenoalkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkylthio or C_1 - C_4 -halogenoalkoxy each having 1 to 5 halogen atoms,

15 excluded compounds of the formula (I), in which

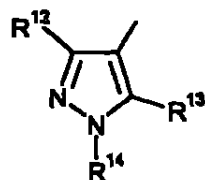
R represents hydrogen and

R^1 , R^2 and R^3 independently of one another each represents hydrogen, halogen; or straight-chain or branched alkyl having 1 to 4 carbon atoms; or straight-chain or branched halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms; and

20 R^4 represents hydrogen

and

A represents a radical of the formula (A1)



(A1), wherein

R^{12} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkyl and

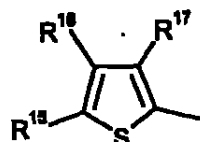
25 R^{13} represents hydrogen and

R^{14} represents methyl,

or

60
54

A represents a radical of the formula (A2)



(A2), wherein

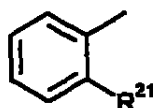
R^{15} and R^{16} independently of one another each represent hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl and

R^{17} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl,

5

or

A represents a radical of the formula (A4)



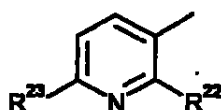
(A4), wherein

R^{21} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl,

or

10

A represents a radical of the formula (A5)



(A5), wherein

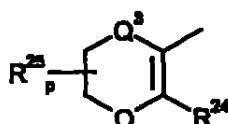
R^{22} represents halogen and

R^{23} represents hydrogen,

or

15

A represents a radical of the formula (A6)



(A6), wherein

R^{24} represents methyl and

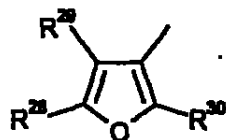
Q^3 represents a sulphur or CH_2 ,

p represents 0,

20

or

A represents a radical of the formula (A9)



(A9), wherein

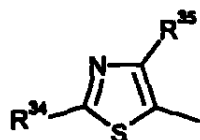
R^{28} and R^{29} independently of one another each represent hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl and

R^{30} represents methyl,

25

or

A represents a radical of the formula (A11)



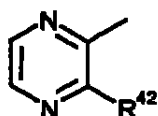
(A11), wherein

R^{34} represents hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl and

R^{35} represents halogen, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkyl,

or

5 A represents a radical of the formula (A16)



(A16), wherein

R^{42} represents halogen.

2. Pyridinylanilides of the formula (I) according to Claim 1, in which

10 R represents hydrogen, fluorine, chlorine, methyl or trifluoromethyl;

R^1 , R^2 and R^3 independently of one another each represents hydrogen, halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thiocarbamoyl;

15 or represents in each case straight-chain or branched alkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 4 carbon atoms and 1 to 9 identical or different halogen atoms;

20 or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkylcarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxy carbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 4 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain;

or represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

25 or represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 represents hydrogen, hydroxyl or C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms or C_3 - C_6 -cycloalkyl and

Q^2 represents hydroxyl, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -halogenoalkyl or C_1 - C_4 -halogenoalkoxy each having 1 to 9 identical or different halogen atoms,

30 or

R^2 and R^3 , if attached to the pyridinyl moiety in ortho position to each other, furthermore together represent $-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_4-$, $-CH=CH-CH=CH-$, $-O(CH_2)_2-$, $-O(CH_2)_3-$,

61

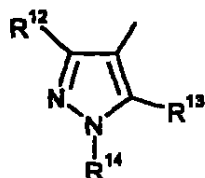
-OCH₂O-, -O(CH₂)₂O-, in each case optionally mono- to tetra-substituted, identically or differently, by fluorine, chlorine, oxo, methyl, ethyl, trifluoromethyl,

- 5 R^4 represents hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₄-alkylsulfinyl, C₁-C₄-alkylsulfonyl, C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl; C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-halogenoalkylthio, C₁-C₄-halogenoalkylsulfinyl, C₁-C₄-halogenoalkylsulfonyl, halogeno-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; formyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl; (C₁-C₃-halogenoalkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, (C₁-C₃-halogenoalkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl having in each case 1 to 7 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms, (C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl, (C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl having in each case 1 to 6 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms, (C₁-C₃-halogenoalkyl)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl, (C₁-C₃-halogenoalkoxy)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl having in each case 1 to 13 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; -COR⁵, -CONR⁶R⁷ or -CH₂NR⁸R⁹,
- 10 R^5 represents hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl; C₁-C₄-halogenoalkyl, C₁-C₄-halogenoalkoxy, halogeno-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; or -COR¹⁰,
- 15 R^6 and R^7 independently of one another each represent hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl; C₁-C₄-halogenoalkyl, halogeno-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms,
- 20 R^6 and R^7 furthermore together with the nitrogen atom to which they are attached, represent a saturated 5- to 8-membered heterocycle, which heterocycle may have 1 or 2 additional, non-adjacent heteroatoms selected from the group consisting of oxygen, sulphur and NR¹¹, and which heterocycle may optionally be mono- to tetra-substituted, identically or differently, by halogen or C₁-C₄-alkyl,
- 25 R^8 and R^9 independently of one another each represent hydrogen, C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-cycloalkyl; C₁-C₄-halogenoalkyl, C₃-C₆-halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms,
- 30 R^8 and R^9 furthermore together with the nitrogen atom to which they are attached, represent a saturated 5- to 8-membered heterocycle, which heterocycle may have 1 or 2 additional, non-adjacent heteroatoms selected from the group consisting of oxygen, sulphur and NR¹¹, and which heterocycle may optionally be mono- to tetra-substituted, identically or differently, by halogen or C₁-C₄-alkyl,
- 35

R^{10} represents hydrogen, 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 -halogenoalkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkoxy, halogeno- C_1 - C_3 -alkoxy- C_1 - C_3 -alkyl, C_3 - C_6 -halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms,

5 R^{11} represents hydrogen or C_1 - C_4 -alkyl,

A represents a radical of the formula (A1)



(A1), wherein

10 R^{12} represents hydrogen, cyano, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, iso-propyl, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio, cyclopropyl, C_1 - C_2 -halogenoalkyl, C_1 - C_2 -halogenoalkoxy each having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, trifluoromethylthio, difluoromethylthio, aminocarbonyl, aminocarbonylmethyl or aminocarbonyl ethyl and

15 R^{13} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, methoxy, ethoxy, methylthio or ethylthio and

R^{14} represents hydrogen, methyl, ethyl, n-propyl, iso-propyl, C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, hydroxymethyl, hydroxyethyl, cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl or phenyl,

or

20 A represents a radical of the formula (A2)



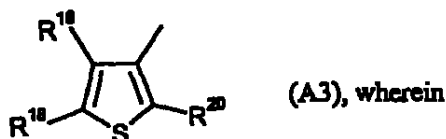
(A2), wherein

R^{15} and R^{16} independently of one another each represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms and

25 R^{17} represents fluorine, chlorine, bromine, cyano, methyl, ethyl, C_1 - C_2 -halogenoalkyl or C_1 - C_2 -halogenoalkoxy each having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms,

or

A represents a radical of the formula (A3)



R^{18} and R^{19} independently of one another each represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms and

5 R^{20} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms,

or

A represents a radical of the formula (A4)



10 R^{21} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, hydroxyl, cyano, C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_2 -halogenoalkyl, C_1 - C_2 -halogenoalkoxy or C_1 - C_2 -halogenoalkylthio each having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms,

or

A represents a radical of the formula (A5)



15

R^{22} represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, hydroxyl, cyano, C_1 - C_4 -alkyl, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio, difluoromethylthio, trifluoromethylthio, C_1 - C_2 -halogenoalkyl or C_1 - C_2 -halogenoalkoxy each having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms and

20 R^{23} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, cyano, C_1 - C_4 -alkyl, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio, C_1 - C_2 -halogenoalkyl or C_1 - C_2 -halogenoalkoxy each having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms, C_1 - C_2 -alkylsulphinyl or C_1 - C_2 -alkylsulphonyl,

or

25 A represents a radical of the formula (A6)



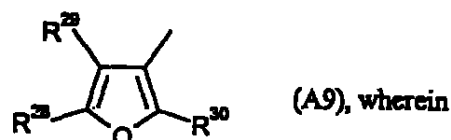
R^{24} represents methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms and

R^{25} represents methyl or ethyl,
 Q^3 represents a sulphur atom, SO_2 or CH_2 ,
 p represents 0 or 1,

or

5

A represents a radical of the formula (A9)



R^{28} and R^{29} independently of one another each represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, amino, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms and

10

R^{30} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms,

or

A represents a radical of the formula (A10)



15

R^{31} and R^{32} independently of one another each preferably represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, amino, nitro, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms and

R^{33} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms,

20

or

A represents a radical of the formula (A11)



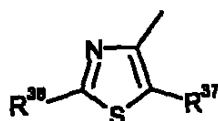
R^{34} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, amino, C_1 - C_4 -alkylamino, di(C_1 - C_4 -alkyl)amino, cyano, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms and

25

R^{35} represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms,

or

A represents a radical of the formula (A12)



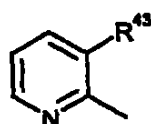
(A12), wherein

R^{36} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, amino, C_1 - C_4 -alkylamino, di(C_1 - C_4 -alkyl)amino, cyano, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms and

5 R^{37} represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C_1 - C_2 -halogenoalkyl having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms,

or

A represents a radical of the formula (A17)



(A17), wherein

10 R^{43} preferably represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, hydroxyl, C_1 - C_4 -alkyl, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio, difluoromethylthio, trifluoromethylthio, C_1 - C_2 -halogenoalkyl or C_1 - C_2 -halogenoalkoxy each having 1 to 5 fluorine, chlorine and/or bromine atoms,

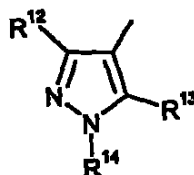
15 excluded compounds of the formula (I), in which

R represents hydrogen and

R^1 , R^2 and R^3 independently of one another each represents hydrogen, halogen; or straight-chain or branched alkyl having 1 to 4 carbon atoms; or straight-chain or branched halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms; and

20 R^4 represents hydrogen and

A represents a radical of the formula (A1)



(A1), wherein

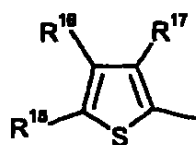
25 R^{12} represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, iso-propyl, C_1 - C_2 -halogenoalkyl and

R^{13} represents hydrogen and

R^{14} represents methyl,

or

A represents a radical of the formula (A2)



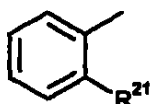
(A2), wherein

R^{15} and R^{16} independently of one another each represent hydrogen, methyl or ethyl
and

R^{17} represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, or C_1 - C_2 -halogenoalkyl,

5 or

A represents a radical of the formula (A4)

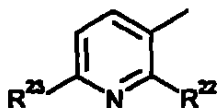


(A4), wherein

R^{21} represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -halo-
genoalkyl,

10 or

A represents a radical of the formula (A5)



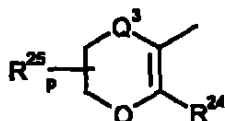
(A5), wherein

R^{22} represents fluorine, chlorine, bromine, iodine and

R^{23} represents hydrogen,

15 or

A represents a radical of the formula (A6)



(A6), wherein

R^{24} represents methyl and

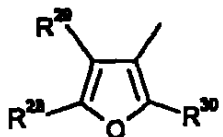
Q^3 represents a sulphur or CH_2 ,

20

p represents 0,

or

A represents a radical of the formula (A9)



(A9), wherein

R^{29} and R^{30} independently of one another each represent hydrogen, methyl or ethyl
and

R^{30} represents methyl,

25

6A 6B

or

A represents a radical of the formula (A11)



(A11), wherein

R³⁴ represents hydrogen, methyl or ethyl and5 R³⁵ represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl or C₁-C₂-halogenoalkyl.

3. Pyridinylanilides of the formula (I) according to Claim 1, in which

R represents hydrogen, fluorine, chlorine, methyl or trifluoromethyl;

10 R¹, R² and R³ independently of one another each represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, cyano; methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, methoxy, ethoxy, n- or iso-propoxy, n-, iso-, sec- or tert-butoxy, methylthio, ethylthio, n- or iso-propylthio, n-, iso-, sec- or tert-butylthio, trifluoromethyl, trifluoroethyl, difluoromethoxy, trifluoromethoxy, difluorochloromethoxy, trifluoroethoxy, cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl,

15 or represents the grouping -C(Q¹)=N-Q², whereinQ¹ represents hydrogen, methyl, ethyl, trifluoromethyl or cyclopropyl, andQ² represents hydroxyl, methoxy, ethoxy, n-propoxy or iso-propoxy,

or

20 R² and R³, if attached to the pyridinyl moiety in ortho position to each other, furthermore together represent -(CH₂)₃-, -(CH₂)₄-, -CH=CH-CH=CH-, -OCH₂O-, -O(CH₂)₂O-, -OCF₂O-, -O(CF₂)₂O-,

25 R⁴ represents hydrogen, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, pentyl or hexyl, methylsulfinyl, ethylsulfinyl, n- or iso-propylsulfinyl, n-, iso-, sec- or tert-butylsulfinyl, methylsulfonyl, ethylsulfonyl, n- or iso-propylsulfonyl, n-, iso-, sec- or tert-butylsulfonyl, methoxymethyl, methoxyethyl, ethoxymethyl, ethoxyethyl, cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl, trifluoromethyl, trichloromethyl, trifluoroethyl, difluoromethylthio, difluorochloromethylthio, trifluoromethylthio, trifluoromethylsulfinyl, trifluoromethylsulfonyl, trifluoromethoxymethyl; -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, -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,

30

$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CF}_3$,
 $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCCl}_2\text{CCl}_3$,
 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OCH}_2\text{CCl}_3$,
 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{O}-\text{CCl}_2\text{CCl}_3$; $-\text{COR}^5$, $-\text{CONR}^6\text{R}^7$ or $-\text{CH}_2\text{NR}^8\text{R}^9$,

5 R^5 represents hydrogen, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, tert-butyl, methoxy, ethoxy, tert-butoxy, cyclopropyl; trifluoromethyl, trifluoromethoxy; or $-\text{COR}^{10}$,

R^6 and R^7 independently of one another each represent hydrogen, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, methoxymethyl, methoxyethyl, ethoxymethyl, ethoxyethyl, cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl; trifluoromethyl, trichloromethyl, trifluoroethyl, trifluoromethoxymethyl,

10 R^6 and R^7 furthermore together with the nitrogen atom to which they are attached, represent a saturated heterocycle selected from the group consisting of morpholine, thiomorpholine and piperazine, which heterocycle may optionally be mono- to tetra-substituted, identically or differently, by fluorine, chlorine, bromine or methyl and where the piperazine additionally at the second nitrogen atom may be substituted by R^{11} ,

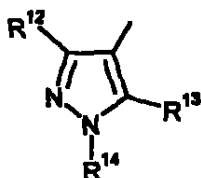
R^8 and R^9 independently of one another each represent hydrogen, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl, methoxymethyl, methoxyethyl, ethoxymethyl, ethoxyethyl, cyclopropyl, cyclopentyl, cyclohexyl; trifluoromethyl, trichloromethyl, trifluoroethyl, trifluoromethoxymethyl,

20 R^8 and R^9 furthermore together with the nitrogen atom to which they are attached, represent a saturated heterocycle selected from the group consisting of morpholine, thiomorpholine and piperazine, which heterocycle may optionally be mono- to tetra-substituted, identically or differently, by fluorine, chlorine, bromine or methyl and where the piperazine additionally at the second nitrogen atom may be substituted by R^{11} ,

25 R^{10} represents hydrogen, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, tert-butyl, methoxy, ethoxy, n- or iso-propoxy, tert-butoxy, cyclopropyl; trifluoromethyl, trifluoromethoxy,

R^{11} represents hydrogen, methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl,

A represents a radical of the formula (A1)



(A1), wherein

30

R^{12} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, iso-propyl, monofluoromethyl, monofluoroethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, difluorochloromethyl, trichloromethyl, dichloromethyl, cyclopropyl,

65 64

methoxy, ethoxy, trifluoromethoxy, trichloromethoxy, methylthio, ethylthio, trifluoromethylthio or difluoromethylthio and

R^{13} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine or methyl and

R^{14} represents hydrogen, methyl, ethyl, iso-propyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, hydroxymethyl, hydroxyethyl or phenyl,

5

or

A represents a radical of the formula (A2)



(A2), wherein

R^{15} and R^{16} independently of one another each represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl and

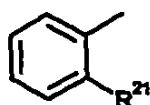
10

R^{17} represents fluorine, chlorine, bromine, cyano, methyl, trifluoromethyl, trifluoromethoxy, difluoromethoxy, difluorochloromethoxy or trichloromethoxy,

15

or

A represents a radical of the formula (A4)



(A4), wherein

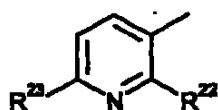
R^{21} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, hydroxyl, cyano, methyl, ethyl, n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, difluorochloromethyl, trichloromethyl, trifluoromethoxy, difluoromethoxy, difluorochloromethoxy, trichloromethoxy, trifluoromethylthio, difluoromethylthio, difluorochloromethylthio or trichloromethylthio,

20

or

25

A represents a radical of the formula (A5)



(A5), wherein

R^{22} represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, hydroxyl, cyano, methyl, ethyl, n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl, trichloromethyl, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio, difluoromethylthio, trifluoromethylthio, tri-

30

fluoromethoxy, difluoromethoxy, difluorochloromethoxy or trichloromethoxy and

R^{23} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, cyano, n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl, trichloromethyl, methoxy, ethoxy, methylthio, ethylthio, trifluoromethoxy, difluoromethoxy, difluorochloromethoxy, trichloromethoxy, methylsulphinyl or methylsulphonyl,

or

A represents a radical of the formula (A6)



R^{24} represents methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl and

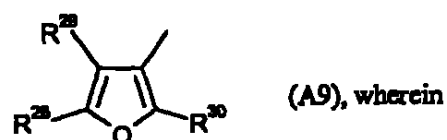
R^{23} represents methyl,

Q^3 represents a sulphur atom or CH_2 ,

p represents 0,

or

A represents a radical of the formula (A9)



R^{28} and R^{29} independently of one another each represent hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl and

R^{30} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl,

or

A represents a radical of the formula (A11)



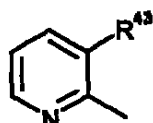
R^{34} represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine, amino, methylamino, dimethylamino, cyano, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl and

66 68

R^{35} represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl,

or

A represents a radical of the formula (A17)



(A17), wherein

R^{43} preferably represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl, trichloromethyl,

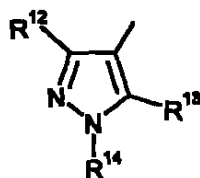
10 excluded compounds of the formula (I), in which

R represents hydrogen and

R^1 , R^2 and R^3 independently of one another each represents hydrogen, fluorine, chlorine, bromine; methyl, ethyl, n- or iso-propyl, n-, iso-, sec- or tert-butyl; or trifluoromethyl or trifluoroethyl; and

15 R^4 represents hydrogen and

A represents a radical of the formula (A1)



(A1), wherein

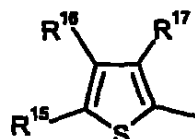
R^{12} represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, iso-propyl, monofluoromethyl, monofluoroethyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, difluorochloromethyl, trichloromethyl, dichloromethyl and

R^{13} represents hydrogen and

R^{14} represents methyl,

or

25 A represents a radical of the formula (A2)



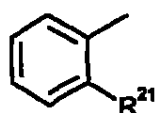
(A2), wherein

R^{15} and R^{16} independently of one another each represent hydrogen, methyl or ethyl and

R^{17} represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, or trifluoromethyl,

or

A represents a radical of the formula (A4)

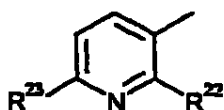


(A4), wherein

R²¹ represents fluorine, chlorine, bromine, iodine, methyl, ethyl, n-propyl, iso-propyl, n-butyl, iso-butyl, sec-butyl, tert-butyl, difluoromethyl, trifluoromethyl, difluorochloromethyl, trichloromethyl,

or

A represents a radical of the formula (A5)



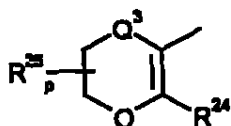
(A5), wherein

R²² represents fluorine, chlorine, bromine, iodine and

R²³ represents hydrogen,

or

A represents a radical of the formula (A6)



(A6), wherein

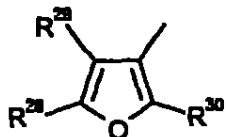
R²⁴ represents methyl and

Q¹ represents a sulphur or CH₂,

p represents 0,

or

A represents a radical of the formula (A9)



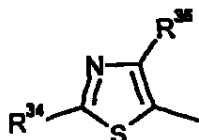
(A9), wherein

R²⁸ and R²⁹ independently of one another each represent hydrogen, methyl or ethyl
and

R³⁰ represents methyl,

or

A represents a radical of the formula (A11)



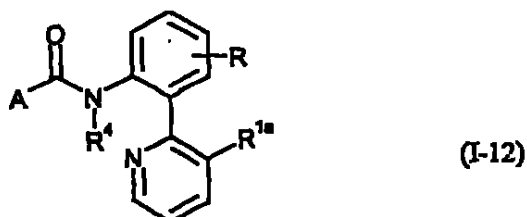
(A11), wherein

67 66

R^{34} represents hydrogen, methyl or ethyl and

R^{35} represents fluorine, chlorine, bromine, methyl, ethyl, trifluoromethyl, difluoromethyl, difluorochloromethyl or trichloromethyl.

- 5 4. Pyridinylanilides of the formula (I) according to Claims 1, 2 or 3, in which R^4 represents hydrogen.
5. Pyridinylanilides of the formula (I) according to Claims 1, 2 or 3, in which R represents hydrogen.
- 10 6. Pyridinylanilides of the formula (I-12)



in which

R, R^4 and A are as defined in Claims 1, 2 or 3 and

- 15 R^{1a} represents halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thio-carbamoyl;
- or represents in each case straight-chain or branched alkyl, hydroxyalkyl, oxoalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, dialkoxyalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkyl-sulfonyl having in each case 1 to 8 carbon atoms in the respective alkyl moiety;
- 20 or represents in each case straight-chain or branched alkenyl or alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms;
- or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 13 identical or different halogen atoms;
- 25 or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkenyl or halogeno-alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms and 1 to 11 identical or different halogen atoms;
- or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkyl-carbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxycarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocar-bonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 6 carbon atoms
- 30 in the respective hydrocarbon chain, alkenylcarbonyl or alkynylcarbonyl having 2 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain;

or represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

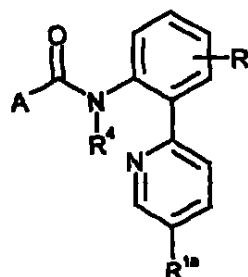
or represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 represents hydrogen, hydroxyl or C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms, or C_3-C_6 -cycloalkyl and

Q^2 represents hydroxyl, amino, methylamino, phenyl, benzyl; or represents C_1-C_4 -alkyl or C_1-C_4 -alkoxy, each of which is optionally substituted by halogen, cyano, hydroxyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -alkylthio, C_1-C_4 -alkylamino, di(C_1-C_4 -alkyl)amino or phenyl; or represents C_2-C_4 -alkenyloxy or C_2-C_4 -alkynyloxy,

represents phenyl, phenoxy, phenylthio, benzoyl, benzoylethenyl, cinnamoyl, heterocyclyl or phenylalkyl, phenylalkyloxy, phenylalkylthio or heterocyclylalkyl having in each case 1 to 3 carbon atoms in the respective alkyl moieties, each of which is optionally mono- to tri-substituted, identically or differently, in the ring moiety by halogen, in each case straight-chain or branched C_1-C_4 -alkyl and C_1-C_4 -alkoxy.

7. Pyridinylanilides of the formula (I-13)



(I-13)

in which

R , R^4 and A are as defined in Claims 1, 2 or 3 and

R^{1a} represents halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thio-carbamoyl;

or represents in each case straight-chain or branched alkyl, hydroxyalkyl, oxoalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, dialkoxyalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkyl-sulfonyl having in each case 1 to 8 carbon atoms in the respective alkyl moiety;

or represents in each case straight-chain or branched alkenyl or alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 13 identical or different halogen atoms;

68 67

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkenyl or halogeno-alkenylloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms and 1 to 11 identical or different halogen atoms;

or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkyl-carbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxycarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocar-bonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain, alkenylcarbonyl or alkynylcarbonyl having 2 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain;

or represents cycloalkyl or cycloalkylloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

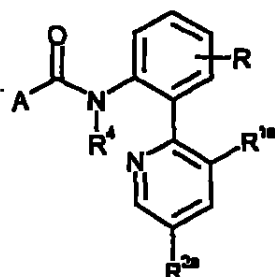
or represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 represents hydrogen, hydroxyl or C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms, or C_3-C_6 -cycloalkyl and

Q^2 represents hydroxyl, amino, methylamino, phenyl, benzyl; or represents C_1-C_4 -alkyl or C_1-C_4 -alkoxy, each of which is optionally substituted by halogen, cyano, hydroxyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -alkylthio, C_1-C_4 -alkylamino, di(C_1-C_4 -alkyl)amino or phenyl; or represents C_2-C_4 -alkenylloxy or C_2-C_4 -alkynylloxy,

represents phenyl, phenoxy, phenylthio, benzoyl, benzoylethenyl, cinnamoyl, heterocyclyl or phenylalkyl, phenylalkylloxy, phenylalkylthio or heterocyclylalkyl having in each case 1 to 3 carbon atoms in the respective alkyl moieties, each of which is optionally mono- to tri-substituted, identically or differently, in the ring moiety by halogen, in each case straight-chain or branched C_1-C_4 -alkyl and C_1-C_4 -alkoxy.

8. Pyridinylanilides of the formula (I-14)



(I-14)

in which

R , R^4 and A are as defined in Claims 1, 2 or 3 and

R^{1a} and R^{2a} independently of one another each represents halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thiocarbamoyl;

or represents in each case straight-chain or branched alkyl, hydroxyalkyl, oxoalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, dialkoxyalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkyl-sulfonyl having in each case 1 to 8 carbon atoms in the respective alkyl moiety;

or represents in each case straight-chain or branched alkenyl or alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 13 identical or different halogen atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkenyl or halogenoalkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms and 1 to 11 identical or different halogen atoms;

or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkylcarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxy carbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain, alkenylcarbonyl or alkynylcarbonyl having 2 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain;

or represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

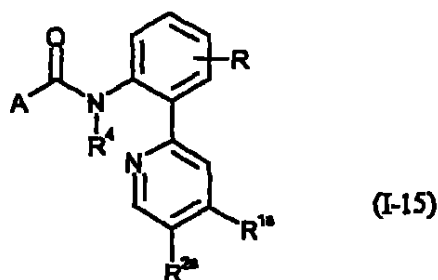
or represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 represents hydrogen, hydroxyl or C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms, or C_3-C_6 -cycloalkyl and

Q^2 represents hydroxyl, amino, methylamino, phenyl, benzyl; or represents C_1-C_4 -alkyl or C_1-C_4 -alkoxy, each of which is optionally substituted by halogen, cyano, hydroxyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -alkylthio, C_1-C_4 -alkylamino, di(C_1-C_4 -alkyl)amino or phenyl; or represents C_1-C_4 -alkenyloxy or C_1-C_4 -alkynyloxy,

represents phenyl, phenoxy, phenylthio, benzoyl, benzoyl ethenyl, cinnamoyl, heterocyclyl or phenylalkyl, phenylalkyloxy, phenylalkylthio or heterocyclylalkyl having in each case 1 to 3 carbon atoms in the respective alkyl moieties, each of which is optionally mono- to tri-substituted, identically or differently, in the ring moiety by halogen, in each case straight-chain or branched C_1-C_4 -alkyl and C_1-C_4 -alkoxy.

9. Pyridinylanilides of the formula (I-15)



in which

R, R^4 and A are as defined in Claims 1, 2 or 3 and

69 68

R^{1a} and R^{2a} independently of one another each represents halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thiocarbamoyl;

or represents in each case straight-chain or branched alkyl, hydroxyalkyl, oxoalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, dialkoxyalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkyl-

sulfonyl having in each case 1 to 8 carbon atoms in the respective alkyl moiety;

or represents in each case straight-chain or branched alkenyl or alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 13 identical or different halogen atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkenyl or halogenoalkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms and 1 to 11 identical or different halogen atoms;

or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkyl-carbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxy-carbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain, alkenylcarbonyl or alkynylcarbonyl having 2 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain;

or represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

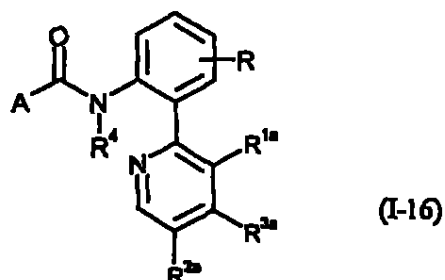
or represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 represents hydrogen, hydroxyl or C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms, or C_3 - C_6 -cycloalkyl and

Q^2 represents hydroxyl, amino, methylamino, phenyl, benzyl; or represents C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -alkoxy, each of which is optionally substituted by halogen, cyano, hydroxyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_1 - C_4 -alkylamino, di(C_1 - C_4 -alkyl)amino or phenyl; or represents C_2 - C_4 -alkenyloxy or C_2 - C_4 -alkynyloxy,

represents phenyl, phenoxy, phenylthio, benzoyl, benzoylethenyl, cinnamoyl, heterocyclyl or phenylalkyl, phenylalkyloxy, phenylalkylthio or heterocyclylalkyl having in each case 1 to 3 carbon atoms in the respective alkyl moieties, each of which is optionally mono- to tri-substituted, identically or differently, in the ring moiety by halogen, in each case straight-chain or branched C_1 - C_4 -alkyl and C_1 - C_4 -alkoxy.

10. Pyridinylamides of the formula (I-16)



in which

R, R⁴ and A are as defined in Claims 1, 2 or 3 and

R^{1a}, R^{2a} and R^{2b} independently of one another each represents halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thiocarbamoyl;

or represents in each case straight-chain or branched alkyl, hydroxyalkyl, oxoalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, dialkoxyalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkylsulfonyl having in each case 1 to 8 carbon atoms in the respective alkyl moiety;

or represents in each case straight-chain or branched alkenyl or alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 13 identical or different halogen atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkenyl or halogenoalkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms and 1 to 11 identical or different halogen atoms;

or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkylcarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxycarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain, alkenylcarbonyl or alkynylcarbonyl having 2 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain;

or represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

or represents the grouping -C(Q¹)=N-Q², wherein

Q¹ represents hydrogen, hydroxyl or C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms, or C₃-C₆-cycloalkyl and

Q² represents hydroxyl, amino, methylamino, phenyl, benzyl; or represents C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-alkoxy, each of which is optionally substituted by halogen, cyano, hydroxyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-alkylamino, di(C₁-C₄-alkyl)amino or phenyl; or represents C₂-C₄-alkenyloxy or C₂-C₄-alkynyloxy,

represents phenyl, phenoxy, phenylthio, benzoyl, benzoyl-ethenyl, cinnamoyl, heterocyclyl or phenylalkyl, phenylalkyloxy, phenylalkylthio or heterocyclylalkyl

70 69

having in each case 1 to 3 carbon atoms in the respective alkyl moieties, each of which is optionally mono- to tri-substituted, identically or differently, in the ring moiety by halogen, in each case straight-chain or branched C₁-C₄-alkyl and C₁-C₄-alkoxy.

- 5 11. Process for preparing pyridinylanilides of the formula (I) according to Claim 1, characterized in that

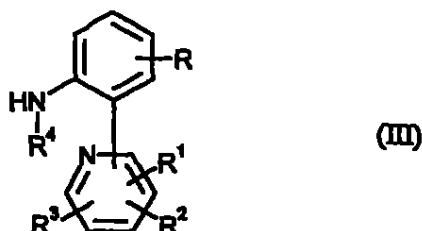
- a) carboxylic acid derivatives of the formula (II)



in which

- 10 X¹ represents halogen or hydroxyl and
A is as defined in Claim 1,

are reacted with amines of the formula (III)



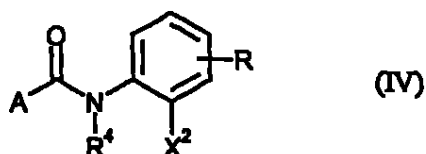
15 in which

R, R¹, R², R³ and R⁴ are as defined in Claim 1,

if appropriate in the presence of a catalyst, if appropriate in the presence of a condensing agent, if appropriate in the presence of an acid binder and if appropriate in the presence of a diluent,

20 or

- b) halogeno-carboxamides of the formula (IV)

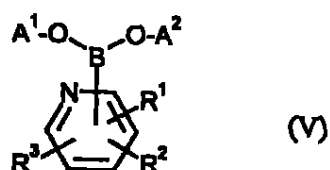


in which

25 R, R⁴ and A are as defined in Claim 1, and

X² represents bromine or iodine,

are reacted with boronic acid derivatives of the formula (V)



in which

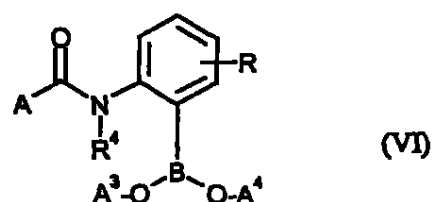
R^1 , R^2 and R^3 are as defined in Claim 1, and

A^1 and A^2 each represent hydrogen or together represent tetramethylethylene,

in the presence of a catalyst, if appropriate in the presence of an acid binder and if appropriate in the presence of a diluent,

or

c) carboxamide boronic acid derivatives of the formula (VI)

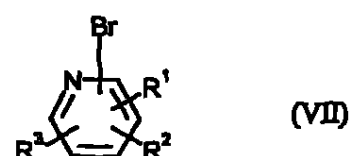


in which

R , R^4 and A are as defined in Claim 1, and

A^3 and A^4 each represent hydrogen or together represent tetramethylethylene,

are reacted with pyridinyl derivatives of the formula (VII)



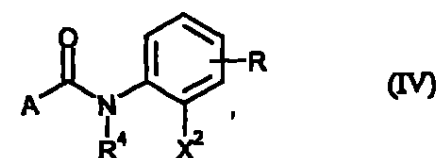
in which

R^1 , R^2 and R^3 are as defined in Claim 1,

in the presence of a catalyst, if appropriate in the presence of an acid binder and if appropriate in the presence of a diluent,

or

d) halogeno-carboxamides of the formula (IV)

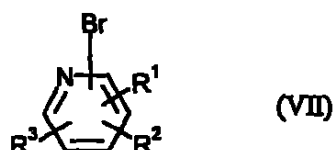


in which

R , R^4 and A are as defined in Claim 1, and

X^2 represents bromine or iodine,

are reacted with pyridinyl derivatives of the formula (VII)



5

in which

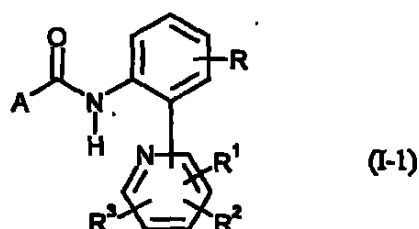
R^1 , R^2 and R^3 are as defined in Claim 1,

10

in the presence of a palladium or platinum catalyst and in the presence of 4,4',4',5,5,5'-octamethyl-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolane [bis(pinacolato)diboron], if appropriate in the presence of an acid binder and if appropriate in the presence of a diluent,

or

e) pyridinylanilides of the formula (I-1)



15

in which

R , R^1 , R^2 , R^3 and A are as defined in Claim 1,

are reacted with halogenides of the formula (VIII)



20

in which

X^3 represents chlorine, bromine or iodine,

R^{4a} represents 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 -halogenoalkyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylthio, C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfinyl, C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfonyl, halogeno- C_1 - C_8 -alkoxy- C_1 - C_8 -alkyl, C_3 - C_8 -halogenocycloalkyl having in each case 1 to 9 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; 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 -halogenoalkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, (C_1 - C_3 -halogenoalkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl having in each case 1 to 7 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms,

25

(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl, (C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl having in each case 1 to 6 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms, (C₁-C₃-halogenoalkyl)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl, (C₁-C₃-halogenoalkoxy)carbonyl-C₁-C₃-halogenoalkyl having in each case 1 to 13 fluorine-, chlorine- and/or bromine atoms; -COR⁵, -CONR⁶R⁷ or -CH₂NR⁸R⁹,
 5 R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ and R⁹ are as defined in Claim 1,
 in the presence of a base and in the presence of a diluent.

12. Compositions for controlling unwanted microorganisms, characterized in that they comprise
 10 at least one pyridinylanilide of the formula (I) according to Claim 1, in addition to extenders and/or surfactants.

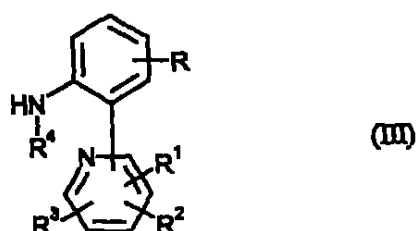
13. Use of pyridinylanilides of the formula (I) according to Claim 1 for controlling unwanted microorganisms.

15

14. Method for controlling unwanted microorganisms, characterized in that pyridinylanilides of the formula (I) according to Claim 1 are applied to the microorganisms and/or their habitats.

15. Process for preparing compositions for controlling unwanted microorganisms, characterized
 20 in that pyridinylanilides of the formula (I) according to Claim 1 are mixed with extenders and/or surfactants.

16. Amines of the formula (III)



25

in which

R, R¹, R², R³ and R⁴ are as defined in Claim 1,

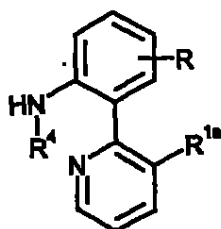
excluded compounds of the formula (III), in which

R represents hydrogen and ^

R¹, R² and R³ independently of one another each represents hydrogen, halogen, straight-chain
 30 or branched alkyl having 1 to 4 carbon atoms or straight-chain or branched halogenoalkyl having 1 to 4 carbon atoms; and R⁴ represents hydrogen.

72 #7

17. Amines of the formula



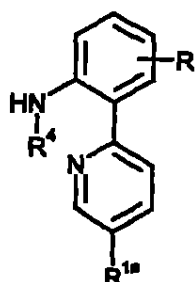
in which

R and R⁴ are as defined in Claims 1, 2 or 3 and

- 5 R^{1a} represents halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thio-carbamoyl;
or represents in each case straight-chain or branched alkyl, hydroxyalkyl, oxoalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, dialkoxyalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkyl-sulfonyl having in each case 1 to 8 carbon atoms in the respective alkyl moiety;
10 or represents in each case straight-chain or branched alkenyl or alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms;
or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 13 identical or different halogen atoms;
15 or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkenyl or halogeno-alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms and 1 to 11 identical or different halogen atoms;
or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkyl-carbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxy-carbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocar-bonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 6 carbon atoms
20 in the respective hydrocarbon chain, alkenylcarbonyl or alkynylcarbonyl having 2 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain;
or represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;
or represents the grouping -C(Q¹)=N-Q², wherein
25 Q¹ represents hydrogen, hydroxyl or C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms, or C₃-C₆-cycloalkyl and
Q² represents hydroxyl, amino, methylamino, phenyl, benzyl; or represents C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-alkoxy, each of which is optionally substituted by halogen, cyano, hydroxyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-alkylamino, di(C₁-C₄-
30 alkyl)amino or phenyl; or represents C₂-C₄-alkenyloxy or C₂-C₄-alkynyloxy, represents phenyl, phenoxy, phenylthio, benzoyl, benzoyl-ethenyl, cinnamoyl, heterocyclyl or phenylalkyl, phenylalkyloxy, phenylalkylthio or heterocyclylalkyl

having in each case 1 to 3 carbon atoms in the respective alkyl moieties, each of which is optionally mono- to tri-substituted, identically or differently, in the ring moiety by halogen, in each case straight-chain or branched C₁-C₄-alkyl and C₁-C₄-alkoxy.

5 18. Amines of the formula



in which

R and R⁴ are as defined in Claims 1, 2 or 3 and

R^{1a} represents halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thio-
carbamoyl;

or represents in each case straight-chain or branched alkyl, hydroxyalkyl, oxoalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, dialkoxyalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkylsulfonyl having in each case 1 to 8 carbon atoms in the respective alkyl moiety;

or represents in each case straight-chain or branched alkenyl or alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 13 identical or different halogen atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkenyl or halogenoalkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms and 1 to 11 identical or different halogen atoms;

or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkylcarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxycarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain, alkenylcarbonyl or alkynylcarbonyl having 2 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain;

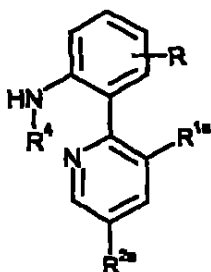
or represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

or represents the grouping -C(Q¹)=N-Q², wherein

Q¹ represents hydrogen, hydroxyl or C₁-C₄-alkyl, C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms, or C₃-C₆-cycloalkyl and

Q² represents hydroxyl, amino, methylamino, phenyl, benzyl; or represents C₁-C₄-alkyl or C₁-C₄-alkoxy, each of which is optionally substituted by halogen, cyano, hydroxyl, C₁-C₄-alkoxy, C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₄-alkylamino, di(C₁-C₄-alkyl)amino or phenyl; or represents C₂-C₄-alkenyloxy or C₂-C₄-alkynyloxy, represents phenyl, phenoxy, phenylthio, benzoyl, benzoylthienyl, cinnamoyl, heterocyclyl or phenylalkyl, phenylalkyloxy, phenylalkylthio or heterocyclalkyl having in each case 1 to 3 carbon atoms in the respective alkyl moieties, each of which is optionally mono- to tri-substituted, identically or differently, in the ring moiety by halogen, in each case straight-chain or branched C₁-C₄-alkyl and C₁-C₄-alkoxy.

19. Amines of the formula



in which

R and R⁴ are as defined in Claims 1, 2 or 3 and

R^{1a} and R^{2a} independently of one another each represents halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thiocarbamoyl; or represents in each case straight-chain or branched alkyl, hydroxyalkyl, oxoalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, dialkoxyalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkylsulfonyl having in each case 1 to 8 carbon atoms in the respective alkyl moiety; or represents in each case straight-chain or branched alkenyl or alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms; or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 13 identical or different halogen atoms; or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkenyl or halogenoalkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms and 1 to 11 identical or different halogen atoms; or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkylcarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxy carbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 6 carbon atoms

in the respective hydrocarbon chain, alkenylcarbonyl or alkynylcarbonyl having 2 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain;

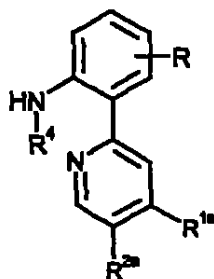
or represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

or represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

5 Q^1 represents hydrogen, hydroxyl or C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms, or C_3 - C_6 -cycloalkyl and

Q^2 represents hydroxyl, amino, methylamino, phenyl, benzyl; or represents C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -alkoxy, each of which is optionally substituted by halogen, cyano, hydroxyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_1 - C_4 -alkylamino, di(C_1 - C_4 -alkyl)amino or phenyl; or represents C_2 - C_4 -alkenyloxy or C_2 - C_4 -alkynyloxy, represents phenyl, phenoxy, phenylthio, benzoyl, benzoyl-ethenyl, cinnamoyl, heterocyclyl or phenylalkyl, phenylalkyloxy, phenylalkylthio or heterocyclalkyl having in each case 1 to 3 carbon atoms in the respective alkyl moieties, each of which is optionally mono- to tri-substituted, identically or differently, in the ring moiety by halogen, in each case straight-chain or branched C_1 - C_4 -alkyl and C_1 - C_4 -alkoxy.

20. Amines of the formula



in which

20 R and R^4 are as defined in Claims 1, 2 or 3 and

R^{1a} and R^{2a} independently of one another each represents halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thiocarbamoyl;

or represents in each case straight-chain or branched alkyl, hydroxyalkyl, oxoalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, dialkoxyalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkyl-sulfonyl having in each case 1 to 8 carbon atoms in the respective alkyl moiety;

25 or represents in each case straight-chain or branched alkenyl or alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 13 identical or different halogen atoms;

30

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkenyl or halogenoalkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms and 1 to 11 identical or different halogen atoms;

or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkylcarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxycarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain, alkenylcarbonyl or alkynylcarbonyl having 2 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain;

or represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

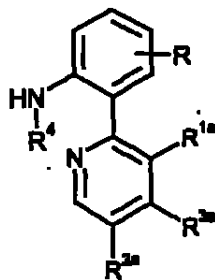
or represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 represents hydrogen, hydroxyl or C_1-C_4 -alkyl, C_1-C_4 -halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms, or C_3-C_6 -cycloalkyl and

Q^2 represents hydroxyl, amino, methylamino, phenyl, benzyl; or represents C_1-C_4 -alkyl or C_1-C_4 -alkoxy, each of which is optionally substituted by halogen, cyano, hydroxyl, C_1-C_4 -alkoxy, C_1-C_4 -alkylthio, C_1-C_4 -alkylamino, di(C_1-C_4 -alkyl)amino or phenyl; or represents C_2-C_4 -alkenyloxy or C_2-C_4 -alkynyloxy,

represents phenyl, phenoxy, phenylthio, benzoyl, benzoylethenyl, cinnamoyl, heterocyclyl or phenylalkyl, phenylalkyloxy, phenylalkylthio or heterocyclalkyl having in each case 1 to 3 carbon atoms in the respective alkyl moieties, each of which is optionally mono- to tri-substituted, identically or differently, in the ring moiety by halogen, in each case straight-chain or branched C_1-C_4 -alkyl and C_1-C_4 -alkoxy.

21. Amines of the formula



in which

R and R^4 are as defined in Claims 1, 2 or 3 and

R^{1a} , R^{2a} and R^{3a} independently of one another each represents halogen, cyano, nitro, amino, hydroxyl, formyl, carboxyl, carbamoyl, thiocarbamoyl;

or represents in each case straight-chain or branched alkyl, hydroxyalkyl, oxoalkyl, alkoxy, alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, dialkoxyalkyl, alkylthio, alkylsulfinyl or alkylsulfonyl having in each case 1 to 8 carbon atoms in the respective alkyl moiety;

or represents in each case straight-chain or branched alkenyl or alkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkyl, halogenoalkoxy, halogenoalkylthio, halogenoalkylsulfinyl or halogenoalkylsulfonyl having in each case 1 to 6 carbon atoms and 1 to 13 identical or different halogen atoms;

or represents in each case straight-chain or branched halogenoalkenyl or halogenoalkenyloxy having in each case 2 to 6 carbon atoms and 1 to 11 identical or different halogen atoms;

or represents in each case straight-chain or branched alkylamino, dialkylamino, alkylcarbonyl, alkylcarbonyloxy, alkoxycarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, arylalkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyloxy having 1 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain, alkenylcarbonyl or alkynylcarbonyl having 2 to 6 carbon atoms in the respective hydrocarbon chain;

or represents cycloalkyl or cycloalkyloxy having in each case 3 to 6 carbon atoms;

or represents the grouping $-C(Q^1)=N-Q^2$, wherein

Q^1 represents hydrogen, hydroxyl or C_1 - C_4 -alkyl, C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 9 identical or different halogen atoms, or C_3 - C_6 -cycloalkyl and

Q^2 represents hydroxyl, amino, methylamino, phenyl, benzyl; or represents C_1 - C_4 -alkyl or C_1 - C_4 -alkoxy, each of which is optionally substituted by halogen, cyano, hydroxyl, C_1 - C_4 -alkoxy, C_1 - C_4 -alkylthio, C_1 - C_4 -alkylamino, di(C_1 - C_4 -alkyl)amino or phenyl; or represents C_2 - C_4 -alkenyloxy or C_2 - C_4 -alkynyloxy,

represents phenyl, phenoxy, phenylthio, benzoyl, benzoylethenyl, cinnamoyl, heterocyclyl or phenylalkyl, phenylalkyloxy, phenylalkylthio or heterocyclylalkyl having in each case 1 to 3 carbon atoms in the respective alkyl moieties, each of which is optionally mono- to tri-substituted, identically or differently, in the ring moiety by halogen, in each case straight-chain or branched C_1 - C_4 -alkyl and C_1 - C_4 -alkoxy.

75
80

WO 2005/004606-CO

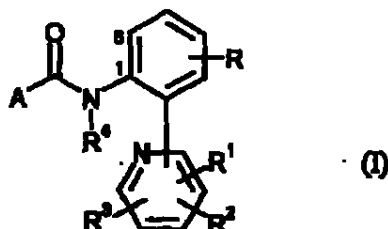
-2-

PIRIDINILANILIDAS

La presente invención se refiere a nuevas piridinilanilidas, a varios procedimientos para su preparación y a su uso en el control de microorganismos indeseados.

Se sabe ya que ciertas piridinilanilidas presentan propiedades fungicidas (véase WO 01/53259 y JP-A 8-92223). Así, por ejemplo, para el control de hongos se pueden emplear las piridinilanilidas N-[2-(2-cloro-3-piridinil)fenil]-1,4-dimetil-1H-pirrol-3-carboxamida y 1,4-dimetil-N-{2-[2-(trifluormetil)-4-piridinil]fenil}-1H-pirrol-3-carboxamida (WO 01/53259) o 1-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida y 2-cloro-N-(2-piridin-2-ilfenil)nicotinamida (JP-A 8-92223). Sin embargo, la actividad de tales compuestos no siempre es satisfactoria, en particular si se aplican en dosis bajas. Otras piridinilanilidas, por ejemplo N-[2-(6-bromo-2-piridinil)-4-metilfenil]-2,2-dimetilpropanamida, N-{4-metil-2-[6-(trifluormetil)-2-piridinil]fenil}-ciclopropanecarboxamida y N-{4-metil-2-[6-(trifluormetil)-2-piridinil]fenil}benzamida, son conocidas como herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas (véase WO 95/09846).

Esta invención está dirigida a nuevas piridinilanilidas de fórmula (I)



en donde

R representa hidrógeno, fluor, cloro, metilo o trifluormetilo;

R¹, R² y R³ independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno,

76.
81

-3-

halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo;

o representan en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 8 átomos de carbono en la respectiva mitad alquilo;

o representan en cada caso alquenilo de cadena lineal o ramificada o alqueniloxi que tienen, en cada caso, de 2 a 6 átomos de carbono;

o representan en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso haloalquenilo de cadena lineal o ramificada o haloalqueniloxi que tienen en cada caso de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 11 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada, alquenilcarbonilo o alquinilcarbonilo que tienen de 2 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;

o representan cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;

o representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que

77
88

-4-

tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C₃-C₆ y

Q² representa hidroxilo, amino, metilamino, fenilo, bencilo; o representa alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, alquil(C₁-C₄)tio, alquil(C₁-C₄)amino, dialquil(C₁-C₄)amino o fenilo; o representa alquenil(C₂-C₄)oxi o alquini(C₂-C₄)oxi,

representa fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoiletlenilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquiloxi, fenilalquiltio o heterocicilalquilo que tienen en cada caso de 1 a 3 átomos de carbono en las respectivas mitades alquilo, cada uno de los cuales está opcionalmente mono- a tri-sustituido, de forma idéntica o diferente, en la mitad del anillo por halógeno, en cada caso alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄ de cadena lineal o ramificada;

o

R² y R³, si están unidos a la mitad piridinilo en posición orto entre sí, representan además juntos alquileno C₃-C₄, alqueni(C₃-C₄), oxialquileno C₂-C₃ o dioxialquileno C₁-C₂, en cada caso opcionalmente mono- a tetra-sustituidos, de forma idéntica o diferente, por fluor, cloro, oxo, metilo, etilo, trifluormetilo;

R⁴ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₈, alquil(C₁-C₆)sulfinilo, alquil(C₁-C₆)sulfonilo, alcoxi(C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₈; haloalquilo C₁-C₆, haloalquil(C₁-C₄)tio, haloalquil(C₁-C₄)sulfinilo, haloalquil(C₁-C₄)sulfonilo, haloalcoxi(C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₈ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo; formilalquilo C₁-C₃, alquil(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃, alcoxi(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃; haloalquil(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃ que tienen en

78
83

-5-

cada caso de 1 a 7 átomos de fluor, cloro y/o bromo, alquil(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃, alcoxi(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃ que tienen en cada caso de 1 a 6 átomos de fluor, cloro y/o bromo, haloalquil(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃, haloalcoxi(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃ que tienen en cada caso de 1 a 13 átomos de fluor, cloro y/o bromo; -COR⁵, -CONR⁶R⁷ o -CH₂NR⁸R⁹;

R⁵ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₈, alcoxi C₁-C₈, alcoxi(C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₈; haloalquilo C₁-C₈, haloalcoxi C₁-C₈, haloalcoxi(C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₈ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo; o -COR¹⁰,

R⁶ y R⁷ independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, alquilo C₁-C₈, alcoxi(C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₈; haloalquilo C₁-C₈, haloalcoxi(C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₈ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

R⁶ y R⁷ además junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, representan un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, cuyo heterociclo puede tener 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes seleccionados del grupo consistente en oxígeno, azufre y NR¹¹, y cuyo heterociclo puede estar opcionalmente mono- a poli-sustituido, de forma idéntica o diferente, por halógeno o alquilo C₁-C₄,

R⁸ y R⁹ independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, alquilo C₁-C₈, cicloalquilo C₃-C₈; haloalquilo C₁-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

R⁸ y R⁹ además junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, representan un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, cuyo heterociclo puede tener 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes seleccionados del grupo consistente en

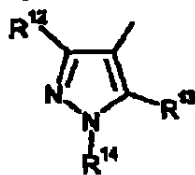
79
84

oxígeno, azufre y NR^{11} , y cuyo heterociclo puede estar opcionalmente mono- a poli-sustituido, de forma idéntica o diferente, por halógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$,

R^{10} representa hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_8$, alcoxi($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_8$; haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_6$, haloalcoxi($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, halocicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_8$ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

R^{11} representa hidrógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$,

A representa un radical de fórmula (A1)



(A1)

, en donde

R^{12} representa hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquil($\text{C}_1\text{-C}_4$)tio, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ o haloalquil($\text{C}_1\text{-C}_4$)tio teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno, aminocarbonilo o aminocarbonil-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ y

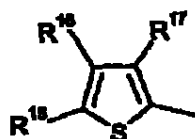
R^{13} representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ o alquil($\text{C}_1\text{-C}_4$)tio y

R^{14} representa hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, hidroxialquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquenilo $\text{C}_2\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, alquil($\text{C}_1\text{-C}_4$)tio-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalquil($\text{C}_1\text{-C}_4$)tio-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcoxi($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno, o fenilo,

o

A representa un radical de fórmula (A2)

-7-



(A2),

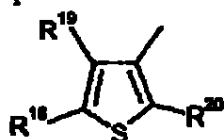
en donde

R¹⁵ y R¹⁶ independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

R¹⁷ representa halógeno, ciano o alquilo C₁-C₄, o haloalquilo C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄ teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A3)



(A3),

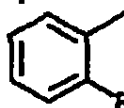
en donde

R¹⁸ y R¹⁹ independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

R²⁰ representa hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A4)



(A4),

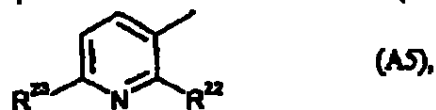
en donde

R²¹ representa hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ o haloalquil(C₁-C₄)tio teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

-8-

A representa un radical de fórmula (A5)



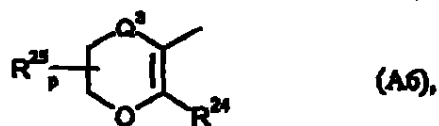
en donde

R^{22} representa halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, haloalquilo C_1-C_4 , haloalquil(C_1-C_4)tio o haloalcoxi C_1-C_4 teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R^{23} representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, haloalquilo C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno, alquil(C_1-C_4)sulfinilo o alquil(C_1-C_4)sulfonilo,

o

A representa un radical de fórmula (A6)



en donde

R^{24} representa alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R^{25} representa alquilo C_1-C_4 ,

Q^3 representa un átomo de azufre u oxígeno, representa SO, SO₂ o CH₂,

p representa 0, 1 o 2, en donde R^{25} representa radicales idénticos o diferentes en el caso de que p represente 2,

o

A representa un radical de fórmula (A7)

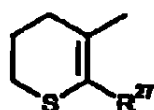


en donde

R^{26} representa alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

O

A representa un radical de fórmula (A8)



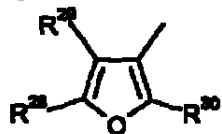
(A8),

en donde

R^{27} representa alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

O

A representa un radical de fórmula (A9)



(A9),

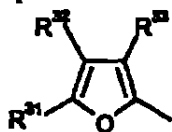
en donde

R^{28} y R^{29} independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno, amino, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

R^{30} representa hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

O

A representa un radical de fórmula (A10)



(A10),

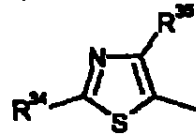
en donde

R^{31} y R^{32} independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno, amino, nitro, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

R^{33} representa hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A11)



(A11),

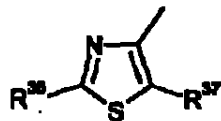
en donde

R^{34} representa hidrógeno, halógeno, amino, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_1-C_4)amino, ciano, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

R^{35} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A12)



(A12),

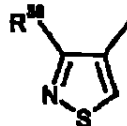
en donde

R^{36} representa hidrógeno, halógeno, amino, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_1-C_4)amino, ciano, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

R^{37} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A13)



(A13),

en donde

R^{38} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A14)

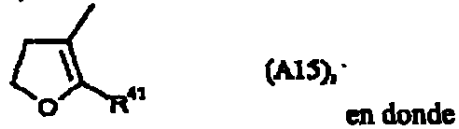


R^{39} representa hidrógeno o alquilo C_1-C_4 y

R^{40} representa halógeno o alquilo C_1-C_4 ,

o

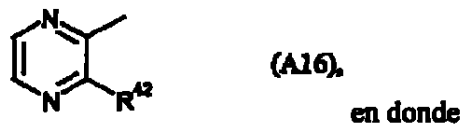
A representa un radical de fórmula (A15)



R^{41} representa alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

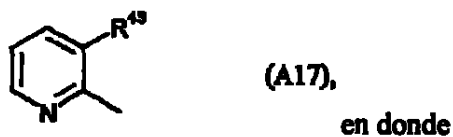
A representa un radical de fórmula (A16)



R^{42} representa hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A17)



85 90

-12-

R^{43} representa halógeno, hidroxilo, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, haloalquilo C_1-C_4 , haloalquil(C_1-C_4)tio o haloalcoxi C_1-C_4 teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno,

quedando excluidos los compuestos de fórmula (I) en donde

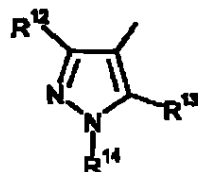
R representa hidrógeno y

R^1 , R^2 y R^3 independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno; o alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono; o haloalquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono; y

R^4 representa hidrógeno

y

A representa un radical de fórmula (A1)



(A1)

, en donde

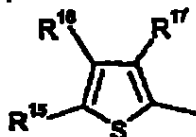
R^{12} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y

R^{13} representa hidrógeno y

R^{14} representa metilo

o

A representa un radical de fórmula (A2)



(A2),

en donde

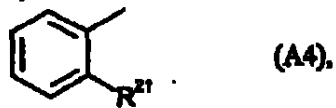
R^{15} y R^{16} independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno o alquilo C_1-C_4 y

-13-

R^{17} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ,

o

A representa un radical de fórmula (A4)

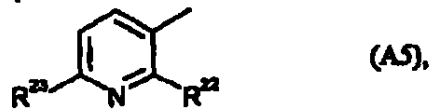


en donde

R^{21} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ,

o

A representa un radical de fórmula (A5)



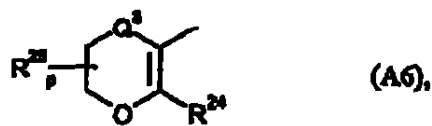
en donde

R^{22} representa halógeno y

R^{23} representa hidrógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A6)



en donde

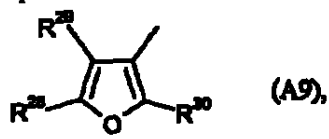
R^{24} representa metilo y

Q^3 representa azufre o CH_2 ,

p representa 0,

o

A representa un radical de fórmula (A9)



en donde

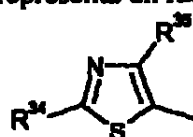
R^{28} y R^{29} independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno o

alquilo C₁-C₄ y

R³⁰ representa metilo,

o

A representa un radical de fórmula (A11)



(A11),

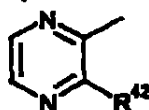
en donde

R³⁴ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄ y

R³⁵ representa halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄,

o

A representa un radical de fórmula (A16)



(A16),

en donde

R⁴² representa halógeno.

Los compuestos excluidos son conocidos por JP-A-8-92223.

En cada caso, los siguientes compuestos individuales dados a conocer en JP-A-8-

92223 quedan excluidos de forma explícita del alcance de protección:

2-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-4-(trifluormetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida;

N-(2-piridin-2-ilfenil)-4-(trifluormetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida;

4-yodo-N-(2-piridin-2-ilfenil)-1,3-tiazol-5-carboxamida;

1-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida;

3-yodo-1-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-1H-pirazol-4-carboxamida;

2-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-3-furamida;

3-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)tiofen-2-carboxamida;

2-cloro-N-(2-piridin-2-ilfenil)benzamida;

88 93

2-cloro-N-(2-piridin-2-ilfenil)nicotinamida;
3-cloro-N-(2-piridin-2-ilfenil)pirazin-2-carboxamida;
2-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-5,6-dihidro-1,4-oxatiin-3-carboxamida;
2-cloro-N-(2-piridin-3-ilfenil)nicotinamida;
2-cloro-N-(2-piridin-4-ilfenil)nicotinamida;
2-metil-N-[2-(6-metilpiridin-2-il)fenil]-4-(trifluormetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida;
1-metil-N-[2-(6-metilpiridin-2-il)fenil]-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida.

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden existir en diferentes formas isómeras, en particular en forma de estereoisómeros, tales como por ejemplo E y Z, treo y eritro, isómeros ópticos y opcionalmente en forma de tautómeros. La invención se refiere también al uso de los isómeros puros así como de los isómeros E y Z, isómeros treo y eritro, isómeros ópticos, mezclas opcionales de estos isómeros y de las posibles formas tautómeras.

Por otro lado, se ha comprobado que las piridinilanilidas de fórmula (I) se obtienen cuando:

a) derivados de ácidos carboxílicos de fórmula (II)

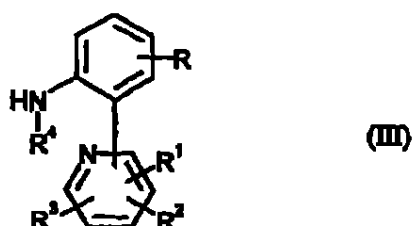


en donde

X¹ representa halógeno o hidroxilo y

A se define como anteriormente,

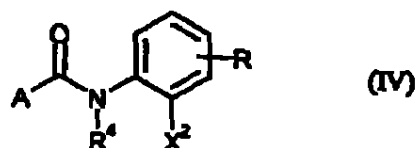
se hacen reaccionar con aminas de fórmula (III)



en donde R, R¹, R², R³ y R⁴ se definen como anteriormente,
 si resulta adecuado en presencia de un catalizador, si resulta adecuado en presencia de
 un agente de condensación, si resulta adecuado en presencia de un aceptor de ácido y si
 resulta adecuado en presencia de un diluyente,

o

b) halo-carboxamidas de fórmula (IV)

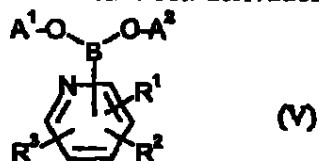


en donde

R, R⁴ y A se definen como anteriormente y

X² representa bromo o yodo,

se hacen reaccionar con derivados de ácido borónico de fórmula (V)



en donde

R¹, R² y R³ se definen como anteriormente y

A¹ y A² representan cada uno de ellos hidrógeno o juntos representan tetrametiletileno,

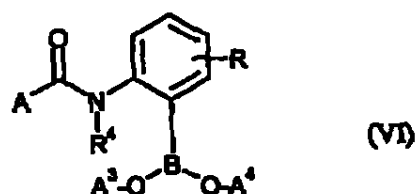
en presencia de un catalizador, si resulta adecuado en presencia de un aceptor de ácido y
 si resulta adecuado en presencia de un diluyente,

no 95

-17-

o

c) derivados de carboxamida de ácido borónico de fórmula (VI)



en donde

R, R⁴ y A se definen como anteriormente y

A³ y A⁴ representan cada uno de ellos hidrógeno o juntos representan tetrametiletileno,

se hacen reaccionar con derivados de piridinilo de fórmula (VII)



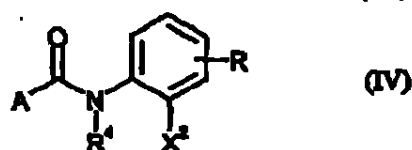
en donde R¹, R² y R³ se definen como anteriormente,

en presencia de un catalizador, si resulta adecuado en presencia de un aceptor de ácido y

si resulta adecuado en presencia de un diluyente,

o

d) halo-carboxamidas de fórmula (IV)



en donde

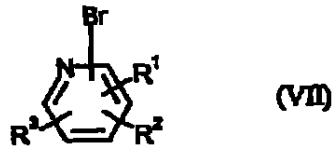
R, R⁴ y A se definen como anteriormente y

X² representa bromo o yodo,

se hacen reaccionar con derivados de piridinilo de fórmula (VII)

a1 96

-18-

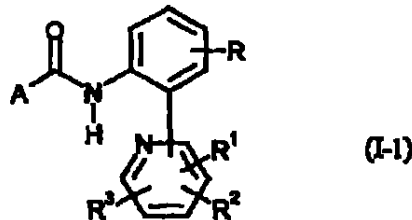


en donde R^1 , R^2 y R^3 se definen como anteriormente,

en presencia de un catalizador de paladio o platino y en presencia de 4,4',4',5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano [bis(pinacolato)diboron], si resulta adecuado en presencia de un aceptor de ácido y si resulta adecuado en presencia de un diluyente,

o

e) piridinilánilidas de fórmula (I-1)



en donde R , R^1 , R^2 , R^3 y A se definen como anteriormente, se hacen reaccionar con halogenuros de fórmula (VIII)



en donde

X^3 representa cloro, bromo o yodo,

R^{4a} representa alquilo C_1-C_8 , alquil(C_1-C_6)sulfinilo, alquil(C_1-C_6)sulfonilo, alcoxi(C_1-C_4)-alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_8 ; haloalquilo C_1-C_6 , haloalquil(C_1-C_4)tio, haloalquil(C_1-C_4)sulfinilo, haloalquil(C_1-C_4)sulfonilo, haloalcoxi(C_1-C_4)-alquilo C_1-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_8 que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo; formilalquilo C_1-C_3 , alquil(C_1-C_3)carbonil-alquilo C_1-C_3 , alcoxi(C_1-C_3)carbonil-alquilo C_1-C_3 ; haloalquil(C_1-C_3)carbonil-alquilo C_1-C_3 , haloalcoxi(C_1-C_3)carbonil-alquilo C_1-C_3 que tienen en

9294

-19-

cada caso de 1 a 7 átomos de fluor, cloro y/o bromo, alquil(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃, alcoxi(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃ que tienen en cada caso de 1 a 6 átomos de fluor, cloro y/o bromo, haloalquil(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃, haloalcoxi(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃ que tienen en cada caso de 1 a 13 átomos de fluor, cloro y/o bromo; -COR⁵, -CONR⁶R⁷ o -CH₂NR⁸R⁹;

R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ se definen como anteriormente,

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

Por último, se ha comprobado que las nuevas piridinilánilidas de fórmula (I) presentan propiedades microbidas muy buenas y que se pueden emplear para el control de microorganismos indeseados tanto en la protección de cultivos como en la protección de materiales.

De manera sorprendente, las piridinilánilidas de fórmula (I) según la invención tienen una actividad fungicida considerablemente mejor que los compuestos activos estructuralmente más similares del estado de la técnica que presentan la misma dirección de acción.

La fórmula (I) proporciona una definición general de las piridinilánilidas de acuerdo con la invención. A continuación se ofrecen las definiciones preferidas de los radicales de las fórmulas antes y/o a continuación mencionadas. Estas definiciones se aplican de la misma manera a los productos finales de fórmula (I) así como a todos los compuestos intermedios.

R preferentemente representa hidrógeno.

R además preferentemente representa fluor, cuyo fluor particularmente con preferencia está en la posición 4, 5 o 6, muy particularmente con preferencia en la posición 4 o 6 de la mitad anilida [véase la fórmula (I) anterior].

- R además preferentemente representa cloro, cuyo cloro particularmente con preferencia está en la posición 5 de la mitad anilida [véase la fórmula (I) anterior].
- R además preferentemente representa metilo, cuyo metilo particularmente con preferencia está en la posición 3 de la mitad anilida [véase la fórmula (I) anterior].
- R además preferentemente representa trifluormetilo, cuyo trifluormetilo particularmente con preferencia está en la posición 4 o 5 de la mitad anilida [véase la fórmula (I) anterior].
- R¹, R² y R³ independientemente entre sí cada uno de ellos preferentemente representan hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo;
- o preferentemente representan en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen en cada caso de 1 a 6 átomos de carbono;
- o preferentemente representan en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen en cada caso de 1 a 4 átomos de carbono y de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes;
- o preferentemente representan en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilaquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi que tienen de 1 a 4 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;
- o preferentemente representan cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;
- o preferentemente representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

a4

Q^1 preferentemente representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C_3-C_6 y

Q^2 preferentemente representa hidroxilo, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 teniendo cada uno de ellos de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes.

R^2 y R^3 , si están unidos a la mitad piridinilo en posición orto entre sí, juntos preferentemente representan $-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_4-$, $-CH=CH-CH=CH-$, $-O(CH_2)_2-$, $-O(CH_2)_3-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$, en cada caso opcionalmente mono- a tetra-sustituídos, de forma idéntica o diferente, por fluor, cloro, oxo, metilo, etilo, trifluormetilo.

R^1 , R^2 y R^3 independientemente entre sí cada uno particularmente con preferencia representan hidrógeno, fluor, cloro, bromo, ciano; metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, n-, iso-, sec- o terc-butoxi, metiltio, etiltio, n- o iso-propiltio, n-, iso-, sec- o terc-butiltio, trifluormetilo, trifluoretilo, difluormetoxi, trifluormetoxi, difluorclorometoxi, trifluoretoxi, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, o particularmente con preferencia representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 particularmente con preferencia representa hidrógeno, metilo, etilo, trifluormetilo o ciclopropilo y

Q^2 particularmente con preferencia representa hidroxilo, metoxi, etoxi, n-propoxi o iso-propoxi.

R^2 y R^3 , si están unidos a la mitad piridinilo en posición orto entre sí, juntos particularmente con preferencia representan $-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_4-$, $-CH=CH-CH=CH-$

95 / 100

, -OCH₂O-, -O(CH₂)₂O-, -OCF₂O-, -O(CF₂)₂O-.

R¹, R² y R³ independientemente entre sí cada uno muy particularmente con preferencia representan hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, trifluormetilo, trifluoretilo, difluormetoxi, trifluormetoxi, difluorclorometoxi, trifluoretoxi, o muy particularmente con preferencia representa la agrupación -C(Q¹)=N-Q², en donde

Q¹ muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, metilo o etilo y

Q² muy particularmente con preferencia representa hidroxilo, metoxi, etoxi, n-propoxi o iso-propoxi.

R² y R³, si están unidos a la mitad piridinilo en posición orto entre sí, juntos muy particularmente con preferencia representan -CH=CH-CH=CH-, -OCF₂O-, -O(CF₂)₂O-.

R⁴ preferentemente representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquil(C₁-C₄)sulfinilo, alquil(C₁-C₄)sulfonilo, alcoxi(C₁-C₃)-alquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆; haloalquilo C₁-C₄, haloalquil(C₁-C₄)tio, haloalquil(C₁-C₄)sulfinilo, haloalquil(C₁-C₄)sulfonilo, haloalcoxi(C₁-C₃)-alquilo C₁-C₃, halocicloalquilo C₃-C₆ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo; formilalquilo C₁-C₃, alquil(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃, alcoxi(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃; haloalquil(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃ que tienen en cada caso de 1 a 7 átomos de fluor, cloro y/o bromo, alquil(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃, alcoxi(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃ que tienen en cada caso de 1 a 6 átomos de fluor, cloro y/o bromo, haloalquil(C₁-C₃)carbonil-haloalquil C₁-C₃, haloalcoxi(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃ que tienen en cada caso de 1 a 13 átomos de fluor, cloro y/o bromo; -COR⁵, -CONR⁶R⁷ o -CH₂NR⁸R⁹.

- R⁴** particularmente con preferencia representa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o tert-butilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o iso-propilsulfinilo, n-, iso-, sec- o tert-butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o iso-propilsulfonilo, n-, iso-, sec- o tert-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, trifluormetilo, triclorometilo, trifluoretilo, difluormetiltio, difluorclorometiltio, trifluormetiltio, trifluormetilsulfinilo, trifluormetilsulfonilo, trifluormetoximetilo; -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, -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, -CH₂CH₂-C(O)O-CCl₂CCl₃; -COR⁵, -CONR⁶R⁷ o -CH₂NR⁸R⁹.
- R⁴** muy particularmente con preferencia representa hidrógeno; metilo, metoximetilo, -CH₂-CHO, -CH₂CH₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂ o -COR⁵.
- R⁵** preferentemente representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄, alcóxi(C₁-C₃)-alquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆; haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, haloalcoxi(C₁-C₃)-alquilo C₁-C₃, halocicloalquilo C₃-C₆ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo; o -COR¹⁰.
- R⁵** particularmente con preferencia representa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, terc-butilo, metoxi, etoxi, terc-butoxi, ciclopropilo; trifluormetilo,

trifluormetoxi; o -COR¹⁰.

R⁵ muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, -COCH₃, -CHO, -COCH₂OCH₃, -COCO₂CH₃, -COCO₂CH₂CH₃; o -COR¹⁰.

R⁶ y R⁷ independientemente entre sí preferentemente representan cada uno de ellos hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi(C₁-C₃)-alquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆; haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi(C₁-C₃)-alquilo C₁-C₃, halocicloalquilo C₃-C₆ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R⁶ y R⁷ además junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, preferentemente representan un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, cuyo heterociclo puede tener 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes seleccionados del grupo consistente en oxígeno, azufre y NR¹¹, y cuyo heterociclo puede estar opcionalmente mono- a poli-sustituido, de forma idéntica o diferente, por halógeno o alquilo C₁-C₄.

R⁶ y R⁷ independientemente entre sí cada uno particularmente con preferencia representan hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluormetilo, triclorometilo, trifluoretilo, trifluormetoximetilo.

R⁶ y R⁷ además junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, particularmente con preferencia representan un heterociclo saturado seleccionado del grupo consistente en morfolina, tiomorfolina y piperazina, cuyo heterociclo puede opcionalmente estar mono- a tetra-sustituido, de forma idéntica o diferente, por fluor, cloro, bromo o metilo y en donde la piperazina adicionalmente en el segundo átomo de nitrógeno puede estar sustituida por R¹¹.

R⁸ y R⁹ independientemente entre sí preferentemente representan cada uno de ellos hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆; haloalquilo C₁-C₄, halocicloalquilo

C₃-C₆ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R⁸ y R⁹ además junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, preferentemente representan un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, cuyo heterociclo puede tener 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes seleccionados del grupo consistente en oxígeno, azufre y NR¹¹, y cuyo heterociclo puede estar opcionalmente mono- a poli-sustituido, de forma idéntica o diferente, por halógeno o alquilo C₁-C₄.

R⁸ y R⁹ independientemente entre sí cada uno particularmente con preferencia representa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluormetilo, triclorometilo, trifluoretilo, trifluormetoximetilo.

R⁸ y R⁹ además junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, particularmente con preferencia representan un heterociclo saturado seleccionado del grupo consistente en morfolina, tiomorfolina y piperazina, cuyo heterociclo puede opcionalmente estar mono- a tetra-sustituido, de forma idéntica o diferente, por fluor, cloro, bromo o metilo y en donde la piperazina adicionalmente en el segundo átomo de nitrógeno puede estar sustituida por R¹¹.

R¹⁰ preferentemente representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₄, alcoxi(C₁-C₃)-alquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆; haloalquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, haloalcoxi(C₁-C₃)-alquilo C₁-C₃, halocicloalquilo C₃-C₆ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

R¹⁰ particularmente con preferencia representa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, terc-butilo, metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, terc-butoxi, ciclopropilo; trifluormetilo, trifluormetoxi.

R¹¹ preferentemente representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄.

- R¹¹ particularmente con preferencia representa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo.
- A preferentemente representa uno de los radicales:
A1, A2, A3, A4, A5, A6, A9, A10, A11, A12 o A17.
- A particularmente con preferencia representa uno de los radicales:
A1, A2, A4, A5, A6, A9, A11, A17.
- A muy particularmente con preferencia representa el radical A1.
- A además muy particularmente con preferencia representa el radical A2.
- A además muy particularmente con preferencia representa el radical A4.
- A además muy particularmente con preferencia representa el radical A5.
- A además muy particularmente con preferencia representa el radical A6.
- A además muy particularmente con preferencia representa el radical A9.
- A además muy particularmente con preferencia representa el radical A11.
- A además muy particularmente con preferencia representa el radical A17.
- R¹² preferentemente representa hidrógeno, ciano, fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, isopropilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, ciclopropilo, haloalquilo C₁-C₂, haloalcoxi C₁-C₂ teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo, trifluormetiltio, difluormetiltio, aminocarbonilo, aminocarbonilmetilo o aminocarboniletilo.
- R¹² particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, isopropilo, monofluormetilo, monofluoretilo, difluormetilo, trifluormetilo, difluorclorometilo, triclorometilo, diclorometilo, ciclopropilo, metoxi, etoxi, trifluormetoxi, triclorometoxi, metiltio, etiltio, trifluormetiltio o difluormetiltio y
- R¹² muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo,

yodo, metilo, isopropilo, monofluormetilo, monofluoretilo, difluormetilo, trifluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

- R¹² especialmente con preferencia representa metilo, monofluormetilo, difluormetilo o trifluormetilo.
- R¹³ preferentemente representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio o etiltio.
- R¹³ particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo o metilo.
- R¹³ muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro o metilo.
- R¹⁴ preferentemente representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo, hidroximetilo, hidroxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo o fenilo.
- R¹⁴ particularmente con preferencia representa hidrógeno, metilo, etilo, iso-propilo, trifluormetilo, difluormetilo, hidroximetilo, hidroxietilo o fenilo.
- R¹⁴ muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, metilo, trifluormetilo o fenilo.
- R¹⁴ especialmente con preferencia representa metilo.
- R¹⁵ y R¹⁶ independientemente entre sí cada uno preferentemente representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.
- R¹⁵ y R¹⁶ independientemente entre sí cada uno particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluormetilo, trifluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.
- R¹⁵ y R¹⁶ independientemente entre sí cada uno muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluormetilo,

101 / 96

trifluormetilo o triclorometilo.

R¹⁵ y R¹⁶ especialmente con preferencia representa cada uno hidrógeno.

R¹⁷ preferentemente representa fluor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, haloalquilo C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂ cada uno de ellos con 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R¹⁷ particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, ciano, metilo, trifluormetilo, trifluormetoxi, difluormetoxi, difluorclorometoxi o triclorometoxi.

R¹⁷ muy particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, trifluormetilo o trifluormetoxi.

R¹⁷ especialmente con preferencia representa metilo.

R¹⁸ y R¹⁹ independientemente entre sí cada uno preferentemente representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R¹⁸ y R¹⁹ independientemente entre sí cada uno particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluormetilo, trifluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R¹⁸ y R¹⁹ independientemente entre sí cada uno muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluormetilo, trifluormetilo o triclorometilo.

R¹⁸ y R¹⁹ especialmente con preferencia representa cada uno hidrógeno.

R²⁰ preferentemente representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R²⁰ particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, metilo o trifluormetilo.

R²⁰ muy particularmente con preferencia representa metilo.

- R²¹ preferentemente representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₂, haloalcoxi C₁-C₂ o haloalquil(C₁-C₂)tio cada uno de ellos con 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.
- R²¹ particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, difluormetilo, trifluormetilo, difluorclorometilo, triclorometilo, trifluormetoxi, difluormetoxi, difluorclorometoxi, triclorometoxi, trifluormetiltio, difluormetiltio, difluorclorometiltio o triclorometiltio.
- R²¹ muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, difluormetilo, trifluormetilo o triclorometilo.
- R²¹ especialmente con preferencia representa yodo, metilo, difluormetilo o trifluormetilo.
- R²² preferentemente representa fluor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, alquilo C₁-C₄, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluormetiltio, trifluormetiltio, haloalquilo C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂ cada uno de ellos con 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.
- R²² particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo, triclorometilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluormetiltio, trifluormetiltio, trifluormetoxi, difluormetoxi, difluorclorometoxi o triclorometoxi.
- R²² muy particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, trifluormetilo, difluormetilo o triclorometilo.
- R²³ preferentemente representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, ciano, alquilo C₁-C₄, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, haloalquilo C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂ cada uno

de ellos con 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo, alquil(C₁-C₂)sulfinilo o alquil(C₁-C₂)sulfonilo.

R²³ particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, ciano, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo, triclorometilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, trifluormetoxi, difluormetoxi, difluorclorometoxi, triclorometoxi, metilsulfinilo o metilsulfonilo.

R²³ muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, trifluormetilo, difluormetilo, triclorometilo, metilsulfinilo o metilsulfonilo.

R²³ especialmente con preferencia representa hidrógeno.

R²⁴ preferentemente representa metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R²⁴ particularmente con preferencia representa metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R²⁵ preferentemente representa metilo o etilo.

R²⁵ particularmente con preferencia representa metilo.

Q³ preferentemente representa un átomo de azufre, SO₂ o CH₂.

Q³ particularmente con preferencia representa un átomo de azufre o CH₂.

Q³ muy particularmente con preferencia representa un átomo de azufre.

p preferentemente representa 0 o 1.

p particularmente con preferencia representa 0.

R²⁶ preferentemente representa metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R²⁶ particularmente con preferencia representa metilo, etilo, trifluormetilo,

difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R²⁶ muy particularmente con preferencia representa metilo, trifluormetilo, difluormetilo o triclorometilo.

R²⁷ preferentemente representa metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R²⁷ particularmente con preferencia representa metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R²⁷ muy particularmente con preferencia representa metilo, trifluormetilo, difluormetilo o triclorometilo.

R²⁸ y R²⁹ independientemente entre sí cada uno preferentemente representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, amino, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R²⁸ y R²⁹ independientemente entre sí cada uno particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R²⁸ y R²⁹ independientemente entre sí cada uno muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, trifluormetilo, difluormetilo o triclorometilo.

R²⁸ y R²⁹ especialmente con preferencia representa cada uno hidrógeno.

R³⁰ preferentemente representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R³⁰ particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R³⁰ muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, trifluormetilo, difluormetilo o triclorometilo.

R³⁰ especialmente con preferencia representa metilo.

R³¹ y R³² independientemente entre sí cada uno preferentemente representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, amino, nitro, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R³¹ y R³² independientemente entre sí cada uno particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, nitro, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R³¹ y R³² independientemente entre sí cada uno muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.

R³¹ y R³² especialmente con preferencia cada uno representa hidrógeno.

R³³ preferentemente representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R³³ particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R³³ muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, trifluorometilo, difluorometilo o triclorometilo.

R³³ especialmente con preferencia representa metilo.

R³⁴ preferentemente representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, amino, alquil(C₁-C₄)amino, dialquil(C₁-C₄)amino, ciano, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R³⁴ particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metilo, etilo, trifluorometilo, difluorometilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R³⁴ muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo,

amino, metilamino, dimetilamino, metilo, trifluormetilo, difluormetilo o triclorometilo.

R³⁴ especialmente con preferencia representa amino, metilamino, dimetilamino, metilo o trifluormetilo.

R³⁵ preferentemente representa fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R³⁵ particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R³⁵ muy particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, metilo, trifluormetilo, difluormetilo o triclorometilo.

R³⁵ especialmente con preferencia representa metilo, trifluormetilo o difluormetilo.

R³⁶ preferentemente representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, amino, alquil(C₁-C₄)amino, dialquil(C₁-C₄)amino, ciano, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R³⁶ particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R³⁶ muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, metilo, trifluormetilo, difluormetilo o triclorometilo.

R³⁶ especialmente con preferencia representa amino, metilamino, dimetilamino, metilo o trifluormetilo.

R³⁷ preferentemente representa fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R³⁷ particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, metilo, etilo,

trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R³⁷ muy particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, metilo, trifluormetilo, difluormetilo o triclorometilo.

R³⁷ especialmente con preferencia representa metilo, trifluormetilo o difluormetilo.

R³⁸ preferentemente representa fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R³⁸ particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R³⁸ muy particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, metilo, trifluormetilo, difluormetilo o triclorometilo.

R³⁹ preferentemente representa hidrógeno, metilo o etilo.

R³⁹ particularmente con preferencia representa metilo.

R⁴⁰ preferentemente representa fluor, cloro, bromo, metilo o etilo.

R⁴⁰ particularmente con preferencia representa fluor, cloro o metilo.

R⁴¹ preferentemente representa metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R⁴¹ particularmente con preferencia representa metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

R⁴¹ muy particularmente con preferencia representa metilo, trifluormetilo, difluormetilo o triclorometilo.

R⁴¹ especialmente con preferencia representa metilo o trifluormetilo.

R⁴² preferentemente representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

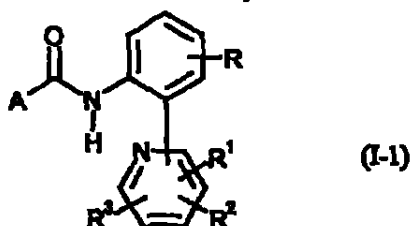
R⁴² particularmente con preferencia representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo o trifluormetilo.

R^{43} preferentemente representa fluor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, alquilo C_1-C_4 , metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluormetiltio, trifluormetiltio, haloalquilo C_1-C_2 o haloalcoxi C_1-C_2 cada uno con 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo.

R^{43} particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo, triclorometilo.

R^{43} muy particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, trifluormetilo, difluormetilo o triclorometilo.

Por otro lado, se da un énfasis a los compuestos de fórmula (I-1)



en donde R , R^1 , R^2 , R^3 y A se definen como anteriormente, quedando excluidos los compuestos de fórmula (I-1) en donde:

R representa hidrógeno y

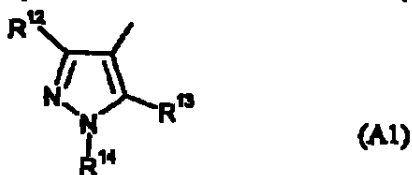
R^1 , R^2 y R^3 independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno;

o alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono;

o haloalquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono;

y

A representa un radical de fórmula (A1)



, en donde

R^{12} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y

R^{13} representa hidrógeno y

R^{14} representa metilo

o

A representa un radical de fórmula (A2)



(A2),

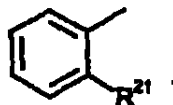
en donde

R^{15} y R^{16} independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno o alquilo C_1-C_4 y

R^{17} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ,

o

A representa un radical de fórmula (A4)



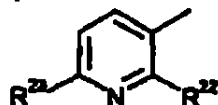
(A4),

en donde

R^{21} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ,

o

A representa un radical de fórmula (A5)



(A5),

en donde

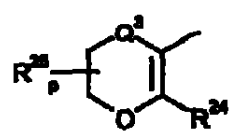
R^{22} representa halógeno y

R^{23} representa hidrógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A6)

110 15



(A6),

en donde

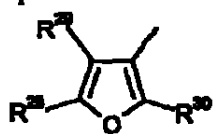
R^{24} representa metilo y

Q^3 representa azufre o CH_2 ,

p representa 0,

o

A representa un radical de fórmula (A9)



(A9),

en donde

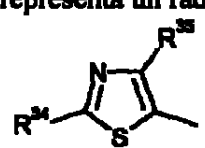
R^{28} y R^{29} independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno o

alquilo C_1-C_4 y

R^{30} representa metilo,

o

A representa un radical de fórmula (A11)



(A11),

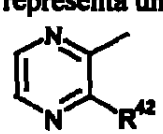
en donde

R^{34} representa hidrógeno o alquilo C_1-C_4 y

R^{35} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ,

o

A representa un radical de fórmula (A16)



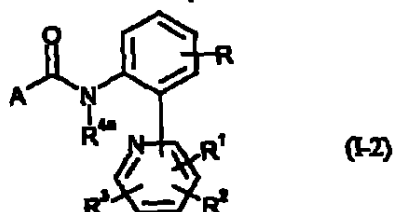
(A16),

en donde

R^{42} representa halógeno.

111
16

Además, hay que destacar a los compuestos de fórmula (I-2)



en donde R, R¹, R², R³, R^{4a} y A se definen como anteriormente.

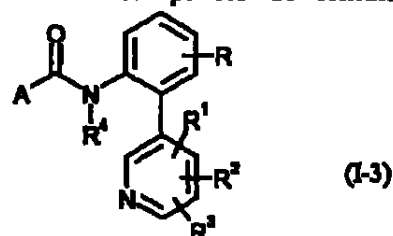
R^{4a} preferentemente representa alquilo C₁-C₆, alquil(C₁-C₄)sulfinilo, alquil(C₁-C₄)sulfonilo, alcoxi(C₁-C₃)-alquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆; haloalquilo C₁-C₄, haloalquil(C₁-C₄)tio, haloalquil(C₁-C₄)sulfinilo, haloalquil(C₁-C₄)sulfonilo, haloalcoxi(C₁-C₃)-alquilo C₁-C₃, halocicloalquilo C₃-C₆ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo; formilalquilo C₁-C₃, alquil(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃, alcoxi(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃; haloalquil(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃ que tienen en cada caso de 1 a 7 átomos de fluor, cloro y/o bromo, alquil(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃, alcoxi(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃ que tienen en cada caso de 1 a 6 átomos de fluor, cloro y/o bromo, haloalquil(C₁-C₃)carbonil-haloalquil C₁-C₃, haloalcoxi(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃ que tienen en cada caso de 1 a 13 átomos de fluor, cloro y/o bromo; -COR⁵, -CONR⁶R⁷ o -CH₂NR⁸R⁹, en donde R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ se definen como anteriormente.

R^{4a} particularmente con preferencia representa metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o tert-butilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o isopropilsulfinilo, n-, iso-, sec- o tert-butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o isopropilsulfonilo, n-, iso-, sec- o tert-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, trifluormetilo, triclorometilo, trifluoretilo, difluormetiltio, difluorclorometiltio, trifluormetiltio,

trifluormetilsulfinilo, trifluormetilsulfonilo, trifluormetoximetilo; $-\text{CH}_2\text{-CHO}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CHO}$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH(CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH(CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH(CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH(CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCCl}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)O-CCl}_2\text{CCl}_3$; $-\text{COR}^5$, $-\text{CONR}^6\text{R}^7$ o $-\text{CH}_2\text{NR}^8\text{R}^9$, en donde R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 se definen como anteriormente.

R^{4a} muy particularmente con preferencia representa metilo, metoximetilo, $-\text{CH}_2\text{-CHO}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CHO}$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH(CH}_3)_2$ o $-\text{COR}^5$, en donde R^5 se define como anteriormente.

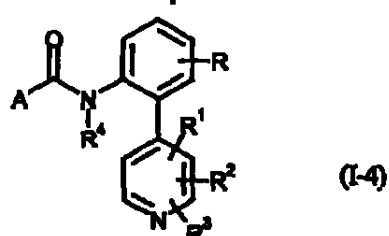
Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-3)



en donde R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y A se definen como anteriormente,

en donde queda excluida la 2-cloro-N-(2-piridin-3-ilfenil)nicotinamida.

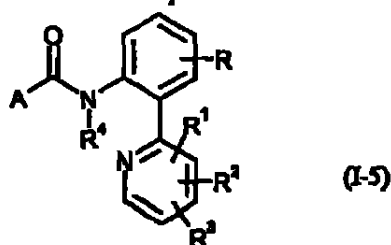
Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-4)



en donde R, R¹, R², R³, R⁴ y A se definen como anteriormente,

en donde queda excluida la 2-cloro-N-(2-piridin-4-ilfenil)nicotinamida.

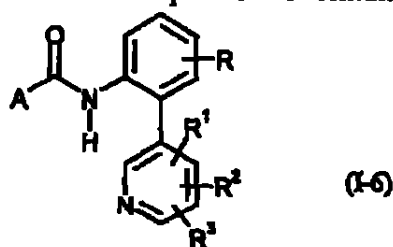
Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-5)



en donde R, R¹, R², R³, R⁴ y A se definen como anteriormente,

en donde quedan excluidos los compuestos 2-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-4-(trifluormetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida; N-(2-piridin-2-ilfenil)-4-(trifluormetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida; 4-iodo-N-(2-piridin-2-ilfenil)-1,3-tiazol-5-carboxamida; 1-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida; 3-iodo-1-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-1H-pirazol-4-carboxamida; 2-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-3-furamida; 3-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)tiofen-2-carboxamida; 2-cloro-N-(2-piridin-2-ilfenil)benzamida; 2-cloro-N-(2-piridin-2-ilfenil)nicotinamida; 3-cloro-N-(2-piridin-2-ilfenil)pirazin-2-carboxamida; 2-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-5,6-dihidro-1,4-oxatiin-3-carboxamida; 2-cloro-N-(2-piridin-3-ilfenil)nicotinamida; 2-cloro-N-(2-piridin-4-ilfenil)nicotinamida; 2-metil-N-[2-(6-metilpiridin-2-il)fenil]-4-(trifluormetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida; 1-metil-N-[2-(6-metilpiridin-2-il)fenil]-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida.

Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-6)

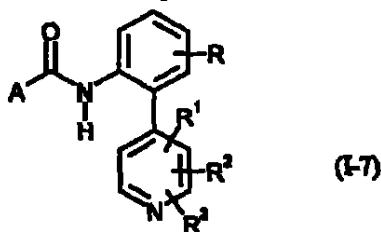


114 / 169

en donde R, R¹, R², R³ y A se definen como anteriormente,

en donde queda excluida la 2-cloro-N-(2-piridin-3-ilfenil)nicotinamida.

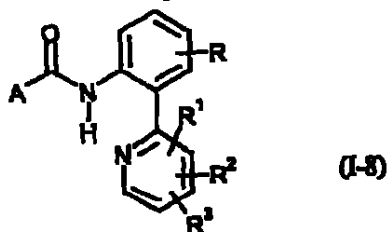
Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-7)



en donde R, R¹, R², R³ y A se definen como anteriormente,

en donde queda excluida la 2-cloro-N-(2-piridin-4-ilfenil)nicotinamida.

Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-8)

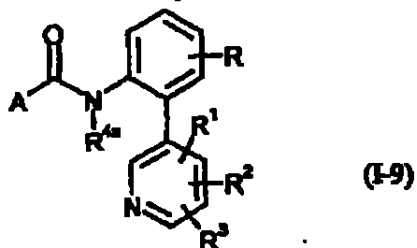


en donde R, R¹, R², R³ y A se definen como anteriormente,

en donde quedan excluidos los compuestos 2-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-4-(trifluormetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida; N-(2-piridin-2-ilfenil)-4-(trifluormetil)-1,3-tiazol-5-carboxamida; 4-iodo-N-(2-piridin-2-ilfenil)-1,3-tiazol-5-carboxamida; 1-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida; 3-iodo-1-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-1H-pirazol-4-carboxamida; 2-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-3-furamida; 3-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)tiofen-2-carboxamida; 2-cloro-N-(2-piridin-2-ilfenil)benzamida; 2-cloro-N-(2-piridin-2-ilfenil)nicotinamida; 3-cloro-N-(2-piridin-2-ilfenil)pirazin-2-carboxamida; 2-metil-N-(2-piridin-2-ilfenil)-5,6-dihidro-1,4-oxatiin-3-carboxamida; 2-cloro-N-(2-piridin-3-ilfenil)nicotinamida; 2-cloro-N-(2-piridin-4-ilfenil)nicotinamida; 2-metil-N-[2-(6-metilpiridin-2-il)fenil]-4-(trifluormetil)-1,3-tiazol-

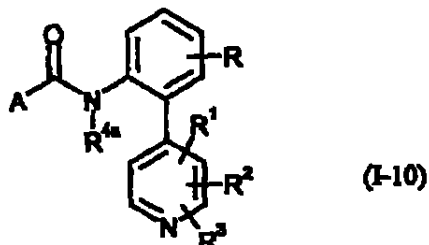
5-carboxamida; 1-metil-N-[2-(6-metilpiridin-2-il)fenil]-3-(trifluormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida.

Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-9)



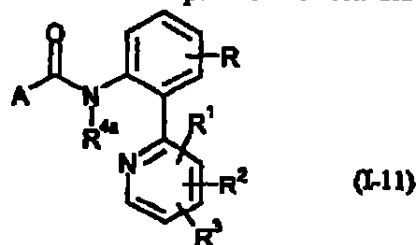
en donde R, R¹, R², R³, R^{4a} y A se definen como anteriormente.

Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-10)



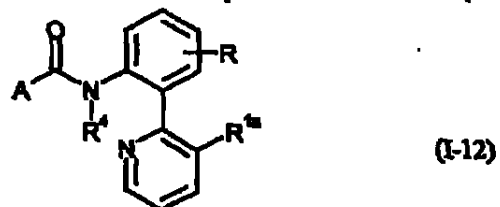
en donde R, R¹, R², R³, R^{4a} y A se definen como anteriormente.

Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-11)



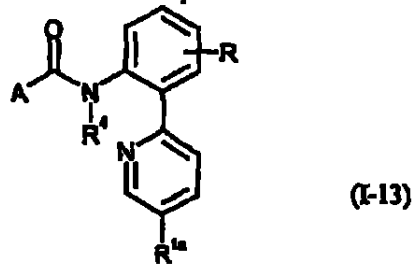
en donde R, R¹, R², R³, R^{4a} y A se definen como anteriormente.

Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-12)



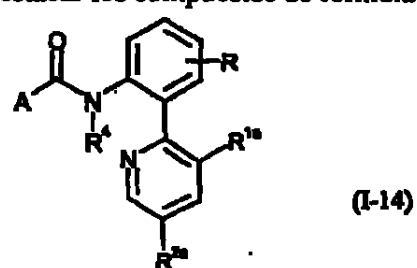
en donde R, R⁴ y A se definen como anteriormente y R^{1a} se define como a continuación se indica.

Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-13)



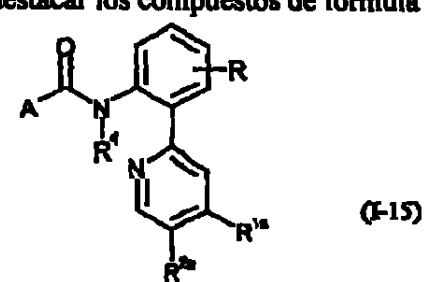
en donde R, R⁴ y A se definen como anteriormente y R^{1a} se define como a continuación se indica.

Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-14)



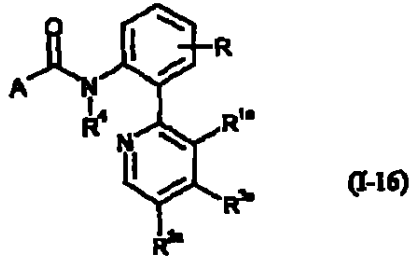
en donde R, R⁴ y A se definen como anteriormente y R^{1a} y R^{2a} se definen como a continuación se indica.

Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-15)



en donde R, R⁴ y A se definen como anteriormente y R^{1a} y R^{2a} se definen como a continuación se indica.

Además, hay que destacar los compuestos de fórmula (I-16)



en donde R, R⁴ y A se definen como anteriormente y R^{1a}, R^{2a} y R^{3a} se definen como a continuación se indica.

R^{1a}, R^{2a} y R^{3a} independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo;

o representan en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 8 átomos de carbono en la respectiva mitad alquilo;

o representan en cada caso alqueno de cadena lineal o ramificada o alquenoiloxi que tienen, en cada caso, de 2 a 6 átomos de carbono;

o representan en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso haloalqueno de cadena lineal o ramificada o haloalquenoiloxi que tienen en cada caso de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 11 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcóxicarbonilo,

alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada, alquénilcarbonilo o alquínilcarbonilo que tienen de 2 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;

o representan cicloalquilo o cicloalquilo que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;

o representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C_3-C_6 y

Q^2 representa hidroxilo, amino, metilamino, fenilo, bencilo; o representa alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_1-C_4)amino o fenilo; o representa alquénil(C_2-C_4)oxi o alquínil(C_2-C_4)oxi,

representa fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoileténilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquilo, fenilalquiltio o heterociclilalquilo que tienen en cada caso de 1 a 3 átomos de carbono en las respectivas mitades alquilo, cada uno de los cuales está opcionalmente mono- a tri-sustituido, de forma idéntica o diferente, en la mitad del anillo por halógeno, en cada caso alquilo C_1-C_4 y alcoxi C_1-C_4 de cadena lineal o ramificada.

R^{1a} , R^{2a} y R^{3a} independientemente entre sí cada uno de ellos preferentemente representan hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo;

o preferentemente representan en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que

tienen en cada caso de 1 a 6 átomos de carbono;

o preferentemente representan en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen en cada caso de 1 a 4 átomos de carbono y de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o preferentemente representan en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilaquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi que tienen de 1 a 4 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;

o preferentemente representan cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;

o preferentemente representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 preferentemente representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C_3-C_6 y

Q^2 preferentemente representa hidroxilo, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 o haloalcoxi C_1-C_4 teniendo cada uno de ellos de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes.

R^{1a} , R^{2a} y R^{3a} independientemente entre sí cada uno particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, ciano; metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, n-, iso-, sec- o terc-butoxi, metiltio, etiltio, n- o iso-propiltio, n-, iso-, sec- o terc-butiltio, trifluormetilo, trifluoretilo, difluormetoxi, trifluormetoxi, difluorclorometoxi, trifluoretoxi, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo,

o particularmente con preferencia representa la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 particularmente con preferencia representa hidrógeno, metilo, etilo, trifluormetilo o ciclopropilo y

Q^2 particularmente con preferencia representa hidroxilo, metoxi, n-propoxi o iso-propoxi.

R^{1a} , R^{2a} y R^{3a} independientemente entre sí cada uno muy particularmente con preferencia representa fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, trifluormetilo, trifluoretilo, difluormetoxi, trifluormetoxi, difluorclorometoxi, trifluoretoxi,

o muy particularmente con preferencia representa la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 muy particularmente con preferencia representa hidrógeno, metilo o etilo y

Q^2 muy particularmente con preferencia representa hidroxilo, metoxi, etoxi, n-propoxi o iso-propoxi.

Los radicales hidrocarburo saturados o insaturados, tal como alquilo o alqueno, pueden ser en cada caso de cadena lineal o ramificada en cuanto ello sea posible, incluso en combinación con heteroátomos tal como, por ejemplo, en alcoxi.

Los radicales opcionalmente sustituidos pueden estar mono- o poli-sustituidos, en donde, en el caso de poli-sustituciones, los sustituyentes pueden ser idénticos o diferentes.

Los radicales halo-sustituidos, tal como, por ejemplo, haloalquilo, están mono- o poli-halogenados. En el caso de poli-halogenación, los átomos de halógeno pueden ser idénticos o diferentes. En este caso, halógeno representa fluor, cloro, bromo y yodo, en particular fluor, cloro y bromo.

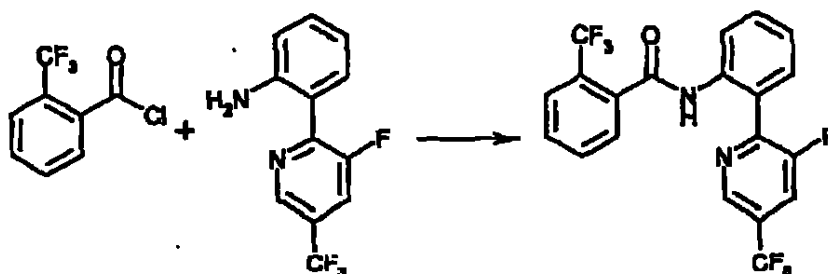
Sin embargo, las definiciones o ilustraciones de radicales generales o preferidas

indicadas anteriormente, se pueden combinar también entre sí según se desee, es decir incluyendo combinaciones entre las respectivas variedades y variedades preferidas. Esto se aplica también a los productos finales y, de manera correspondiente, a los precursores y compuestos intermedios. Además, pueden no aplicarse las definiciones individuales.

Descripción detallada de los procedimientos y compuestos intermedios

Procedimiento (a)

Empleando cloruro de 2-(trifluorometil)benzoilo y 2-[3-fluor-5-(trifluorometil)-2-piridin]fenil-amina como materiales de partida, el curso del procedimiento (a) según la invención puede ilustrarse por el siguiente esquema de fórmulas.



La fórmula (II) proporciona una definición general de los derivados de ácidos carboxílicos requeridos como materiales de partida para realizar el procedimiento (a) según la invención. En esta fórmula, A tiene preferentemente aquellos significados que ya han sido mencionados en conexión con la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferidos, particularmente preferidos o muy particularmente preferidos para estos radicales. Con preferencia, X^1 representa cloro, bromo o hidroxilo, en particular preferentemente cloro o hidroxilo.

Los derivados de ácidos carboxílicos de fórmula (II) son conocidos o se pueden preparar por procedimientos conocidos (véase WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 y EP-A 0 589 313).

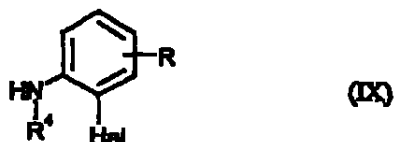
La fórmula (III) proporciona una definición general de las aminas requeridas

como componentes de reacción para realizar el procedimiento (a) según la invención. En esta fórmula, R, R¹, R² y R³ tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido mencionados en conexión con la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferidos, particularmente preferidos o muy particularmente preferidos para estos radicales.

Las aminas de fórmula (III) excluyendo los compuestos de fórmula (III) en donde R representa hidrógeno y R¹, R² y R³ independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono o haloalquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono; y R⁴ representa hidrógeno son nuevas (véase JP-A 8-92223). Las aminas de fórmula (III) empleadas para la producción de compuestos de fórmulas (I-12), (I-13), (I-14), (I-15) y (I-16). Algunas de ellas se pueden preparar por métodos conocidos (Heterocycles 1989, 29, 1013-1016; J. Med. Chem. 1996, 39, 892-903; Synthesis 1995, 713-16; Synth. Commun. 1994, 24, 267-272; DE-A 27 27 416; Synthesis 1994, 142-144; 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).

Además, los derivados de anilina de fórmula (III) se obtienen mediante

f) reacción de 2-halo-aminas de fórmula general (IX)



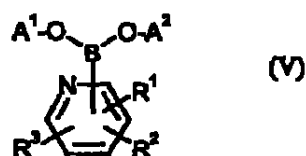
en donde

R y R⁴ se definen como anteriormente y

Hal representa halógeno,

con derivados de ácido borónico de fórmula (V)

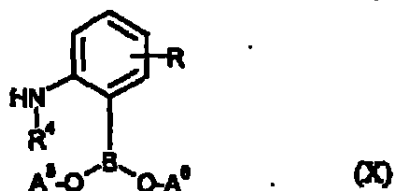
-50-



en donde R^1 , R^2 , R^3 , A^1 y A^2 se definen como anteriormente,
si resulta adecuado en presencia de un aceptor de ácido, si resulta adecuado en
presencia de un disolvente orgánico inerte y si resulta adecuado en presencia de un
catalizador,

o

g) reacción de derivados de ácido borónico de fórmula (X)



en donde

R y R^4 se definen como anteriormente y

A^5 y A^6 representan cada uno hidrógeno o juntos representan tetrametiletileno,
con derivados de piridinilo de fórmula (VII)



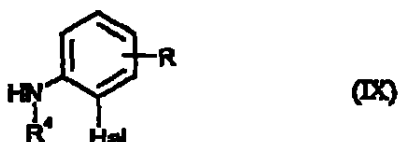
en donde R^1 , R^2 y R^3 se definen como anteriormente,

si resulta adecuado en presencia de un aceptor de ácido, si resulta adecuado en
presencia de un disolvente orgánico inerte y si resulta adecuado en presencia de un
catalizador,

o

h) reacción de 2-halo-aminas de fórmula general (IX)

-51-



en donde

R y R⁴ se definen como anteriormente y

Hal representa halógeno,

con derivados de piridinilo de fórmula (VII)



en donde R¹, R² y R³ se definen como anteriormente,

en presencia de un catalizador de paladio o platino y en presencia de 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano, si resulta adecuado en presencia de un aceptor de ácido y si resulta adecuado en presencia de un diluyente.

La fórmula (IX) proporciona una definición general de las 2-halo-aminas requeridas como componentes de reacción para realizar los procedimientos (f) y (h) según la invención. En esta fórmula, R y R⁴ tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido mencionados en conexión con la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferidos, particularmente preferidos o muy particularmente preferidos para estos radicales. Hal representa preferentemente cloro, bromo o yodo, en particular preferentemente bromo o yodo.

Las 2-halo-aminas de fórmula (IX) son conocidas y/o se pueden preparar por métodos conocidos a partir de los correspondientes compuestos nitro por reducción. En el caso en donde R⁴ no representa hidrógeno, los compuestos de fórmula (IX) se pueden obtener por derivaciones conocidas de los derivados de anilina resultantes.

Los derivados de ácido borónico de fórmula (V) requeridos también como materiales de partida para realizar el procedimiento (f) según la invención se describen con mayor detalle a continuación en conexión con el procedimiento (b) según la invención.

La fórmula (X) proporciona una definición general de los derivados de ácido borónico requeridos como componentes de reacción para realizar el procedimiento (g) según la invención. En esta fórmula, R y R⁴ tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido mencionados en conexión con la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferidos, particularmente preferidos o muy particularmente preferidos para estos radicales. A⁵ y A⁶ representan cada uno de ellos preferentemente hidrógeno o juntos representan tetrametiletileno.

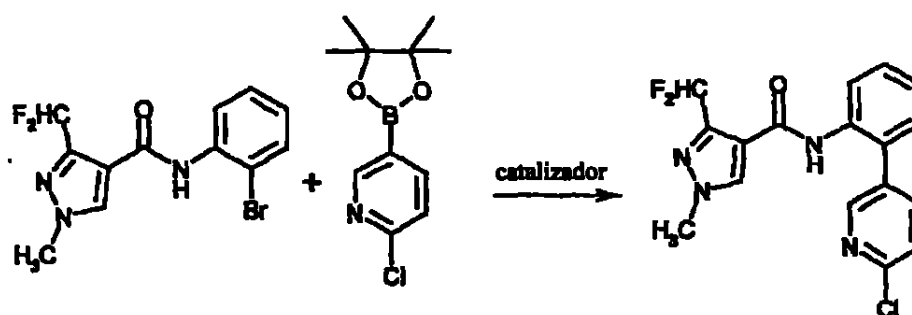
Los derivados de ácido borónico de fórmula (X) son conocidos y/o se pueden obtener por métodos conocidos.

Los derivados fenílicos de fórmula (VII) requeridos también como materiales de partida para realizar los procedimientos (g) y (h) según la invención se ilustran con mayor detalle a continuación, en conexión con el procedimiento (c) según la invención.

Procedimiento (b)

Empleando N-(2-bromofenil)-3-(difluormetil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y 2-cloro-5-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)piridina como materiales de partida y un catalizador, el curso del procedimiento (b) según la invención puede ser ilustrado por el siguiente esquema de fórmulas.

126 130



La fórmula (IV) proporciona una definición general de las halo-carboxamidas requeridas como materiales de partida para realizar el procedimiento (b) según la invención. En esta fórmula, R, R⁴ y A tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido mencionados en conexión con la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferidos, particularmente preferidos o muy particularmente preferidos para estos radicales.

Los derivados de carboxamida de fórmula (IV) son conocidos o se pueden preparar por procedimientos conocidos (véase WO 91/01311, EP-A 0 371 950). Los mismos se obtienen, por ejemplo, mediante

- i) reacción de derivados de ácidos carboxílicos de fórmula (II)

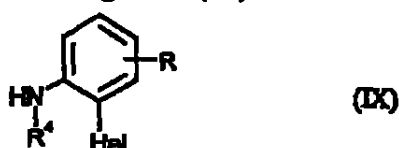


en donde

X¹ representa halógeno o hidroxilo y

A se define como anteriormente,

con 2-halo-aminas de fórmula general (IX)



en donde

127
131

R y R⁴ se definen como anteriormente y

Hal representa halógeno,

si resulta adecuado en presencia de un catalizador, si resulta adecuado en presencia de un agente de condensación, si resulta adecuado en presencia de un aceptor de ácido y si resulta adecuado en presencia de un diluyente.

Los derivados de ácidos carboxílicos de fórmula (III) requeridos como materiales de partida para realizar el procedimiento (i) según la invención se ilustran con mayor detalle a continuación, en conexión con el procedimiento (a) según la invención.

Las 2-halo-aminas de fórmula (IX) requeridas también como materiales de partida para realizar el procedimiento (i) según la invención se ilustran con mayor detalle a continuación, en conexión con el procedimiento (f) según la invención.

La fórmula (V) proporciona una definición general de los derivados de ácido borónico requeridos también como materiales de partida para realizar el procedimiento (b) según la invención. En esta fórmula, R¹, R² y R³ tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido mencionados en conexión con la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferidos, particularmente preferidos o muy particularmente preferidos para estos radicales. A¹ y A² representan cada uno de ellos preferentemente hidrógeno o juntos representan tetrametiletileno.

Los derivados de ácido borónico de fórmula (V) son conocidos y/o se pueden preparar por procedimientos conocidos (véase WO 01/90084 y US 5.633.218). Los mismos se obtienen, por ejemplo, mediante

k) reacción de derivados de piridinilo de fórmula (VII)



128 132

-55-

en donde R^1 , R^2 y R^3 se definen como anteriormente,

con ésteres de ácido bórico de fórmula (XI)



en donde Alk representa alquilo C_1-C_4 ,

o con 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano,

en presencia de magnesio o alquil-litio, si resulta apropiado en presencia de un diluyente (por ejemplo, tetrahidrofurano).

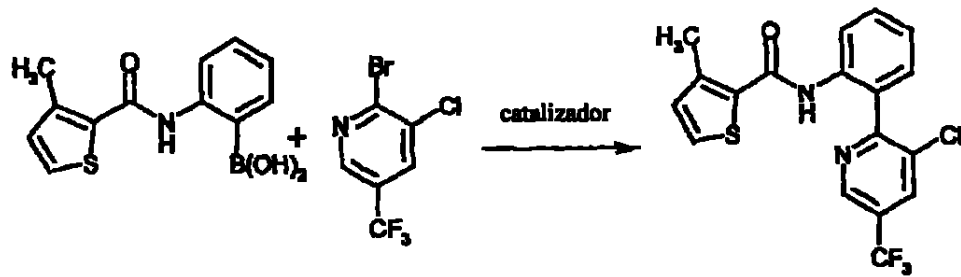
La fórmula (XI) proporciona una definición general de los ésteres de ácido bórico requeridos como componentes de reacción para realizar el procedimiento (h) según la invención. En esta fórmula, Alk representa preferentemente metilo, etilo, n- o iso-propilo, en particular preferentemente metilo o etilo.

Los ésteres de ácido bórico de fórmula (XI) son compuestos químicos conocidos para síntesis.

Los derivados de piridinilo de fórmula (VII) requeridos también como materiales de partida para realizar el procedimiento (h) según la invención se ilustran con mayor detalle a continuación, en conexión con el procedimiento (c) según la invención.

Procedimiento (c)

Empleando ácido 2-{[(3-metil-2-tienil)carbonil]amino} fenilborónico y 2-bromo-3-cloro-5-(trifluormetil)piridina como materiales de partida y un catalizador, el curso del procedimiento (c) según la invención se puede ilustrar por el siguiente esquema de fórmulas.



La fórmula (VI) proporciona una definición general de los derivados de carboxamida de ácido borónico requeridos como componentes de reacción para realizar el procedimiento (c) según la invención. En esta fórmula, R, R⁴ y A tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido mencionados en conexión con la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferidos, particularmente preferidos o muy particularmente preferidos para estos radicales. A³ y A⁴ representan cada uno de ellos preferentemente hidrógeno o juntos representan tetrametiletileno.

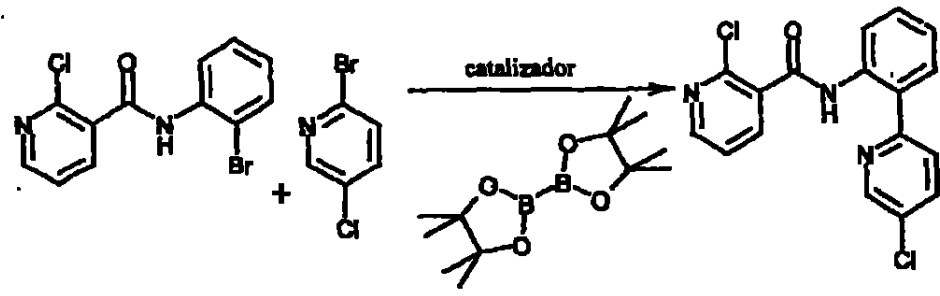
Los derivados de carboxamida de ácido borónico de fórmula (VI) son conocidos y/o se pueden preparar por métodos conocidos.

La fórmula (VII) proporciona una definición general de los derivados de piridinilo requeridos como materiales de partida para realizar el procedimiento (c) según la invención. En esta fórmula, R¹, R² y R³ tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido mencionados en conexión con la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferidos, particularmente preferidos o muy particularmente preferidos para estos radicales.

Los derivados de piridinilo de fórmula (VII) son conocidos o se pueden preparar por métodos conocidos (véase Synth. Commun. 2000, 30, 665-669, Synth. Commun. 1999, 29, 1697-1701 y también los ejemplos ofrecidos más adelante).

Procedimiento (d)

Empleando N-(2-bromofenil)-2-cloronicotinamida y 2-bromo-5-cloropiridina como materiales de partida y un catalizador y 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano, el curso del procedimiento (d) según la invención se puede ilustrar por el siguiente esquema de fórmulas.

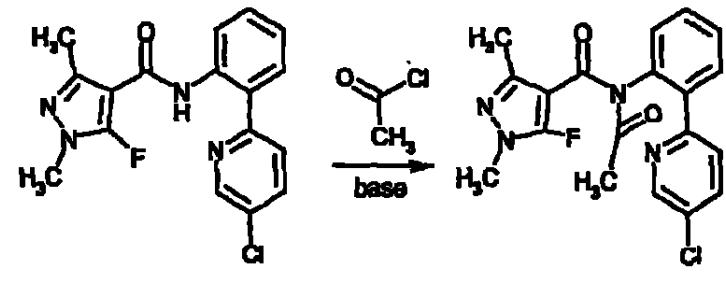


Las halo-carboxamidas de fórmula (IV) y los derivados de piridinilo de fórmula (VII) requeridos como materiales de partida para realizar el procedimiento (d) según la invención ya se han descrito anteriormente en conexión con los procedimientos (b) y (c) según la invención.

El 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano requerido también para realizar el procedimiento (d) según la invención es una sustancia química conocida.

Procedimiento (e)

Empleando N-[2-(5-cloro-2-piridinil)fenil]-5-fluor-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida y cloruro de acetilo como materiales de partida, el curso del procedimiento (e) según la invención se puede ilustrar por el siguiente esquema de fórmulas.



131 735

La fórmula (I-1) proporciona una definición general de las piridinilánilidas requeridas como materiales de partida para realizar el procedimiento (e) según la invención. En esta fórmula, R, R¹, R², R³ y A tienen preferentemente aquellos significados que ya han sido mencionados en conexión con la descripción de los compuestos de fórmula (I) según la invención como preferidos, particularmente preferidos o muy particularmente preferidos para estos radicales.

Los compuestos de fórmula (I-1) son compuestos según la invención y se pueden obtener de acuerdo con cualquiera de los procedimientos (a) a (d).

La fórmula (VIII) proporciona una definición general de los halogenuros requeridos como materiales de partida para realizar el procedimiento (e) según la invención. En esta fórmula, A^{4a} tiene preferentemente aquellos significados que ya han sido mencionados en conexión con la descripción de los compuestos de fórmula (I-2) según la invención como preferidos, particularmente preferidos o muy particularmente preferidos para estos radicales. X³ representa cloro, bromo o yodo.

Los halogenuros de fórmula (VIII) son ampliamente conocidos.

Condiciones de reacción

Diluyentes adecuados para realizar los procedimientos (a) y (i) según la invención son todos los disolventes orgánicos inertes usuales. Se da preferencia al uso de hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados, tales como clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-terc-butiléter, metil-terc-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o iso-butironitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-

dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o hexametilfosfotriamida; mezclas de los anteriores con agua o agua pura.

Diluyentes adecuados para realizar los procedimientos (b), (c), (d), (f), (g) y (h) según la invención son en cada caso todos los disolventes orgánicos inertes usuales. Se da preferencia al uso de hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-terc-butiléter, metil-terc-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o iso-butironitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o hexametilfosfotriamida; ésteres, tales como acetato de metilo o acetato de etilo; sulfóxidos, tal como dimetilsulfóxido; o sulfonas, tal como sulfolano; alcoholes, tales como metanol, etanol, n- o iso-propanol, n-, iso-, sec- o terc-butanol, etanodiol, propano-1,2-diol, etoxietanol, metoxietanol, monometiléter de dietilenglicol, monoetiléter de dietilenglicol; mezclas de los mismos con agua o agua pura.

Diluyentes adecuados para realizar el procedimiento (e) según la invención son todos los disolventes orgánicos inertes usuales. Se da preferencia al uso de hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados, tales como clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-terc-butiléter, metil-terc-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o hexametilfosfotriamida.

Aceptores de ácido adecuados para realizar los procedimientos (a) y (i) según la invención son todas las bases inorgánicas y orgánicas usuales para tales reacciones. Se da preferencia al uso de hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, tales como hidruro sódico, amida sódica, diisopropilamida de litio, metanolato sódico, etanolato sódico, terc-butanolato potásico, acetato sódico, acetato potásico, acetato cálcico, hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico o carbonato amónico; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

Aceptores de ácido adecuados para realizar los procedimientos (b), (c), (d), (f), (g) y (h) según la invención son todas las bases inorgánicas y orgánicas usuales para tales reacciones. Se da preferencia al uso de hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, fluoruros, fosfatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, tales como hidruro sódico, amida sódica, diisopropilamida de litio, metanolato sódico, etanolato sódico, terc-butanolato potásico, acetato sódico, acetato potásico, acetato cálcico, hidróxido sódico, hidróxido potásico, acetato sódico, fosfato sódico, fosfato potásico, fluoruro potásico, fluoruro de cesio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico o carbonato de cesio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

Aceptores de ácido adecuados para realizar el procedimiento (e) según la invención son todas las bases inorgánicas y orgánicas usuales para tales reacciones. Se da preferencia al uso de hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos, tales como hidruro sódico, amida sódica, diisopropilamida de litio, metanolato sódico, etanolato sódico, terc-butanolato potásico, acetato sódico, acetato potásico, acetato cálcico, hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico o carbonato de cesio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

Agentes de condensación adecuados para realizar los procedimientos (a) y (i) según la invención son todos los agentes de condensación usuales para dichas reacciones de amidación. Se da preferencia al uso de haluros de ácido, tales como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxido de tricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; formadores de anhídridos, tales como cloroformato de etilo, cloroformato de metilo, cloroformato de isopropilo, cloroformato de isobutilo o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas, tal como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes de condensación usuales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonildiimidazol, 2-etoxi-N-etoxycarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano o bromo-tripirrolidinofosfonio-hexafluorofosfato.

Los procedimientos (a) y (i) según la invención se efectúan opcionalmente en presencia de un catalizador. Se da preferencia a 4-dimetilaminopiridina, 1-

135 

hidroxibenzotriazol o dimetilformamida.

Los procedimientos (b), (c), (d), (f), (g) y (h) según la invención se efectúan en presencia de un catalizador. Se da preferencia a las sales o complejos de paladio, tales como cloruro de paladio, acetato de paladio, tetraquis-(trifenilfosfina)paladio, dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno paladio(II).

También es posible generar un complejo de paladio directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo, tal como trietilfosfano, tri-terc-butilfosfano, triciclohexilfosfano, 2-(díciclohexilfosfano)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfano)bifenilo, 2-(díciclohexilfosfano)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfano, tris-(o-tolil)fosfano, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato sódico, tris-2-(metoxifenil)fosfano, 2,2'-bis(difenilfosfano)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis(difenilfosfano)butano, 1,2-bis(difenilfosfano)etano, 1,4-bis(díciclohexilfosfano)butano, 1,2-bis(díciclohexilfosfano)etano, 2-(díciclohexilfosfano)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno o tris-(2,4-terc-butilfenil)-fosfito.

Cuando se efectúan los procedimientos (a) y (i) según la invención, la temperatura de reacción puede variar dentro de un intervalo relativamente amplio. En general, el procedimiento se efectúa a temperaturas entre 0 y 150° C, con preferencia entre 0 y 120° C, en particular preferentemente entre 10 y 80° C.

Cuando se efectúan los procedimientos (b), (c), (d), (f), (g) y (h) según la invención, las temperaturas de reacción pueden en cada caso variar dentro de un intervalo relativamente amplio. En general, los procedimientos se efectúan a temperaturas entre 0 y 180° C, con preferencia entre 10 y 150° C, en particular preferentemente entre 20 y 120° C.

Cuando se efectúa el procedimiento (e) según la invención, la temperatura de reacción puede variar dentro de un intervalo relativamente amplio. En general, el

procedimiento se efectúa a temperaturas entre 0 y 150° C, con preferencia entre 20 y 110° C.

Cuando se efectúa el procedimiento (a) según la invención, en general se emplean entre 0,8 y 15 moles, con preferencia entre 0,8 y 8 moles, de amina de fórmula (III) y de 1 a 3 moles de aceptor de ácido por mol de derivado de ácido carboxílico de fórmula (II). Sin embargo, también es posible emplear los componentes de reacción en otras proporciones. La elaboración se efectúa por los métodos usuales. En general, se añade agua a la mezcla de reacción y la fase orgánica se separa y, después del secado, se concentra bajo presión reducida. El residuo que permanece puede ser liberado, si resulta adecuado, de cualquier impureza que pueda estar todavía presente, empleando métodos usuales, tal como cromatografía o recristalización.

Cuando se efectúa el procedimiento (b) según la invención, en general se emplean de 1 a 15 moles, con preferencia de 2 a 8 moles, de derivado de ácido borónico de fórmula (V) y de 1 a 5 moles de aceptor de ácido por mol de halo-carboxamida de fórmula (IV). Sin embargo, también es posible emplear los componentes de reacción en otras proporciones. La elaboración se efectúa por métodos usuales. En general, se añade agua a la mezcla de reacción y el precipitado se separa y se seca. El residuo que permanece puede ser liberado, si resulta adecuado, de cualquier impureza que pueda estar todavía presente, empleando métodos usuales, tal como cromatografía o recristalización.

Cuando se efectúa el procedimiento (c) según la invención, en general se emplean de 0,8 a 15 moles, con preferencia de 0,8 a 8 moles, de derivado de piridinilo de fórmula (VII) y de 1 a 10 moles de aceptor de ácido y de 0,5 a 5 moles% de un catalizador por mol de derivado de carboxamida de ácido borónico de fórmula (VI). Sin embargo, también es posible emplear los componentes de reacción en otras

146

137

proporciones. La elaboración se efectúa por métodos usuales. En general, se añade agua a la mezcla de reacción y el precipitado se separa y se seca. El residuo que permanece puede ser liberado, si resulta adecuado, de cualquier impureza que pueda estar todavía presente, empleando métodos usuales, tal como cromatografía o recristalización.

Cuando se efectúa el procedimiento (d) según la invención, en general se emplean de 0,8 a 15 moles, con preferencia de 0,8 a 8 moles, de derivado de piridinilo de fórmula (VII) y de 0,8 a 15 moles, con preferencia de 0,8 a 8 moles, de 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano y de 1 a 5 moles de aceptor de ácido y de 1 a 5 moles de un catalizador por mol de derivado de carboxamida de fórmula (IV). Sin embargo, también es posible emplear los componentes de reacción en otras proporciones. La elaboración se efectúa por métodos usuales. En general, se añade agua a la mezcla de reacción y el precipitado se separa y se seca. El residuo que permanece puede ser liberado, si resulta adecuado, de cualquier impureza que pueda estar todavía presente, empleando métodos usuales, tal como cromatografía o recristalización.

Cuando se efectúa el procedimiento (e) según la invención, por mol de la piridinilánilida de fórmula (I-1) en general se emplean de 0,2 a 5 moles, con preferencia de 0,5 a 2 moles de un halogenuro de fórmula (VIII). Sin embargo, también es posible emplear los componentes de reacción en otras proporciones. La elaboración se efectúa por métodos usuales.

Todos los procedimientos según la invención se efectúan generalmente bajo presión atmosférica. Sin embargo, en cada caso también es posible trabajar bajo presión elevada o reducida, en general entre 0,1 y 10 bares.

Las sustancias según la invención tienen una potente actividad microbicida y pueden ser empleados para controlar microorganismos indeseables, tales como hongos y bacterias, en la protección de cultivos y en la protección de materiales.

Los fungicidas se pueden emplear en la protección de cultivos para controlar Plasmodiophoromicetos, Oomicetos, Quitridiomicetos, Zigomicetos, Ascomicetos, Basidiomicetos y Deuteromicetos.

Los bactericidas se pueden emplear en la protección de cultivos para controlar Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae y Streptomyetaceae.

Se ofrecen ahora ejemplos, solo a título ilustrativo y de ningún modo limitativo, de algunos patógenos causantes de enfermedades fúngicas y bacterianas que se encuentran bajo los nombres genéricos antes indicados:

Especies de *Xanthomonas*, tal como, por ejemplo, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

Especies de *Pseudomonas*, tal como, por ejemplo *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

Especies de *Erwinia*, tal como, por ejemplo, *Erwinia amylovora*;

Especies de *Pythium*, tal como, por ejemplo, *Pythium ultimum*;

Especies de *Phytophthora*, tal como, por ejemplo, *Phytophthora infestans*;

Especies de *Pseudoperonospora*, tal como, por ejemplo, *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*;

Especies de *Plasmopara*, tal como, por ejemplo, *Plasmopara viticola*;

Especies de *Bremia*, tal como, por ejemplo, *Bremia lactucae*;

Especies de *Peronospora*, tal como, por ejemplo, *Peronospora pisi* o *P. brassicae*;

Especies de *Erysiphe*, tal como, por ejemplo, *Erysiphe graminis*;

Especies de *Sphaerotheca*, tal como, por ejemplo, *Sphaerotheca fuliginea*;

Especies de *Podosphaera*, tal como, por ejemplo, *Podosphaera leucotricha*;

Especies de *Venturia*, tal como, por ejemplo, *Venturia inaequalis*;

Especies de *Pyrenophora*, tal como, por ejemplo, *Pyrenophora teres* o *P. graminea*

(forma de conidios: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Especies de Cochliobolus, tal como, por ejemplo, Cochliobolus sativus

(forma de conidios: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Especies de Uromyces, tal como, por ejemplo, Uromyces appendiculatus;

Especies de Puccinia, tal como, por ejemplo, Puccinia recondita;

Especies de Sclerotinia, tal como, por ejemplo, Sclerotinia sclerotiorum;

Especies de Tilletia, such as for example, Tilletia caries;

Especies de Ustilago, tal como, por ejemplo, Ustilago nuda or Ustilago avenae;

Especies de Pellicularia, such as for example, Pellicularia sasakii;

Especies de Pyricularia, such as for example, Pyricularia oryzae;

Especies de Fusarium, tal como, por ejemplo, Fusarium culmorum;

Especies de Botrytis, tal como, por ejemplo, Botrytis cinerea;

Especies de Septoria, tal como, por ejemplo, Septoria nodorum;

Especies de Leptosphaeria, tal como, por ejemplo, Leptosphaeria nodorum;

Especies de Cercospora, tal como, por ejemplo, Cercospora canescens;

Especies de Alternaria, tal como, por ejemplo, Alternaria brassicae; and

Especies de Pseudocercospora, tal como, por ejemplo, Pseudocercospora herpotrichoides.

Los compuestos activos según la invención tienen también una muy buena acción fortalecedora en plantas. Por tanto, los mismos se pueden emplear para movilizar las defensas de la planta frente al ataque por microorganismos indeseados.

En el presente contexto, por sustancias fortalecedoras de las plantas (inductoras de resistencia) han de entenderse aquellas sustancias capaces de estimular el sistema de defensa de las plantas de tal manera que, cuando las plantas tratadas son posteriormente inoculadas con microorganismos indeseados, las mismas muestran una resistencia

CAF
120

sustancial contra dichos microorganismos.

En el presente caso, por microorganismos indeseados han de entenderse hongos fitopatógenos, bacterias y virus. Por tanto, las sustancias según la invención se pueden emplear para proteger plantas durante un cierto periodo después del tratamiento contra el ataque por los patógenos mencionados. El periodo durante el cual se aporta dicha protección abarca generalmente de 1 a 10 días, preferentemente 1 a 7 días, después del tratamiento de las plantas con los compuestos activos.

El hecho de que los compuestos activos sean bien tolerados por las plantas en las concentraciones requeridas para controlar enfermedades de las plantas, permite el tratamiento de partes de las plantas situadas por encima del suelo, de material de propagación y semillas y del suelo.

Los compuestos activos según la invención son también adecuados para aumentar la producción de cultivos. Además, muestran una menor toxicidad y son bien tolerados por las plantas.

En ciertas concentraciones y proporciones de aplicación, los compuestos activos según la invención se pueden emplear también como herbicidas, para influenciar el crecimiento de las plantas y para controlar plagas en animales. Igualmente, se pueden emplear como compuestos intermedios y precursores para la síntesis de otros compuestos activos.

Los compuestos activos según la invención se pueden emplear para tratar todas las plantas y partes de las mismas. Por el término "plantas" ha de entenderse aquí todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas e indeseadas o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante métodos de reproducción y optimización convencionales o por métodos biotecnológicos o de ingeniería genética o

combinaciones de estos métodos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo las variedades vegetales que no pueden ser protegidas por el derecho de propiedad de variedades vegetales. Por el término "partes de plantas" ha de entenderse todas aquellas partes y órganos de las plantas situadas por encima y por debajo del suelo, tales como retoños, hojas, flores y raíces, pudiéndose mencionar como ejemplos de las mismas: hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas y también raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de las plantas incluyen también plantas cosechadas y material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo plántulas, tubérculos, rizomas, esquejes y semillas.

El tratamiento de las plantas y de las partes de las mismas con los compuestos activos de acuerdo con la invención se efectúa directamente o por acción en su entorno, hábitat o espacio de almacenamiento, de acuerdo con los métodos de tratamiento usuales, por ejemplo mediante goteo, pulverización, evaporación, atomización, a boleo, esparcido y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, además mediante el revestimiento en una o varias capas.

En la protección de materiales, los compuestos según la invención se pueden emplear para proteger materiales industriales contra la infección con, y destrucción por, microorganismos indeseados.

Los materiales industriales se entienden, en el presente contexto, como representando materiales no vivos que han sido preparados para su uso industrial. Por ejemplo, los materiales industriales destinados a ser protegidos por los compuestos activos según la invención contra alteraciones o destrucción por parte de microbios, pueden consistir en adhesivos, aprestos, papel y cartón, textiles, cuero, madera, pinturas y artículos de material plástico, lubricantes de refrigeración y otros materiales que pueden resultar infectados con, o destruidos por, microorganismos. Dentro del alcance

146

142

-69-

de los materiales a proteger pueden mencionarse también partes de plantas de producción, por ejemplo, circuitos de agua de refrigeración, que pueden resultar dañadas por la proliferación de microorganismos. Los materiales industriales que pueden citarse dentro del alcance de la presente invención son preferentemente adhesivos, aprestos, papeles y cartones, cuero, madera, pinturas, lubricantes de refrigeración y líquidos de transferencia térmica, preferentemente, en particular, madera.

Como microorganismos capaces de degradar o alterar los materiales industriales pueden mencionarse, por ejemplo, bacterias, hongos, levadura, algas y babaza u organismos. Los compuestos activos según la invención actúan preferentemente contra hongos, en particular mohos, hongos decolorantes de la madera y destructores de la madera (Basidiomicetos) y contra organismos de la babaza y algas.

Como ejemplos se pueden citar los microorganismos de los siguientes géneros:

Alternaria, tal como *Alternaria tenuis*,
Aspergillus, tal como *Aspergillus niger*,
Chaetomium, tal como *Chaetomium globosum*,
Coniophora, tal como *Coniophora puetana*,
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*,
Trichoderma, tal como *Trichoderma viride*,
Escherichia, tal como *Escherichia coli*,
Pseudomonas, tal como *Pseudomonas aeruginosa*,
Staphylococcus, tal como *Staphylococcus aureus*.

Dependiendo de sus propiedades físicas y/o químicas particulares, los compuestos activos se pueden convertir a las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, pastas, gránulos, aerosoles y microencapsulaciones en sustancias poliméricas y en composiciones de revestimiento para semillas, y formulaciones de nebulización en frío y en caliente ULV.

Estas formulaciones se pueden preparar según métodos conocidos per se, por ejemplo, mezclando los compuestos activos con extendedores, concretamente diluyentes líquidos; diluyentes gaseosos licuados; diluyentes o vehículos sólidos, y usando opcionalmente agentes de superficie activa, concretamente emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes formadores de espuma. En el caso de emplear agua como extendedor, por ejemplo, se pueden añadir también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Esencialmente, disolventes líquidos adecuados son: hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, xileno, tolueno o alquilnaftalenos), hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados (por ejemplo, clorobencenos, cloruros de etileno o cloruro de metileno), hidrocarburos alifáticos [por ejemplo, ciclohexano o parafinas (por ejemplo, fracciones de petróleo)], alcoholes (por ejemplo, butanol o glicol y sus éteres, ésteres), cetonas (por ejemplo, acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona), disolventes fuertemente polares (por ejemplo, dimetilformamida o dimetilsulfóxido) o también agua. Los extendedores o vehículos gaseosos licuados son sustancias líquidas que son gases a temperatura y presión normales y a este respecto pueden citarse, por ejemplo, propulsores de aerosoles, tales como hidrocarburos halogenados, o también butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono. Como vehículos sólidos adecuados se pueden mencionar, por ejemplo, minerales naturales molidos (por ejemplo, caolín, arcilla, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita, tierra de diatomeas) y minerales sintéticos molidos (por ejemplo, ácido silícico

144

144

-71-

altamente disperso, alúmina y silicatos). Como vehículos sólidos adecuados para gránulos se pueden mencionar, por ejemplo, rocas trituradas y fraccionadas (por ejemplo, calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita) o también gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, partículas de materiales orgánicos (por ejemplo, polvo de serrín, cortezas de coco, carozos de maíz y tallos de tabaco). Como emulsionantes y/o agentes espumantes adecuados se pueden mencionar, por ejemplo, emulsionantes no iónicos y aniónicos [por ejemplo, ésteres de polioxietileno y de ácidos grasos, éteres de polioxietileno y de alcoholes de ácidos grasos (por ejemplo, alquilarilpoliglicoléteres, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos)] o también hidrolizados de proteínas. Los dispersantes adecuados incluyen, por ejemplo, licor residual de ligninsulfito y metilcelulosa. También se pueden emplear agentes aportadores de viscosidad en las formulaciones (polvos, gránulos, concentrados emulsionables). Como tales agentes se pueden citar, por ejemplo, carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos (por ejemplo, goma arábiga, alcohol polivinílico y acetato de polivinilo) o también fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Otros posibles aditivos son los aceites minerales y naturales. También se pueden usar colorantes. Como dichos colorantes se pueden mencionar, por ejemplo, pigmentos inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio y Azul Prusia), colorantes orgánicos tales como colorantes alizarínicos, colorantes azoicos o colorantes de ftalocianinas metálicas, y además trazas de nutrientes tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y zinc.

Las formulaciones comprenden en general entre 0,1 y 95% en peso de compuesto activo, con preferencia entre 0,5 y 90%.

Los compuestos activos según la invención se pueden emplear como tales o en sus formulaciones, también en mezcla con fungicidas, bactericidas, acaricidas,

149
125

nematicidas o insecticidas, todos ellos conocidos, para ampliar, por ejemplo, el espectro de actividad o para prevenir el desarrollo de resistencia. En muchos casos, se obtienen efectos sinérgicos, es decir, la actividad de la mezcla es mayor que la actividad de los componentes individuales.

Ejemplos de componentes de mezcla adecuados son los siguientes:

Fungicidas:

2-fenilfenol; sulfato de 8-hydroxyquinolina; acibenzolar-S-methyl; aldimorph; amidoflumet; ampropylfos; ampropylfos-potassium; andoprim; anilazine; azaconazole; azoxystrobin; benalaxyl; benodanil; benomyl; benthiavalicarb-isopropyl; benzamacril; benzamacril-isobutyl; bilanafos; binapacryl; biphenyl; bitertanol; blasticidin-S; bromuconazole; bupirimate; buthiobate; butylamine; calcium polysulphide; capsimycin; captafol; captan; carbendazim; carboxin; carpropamid; carvone; chinomethionat; chlobenthiazone; chlorfenazole; chloroneb; chlorothalonil; chlozolate; clozylacon; cyazofamid; cyflufenamid; cymoxanil; cyproconazole; cyprodinil; cyprofuram; Dagger G; debacarb; dichlofluanid; dichlone; dichlorophen; diclocymet; diclomezine; dicloran; diethofencarb; difenoconazole; diflumetorim; 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; fenciclonil; fenpropidin; fenpropimorph; ferbam; fluazinam; flubenzimine; fludioxonil; flumetover; flumorph; fluoromide; fluoxastrobin; fluquinconazole; flurprimidol; flusilazole; flusulfamide; flutolanil; flutriafol; folpet; fosetyl-Al; fosetyl-sodium; fuberidazole; furalaxyl; furametpyr; furcarbanil; furmecyclox; guazatine; hexachlorobenzene; hexaconazole; hymexazole; imazalil; imibenconazole; iminoctadine triacetate; iminoctadine tris(albesilate);

150
146

iodocarb; ipconazole; iprobenfos; iprodione; iprovalicarb; irumamycin; isoprothiolane; isovaledione; kasugamycin; kresoxim-methyl; mancozeb; maneb; meferimzone; mepanipyrin; mepronil; metalaxyl; metalaxyl-M; metconazole; methasulfocarb; methfuroxam; metiram; metominostrobin; metsulfovax; mildiomyacin; myclobutanil; myclozolin; natamycin; nicobifen; nitrothal-isopropyl; noviflumuron; nuarimol; ofurace; orysastrobin; oxadixyl; oxolinic acid; oxpoconazole; oxycarboxin; oxyfenthiin; paclobutrazole; pefurazoate; penconazole; pencycuron; phosdiphen; phthalide; picoxystrobin; piperalin; polyoxins; polyoxorim; probenazole; prochloraz; procymidone; propamocarb; propanosine-sodium; propiconazole; propineb; proquinazid; prothioconazole; pyraclostrobin; pyrazophos; pyrifenox; pyrimethanil; pyroquilon; pyroxyfur; pyrrolnitrin; quinconazole; quinoxifen; quintozene; simeconazole; spiroxamine; sulfur; tebuconazole; tecloftalam; tecnazene; tetcyclacis; tetraconazole; thiabendazole; thicyofen; thifluzamide; thiophanate-methyl; thiram; tioxyimid; tolclfos-methyl; tolylfluanid; triadimefon; triadimenol; triazbutil; triazoxide; tricyclamide; tricyclazole; tridemorph; trifloxystrobin; triflumizole; triforine; triticonazole; uniconazole; validamycin A; vinclozolin; zineb; ziram; zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)-amino]butanamida; 1-(1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona; 2,3,5,6-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; actinovato; cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol; metil(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato; carbonato monopotásico; N-(6-metoxi-3-piridinil)-ciclopropancarboxamida; N-butil-8-(1,1-dimetiletil)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amina; tetratiocarbonato sódico; y sales y preparados de cobre, tales como mezcla Burdeos; hidróxido de cobre; naftenato

152

147

de cobre; oxiclورو de cobre; sulfato de cobre; cufraneb; óxido de cobre; mancopper; oxine-copper.

Bactericidas:

bronopol, dichlorophen, nitrapyrin, nickel dimethyldithiocarbamate, kasugamycin, othilinone, furancarboxylic acid, oxytetracyclin, probenazole, streptomycin, tecloftalam, sulfato de cobre y otros preparados de cobre.

Insecticidas/acaricidas/nematicidas:

abamectin, ABG-9008, acephate, acequinocyl, acetamiprid, acetoprole, acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, alanycarb, aldicarb, aldoxycarb, allethrin, allethrin 1R-isomers, alpha-cypermethrin (alphamethrin), amidoflume, aminocarb, amitraz, avermectin, AZ-60541, azadirachtin, azamethiphos, azinphos-methyl, azinphos-ethyl, 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-cyclopentyl-isómero, bioethanomethrin, biopermethrin, bioresmethrin, bistrifluron, BPMC, brofenprox, bromophos-ethyl, bromopropylate, bromfenvinfos (-methyl), BTG-504, BTG-505, bufencarb, buprofezin, butathiofos, butocarboxim, butoxycarboxim, butylpyridaben, cadusafos, camphechlor, carbaryl, carbofuran, carbophenothion, carbosulfan, cartap, CGA-50439, chinomethionat, chlordane, chlordimeform, chloethocarb, chlor-ethoxyfos, chlorfenapyr, chlorfenvinphos, chlorfluazuron, chlormephos, chlorobenzilate, chloropicrin, chlorproxyfen, chlorpyrifos-methyl, chlorpyrifos (-ethyl), chlovaporthrin, chromafenozide, cis-cypermethrin, cis-resmethrin, cis-permethrin, clocythrin, cloethocarb, clofentezine, clothianidin, clothiazoben, codlemone, coumaphos,

152

148

-75-

cyanofenphos, cyanophos, cycloprene, cycloprothrin, *Cydia pomonella*, cyfluthrin, cyhalothrin, cyhexatin, cypermethrin, cyphenothrin (isómero 1R-trans), cyromazine, DDT, deltamethrin, demeton-S-methyl, demeton-S-methylsulphone, diafenthion, dialifos, diazinon, dichlofenthion, dichlorvos, dicofol, dicrotophos, dicyclanil, diflubenzuron, dimethoate, dimethylvinphos, dinobuton, dinocap, dinetofuran, diofenolan, disulfoton, docusat-sodium, dofenapyn, DOWCO-439, eflusilanate, emamectin, emamectin-benzoate, empenthrin (1R-isomer), endosulfan, *Entomophthora* spp., EPN, esfenvalerate, ethiofencarb, ethiprole, ethion, ethoprophos, etofenprox, etoxazole, etrimfos, famphur, fenamiphos, fenazaquin, fenbutatin oxide, fenfluthrin, fenitrothion, fenobucarb, fenothiocarb, fenoxacrim, fenoxycarb, fenpropathrin, fenpyrad, fenpyrithrin, fenpyroximate, fensulfothion, fenthion, fentrifanil, fenvalerate, fipronil, flonicamid, fluacrypyrim, fluazuron, flubenzimine, flubrocycrin, flucycloxuron, flucythrinate, flufenerim, flufenoxuron, flufenprox, flumethrin, flupyrazofos, flutenzin (flufenzine), fluvalinate, fonofos, formetanate, formothion, fosmethilan, fosthiazate, fubfenprox (fluproxyfen), furathiocarb, gamma-HCH, gossyplure, grandlure, virus de granulosis, halfenprox, halofenozide, HCH, HCN-801, heptenophos, hexaflumuron, hexythiazox, hydramethylnone, hydroprene, IKA-2002, imidacloprid, imiprothrin, indoxacarb, iodofenphos, iprobenfos, isazofos, isofenphos, isoprocarb, isoxathion, ivermectin, japonilure, kadethrin, polihedrovirus nucleares, kinoprene, lambda-cyhalothrin, lindane, lufenuron, malathion, mecarbam, mesulfenfos, metaldehyde, metam-sodium, 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, 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, paecilomyces fumosoroseus, parathion-methyl, parathion (-ethyl), permethrin (cis-, trans-), petroleum, PH-6045, phenothrin (isómero 1R-trans), phenthoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phosphocarb, phoxim, piperonyl butoxide, pirimicarb, pirimiphos-methyl, pirimiphos-ethyl, 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, spiroadiclofen, spiromesifen, sulfluramid, sulfotep, sulprofos, SZI-121, tau-fluvalinate, tebufenozide, tebufenpyrad, tebupirimfos, teflubenzuron, tefluthrin, temephos, temivinphos, terbam, terbufos, tetrachlorvinphos, tetradifon, tetramethrin, tetramethrin (isómero 1R), tetrasul, theta-cypermethrin, thiacloprid, thiamethoxam, thiapronil, thiatrithos, thiocyclam hydrogenoxalate, thiodicarb, thiofanox, thiometon, thiosultap-sodium, thuringiensin, tolfenpyrad, talocyttrin, talomethrin, transfluthrin, triarathene, triazamate, triazophos, triazuron, trichlophenidine, trichlorfon, triflumuron, trimethacarb, vamidothion, vanilprole, verbutin, Verticillium lecanii, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, xylylcarb, ZA-3274, zeta-cypermethrin, zolaprofos, ZXI-8901, 3-metilfenilpropilcarbamato (tsumacide Z), 3-(5-cloro-3-piridinil)-8-(2,2,2-trifluoretil)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitrilo (CAS-Reg. No. 185982-80-3) y el correspondiente isómero 3-endo (CAS-Reg. No. 185984-60-5) (ver WO-96/37494, WO-98/25923), y preparados que comprenden extractos vegetales insecticidamente activos, nemátodos, hongos o virus.

También es posible la mezcla con otros compuestos activos conocidos, tales

como herbicidas, o con fertilizantes y reguladores del crecimiento, agentes de seguridad y/o productos semioquímicos.

Además, los compuestos de fórmula (I) según la invención tienen también una actividad antimicótica muy buena. Los mismos tienen un espectro de actividad antimicótico muy amplio, en particular contra dermatofitos y levaduras, mohos y hongos difásicos (por ejemplo contra especies de *Candida* tales como *Candida albicans*, *Candida glabrata*) y *Epidermophyton floccosum*, especies de *Aspergillus* tales como *Aspergillus Níger* y *Aspergillus fumigatus*, especies de *Trichophyton* tal como *Trichophyton mentagrophytes*, especies de *Microsporon* tal como *Microsporon canis* y *audouinii*. La lista de dichos hongos de ningún modo limita el espectro micótico que puede ser cubierto, sino que únicamente se ofrece con fines ilustrativos.

Los compuestos activos se pueden emplear como tales, en forma de sus formulaciones o en las formas de uso preparadas a partir de los mismos, tales como soluciones, suspensiones, polvos humectables, pastas, polvos solubles, polvos y gránulos, todas ellas listas para ser empleadas. La aplicación se efectúa del modo usual, por ejemplo mediante riego, pulverización, atomización, aplicación a boleo, espolvoreo, espumado, esparcido, etc. Además, es posible aplicar los compuestos activos mediante el método de volumen ultra-bajo, o bien inyectar el preparado de compuesto activo o el propio compuesto activo en el suelo. También es posible tratar las semillas de las plantas.

Cuando se emplean los compuestos activos según la invención como fungicidas, las proporciones de aplicación pueden variar dentro de un intervalo relativamente amplio, dependiendo del tipo de aplicación. Para el tratamiento de partes de plantas, las proporciones de aplicación del compuesto activo están comprendidas generalmente entre 0,1 y 10.000 g/ha, con preferencia entre 10 y 1.000 g/ha. Para el revestimiento de

151

semillas, las proporciones de aplicación del compuesto activo están comprendidas en general entre 0,001 y 50 g por kg de semillas, preferentemente entre 0,01 y 10 g por kg de semillas. Para el tratamiento del suelo, las proporciones de aplicación del compuesto activo están comprendidas generalmente entre 0,1 y 10.000 g/ha, con preferencia entre 1 y 5.000 g/ha.

Como ya se ha mencionado anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención. En una modalidad preferida, se tratan especies de plantas silvestres y variedades de plantas, o bien aquellas obtenidas por reproducción biológica convencional, tal como por cruzamiento o fusión de protoplastos, y partes de las mismas. En otra modalidad preferida, se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas obtenidas por ingeniería genética, si es adecuado en combinación con métodos convencionales (Genetically Modified Organisms), y partes de las mismas. El término "partes" o "partes de plantas" ha sido explicado anteriormente.

De un modo particularmente preferible, según la invención se tratan plantas de las variedades que, en cada caso, se encuentran comercialmente disponibles o en uso. Por variedades de plantas se quiere dar a entender plantas que tienen nuevas propiedades ("rasgos"), desarrolladas por reproducción convencional, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinante. Pueden consistir en variedades, biotipos y genotipos.

Dependiendo de la especie de planta o variedad de planta, de su ubicación y de las condiciones de crecimiento (suelos, clima, periodo de vegetación, dieta), el tratamiento según la invención puede dar lugar también a efectos superaditivos ("sinérgicos"). Así, por ejemplo, son posibles efectos tales como una menor proporción de aplicación y/o una ampliación del espectro de actividad y/o un incremento de la actividad de las sustancias y composiciones a utilizar según la invención, un mejor crecimiento de las plantas, una mayor tolerancia a altas o bajas temperaturas, una mayor

tolerancia a la sequía o al agua o al contenido en sales del suelo, una mayor producción de flores, una recolección más fácil, una maduración acelerada, mayores producciones de las cosechas, una mejor calidad y/o un mayor valor nutricional de los productos cosechados, una mejor estabilidad en almacenamiento y/o capacidad de procesamiento de los productos cosechados, cuyos efectos excederán de los efectos que cabría esperar realmente.

Las plantas transgénicas o variedades de plantas preferidas (es decir, aquellas obtenidas por ingeniería genética) que han de ser tratadas según la invención incluyen todas las plantas que, en la modificación genética, recibieron material genético que impartía en estas plantas propiedades útiles ("rasgos") particularmente ventajosas. Ejemplos de tales propiedades son un mejor crecimiento de las plantas, una mayor tolerancia a las altas o bajas temperaturas, una mayor tolerancia a la sequía o al agua o al contenido de sales del suelo, una mayor producción de flores, una recolección más fácil, una maduración acelerada, mayores producciones de las cosechas, una mejor calidad y/o un mayor valor nutricional de los productos cosechados, una mejor estabilidad en almacenamiento y/o capacidad de procesamiento de los productos cosechados. Además, como ejemplos particularmente notorios de tales propiedades, se pueden mencionar una mejor defensa de las plantas contra plagas de animales y microbios, tal como contra insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, y también una mayor tolerancia de las plantas a ciertos compuestos con actividad herbicida. Ejemplos de plantas transgénicas que pueden ser citadas son las plantas de cultivo importantes tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, judías, patatas, algodón, colza y también plantas de frutos (por ejemplo, manzanas, peras, frutos cítricos y uvas), dedicándose un énfasis particular a maíz, soja, judías, patatas, algodón y colza. Los rasgos que son mejorados en particular son una mayor defensa de las plantas contra insectos mediante toxinas

formadas en las plantas, en particular aquellas formadas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF y también combinaciones de los mismos) (referidas de aquí en adelante como “plantas Bt”). Los rasgos que son también mejorados de forma particular son una mayor defensa de las plantas contra hongos, bacterias y virus mediante resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, eductores y genes de resistencia y las correspondientes proteínas y toxinas expresadas. Los rasgos que además son mejorados de manera particular son una mayor tolerancia de las plantas a ciertos compuestos con actividad herbicida, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glyphosate o phosphinotricin (por ejemplo, el gen “PAT”). Los genes que imparten los rasgos deseados en cuestión pueden estar también presentes en combinación entre sí en las plantas transgénicas. Ejemplos de “plantas Bt” que pueden mencionarse son variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata que se comercializan con los nombres registrados YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucota® (algodón) y NewLeaf® (patata). Ejemplos de plantas que toleran herbicidas y que pueden ser citadas incluyen variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan con los nombres registrados Roundup Ready® (tolerancia a glyphosate, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia a phosphinotricin, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia a imidazolinonas) y STS® (tolerancia a sulfonilureas, por ejemplo maíz). Como plantas resistentes a herbicidas (plantas reproducidas de manera convencional para adquirir tolerancia a herbicidas) se pueden mencionar las variedades comercializadas con el nombre Clearfield® (por ejemplo, maíz). Como es lógico, todo lo anteriormente indicado es válido también para variedades de plantas que tienen estos

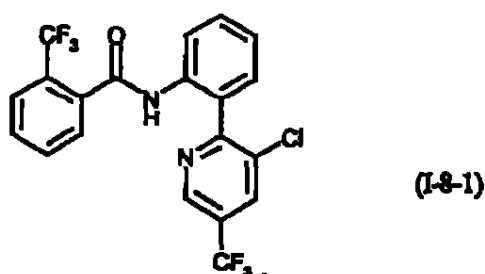
rasgos genéticos desarrollados o que están por desarrollar, cuyas plantas se obtendrán y/o comercializarán en el futuro.

Las plantas indicadas pueden ser tratadas de acuerdo con la invención de un modo particularmente ventajoso con los compuestos de fórmula general (I) o con las mezclas de compuestos activos según la invención. Los rangos preferidos establecidos anteriormente para los compuestos activos o para las mezclas de estos últimos son válidos también para el tratamiento de estas plantas. Un énfasis particular merece el tratamiento de plantas con los compuestos o con las mezclas mencionadas de forma concreta en la presente descripción.

En los siguientes ejemplos se ilustra la preparación y uso de los compuestos activos de acuerdo con la invención.

Ejemplos de preparación

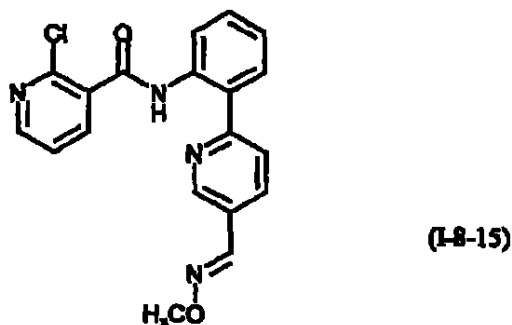
Ejemplo 1



Una solución de 10,0 g (25,6 mmol) de N-(2-yodofenil)-2-(trifluormetil)benzamida, 8,0 g (31,5 mmol) de bis(pinacolato)diboro, 7,4 g (75,4 mmol) de acetato potásico y 0,18 g (0,25 mmol) de cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno paladio (II) en 120 ml de dimetilsulfóxido, se calentó bajo una atmósfera de gas inerte durante 2 horas a 90° C. A temperatura ambiente, se añadieron 6,5 g (25,0 mmol) de 2-bromo-3-cloro-5-(trifluormetil)piridina, 70,0 ml de una solución de carbonato sódico 2 M y 0,18 g (0,25 mmol) de cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno paladio (II). La

mezcla de reacción se calentó durante 16 horas a 90° C. Para la elaboración, la mezcla se vertió en agua, se extrajo con acetato de etilo, se secó sobre sulfato sódico, se filtró y se concentró en vacío. La cromatografía en columna (ciclohexano/acetato de etilo 3:1) proporcionó 1,5 g (3,4 mmol, 13%) de N-{2-[3-cloro-5-(trifluormetil)-2-piridinil]fenil}-2-(trifluormetil)benzamida [$\log P$ (pH 2,3) = 3,58; Compuesto No. I-8-1 de la Tabla 3].

Ejemplo 2

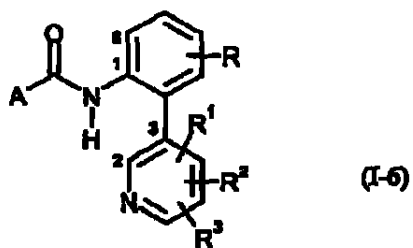


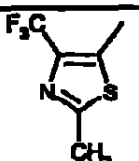
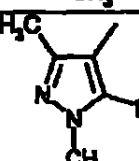
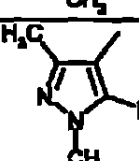
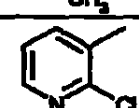
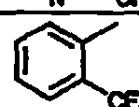
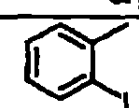
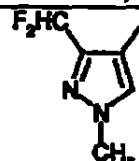
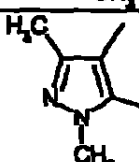
Una mezcla de 0,2 g (0,8 mmol) de (E)-O-metil-oxima de 6-(2-amino-fenil)-piridin-3-carbaldehído (III-2), 0,155 mg (0,88 mmol) de cloruro de 2-cloronicotinilo, 122 mg (0,88 mmol) de carbonato potásico en 20 ml de acetonitrilo, se agitó durante 15 horas a temperatura ambiente. Para la elaboración, la mezcla de reacción se vertió en agua, se extrajo con acetato de etilo, se secó sobre sulfato sódico y se concentró en vacío. El sólido se trituroó con éter de petróleo y se filtró, para proporcionar 150 mg (0,41 mmol, 41 %) de 2-cloro-N-{2-[5-((E)metoxiimino-metil)-piridin-2-i]-fenil}-nicotinamida como un polvo blanco [$\log P$ (pH 2,3) = 2,95; Compuesto No. I-8-15 de la Tabla 3].

Las piridinilanilidas de fórmula (I) indicadas en las siguientes tablas se preparan de manera similar a la descrita en los ejemplos 1 y 2 ofrecidos anteriormente y de acuerdo con las descripciones generales de los procedimientos.

160
156

Table 1



No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP
I-6-1	2-F	H	H	H		2,37
I-6-2	H	H	H	3-CH ₃		2,83
I-6-3	H	H	H	H		2,43
I-6-4	6-Cl	H	H	H		2,00
I-6-5	6-Cl	H	H	H		2,82
I-6-6	6-Cl	H	H	H		2,74
I-6-7	6-Cl	H	H	H		2,10
I-6-8	6-Cl	H	H	H		2,00

167
157

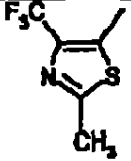
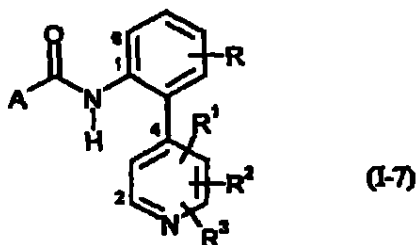
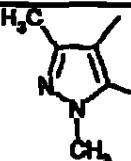
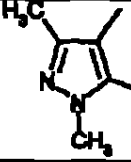
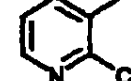
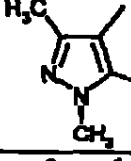
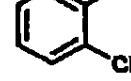
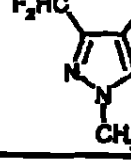
No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP
1-6-9	6-Cl	H	H	H		2,64

Table 2



No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP
1-7-1	H	H	H	4-CF ₃		3,63
1-7-2	H	H	H	H		
1-7-3	2-Br	H	H	H		2,04
1-7-4	2-Br	H	H	H		2,02
1-7-5	2-Br	H	H	H		2,85
1-7-6	2-Br	H	H	H		2,13

-85-

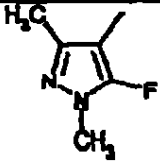
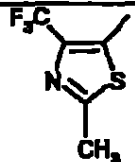
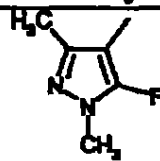
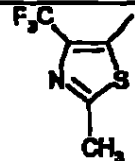
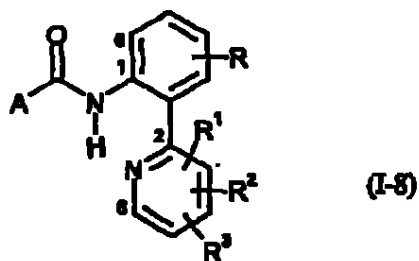
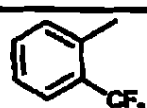
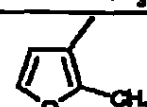
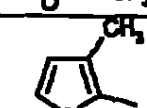
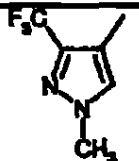
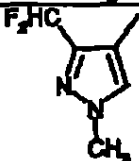
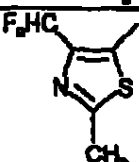
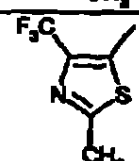
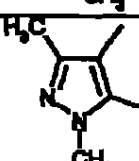
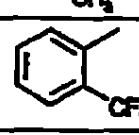
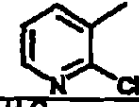
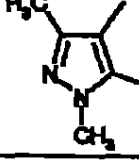
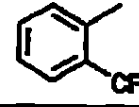
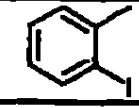
No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP
1-7-7	2-Cl	H	H	H		1,97
1-7-8	2-Cl	H	H	H		2,60
1-7-9	2-Cl	6-Cl	H	H		2,57
1-7-10	2-Cl	6-Cl	H	H		3,27

Tabla 3

No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP p.f./°C
1-8-1	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3,59 139
1-8-2	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3,44
1-8-3	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3,83

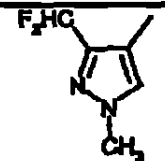
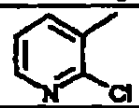
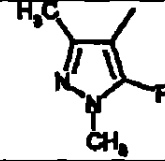
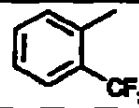
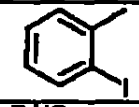
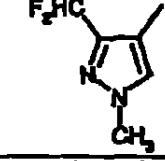
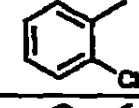
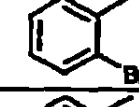
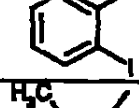
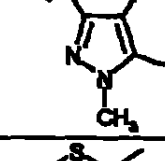
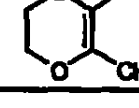
162

159

No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP p.f./°C
I-8-4	4-CH ₃	5-CH=CH-CH=CH-6		H		2.79
I-8-5	4-CH ₃	5-CH=CH-CH=CH-6		H		2.39
I-8-6	4-CH ₃	5-CH=CH-CH=CH-6		H		3.97
I-8-7	H	H	H	5-Cl		3,49
I-8-8	H	H	H	3-CH ₃		2,86
I-8-9	5-CF ₃	H	H	H		4,13
I-8-10	5-Cl	H	H	H		2,95
I-8-11	5-Cl	H	H	H		3,06
I-8-12	5-Cl	H	H	H		4,00
I-8-13	5-Cl	H	H	H		4,13

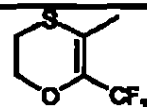
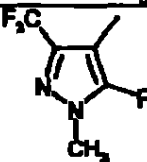
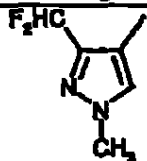
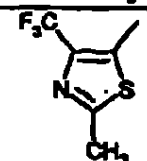
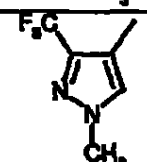
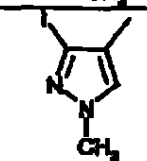
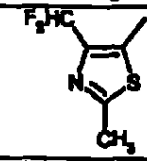
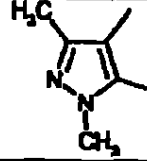
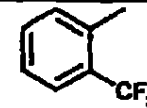
167
160

-87-

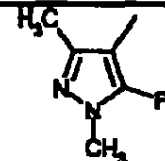
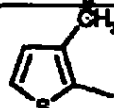
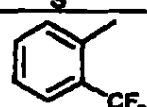
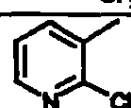
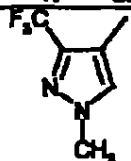
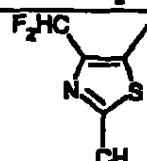
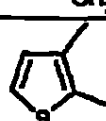
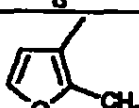
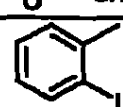
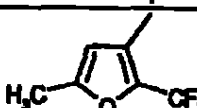
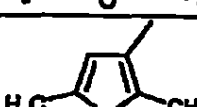
No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP p.f./°C
1-8-14	5-Cl	H	H	H		3,05
1-8-15	5-CH=N-OCH ₃	H	H	H		2,95
1-8-16	5-CH=N-OCH ₃	H	H	H		3,03
1-8-17	5-CH=N-OCH ₃	H	H	H		3,93
1-8-18	5-CH=N-OCH ₃	H	H	H		4,00
1-8-19	5-CH=N-OCH ₃	H	H	H		3,07
1-8-20	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3,45
1-8-21	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3,49
1-8-22	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3,61
1-8-23	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3,04
1-8-24	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3,59

161

161

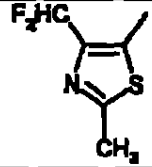
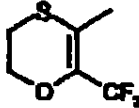
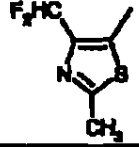
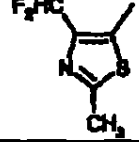
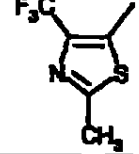
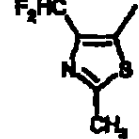
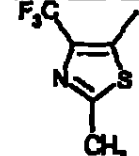
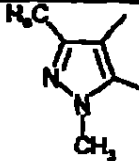
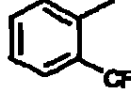
No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP p.f./°C
I-8-25	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3,43
I-8-26	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3,55
I-8-27	3-Cl	5-CF ₃	H	H		2,91
I-8-28	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3,48
I-8-29	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3,13
I-8-30	3-Cl	5-CF ₃	H	H		2,92
I-8-31	3-Cl	5-CF ₃	H	H		3,29
I-8-32	5-CH ₃	H	H	H		1,68
I-8-33	5-CH ₃	H	H	H		2,67

162

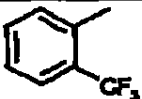
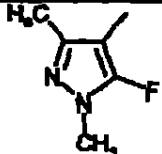
No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP p.f./°C
I-8-34	3-Cl	5-Cl	H	H		2,81
I-8-35	3-Cl	5-Cl	H	H		3,75
I-8-36	3-Cl	5-Cl	H	H		3,40
I-8-37	3-Cl	5-Cl	H	H		2,53
I-8-38	3-Cl	5-Cl	H	H		2,93
I-8-39	5-Br	H	H	H		3,95
I-8-40	5-Br	H	H	H		4,47
I-8-41	3-Cl	5-Cl	H	H		3,30
I-8-42	3-Cl	5-Cl	H	H		3,45
I-8-43	3-Cl	5-Cl	H	H		3,83
I-8-44	3-Cl	5-Cl	H	H		3,75

166

163

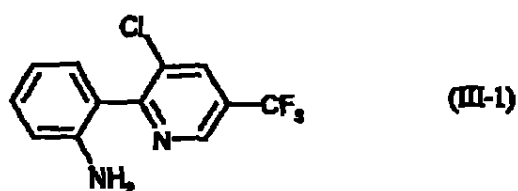
No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP p.f./°C
I-8-45	3-Cl	5-Cl	H	H		3,19
I-8-46	3-Cl	5-Cl	H	H		3,27
I-8-47	5-CH ₃	H	H	H		3,20
I-8-48	3-CH ₃	5-Br	H	H		3,21
I-8-49	3-Cl	5-Br	H	H		3,40
I-8-50	3-Cl	5-Br	H	H		3,27
I-8-51	3-CH ₃	5-Br	H	H		3,30
I-8-52	3-CH ₃	5-Br	H	H		2,71
I-8-53	3-Cl	5-Br	H	H		3,51

~~167~~
164

No.	R ¹	R ²	R ³	R	A	logP p.f./°C
I-8-54	3-CH ₃	5-Br	H	H		3,37
I-8-55	3-Cl	5-Br	H	H		2,94

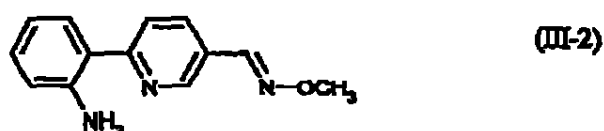
Preparación de materiales de partida de fórmula (III)

Ejemplo (III-1)



Una solución de 0,67 g (3 mmol) de 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)anilina, 0,80 g (3 mmol) de 2-bromo-3-cloro-5-(trifluormetil)piridina y 0,05 g (0,68 mmol) de cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno paladio (II) en 15 ml de dimetilsulfóxido y 9 ml de una solución de carbonato sódico 2 M, se calentó bajo una atmósfera inerte durante 16 horas. Para la elaboración, la mezcla de reacción se vertió en agua, se extrajo con acetato de etilo, se secó sobre sulfato sódico y se concentró en vacío. La purificación por cromatografía en columna proporcionó 0,79 g (2,9 mmol, 95%) de 2-[3-cloro-5-(trifluormetil)-2-piridinil]anilina [logP (pH 2,3) = 2,79].

Ejemplo (III-2)



Una mezcla de 2,852 g (13 mmol) de 2-yodoanilina, 4,298 g (17 mmol) de bis(pinacolato)diboro, 3,834 g (39 mmol) de acetato potásico y 24 mg (0,065 mmol) de

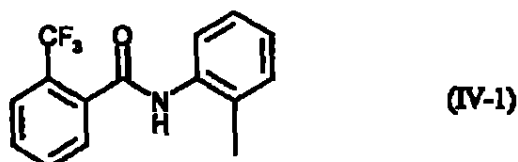
168
165

-92-

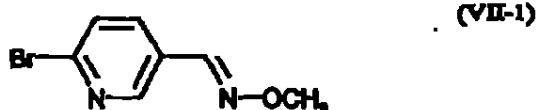
cloruro de bis(difenilfosfino)ferroceno paladio (II), se agitó en 200 ml de dimetilformamida a 80° C bajo argón. Después de 4 horas, se añadieron 7 g (33 mmol) de (E)-O-metil-oxima de 6-bromo-piridin-3-carbaldehído (VII-1), 8,28 g (78 mmol) de carbonato sódico, 100 ml de agua y otros 24 mg (0,065 mmol) de cloruro de bis(difenilfosfino)ferroceno paladio (II) y la mezcla se agitó durante 12 horas a 80° C. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, se vertió en agua, se extrajo con acetato de etilo, se secó sobre sulfato sódico y se concentró bajo vacío. La purificación por cromatografía en columna proporcionó 0,9 g (4,2 mmol, 32%) de 6-(2-amino-fenil)-piridin-3-carbaldehído (E)-O-metil-oxima [$\log P$ (pH 2,3) = 1,59].

Preparación de materiales de partida de fórmula (IV)

Ejemplo (IV-1)



A una solución de 13,1 g (0,06 mol) de o-yodoanilina y 12,1 g (0,12 mol) de trietilamina en 250 ml de tetrahidrofurano se añadió una solución de 15,0 g (0,07 mol) de cloruro de ácido o-trifluorometilbenzoico en 250 ml de tetrahidrofurano a 0° C. La mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos a 0° C y durante 16 horas a temperatura ambiente. La concentración den vacío y la cromatografía en columna (acetato de etilo) proporcionó 23 g (0,06 mmol, 96%) de N-(2-yodofenil)-2-(trifluorometil)benzamida [$\log P$ (pH 2,3) = 2,98].

Preparación de materiales de partida de fórmula (VII)**Ejemplo (VII-1)**

Se disolvieron 10 g de 2-bromopiridin-5-carboxaldehído (54 mmol) y 5,84 g (70 mmol) de hidrocloreto de O-metilhidroxilamina en 100 ml de metanol y 50 ml de agua. La mezcla se agitó durante 20 horas a temperatura ambiente. Se evaporó entonces el metanol bajo presión reducida, se añadió agua al residuo sólido, tras lo cual se filtró para proporcionar 7 g (32 mmol) de 6-bromo-piridin-3-carbaldehído (E)-O-metil-oxima [$\log P$ (pH 2,3) = 2,16].

Los valores $\log P$ proporcionados en los Ejemplos de Preparación fueron determinados de acuerdo con la Directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Resolución) empleando una columna de fase invertida (C 18). Temperatura: 43° C.

Fases móviles para la determinación en el intervalo ácido: 0,1% de ácido fosfórico acuoso, acetonitrilo; gradiente lineal desde 10% de acetonitrilo a 90% de acetonitrilo.

La calibración se realizó empleando alcan-2-onas de cadena lineal (que tienen de 3 a 16 átomos de carbono) con valores $\log P$ conocidos (determinación de los valores $\log P$ por los tiempos de retención empleando interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los valores $\lambda_{\max}$ se determinaron en los máximos de las señales cromatográficas empleando los espectros UV desde 200 nm a 400 nm.

167

Ejemplos de uso

Ejemplo A

Ensayo con *Podosphaera* (manzano)/protector

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

Para obtener un preparado adecuado de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para el ensayo respecto a la actividad protectora, se pulverizan plantas jóvenes con el preparado de compuesto activo en la proporción de aplicación indicada. Una vez que se ha secado el revestimiento pulverizado, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de esporas del patógeno del mildew del manzano *Podosphaera leucotricha*. Las plantas se colocan entonces en un invernadero a 23° C aproximadamente y una humedad atmosférica relativa de alrededor del 70%.

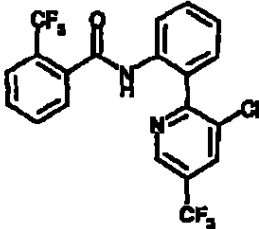
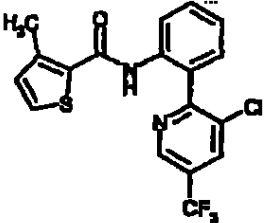
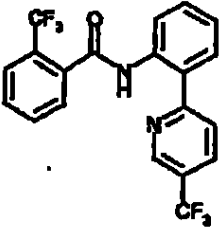
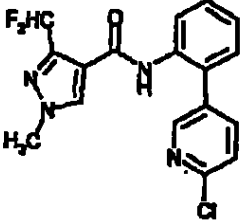
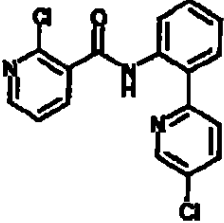
La evaluación se efectúa 10 días después de la inoculación. 0% representa una eficacia que corresponde a la del control, mientras que una eficacia de 100% significa que no se observó infección alguna.

Los compuestos activos, las proporciones de aplicación y los resultados del ensayo se muestran en la siguiente tabla.

170
168

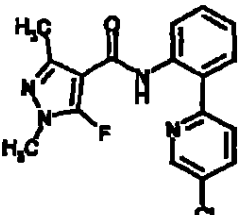
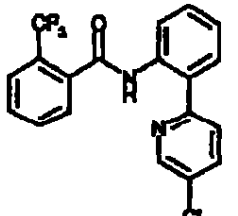
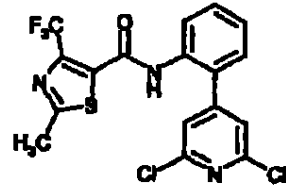
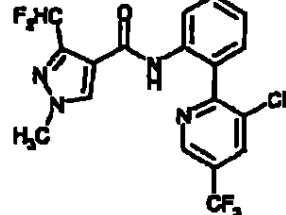
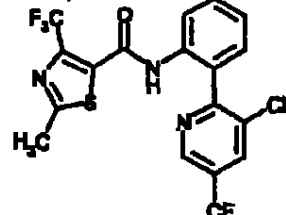
Tabla A

Ensayo con *Podosphaera* (manzano)/protector

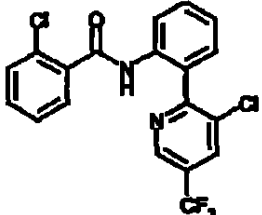
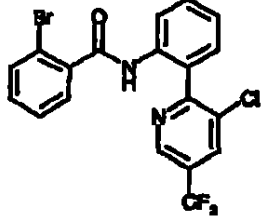
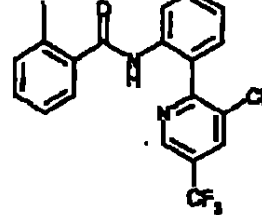
Compuesto activo según la invención	Proporción de aplicación de compuesto activo en g/ha	Eficacia en %
 (I-8-1)	100	100
 (I-8-3)	100	100
 (I-8-9)	100	97
 (I-6-7)	100	98
 (I-8-10)	100	100

171
169

Ensayo con Podosphaera (manzano)/protector

Compuesto activo según la invención	Proporción de aplicación de compuesto activo en g/ha	Eficacia en %
 (1-8-11)	100	95
 (1-8-12)	100	92
 (1-7-10)	100	100
 (1-8-27)	100	97
 (1-8-28)	100	96

127
170

Ensayo con Podosphaera (manzano)/protector		
Compuesto activo según la invención	Proporción de aplicación de compuesto activo en g/ha	Eficacia en %
 (1-8-20)	100	100
 (1-8-21)	100	100
 (1-8-22)	100	100

Ejemplo B

Ensayo con Venturia (manzano)/protector

Disolvente: 24,5 partes en peso de acetona
 24,5 partes en peso de dimetilacetamida

Emulsionante: 1,0 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para obtener un preparado adecuado de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo con las cantidades indicadas de disolventes y emulsionante y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para el ensayo respecto a la actividad protectora, se pulverizan plantas jóvenes con el preparado de compuesto activo en la proporción de aplicación establecida. Una

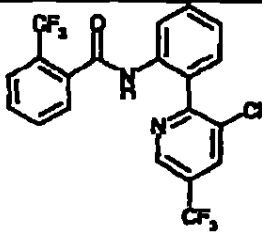
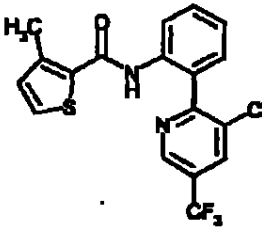
vez que se ha secado el revestimiento pulverizado, las plantas se inoculan con una suspensión acuosa de conidios del patógeno de la costra del manzano *Venturia inaequalis* y se dejan entonces en un armario de incubación a 20° C aproximadamente y una humedad atmosférica relativa del 100% durante 1 día.

Las plantas se colocan entonces en un invernadero a 21° C aproximadamente y una humedad atmosférica relativa de alrededor del 90%.

La evaluación se efectúa 10 días después de la inoculación. 0% representa una eficacia que corresponde a la del control, mientras que una eficacia de 100% significa que no se observó infección alguna.

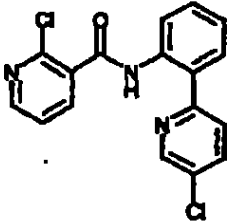
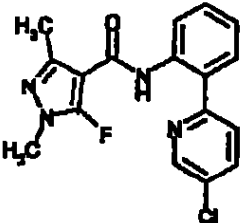
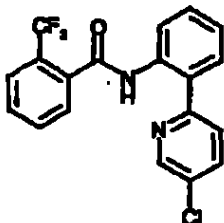
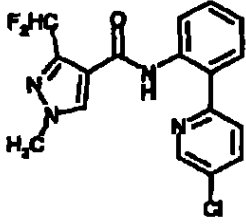
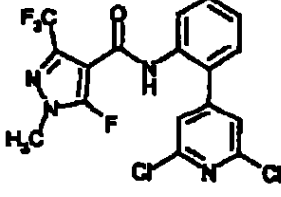
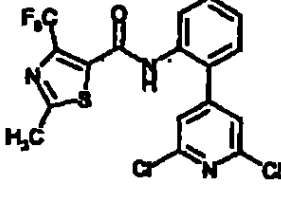
Los compuestos activos, proporciones de aplicación y resultados del ensayo se muestran en la siguiente tabla.

Tabla B
Ensayo con *Venturia* (manzano)/protector

Compuesto activo según la invención	Proporción de aplicación de compuesto activo en g/ha	Eficacia en %
 (I-8-1)	100	100
 (I-8-3)	100	100

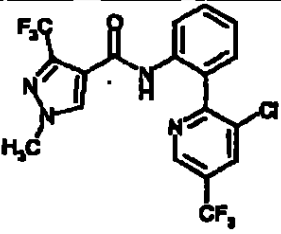
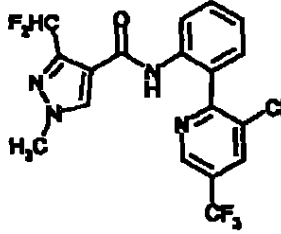
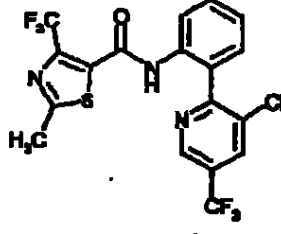
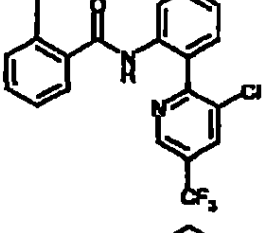
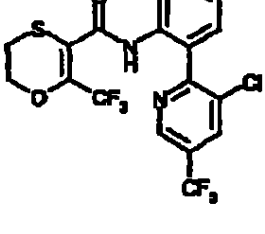
172

Ensayo con Venturia (manzano)/protector

Compuesto activo según la invención	Proporción de aplicación de compuesto activo en g/ha	Eficacia en %
 (I-8-10)	100	100
 (I-8-11)	100	100
 (I-8-12)	100	100
 (I-8-14)	100	100
 (I-7-9)	100	100
 (I-7-10)	100	100

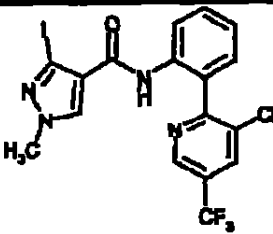
173

Ensayo con Venturia (manzano)/protector

Compuesto activo según la invención	Proporción de aplicación de compuesto activo en g/ha	Eficacia en %
 (I-8-29)	100	98
 (I-8-27)	100	100
 (I-8-28)	100	98
 (I-8-22)	100	99
 (I-8-25)	100	99

176
174

Ensayo con *Venturia* (manzano)/protector

Compuesto activo según la invención	Proporción de aplicación de compuesto activo en g/ha	Eficacia en %
 (I-8-30)	100	92

Ejemplo C

Ensayo con *Alternaria* (tomate)/protector

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

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para obtener un preparado adecuado de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

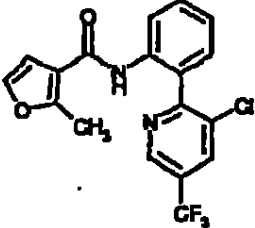
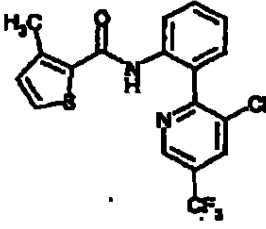
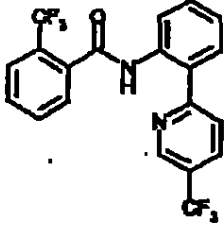
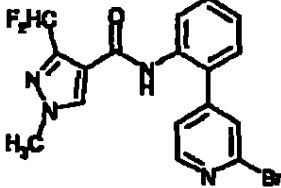
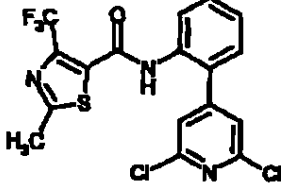
Para el ensayo respecto a la actividad protectora, se pulverizan plantas jóvenes de tomate con el preparado de compuesto activo en la proporción de aplicación establecida. Transcurrido un día desde el tratamiento, las plantas se inoculan con una suspensión de esporas de *Alternaria solani* y luego se dejan a una humedad relativa del 100% y 20° C durante 24 horas. Las plantas se dejan entonces a una humedad atmosférica relativa del 96% y una temperatura de 20° C.

La evaluación se efectúa 7 días después de la inoculación. 0% representa una eficacia que corresponde a la del control, mientras que una eficacia de 100% significa que no se observó infección alguna.

Los compuestos activos, proporciones de aplicación y resultados del ensayo se muestran en la siguiente tabla.

175

Tabla C
Ensayo con Alternaria (tomate)/protector

Compuesto activo según la invención	Proporción de aplicación de compuesto activo en g/ha	Eficacia en %
 (1-8-2)	750	100
 (1-8-3)	750	95
 (1-8-9)	750	95
 (1-7-6)	750	95
 (1-7-10)	750	100

~~178~~
176

Ejemplo D

Ensayo con *Pyrenophora teres* (cebada)/protector

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

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilariipoliglicoléter

Para obtener un preparado adecuado de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo con las cantidades indicadas de disolventes y emulsionante y el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para el ensayo respecto a la actividad protectora, se pulverizan plantas jóvenes con el preparado de compuesto activo en la proporción de aplicación establecida. Una vez que se ha secado el revestimiento pulverizado, las plantas se inoculan con una suspensión de conidios de *Pyrenophora teres* y se dejan entonces en un armario de incubación a 20° C aproximadamente y una humedad atmosférica relativa del 100% durante 48 horas.

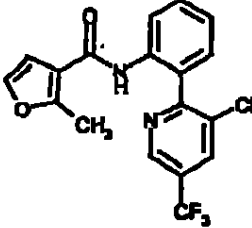
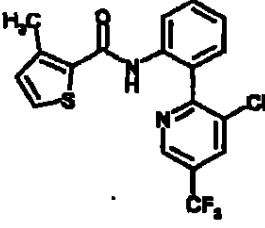
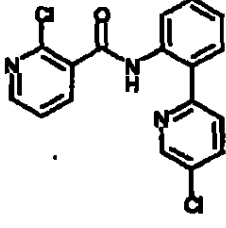
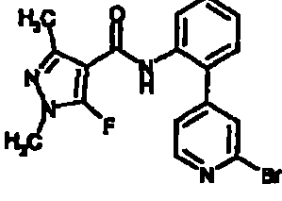
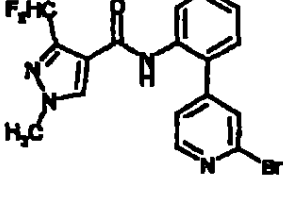
Las plantas se colocan entonces en un invernadero a 20° C aproximadamente y una humedad atmosférica relativa de alrededor del 80%.

La evaluación se efectúa 10 días después de la inoculación. 0% representa una eficacia que corresponde a la del control, mientras que una eficacia de 100% significa que no se observó infección alguna.

Los compuestos activos, proporciones de aplicación y resultados del ensayo se muestran en la siguiente tabla.

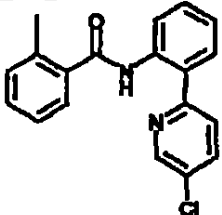
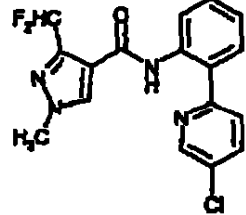
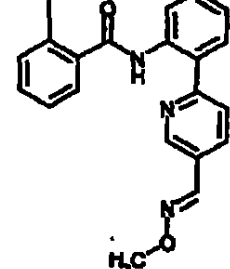
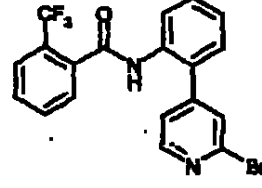
199
177

Tabla D
Ensayo con *Pyrenophora teres* (cebada)/protector

Compuesto activo según la invención	Proporción de aplicación de compuesto activo en g/ha	Eficacia en %
 (I-8-2)	500	100
 (I-8-3)	500	100
 (I-8-10)	500	100
 (I-7-4)	500	93
 (I-7-6)	500	93

280
178

Ensayo con *Pyrenophora teres* (cebada)/protector

Compuesto activo según la invención	Proporción de aplicación de compuesto activo en g/ha	Eficacia en %
 (I-8-13)	500	94
 (I-8-14)	500	94
 (I-8-18)	500	94
 (I-7-5)	500	93

Ejemplo E

Ensayo con *Puccinia* (trigo)/protector

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

Emulsionante: 1 parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para obtener un preparado adecuado de compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso de compuesto activo con las cantidades indicadas de disolventes y emulsionante y

187
179

el concentrado se diluye con agua a la concentración deseada.

Para el ensayo respecto a la actividad protectora, se pulverizan plantas jóvenes con el preparado de compuesto activo en la proporción de aplicación establecida. Una vez que se ha secado el revestimiento pulverizado, las plantas se inoculan con una suspensión de conidios de *Puccinia recondita* y se dejan entonces en un armario de incubación a 20° C aproximadamente y una humedad atmosférica relativa del 100% durante 48 horas.

Las plantas se colocan entonces en un invernadero a 20° C aproximadamente y una humedad atmosférica relativa de alrededor del 80% para promover el desarrollo de pústulas de tizón.

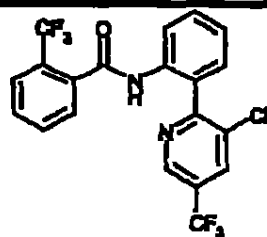
La evaluación se efectúa 10 días después de la inoculación. 0% representa una eficacia que corresponde a la del control, mientras que una eficacia de 100% significa que no se observó infección alguna.

Los compuestos activos, proporciones de aplicación y resultados del ensayo se muestran en la siguiente tabla.

Tabla E

Ensayo con *Puccinia* (trigo)/protector

Compuesto activo según la invención	Proporción de aplicación de compuesto activo en g/ha	Eficacia en %
-------------------------------------	--	---------------



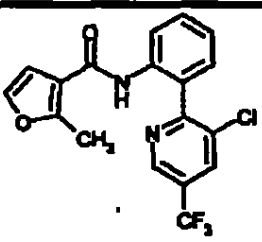
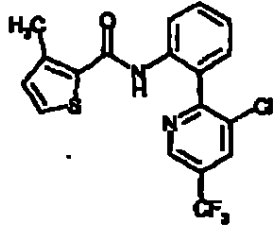
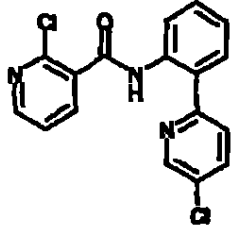
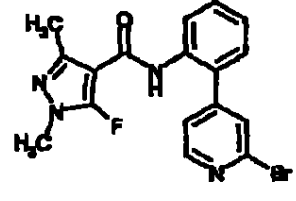
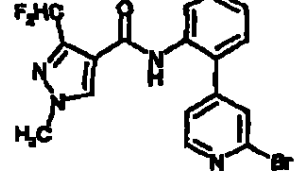
(1-8-1)

500

100

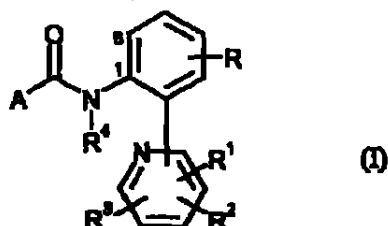
182
186

Ensayo con Puccinia (trigo)/protector

Compuesto activo según la invención	Proporción de aplicación de compuesto activo en g/ha	Eficacia en %
 (I-8-2)	500	100
 (I-8-3)	500	100
 (I-8-10)	500	94
 (I-7-4)	500	100
 (I-7-6)	500	100

REIVINDICACIONES

1.- Piridinilanilidas de fórmula (I)



en donde

R representa hidrógeno, fluor, cloro, metilo o trifluormetilo;

R¹, R² y R³ independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo;

o representan en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 8 átomos de carbono en la respectiva mitad alquilo;

o representan en cada caso alquenilo de cadena lineal o ramificada o alqueniloxi que tienen, en cada caso, de 2 a 6 átomos de carbono;

o representan en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso haloalquenilo de cadena lineal o ramificada o haloalqueniloxi que tienen en cada caso de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 11 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada,

184
182

dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada, alquenilcarbonilo o alquinilcarbonilo que tienen de 2 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;

o representan cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;

o representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C_3-C_6 y

Q^2 representa hidroxilo, amino, metilamino, fenilo, bencilo; o representa alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_1-C_4)amino o fenilo; o representa alquenil(C_2-C_4)oxi o alquinil(C_2-C_4)oxi,

representa fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoileténilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquiloxi, fenilalquiltio o heterocicilalquilo que tienen en cada caso de 1 a 3 átomos de carbono en las respectivas mitades alquilo, cada uno de los cuales está opcionalmente mono- a tri-sustituido, de forma idéntica o diferente, en la mitad del anillo por halógeno, en cada caso alquilo C_1-C_4 y alcoxi C_1-C_4 de cadena lineal o ramificada;

o

R^2 y R^3 , si están unidos a la mitad piridinilo en posición orto entre sí, representan además juntos alquilenos C_3-C_4 , alquenilenos C_3-C_4 , oxialquilenos C_2-C_3 o

185
183

dioxialquilenos C_1-C_2 , en cada caso opcionalmente mono- a tetra-sustituídos, de forma idéntica o diferente, por fluor, cloro, oxo, metilo, etilo, trifluormetilo;

R^4 representa hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alquil(C_1-C_6)sulfinilo, alquil(C_1-C_6)sulfonilo, alcoxi(C_1-C_4)-alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_8 ; haloalquilo C_1-C_6 , haloalquil(C_1-C_4)tio, haloalquil(C_1-C_4)sulfinilo, haloalquil(C_1-C_4)sulfonilo, haloalcoxi(C_1-C_4)-alquilo C_1-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_8 que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo; formilalquilo C_1-C_3 , alquil(C_1-C_3)carbonil-alquilo C_1-C_3 , alcoxi(C_1-C_3)carbonil-alquilo C_1-C_3 ; haloalquil(C_1-C_3)carbonil-alquilo C_1-C_3 , haloalcoxi(C_1-C_3)carbonil-alquilo C_1-C_3 que tienen en cada caso de 1 a 7 átomos de fluor, cloro y/o bromo, alquil(C_1-C_3)carbonil-haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi(C_1-C_3)carbonil-haloalquilo C_1-C_3 que tienen en cada caso de 1 a 6 átomos de fluor, cloro y/o bromo, haloalquil(C_1-C_3)carbonil-haloalquilo C_1-C_3 , haloalcoxi(C_1-C_3)carbonil-haloalquilo C_1-C_3 que tienen en cada caso de 1 a 13 átomos de fluor, cloro y/o bromo; $-COR^5$, $-CONR^6R^7$ o $-CH_2NR^8R^9$;

R^5 representa hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alcoxi C_1-C_8 , alcoxi(C_1-C_4)-alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_8 ; haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi(C_1-C_4)-alquilo C_1-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_8 que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo; o $-COR^{10}$,

R^6 y R^7 independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, alquilo C_1-C_8 , alcoxi(C_1-C_4)-alquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_8 ; haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi(C_1-C_4)-alquilo C_1-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_8 que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

R^6 y R^7 además junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, representan un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, cuyo heterociclo puede tener 1 o 2

heteroátomos adicionales no adyacentes seleccionados del grupo consistente en oxígeno, azufre y NR^{11} , y cuyo heterociclo puede estar opcionalmente mono- a poli-sustituido, de forma idéntica o diferente, por halógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$,

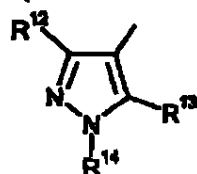
R^8 y R^9 independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_8$; haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$, halocicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_8$ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

R^8 y R^9 además junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, representan un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, cuyo heterociclo puede tener 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes seleccionados del grupo consistente en oxígeno, azufre y NR^{11} , y cuyo heterociclo puede estar opcionalmente mono- a poli-sustituido, de forma idéntica o diferente, por halógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$,

R^{10} representa hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_8$, alcoxi($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_8$; haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_8$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_8$, haloalcoxi($\text{C}_1\text{-C}_4$)-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, halocicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_8$ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

R^{11} representa hidrógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$,

A representa un radical de fórmula (A1)



(A1)

, en donde

R^{12} representa hidrógeno, ciano, halógeno, nitro, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, alquil($\text{C}_1\text{-C}_4$)tio, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ o haloalquil($\text{C}_1\text{-C}_4$)tio teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno, aminocarbonilo o aminocarbonil-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ y

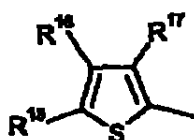
R^{13} representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$ o

alquil(C₁-C₄)tio y

R¹⁴ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil(C₁-C₄)tio-alquilo C₁-C₄, alcoxi(C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, haloalquil(C₁-C₄)tio-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi(C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄ teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno, o fenilo,

o

A representa un radical de fórmula (A2)



(A2),

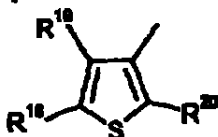
en donde

R¹⁵ y R¹⁶ independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

R¹⁷ representa halógeno, ciano o alquilo C₁-C₄, o haloalquilo C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄ teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A3)



(A3),

en donde

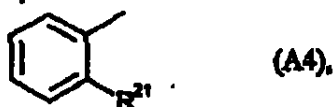
R¹⁸ y R¹⁹ independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

R²⁰ representa hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄, o haloalquilo C₁-C₄ que

tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A4)

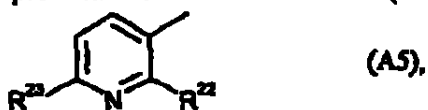


en donde

R^{21} representa hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 o haloalquil(C_1-C_4)tio teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A5)



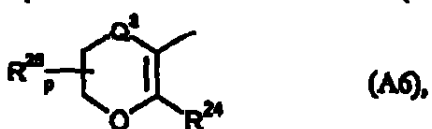
en donde

R^{22} representa halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, haloalquilo C_1-C_4 , haloalquil(C_1-C_4)tio o haloalcoxi C_1-C_4 teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno, y

R^{23} representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, haloalquilo C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno, alquil(C_1-C_4)sulfinilo o alquil(C_1-C_4)sulfonilo,

o

A representa un radical de fórmula (A6)



en donde

R^{24} representa alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de

184
187

halógeno, y

R^{25} representa alquilo C_1-C_4 ,

Q^3 representa un átomo de azufre u oxígeno, representa SO , SO_2 o CH_2 ,

p representa 0, 1 o 2, en donde R^{25} representa radicales idénticos o diferentes en el caso de que p represente 2,

o

A representa un radical de fórmula (A7)



en donde

R^{26} representa alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A8)

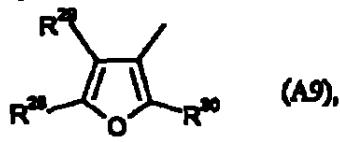


en donde

R^{27} representa alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A9)



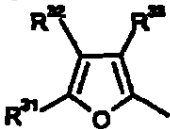
en donde

R^{28} y R^{29} independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno, amino, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

R³⁰ representa hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A10)



(A10),

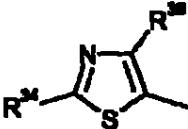
en donde

R³¹ y R³² independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno, amino, nitro, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

R³³ representa hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A11)



(A11),

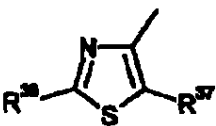
en donde

R³⁴ representa hidrógeno, halógeno, amino, alquil(C₁-C₄)amino, dialquil(C₁-C₄)amino, ciano, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

R³⁵ representa halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A12)



(A12),

en donde

R^{36} representa hidrógeno, halógeno, amino, alquil(C₁-C₄)amino, dialquil(C₁-C₄)amino, ciano, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

R^{37} representa halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A13)



R^{38} representa halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A14)

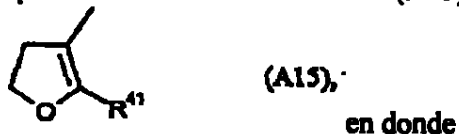


R^{39} representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄ y

R^{40} representa halógeno o alquilo C₁-C₄,

o

A representa un radical de fórmula (A15)

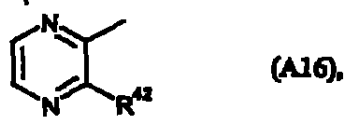


R^{41} representa alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

142
190

A representa un radical de fórmula (A16)

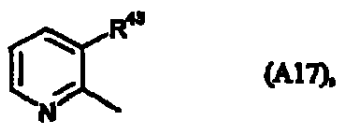


en donde

R⁴² representa hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A17)



en donde

R⁴³ representa halógeno, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil(C₁-C₄)tio, haloalquilo C₁-C₄, haloalquil(C₁-C₄)tio o haloalcoxi C₁-C₄ teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de halógeno,

quedando excluidos los compuestos de fórmula (I) en donde

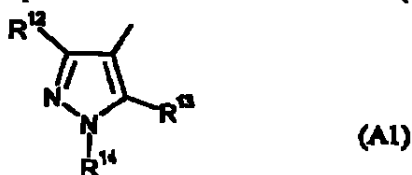
R representa hidrógeno y

R¹, R² y R³ independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno; o alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono; o haloalquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono; y

R⁴ representa hidrógeno

y

A representa un radical de fórmula (A1)



, en donde

143
191

-118-

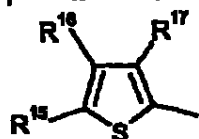
R^{12} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 y

R^{13} representa hidrógeno y

R^{14} representa metilo

o

A representa un radical de fórmula (A2)



(A2),

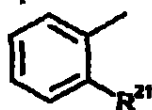
en donde

R^{15} y R^{16} independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno o alquilo C_1-C_4 y

R^{17} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ,

o

A representa un radical de fórmula (A4)



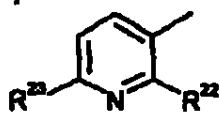
(A4),

en donde

R^{21} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ,

o

A representa un radical de fórmula (A5)



(A5),

en donde

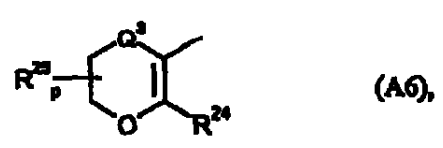
R^{22} representa halógeno y

R^{23} representa hidrógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A6)

194
192



en donde

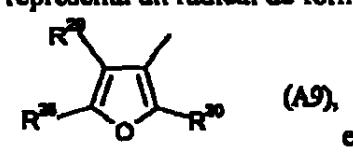
R^{24} representa metilo y

Q^3 representa azufre o CH_2 ,

p representa 0,

o

A representa un radical de fórmula (A9)



en donde

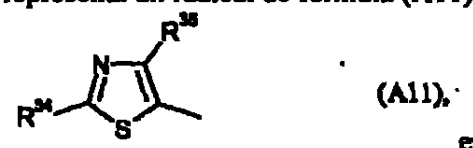
R^{28} y R^{29} independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno o

alquilo C_1-C_4 y

R^{30} representa metilo,

o

A representa un radical de fórmula (A11)



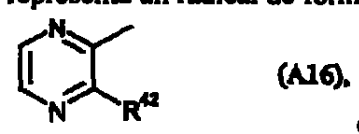
en donde

R^{34} representa hidrógeno o alquilo C_1-C_4 y

R^{35} representa halógeno, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ,

o

A representa un radical de fórmula (A16)



en donde

R^{42} representa halógeno.

2.- Piridinilanilidas de fórmula (I) según la reivindicación 1, en donde

R representa hidrógeno, fluor, cloro, metilo o trifluormetilo;

R¹, R² y R³ independientemente entre sí cada uno de ellos representan hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo;

o representan en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen en cada caso de 1 a 6 átomos de carbono;

o representan en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen en cada caso de 1 a 4 átomos de carbono y de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilaquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi que tienen de 1 a 4 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;

o representan cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;

o representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q¹ representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C₃-C₆ y

Q² representa hidroxilo, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄ teniendo cada uno de ellos de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes.

R² y R³, si están unidos a la mitad piridinilo en posición orto entre sí, juntos representan

$-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_4-$, $-CH=CH-CH=CH-$, $-O(CH_2)_2-$, $-O(CH_2)_3-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$, en cada caso opcionalmente mono- a tetra-sustituídos, de forma idéntica o diferente, por fluor, cloro, oxo, metilo, etilo, trifluormetilo,

R^4 representa hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquil(C_1-C_4)sulfinilo, alquil(C_1-C_4)sulfonilo, alcoxi(C_1-C_3)-alquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 ; haloalquilo C_1-C_4 , haloalquil(C_1-C_4)tio, haloalquil(C_1-C_4)sulfinilo, haloalquil(C_1-C_4)sulfonilo, haloalcoxi(C_1-C_3)-alquilo C_1-C_3 , halocicloalquilo C_3-C_6 que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo; formilalquilo C_1-C_3 , alquil(C_1-C_3)carbonil-alquilo C_1-C_3 , alcoxi(C_1-C_3)carbonil-alquilo C_1-C_3 ; haloalquil(C_1-C_3)carbonil-alquilo C_1-C_3 , haloalcoxi(C_1-C_3)carbonil-alquilo C_1-C_3 que tienen en cada caso de 1 a 7 átomos de fluor, cloro y/o bromo, alquil(C_1-C_3)carbonil-haloalquilo C_1-C_3 , alcoxi(C_1-C_3)carbonil-haloalquilo C_1-C_3 que tienen en cada caso de 1 a 6 átomos de fluor, cloro y/o bromo, haloalquil(C_1-C_3)carbonil-haloalquil C_1-C_3 , haloalcoxi(C_1-C_3)carbonil-haloalquilo C_1-C_3 que tienen en cada caso de 1 a 13 átomos de fluor, cloro y/o bromo; $-COR^5$, $-CONR^6R^7$ o $-CH_2NR^8R^9$,

R^5 representa hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_4 , alcoxi(C_1-C_3)-alquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 ; haloalquilo C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi(C_1-C_3)-alquilo C_1-C_3 , halocicloalquilo C_3-C_6 que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo; o $-COR^{10}$,

R^6 y R^7 independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alcoxi(C_1-C_3)-alquilo C_1-C_3 , cicloalquilo C_3-C_6 ; haloalquilo C_1-C_4 , haloalcoxi(C_1-C_3)-alquilo C_1-C_3 , halocicloalquilo C_3-C_6 que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

R^6 y R^7 además junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, representan un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, cuyo heterociclo puede tener 1 o 2

199
195

heteroátomos adicionales no adyacentes seleccionados del grupo consistente en oxígeno, azufre y NR^{11} , y cuyo heterociclo puede estar opcionalmente mono- a tetra-sustituido, de forma idéntica o diferente, por halógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$,

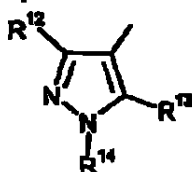
R^8 y R^9 independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$; haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, halocicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

R^8 y R^9 además junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, representan un heterociclo saturado de 5 a 8 miembros, cuyo heterociclo puede tener 1 o 2 heteroátomos adicionales no adyacentes seleccionados del grupo consistente en oxígeno, azufre y NR^{11} , y cuyo heterociclo puede estar opcionalmente mono- a tetra-sustituido, de forma idéntica o diferente, por halógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$,

R^{10} representa hidrógeno, alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, alcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, alcoxi($\text{C}_1\text{-C}_3$)-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, cicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$; haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_4$, haloalcoxi($\text{C}_1\text{-C}_3$)-alquilo $\text{C}_1\text{-C}_3$, halocicloalquilo $\text{C}_3\text{-C}_6$ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

R^{11} representa hidrógeno o alquilo $\text{C}_1\text{-C}_4$,

A representa un radical de fórmula (A1)



(A1)

, en donde

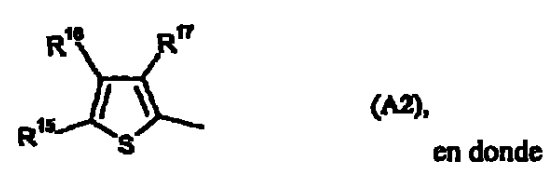
R^{12} representa hidrógeno, ciano, fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, isopropilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, ciclopropilo, haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_2$, haloalcoxi $\text{C}_1\text{-C}_2$ teniendo cada uno de ellos de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo, trifluormetiltio, difluormetiltio, aminocarbonilo, aminocarbonilmetilo o aminocarboniletilo,

R^{13} representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio o etiltio,

R^{14} representa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, haloalquilo C_1-C_2 que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo, hidroximetilo, hidroxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo o fenilo,

o

A representa un radical de fórmula (A2)

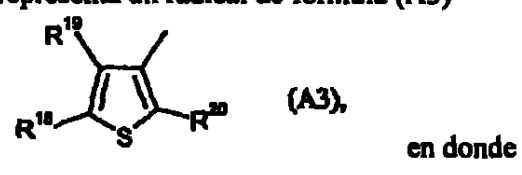


R^{15} y R^{16} independientemente entre sí cada uno representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C_1-C_2 que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo y

R^{17} representa fluor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, haloalquilo C_1-C_2 o haloalcoxi C_1-C_2 cada uno de ellos con 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

o

A representa un radical de fórmula (A3)

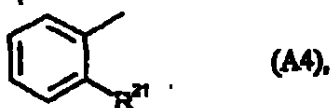


R^{18} y R^{19} independientemente entre sí cada uno representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C_1-C_2 que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo y

R^{20} representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C_1-C_2 que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

o

A representa un radical de fórmula (A4)

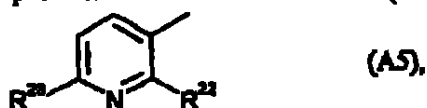


en donde

R²¹ representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₂, haloalcoxi C₁-C₂ o haloalquil(C₁-C₂)tio cada uno de ellos con 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

o

A representa un radical de fórmula (A5)



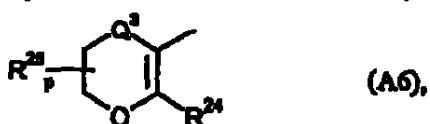
en donde

R²² representa fluor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, alquilo C₁-C₄, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluormetiltio, trifluormetiltio, haloalquilo C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂ cada uno de ellos con 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo y

R²³ representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, ciano, alquilo C₁-C₄, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, haloalquilo C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂ cada uno de ellos con 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo, alquil(C₁-C₂)sulfinilo o alquil(C₁-C₂)sulfonilo,

o

A representa un radical de fórmula (A6)



en donde

R²⁴ representa metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo y

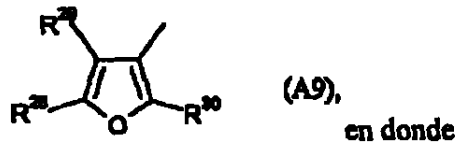
R^{25} representa metilo o etilo,

Q^3 representa un átomo de azufre, SO_2 o CH_3 ,

p representa 0 o 1,

o

A representa un radical de fórmula (A9)



R^{28} y R^{29} independientemente entre sí cada uno representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, amino, metilo, etilo o haloalquilo C_1-C_2 que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo y

R^{30} representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo o haloalquilo C_1-C_2 que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

o

A representa un radical de fórmula (A10)



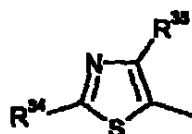
R^{31} y R^{32} independientemente entre sí cada uno representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, amino, nitro, metilo, etilo o haloalquilo C_1-C_2 que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo y

R^{33} representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C_1-C_2 que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

o

A representa un radical de fórmula (A11)

-126-



(A11),

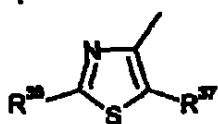
en donde

R^{34} representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, amino, alquil(C₁-C₄)amino, dialquil(C₁-C₄)amino, ciano, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo y

R^{35} representa fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

o

A representa un radical de fórmula (A12)



(A12),

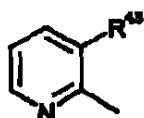
en donde

R^{36} representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, amino, alquil(C₁-C₄)amino, dialquil(C₁-C₄)amino, ciano, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo y

R^{37} representa fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂ que tiene de 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

o

A representa un radical de fórmula (A17)



(A17),

en donde

R^{43} representa fluor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, alquilo C₁-C₄, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluormetiltio, trifluormetiltio, haloalquilo C₁-C₂ o haloalcoxi C₁-C₂ cada uno con 1 a 5 átomos de fluor, cloro y/o bromo,

quedando excluidos los compuestos de fórmula (I) en donde

201
205

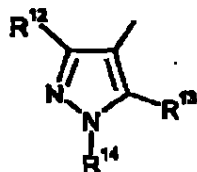
R representa hidrógeno y

R¹, R² y R³ independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, halógeno; o alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono; o haloalquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono; y

R⁴ representa hidrógeno

y

A representa un radical de fórmula (A1)



(A1)

, en donde

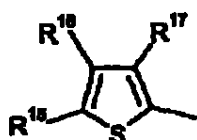
R¹² representa fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, isopropilo, haloalquilo C₁-C₂ y

R¹³ representa hidrógeno y

R¹⁴ representa metilo,

o

A representa un radical de fórmula (A2)



(A2),

en donde

R¹⁵ y R¹⁶ independientemente entre sí cada uno representa hidrógeno, metilo o etilo y

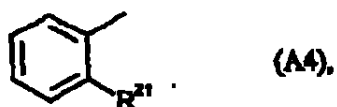
R¹⁷ representa fluor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo o haloalquilo C₁-C₂,

o

A representa un radical de fórmula (A4)

207
201

-128-

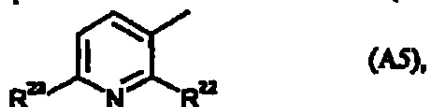


en donde

R^{21} representa fluor, cloro, bromo, yodo, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_2 ,

o

A representa un radical de fórmula (A5)



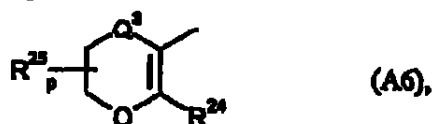
en donde

R^{22} representa fluor, cloro, bromo, yodo y

R^{23} representa hidrógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A6)



en donde

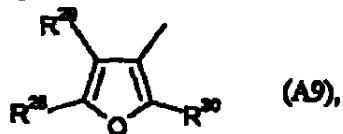
R^{24} representa metilo y

Q^3 representa un átomo de azufre o CH_2 ,

p representa 0,

o

A representa un radical de fórmula (A9)



en donde

R^{28} y R^{29} independientemente entre sí cada uno representa hidrógeno, metilo o etilo y

R^{30} representa metilo,

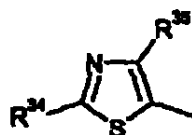
o

A representa un radical de fórmula (A11)

204

202

-129-



(A11),

en donde

R^{34} representa hidrógeno, metilo o etilo y

R^{35} representa fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o haloalquilo C_1-C_2 .

3.- Piridinilánilidas de fórmula (I) según la reivindicación 1, en donde

R representa hidrógeno, fluor, cloro, metilo o trifluormetilo;

R^1 , R^2 y R^3 independientemente entre sí cada uno representan hidrógeno, fluor, cloro, bromo, ciano; metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, n-, iso-, sec- o terc-butoxi, metiltio, etiltio, n- o iso-propiltio, n-, iso-, sec- o terc-butiltio, trifluormetilo, trifluoretilo, difluormetoxi, trifluormetoxi, difluoreclorometoxi, trifluoretoxi, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo,

o representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 representa hidrógeno, metilo, etilo, trifluormetilo o ciclopropilo y

Q^2 representa hidroxilo, metoxi, etoxi, n-propoxi o iso-propoxi,

o

R^2 y R^3 , si están unidos a la mitad piridinilo en posición orto entre sí, juntos representan

$-(CH_2)_3-$, $-(CH_2)_4-$, $-CH=CH-CH=CH-$, $-OCH_2O-$, $-O(CH_2)_2O-$, $-OCF_2O-$, $-O(CF_2)_2O-$,

R^4 representa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o tert-butilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o iso-propilsulfinilo, n-, iso-, sec- o tert-butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o iso-propilsulfonilo, n-, iso-, sec- o tert-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, trifluormetilo, triclorometilo, trifluoretilo,

difluormetiltio, difluorclorometiltio, trifluormetiltio, trifluormetilsulfinilo, trifluormetilsulfonilo, trifluormetoximetilo; $-\text{CH}_2\text{-CHO}$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CHO}$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH(CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH(CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH(CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH(CH}_3)_2$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-CO-CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{-C(O)OCCl}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)OCH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{-C(O)O-CCl}_2\text{CCl}_3$; $-\text{COR}^5$, $-\text{CONR}^6\text{R}^7$ o $-\text{CH}_2\text{NR}^8\text{R}^9$,

R^5 representa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, terc-butilo, metoxi, etoxi, terc-butoxi, ciclopropilo; trifluormetilo, trifluormetoxi; o $-\text{COR}^{10}$,

R^6 y R^7 independientemente entre sí cada uno representan hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluormetilo, triclorometilo, trifluoretilo, trifluormetoximetilo,

R^6 y R^7 además junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, representan un heterociclo saturado seleccionado del grupo consistente en morfolina, tiomorfolina y piperazina, cuyo heterociclo puede opcionalmente estar mono- a tetra-sustituido, de forma idéntica o diferente, por fluor, cloro, bromo o metilo y en donde la piperazina adicionalmente en el segundo átomo de nitrógeno puede estar sustituida por R^{11} ,

R^8 y R^9 independientemente entre sí cada uno representa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluormetilo, triclorometilo,

108
204

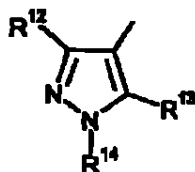
trifluoretilo, trifluormetoximetilo,

R^8 y R^9 además junto con el átomo de nitrógeno al cual están unidos, representan un heterociclo saturado seleccionado del grupo consistente en morfolina, tiomorfolina y piperazina, cuyo heterociclo puede opcionalmente estar mono- a tetra-sustituido, de forma idéntica o diferente, por fluor, cloro, bromo o metilo y en donde la piperazina adicionalmente en el segundo átomo de nitrógeno puede estar sustituida por R^{11} ,

R^{10} representa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, terc-butilo, metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, terc-butoxi, ciclopropilo; trifluormetilo, trifluormetoxi,

R^{11} representa hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo,

A representa un radical de fórmula (A1)



(A1)

, en donde

R^{12} representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, isopropilo, monofluormetilo, monofluoretilo, difluormetilo, trifluormetilo, difluorclorometilo, triclorometilo, diclorometilo, ciclopropilo, metoxi, etoxi, trifluormetoxi, triclorometoxi, metiltio, etiltio, trifluormetiltio o difluormetiltio y

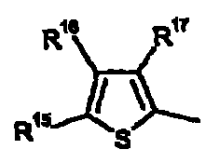
R^{13} representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo o metilo y

R^{14} representa hidrógeno, metilo, etilo, iso-propilo, trifluormetilo, difluormetilo, hidroximetilo, hidroxietilo o fenilo,

o

A representa un radical de fórmula (A2)

267
205



(A2),

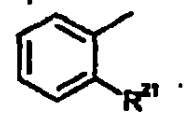
en donde

R¹⁵ y R¹⁶ independientemente entre sí cada uno representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo, difluormetilo, trifluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo y

R¹⁷ representa fluor, cloro, bromo, ciano, metilo, trifluormetilo, trifluormetoxi, difluormetoxi, difluorclorometoxi o triclorometoxi,

o

A representa un radical de fórmula (A4)



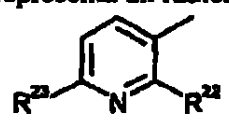
(A4),

en donde

R²¹ representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, difluormetilo, trifluormetilo, difluorclorometilo, triclorometilo, trifluormetoxi, difluormetoxi, difluorclorometoxi, triclorometoxi, trifluormetiltio, difluormetiltio, difluorclorometiltio o triclorometiltio,

o

A representa un radical de fórmula (A5)



(A5),

en donde

R²² representa fluor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo, triclorometilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluormetiltio, trifluormetiltio, trifluormetoxi, difluormetoxi, difluorclorometoxi o triclorometoxi

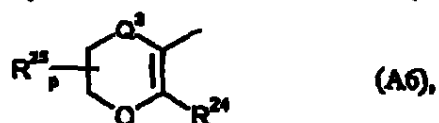
~~205~~
206

y

R^{23} representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, ciano, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo, triclorometilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, trifluormetoxi, difluormetoxi, difluorclorometoxi, triclorometoxi, metilsulfinilo o metilsulfonilo,

o

A representa un radical de fórmula (A6)



en donde

R^{24} representa metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo y

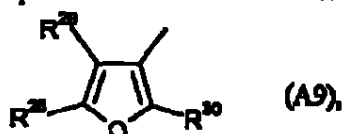
R^{25} representa metilo,

Q^3 representa un átomo de azufre o CH_2 ,

p representa 0,

o

A representa un radical de fórmula (A9)



en donde

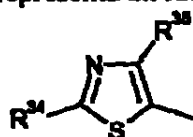
R^{28} y R^{29} independientemente entre sí cada uno representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo y

R^{30} representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo,

o

201
207

A representa un radical de fórmula (A11)



(A11),

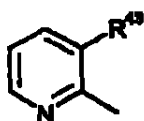
en donde

R^{34} representa hidrógeno, fluor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo y

R^{35} representa fluor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo,

o

A representa un radical de fórmula (A17)



(A17),

en donde

R^{43} representa fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo, triclorometilo,

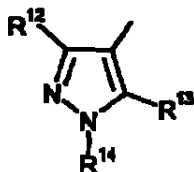
quedando excluidos los compuestos de fórmula (I) en donde

R representa hidrógeno y

R^1 , R^2 y R^3 independientemente entre sí representan cada uno de ellos hidrógeno, fluor, cloro, bromo, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, trifluormetilo o trifluoretilo, y

R^4 representa hidrógeno y

A representa un radical de fórmula (A1)



(A1)

, en donde

26
208

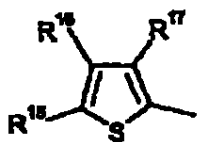
R^{12} representa fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, isopropilo, monofluormetilo, monofluoretilo, difluormetilo, trifluormetilo, difluorclorometilo, triclorometilo, diclorometilo y

R^{13} representa hidrógeno y

R^{14} representa metilo,

o

A representa un radical de fórmula (A2)



(A2),

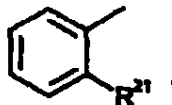
en donde

R^{15} y R^{16} independientemente entre sí cada uno representa hidrógeno, metilo o etilo y

R^{17} representa fluor, cloro, bromo, metilo, etilo o trifluormetilo,

o

A representa un radical de fórmula (A4)



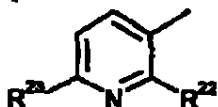
(A4),

en donde

R^{21} representa fluor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc-butilo, difluormetilo, trifluormetilo, difluorclorometilo, triclorometilo,

o

A representa un radical de fórmula (A5)



(A5),

en donde

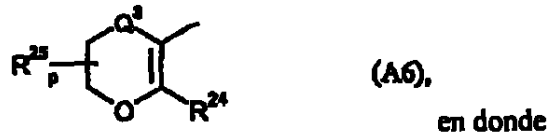
R^{22} representa fluor, cloro, bromo, yodo y

207
209

R^{23} representa hidrógeno,

o

A representa un radical de fórmula (A6)



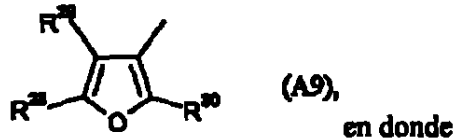
R^{24} representa metilo,

Q^3 representa un átomo de azufre o CH_2 ,

p representa O,

o

A representa un radical de fórmula (A9)



R^{28} y R^{29} independientemente entre sí cada uno representa hidrógeno, metilo o etilo y

R^{30} representa metilo,

o

A representa un radical de fórmula (A11)



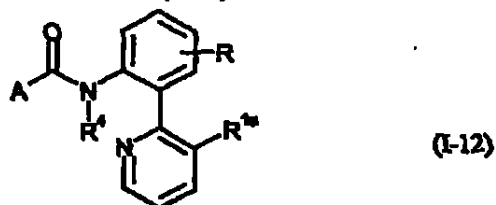
R^{34} representa hidrógeno, metilo o etilo y

R^{35} representa fluor, cloro, bromo, metilo, etilo, trifluormetilo, difluormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo.

4.- Piridinilanilidas de fórmula (I) según las reivindicaciones 1, 2 o 3, en donde R^4 representa hidrógeno.

5.- Piridinilanilidas de fórmula (I) según las reivindicaciones 1, 2 o 3, en donde R representa hidrógeno.

6.- Piridinilanilidas de fórmula (I-12)



en donde

R, R⁴ y A se definen como en la reivindicaciones 1, 2 o 3 y

R^{1a} representa halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo;

o representa en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 8 átomos de carbono en la respectiva mitad alquilo;

o representa en cada caso alquenilo de cadena lineal o ramificada o alqueniloxi que tienen, en cada caso, de 2 a 6 átomos de carbono;

o representa en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representa en cada caso haloalquenilo de cadena lineal o ramificada o haloalqueniloxi que tienen en cada caso de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 11 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representa en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcóxicarbonilo,

213
211

alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada, alquencilcarbonilo o alquinilcarbonilo que tienen de 2 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;

o representa cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;

o representa la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C_3-C_6 y

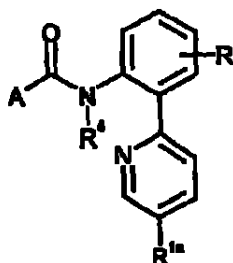
Q^2 representa hidroxilo, amino, metilamino, fenilo, bencilo; o representa alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_1-C_4)amino o fenilo; o representa alquencil(C_2-C_4)oxi o alquinil(C_2-C_4)oxi,

representa fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoiletlenilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquiloxi, fenilalquiltio o heterociclilalquilo que tienen en cada caso de 1 a 3 átomos de carbono en las respectivas mitades alquilo, cada uno de los cuales está opcionalmente mono- a tri-sustituido, de forma idéntica o diferente, en la mitad del anillo por halógeno, en cada caso alquilo C_1-C_4 y alcoxi C_1-C_4 de cadena lineal o ramificada.

7.- Piridinilanilidas de fórmula (I-13)

214
212

-139-



(L-13)

en donde

R, R⁴ y A se definen como en las reivindicaciones 1, 2 o 3 y

R^{1a} representa halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo;

o representa en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 8 átomos de carbono en la respectiva mitad alquilo;

o representa en cada caso alquenilo de cadena lineal o ramificada o alqueniloxi que tienen, en cada caso, de 2 a 6 átomos de carbono;

o representa en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representa en cada caso haloalquenilo de cadena lineal o ramificada o haloalqueniloxi que tienen en cada caso de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 11 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representa en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en la respectiva

213

cadena hidrocarbonada, alquénilcarbonilo o alquinilcarbonilo que tienen de 2 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;

o representa cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;

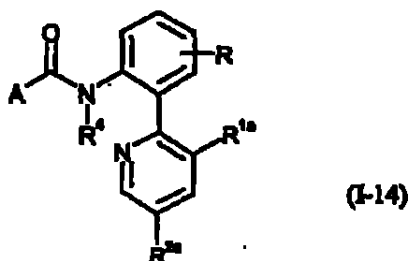
o representa la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C_3-C_6 y

Q^2 representa hidroxilo, amino, metilamino, fenilo, bencilo; o representa alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_1-C_4)amino o fenilo; o representa alquénil(C_2-C_4)oxi o alquinil(C_2-C_4)oxi,

representa fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoileténilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquiloxi, fenilalquiltio o heterociclilalquilo que tienen en cada caso de 1 a 3 átomos de carbono en las respectivas mitades alquilo, cada uno de los cuales está opcionalmente mono- a tri-sustituido, de forma idéntica o diferente, en la mitad del anillo por halógeno, en cada caso alquilo C_1-C_4 y alcoxi C_1-C_4 de cadena lineal o ramificada.

8.- Piridinilánilidas de fórmula (I-14)



en donde

25

214

-141-

R, R⁴ y A se definen como en las reivindicaciones 1, 2 o 3 y

R^{1a} y R^{2a} independientemente entre sí representan cada uno de ellos halógeno, ciano,

nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo;

o representan en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 8 átomos de carbono en la respectiva mitad alquilo;

o representan en cada caso alquenilo de cadena lineal o ramificada o alqueniloxi que tienen, en cada caso, de 2 a 6 átomos de carbono;

o representan en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso haloalquenilo de cadena lineal o ramificada o haloalqueniloxi que tienen en cada caso de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 11 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada, alquenilcarbonilo o alquinilcarbonilo que tienen de 2 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;

o representan cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;

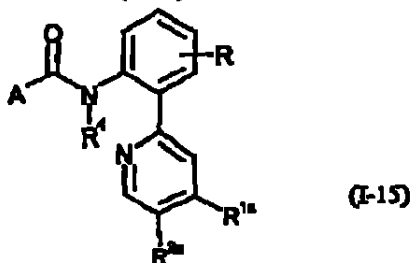
o representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q¹ representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ que tiene

de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C₃-C₆ y Q² representa hidroxilo, amino, metilamino, fenilo, bencilo; o representa alquilo C₁-C₄ o alcoxi C₁-C₄, cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, alquil(C₁-C₄)tio, alquil(C₁-C₄)amino, dialquil(C₁-C₄)amino o fenilo; o representa alquenil(C₂-C₄)oxi o alquinil(C₂-C₄)oxi,

representa fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoiletlenilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquiloxi, fenilalquiltio o heterociclilalquilo que tienen en cada caso de 1 a 3 átomos de carbono en las respectivas mitades alquilo, cada uno de los cuales está opcionalmente mono- a tri-sustituido, de forma idéntica o diferente, en la mitad del anillo por halógeno, en cada caso alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄ de cadena lineal o ramificada.

9.- Piridinilánilidas de fórmula (I-15)



en donde

R, R⁴ y A se definen como en las reivindicaciones 1, 2 o 3 y

R^{1a} y R^{2a} independientemente entre sí representan cada uno de ellos, halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo; o representan en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 8 átomos de

carbono en la respectiva mitad alquilo;

o representan en cada caso alquenilo de cadena lineal o ramificada o alqueniloxi que tienen, en cada caso, de 2 a 6 átomos de carbono;

o representan en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso haloalquenilo de cadena lineal o ramificada o haloalqueniloxi que tienen en cada caso de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 11 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada, alquenilcarbonilo o alquinilcarbonilo que tienen de 2 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;

o representan cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;

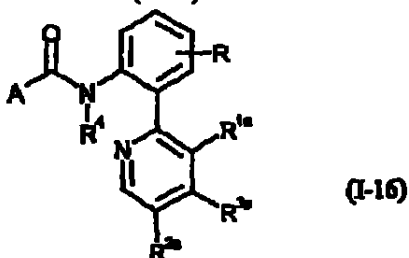
o representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C_3-C_6 y

Q^2 representa hidroxilo, amino, metilamino, fenilo, bencilo; o representa alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_1-C_4)amino o fenilo; o representa alquenil(C_2-C_4)oxi o alquinil(C_2-C_4)oxi,

representa fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoileténilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquilo, fenilalquilo, fenilalquilo o heterociclilalquilo que tienen en cada caso de 1 a 3 átomos de carbono en las respectivas mitades alquilo, cada uno de los cuales está opcionalmente mono- a tri-sustituido, de forma idéntica o diferente, en la mitad del anillo por halógeno, en cada caso alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄ de cadena lineal o ramificada.

10.- Piridinilánilidas de fórmula (I-16)



en donde R, R⁴ y A se definen como en las reivindicaciones 1, 2 o 3 y

R^{1a}, R^{2a} y R^{3a} independientemente entre sí representan cada uno de ellos halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo; o representan en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 8 átomos de carbono en la respectiva mitad alquilo; o representan en cada caso alquénilo de cadena lineal o ramificada o alquénilo que tienen, en cada caso, de 2 a 6 átomos de carbono; o representan en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13 átomos de halógeno idénticos o diferentes; o representan en cada caso haloalquénilo de cadena lineal o ramificada o

720
218

haloalqueniloxi que tienen en cada caso de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 11 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada, alquenilcarbonilo o alquinilcarbonilo que tienen de 2 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;

o representan cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;

o representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C_3-C_6 y

Q^2 representa hidroxilo, amino, metilamino, fenilo, bencilo; o representa alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_1-C_4)amino o fenilo; o representa alquenil(C_2-C_4)oxi o alquinil(C_2-C_4)oxi,

representa fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoiletlenilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquiloxi, fenilalquiltio o heterociclilalquilo que tienen en cada caso de 1 a 3 átomos de carbono en las respectivas mitades alquilo, cada uno de los cuales está opcionalmente mono- a tri-sustituido, de forma idéntica o diferente, en la mitad del anillo por halógeno, en cada caso alquilo C_1-C_4 y alcoxi C_1-C_4 de cadena lineal o ramificada.

11.- Procedimiento para la preparación de piridinilanilidas de fórmula (I) según la

219

reivindicación 1, caracterizado porque:

a) derivados de ácidos carboxílicos de fórmula (II)

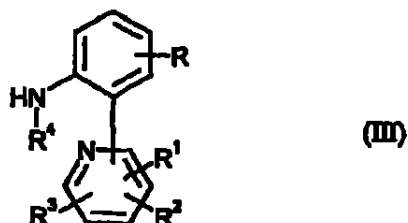


en donde

X^1 representa halógeno o hidroxilo y

A se define como en la reivindicación 1,

se hacen reaccionar con aminas de fórmula (III)

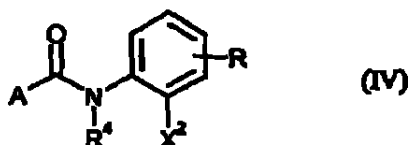


en donde R, R^1 , R^2 , R^3 y R^4 se definen como en la reivindicación 1,

si resulta adecuado en presencia de un catalizador, si resulta adecuado en presencia de un agente de condensación, si resulta adecuado en presencia de un aceptor de ácido y si resulta adecuado en presencia de un diluyente,

o

b) halo-carboxamidas de fórmula (IV)



en donde

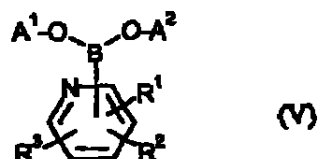
R, R^4 y A se definen como en la reivindicación 1 y

X^2 representa bromo o yodo,

se hacen reaccionar con derivados de ácido borónico de fórmula (V)

272
220

-147-



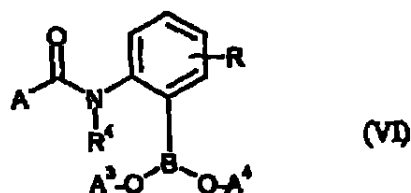
en donde

R^1 , R^2 y R^3 se definen como en la reivindicación 1 y

A^1 y A^2 representan cada uno de ellos hidrógeno o juntos representan tetrametiletileno, en presencia de un catalizador, si resulta adecuado en presencia de un aceptor de ácido y si resulta adecuado en presencia de un diluyente,

o

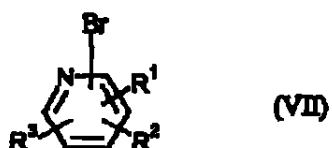
c) derivados de carboxamida de ácido borónico de fórmula (VI)



en donde

R , R^4 y A se definen como en la reivindicación 1 y

A^3 y A^4 representan cada uno de ellos hidrógeno o juntos representan tetrametiletileno, se hacen reaccionar con derivados de piridinilo de fórmula (VII)



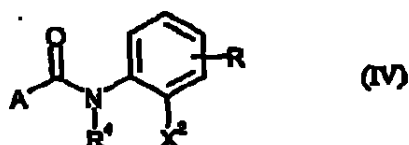
en donde R^1 , R^2 y R^3 se definen como en la reivindicación 1,

en presencia de un catalizador, si resulta adecuado en presencia de un aceptor de ácido y si resulta adecuado en presencia de un diluyente,

o

d) halo-carboxamidas de fórmula (IV)

-148-

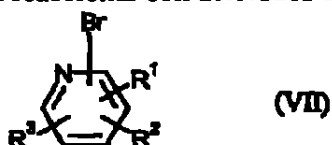


en donde

R, R⁴ y A se definen como en la reivindicación 1 y

X² representa bromo o yodo,

se hacen reaccionar con derivados de piridinilo de fórmula (VII)

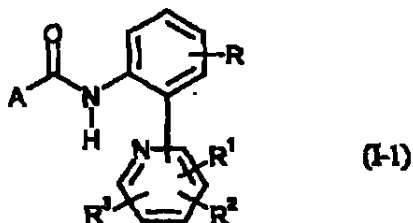


en donde R¹, R² y R³ se definen como en la reivindicación 1,

en presencia de un catalizador de paladio o platino y en presencia de 4,4,4',4',5,5,5',5'-octametil-2,2'-bis-1,3,2-dioxaborolano [bis(pinacolato)diboron], si resulta adecuado en presencia de un aceptor de ácido y si resulta adecuado en presencia de un diluyente,

o

e) piridinilánilidas de fórmula (I-1)



en donde R, R¹, R², R³ y A se definen como en la reivindicación 1, se hacen reaccionar con halogenuros de fórmula (VIII)



en donde

X³ representa cloro, bromo o yodo,

R⁴ᵃ representa alquilo C₁-C₈, alquil(C₁-C₆)sulfinilo, alquil(C₁-C₆)sulfonilo,

224

222

-149-

alcoxi(C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₈; haloalquilo C₁-C₆, haloalquil(C₁-C₄)tio, haloalquil(C₁-C₄)sulfinilo, haloalquil(C₁-C₄)sulfonilo, haloalcoxi(C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, halocicloalquilo C₃-C₈ que tienen en cada caso de 1 a 9 átomos de fluor, cloro y/o bromo; formilalquilo C₁-C₃, alquil(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃, alcoxi(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃; haloalquil(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi(C₁-C₃)carbonil-alquilo C₁-C₃ que tienen en cada caso de 1 a 7 átomos de fluor, cloro y/o bromo, alquil(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃, alcoxi(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃ que tienen en cada caso de 1 a 6 átomos de fluor, cloro y/o bromo, haloalquil(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃, haloalcoxi(C₁-C₃)carbonil-haloalquilo C₁-C₃ que tienen en cada caso de 1 a 13 átomos de fluor, cloro y/o bromo; -COR⁵, -CONR⁶R⁷ o -CH₂NR⁸R⁹;

R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y R⁹ se definen como en la reivindicación 1,

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

12.- Composiciones para controlar microorganismos indeseados, caracterizadas porque comprenden al menos una piridinilánilida de fórmula (I) según la reivindicación 1, además de extendedores y/o surfactantes.

13.- Uso de piridinilánilidas de fórmula (I) según la reivindicación 1 para el control de microorganismos indeseados.

14.- Método para controlar microorganismos indeseados, caracterizado porque las piridinilánilidas de fórmula (I) según la reivindicación 1 se aplican a los microorganismos y/o su hábitat.

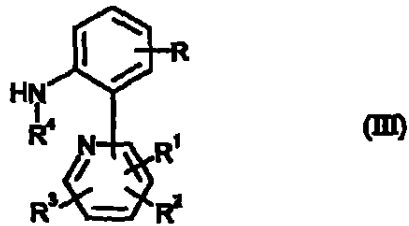
15.- Procedimiento de preparación de composiciones para el control de microorganismos indeseados, caracterizado porque las piridinilánilidas de fórmula (I) según la reivindicación 1 se mezclan con extendedores y/o surfactantes.

223

223

-150-

16.- Aminas de fórmula (III)



en donde

R, R¹, R², R³ y R⁴ se definen como en la reivindicación 1,

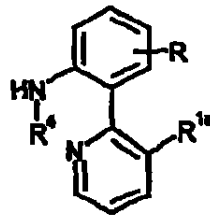
quedando excluidos los compuestos de fórmula (III) en donde

R representa hidrógeno y

R¹, R² y R³ independientemente entre sí representan cada uno hidrógeno, halógeno, alquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono o haloalquilo de cadena lineal o ramificada que tiene de 1 a 4 átomos de carbono; y

R⁴ representa hidrógeno.

17.- Aminas de fórmula



en donde

R y R⁴ se definen como en las reivindicaciones 1, 2 o 3 y

R^{1a} representa halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo;

o representa en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 8 átomos de

224

-151-

carbono en la respectiva mitad alquilo;

o representa en cada caso alquenilo de cadena lineal o ramificada o alqueniloxi que tienen, en cada caso, de 2 a 6 átomos de carbono;

o representa en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representa en cada caso haloalquenilo de cadena lineal o ramificada o haloalqueniloxi que tienen en cada caso de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 11 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representa en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada, alquencilcarbonilo o alquencilcarbonilo que tienen de 2 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;

o representa cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;

o representa la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C_3-C_6 y

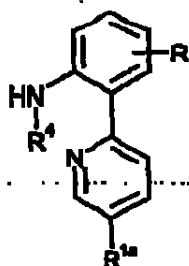
Q^2 representa hidroxilo, amino, metilamino, fenilo, bencilo; o representa alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_1-C_4)amino o fenilo; o representa alquencil(C_2-C_4)oxi o alquencil(C_2-C_4)oxi,

227
225

-152-

representa fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoileténilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquiloxi, fenilalquiltio o heterociclilalquilo que tienen en cada caso de 1 a 3 átomos de carbono en las respectivas mitades alquilo, cada uno de los cuales está opcionalmente mono- a tri-sustituido, de forma idéntica o diferente, en la mitad del anillo por halógeno, en cada caso alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄ de cadena lineal o ramificada.

18.- Aminas de fórmula



en donde

R y R⁴ se definen como en las reivindicaciones 1, 2 o 3 y

R^{1a} representa halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo;

o representa en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 8 átomos de carbono en la respectiva mitad alquilo;

o representa en cada caso alquénilo de cadena lineal o ramificada o alquéniloxi que tienen, en cada caso, de 2 a 6 átomos de carbono;

o representa en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

228
226

o representa en cada caso haloalquenilo de cadena lineal o ramificada o haloalqueniloxi que tienen en cada caso de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 11 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representa en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada, alquenilcarbonilo o alquinilcarbonilo que tienen de 2 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;

o representa cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;

o representa la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

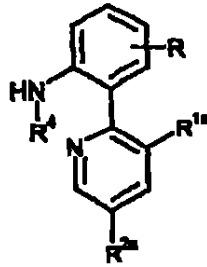
Q^1 representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C_3-C_6 y

Q^2 representa hidroxilo, amino, metilamino, fenilo, bencilo; o representa alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_1-C_4)amino o fenilo; o representa alquenil(C_2-C_4)oxi o alquinil(C_2-C_4)oxi,

representa fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoileténilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquiloxi, fenilalquiltio o heterociclilalquilo que tienen en cada caso de 1 a 3 átomos de carbono en las respectivas mitades alquilo, cada uno de los cuales está opcionalmente mono- a tri-sustituido, de forma idéntica o diferente, en la mitad del anillo por halógeno, en cada caso alquilo C_1-C_4 y alcoxi C_1-C_4 de cadena lineal o ramificada.

227

19.- Aminas de fórmula



en donde

R y R⁴ se definen como en las reivindicaciones 1, 2 o 3 y

R^{1a} y R^{2a} independientemente entre sí representan cada uno de ellos halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo;

o representan en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 8 átomos de carbono en la respectiva mitad alquilo;

o representan en cada caso alquenilo de cadena lineal o ramificada o alqueniloxi que tienen, en cada caso, de 2 a 6 átomos de carbono;

o representan en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso haloalquenilo de cadena lineal o ramificada o haloalqueniloxi que tienen en cada caso de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 11 átomos de halógeno idénticos o diferentes;

o representan en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxycarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo,

dialquilaminocarbonilo que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada, alquénilcarbonilo o alquínilcarbonilo que tienen de 2 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;

o representan cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;

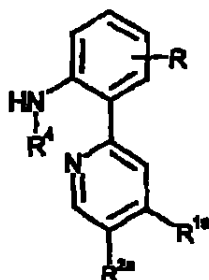
o representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C_3-C_6 y

Q^2 representa hidroxilo, amino, metilamino, fenilo, bencilo; o representa alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_1-C_4)amino o fenilo; o representa alquénil(C_2-C_4)oxi o alquínil(C_2-C_4)oxi,

representa fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoileténilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquiloxi, fenilalquiltio o heterocicilalquilo que tienen en cada caso de 1 a 3 átomos de carbono en las respectivas mitades alquilo, cada uno de los cuales está opcionalmente mono- a tri-sustituido, de forma idéntica o diferente, en la mitad del anillo por halógeno, en cada caso alquilo C_1-C_4 y alcoxi C_1-C_4 de cadena lineal o ramificada.

20.- Aminas de fórmula



229

en donde

R y R⁴ se definen como en las reivindicaciones 1, 2 o 3 y

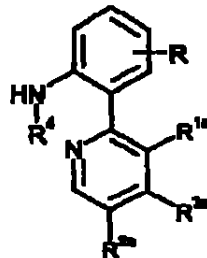
R^{1a} y R^{2a} independientemente entre sí representan cada uno de ellos halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo;
o representan en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio, alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 8 átomos de carbono en la respectiva mitad alquilo;
o representan en cada caso alquenilo de cadena lineal o ramificada o alqueniloxi que tienen, en cada caso, de 2 a 6 átomos de carbono;
o representan en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13 átomos de halógeno idénticos o diferentes;
o representan en cada caso haloalquenilo de cadena lineal o ramificada o haloalqueniloxi que tienen en cada caso de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 11 átomos de halógeno idénticos o diferentes;
o representan en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcoxicarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada, alquenilcarbonilo o alquinilcarbonilo que tienen de 2 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;
o representan cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;
o representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde

Q^1 representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C_3-C_6 y

Q^2 representa hidroxilo, amino, metilamino, fenilo, bencilo; o representa alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_1-C_4)amino o fenilo; o representa alquenil(C_2-C_4)oxi o alquini(C_2-C_4)oxi,

representa fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoiletlenilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquiloxi, fenilalquiltio o heterocicilalquilo que tienen en cada caso de 1 a 3 átomos de carbono en las respectivas mitades alquilo, cada uno de los cuales está opcionalmente mono- a tri-sustituido, de forma idéntica o diferente, en la mitad del anillo por halógeno, en cada caso alquilo C_1-C_4 y alcoxi C_1-C_4 de cadena lineal o ramificada.

21.- Aminas de fórmula



en donde

R y R^4 se definen como en las reivindicaciones 1, 2 o 3 y

R^{1a} , R^{2a} y R^{3a} independientemente entre sí representan cada uno de ellos halógeno, ciano, nitro, amino, hidroxilo, formilo, carboxilo, carbamoilo, tiocarbamoilo; o representan en cada caso alquilo de cadena lineal o ramificada, hidroxialquilo, oxoalquilo, alcoxi, alcoxialquilo, alquiltioalquilo, dialcoxialquilo, alquiltio,

- alquilsulfinilo o alquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 8 átomos de carbono en la respectiva mitad alquilo;
- o representan en cada caso alquenilo de cadena lineal o ramificada o alqueniloxi que tienen, en cada caso, de 2 a 6 átomos de carbono;
- o representan en cada caso haloalquilo de cadena lineal o ramificada, haloalcoxi, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo o haloalquilsulfonilo que tienen, en cada caso, de 1 a 6 átomos de carbono y de 1 a 13 átomos de halógeno idénticos o diferentes;
- o representan en cada caso haloalquenilo de cadena lineal o ramificada o haloalqueniloxi que tienen en cada caso de 2 a 6 átomos de carbono y de 1 a 11 átomos de halógeno idénticos o diferentes;
- o representan en cada caso alquilamino de cadena lineal o ramificada, dialquilamino, alquilcarbonilo, alquilcarboniloxi, alcóxicarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, arilalquilaminocarbonilo, dialquilaminocarboniloxi que tienen de 1 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada, alquencilcarbonilo o alquencilcarbonilo que tienen de 2 a 6 átomos de carbono en la respectiva cadena hidrocarbonada;
- o representan cicloalquilo o cicloalquiloxi que tienen en cada caso de 3 a 6 átomos de carbono;
- o representan la agrupación $-C(Q^1)=N-Q^2$, en donde
- Q^1 representa hidrógeno, hidroxilo o alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 9 átomos de halógeno idénticos o diferentes o cicloalquilo C_3-C_6 y
- Q^2 representa hidroxilo, amino, metilamino, fenilo, bencilo; o representa alquilo C_1-C_4 o alcoxi C_1-C_4 , cada uno de los cuales está opcionalmente sustituido por halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_1-C_4)amino o fenilo; o representa alquencil(C_2-C_4)oxi o

23A:
232

-159-

alquinil(C₂-C₄)oxi,

representa fenilo, fenoxi, feniltio, benzoilo, benzoileténilo, cinamoilo, heterociclilo o fenilalquilo, fenilalquiloxi, fenilalquiltio o heterocicilalquilo que tienen en cada caso de 1 a 3 átomos de carbono en las respectivas mitades alquilo, cada uno de los cuales está opcionalmente mono- a tri-sustituido, de forma idéntica o diferente, en la mitad del anillo por halógeno, en cada caso alquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄ de cadena lineal o ramificada.



FORMATO DE DIGITALIZACI N
RELACION DE ANEXOS



Royni
Technologies S.A.
Sede: Calle 100 No. 100-100, San José, Costa Rica

Expediente No		06001324	No de Folio
Item		No de unidades	
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA	Y	✓
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS:		

Observaciones:
CONTIENE ARTÍCULO FINAL

233

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 268
FECHA : ENERO 3 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	27483194	03/01/2006	41,063,280.00

***** CONCEPTO *****

CANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	463,000.00
	TOTAL :	463,000.

SON: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Cdo 13549-891-047-5

28
23A
SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radicacion : 06001324 00000000
Fecha (AMD): 2006-01-06 16:59:29
Tramite : 011 PCT-PATENT 378 FASE NACI 411 PRESENTAC
Dependencia: 2020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
Folios: 230

235

SUPERINDUSTRIA Y COMERCIO
Radacion 06001324 00000000
Fecha (ANO) 2006-01-06 16:59 29
Tramite 011 PCT-PATENT 378 FASE NNCI 411 PRESENTAC
Dependencia: 0020 DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

Folios: 238

REQUISITOS NECESARIOS PARA LA PRESENTACION Y AGILIZACION DEL TRAMITE

	USUARIO	RADIADOR
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 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		

06 de 2006

236

240
236

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BAYER CROPS SCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT

REFERENCIA	Radicación No.	6 1324
	Solicitud internacional	EP2004/007323
	Fecha inicio fase nacional	10/02/2006
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	
	Oficio No.	2137

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 CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 24 FEB. 2006
adpa11

~~240208~~

