

OP



Industria y Comercio
S U P E R I N T E N D E N C I A

Delegatura de propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

PCT
SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

06-47183

21. EXPEDIENTE No. _____

54. TÍTULO CARBOXAMIDAS SILILADAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL _____

71. SOLICITANTE BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO MONHEIM, REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

74. APODERADO EMILIO FERRERO
C.C. 438.019 de Usaquén

22. BOGOTÁ, D. C., _____

**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 08-047183- -00000-0000
Fea: 2005-05-17 18:29:03 Dep. 2020 NUECREACIONES
TILA 11 PATENTEIYE
EYE 378 FASENACIONALI
ART 411 PRESENTACION Folios 149

**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****S LICITANTE
(71)**

Nombre: **BAYER CROPSCIENCE
AKTIENGESSELLSCHAFT**
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
O APODERADO**

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

IDENTIFICACIÓN

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

4**INVENTOR (ES)
(72)**

1. **Ralf DUNKEL**
Krischer Str. 22
Monheim- 40789
República Federal de Alemania

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

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

7. **Peter DAHMEN**
Altebrücker Str. 61,
Neuss 41470
República Federal de Alemania

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

4. **Alexander KLAUSENER**
16 rue Jean-Marie Leclair,
Lyon- 69009
Francia

6. **Ulrike WACHENDORFF-NEUMANN**
Oberer Markenweg 85,
Neuwied 56568
República Federal de Alemania

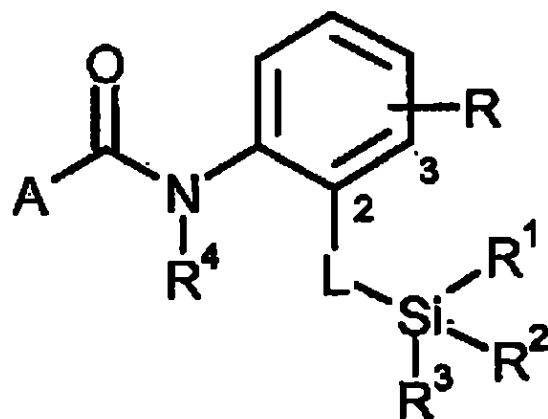
8. **Karl-Heinz KUCK**
Pastor-Löh-Str. 30a,
Langenfeld 40764
República Federal de Alemania

5**PCT (86)**Solicitud Internacional No. PCT/EP2004/012590Fecha: 6 de noviembre 2004Publicación Internacional No. WO2005/049624 A1Fecha: 2 de junio 2005**6****Título (54)****CARBOXAMIDAS SILILADAS.****7****Clasificación Internacional (51) C07F 7/08**

8	Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>DE</u>	(32) Fecha <u>21 de noviembre 2003</u>	(31) Número de Solicitud <u>103 54 607.3</u>
9	Comprobante de pago No.: <u>06-36.138</u> Fecha: <u>15 de mayo 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



(I)

12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE:

EMILIO FERRERO

FIRMA :

C.C. 438.019 de Usaquén T.P. 31.929

FCC

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ **Publicación Internacional WO 2005/049624 A1**

Descripción:

Páginas 41 en el idioma original

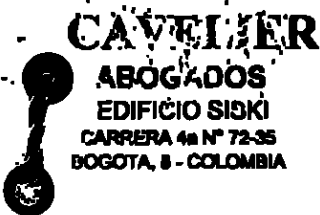
Páginas 56 en español

Reivindicaciones: Número (s) 7

Figuras: Número (s)

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

NO SE PRESENTARON MODIFICACIONES EN LA FASE INTERNACIONAL



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

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

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER-OF-ATTORNEY 13549 10966

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

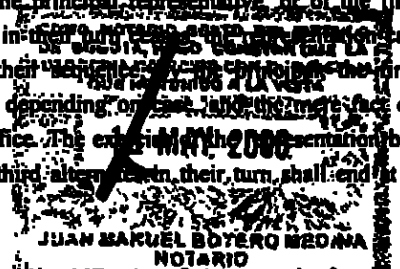
domiciliado (s) en/of Alfred-Nobel-Str. 50,

- 40789 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 parágrafo 1o del Artículo 543 del Código de Comercio, el primero como principal y los demás como suplentes, en su orden, como mis (nuestros) representantes en todos los asuntos de propiedad industrial con facultad para recibir notificaciones y nombrar apoderados judiciales o extrajudiciales. El primer representante suplente reemplazará al principal en caso de ausencia o impedimento temporal o definitivo de aquél. La misma regla se aplicará cuando el segundo representante suplente haya de reemplazar al primero, o el tercero al segundo. En tales casos, el representante principal, o el primero, o segundo suplente, en su caso, o ambos, declararán su intención de no ejercer la representación mediante declaración autenticada por Notario Público en Colombia, o por Notario u otro Funcionario Público, o Cónsul de Colombia, en el extranjero; y si se tratare de impedimento, con el certificado respectivo. Si alguno de los nombrados faltare definitivamente, el siguiente tomará su lugar. Cuando cesare la ausencia o impedimento del representante principal, o de su primero o segundo suplentes, en su caso, podrán ejercer la representación, en su orden, uno u otros según el caso, asumiéndola por el solo hecho de ejercerla, cesando en ese momento el ejercicio de la representación por el primero, segundo o tercer suplente en su caso.

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



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

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.

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

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

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

en/in Leverkusen

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

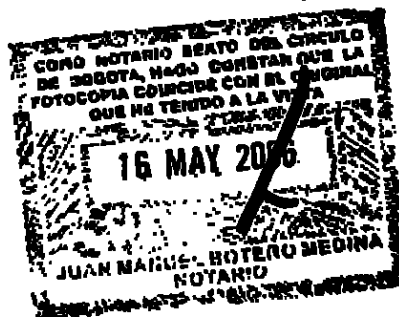
Firma

Signature

Bayer CropScience AG

Handwritten signature: Dr. Bader

Handwritten signature: Dr. Jesse



STENTICACION NOTARIAL (SOCIEDAD)

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

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

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

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

y que el signatario tiene facultad para otorgar este documento.

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

Dado y firmado en Leverkusen

El 12 de febrero, 2003

NOTARIAL AUTHENTICATION (COMPANY)

The undersigned Notary certifies: That the preceding signature
 of

Dr. Axel Bader and Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

is authentic, that the signatory currently acts in the position of
secretaries

of the company Bayer CropScience AG

a company currently existing and organized under the laws of
Germany

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

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

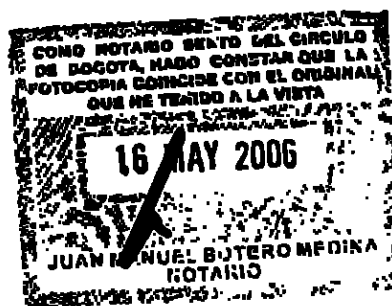
The Notary Public is aware and attests to the above facts upon
 examination of the corresponding documents.

Given and signed in Leverkusen

On 12th of February, 2003

El Notario Público
 (Firma-sello)

The Notary Public
 (Signature-seal)



ORNr. 242/2003

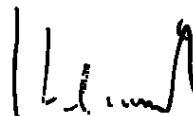
Ich beglaube die vor mir vollzogenen Unterschriften :

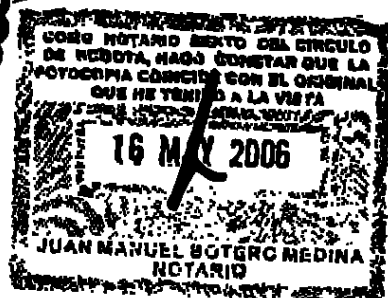
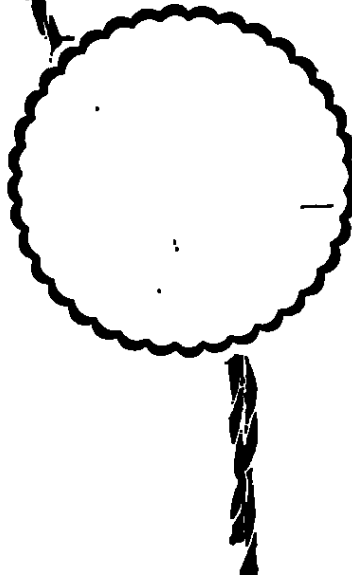
1. des Herrn Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,
2. des Herrn Dr. Axel Bader, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,

- 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

17. FEB. 2003

5. in Köln

6. am _____

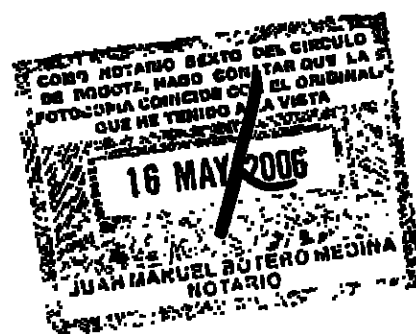
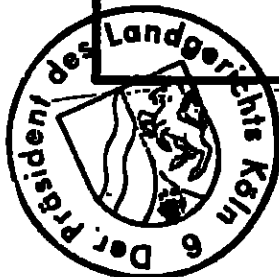
7. durch den Vizepräsidenten des Landgerichts Köln

8. unter Nr. 482103

9. Stempel/Siegel:

10. Unterschrift:

Larín Caliebe



Geb 9 100

Eur 13

528

23.08

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

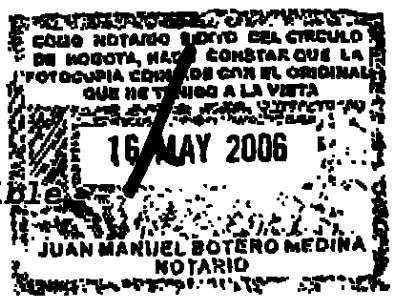
A continuación se traducen los sellos y legalizaciones de un documento escrito en inglés y español por medio del cual Bayer CropScience AG, domiciliado en Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Alemania, por el presente ratifica la solicitud de patente No. 03.005.574, presentada por EMILIO FERRERO el 28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

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

Bayer CropScience AG

Firma Ilegible

Firma Ilegible



(ANEXO)

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

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

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

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

SONO NOTARIO SINTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HACER CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA CONCORDA CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
16 MAY 2006
JUAN MANUEL POTPHO MEDINA
NOTARIO

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO
2003 MAR 18 P 12:24
JEFE DE LEGALIZACIONES
BOGOTÁ D.C.

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

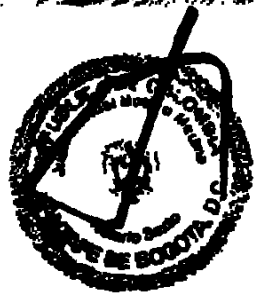
208992
D.F. JORDAN
COPIA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPENA
LAS FUNCIONES INDICADAS

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

IDENTIFICADOS CON C.E. No.(s)

ES(SON) AUTENTICA(S)

SANTAFE DE BOGOTA, 18 MAR 2003



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

16 MAY 2006

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

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.-

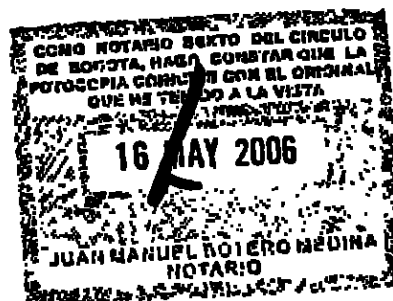
Traducción de los sellos y autenticaciones que aparecen en el documento de representación y poder, escrito en español e inglés, por medio del cual la firma Bayer CropScience AG, domiciliada en Alfred-Nobel-Str. 50, D 40789 Monheim, Alemania, otorga poder a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO,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



[Handwritten signature]

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

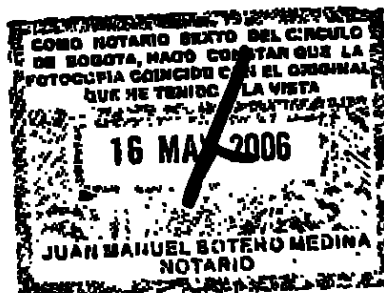
Costas

Art. 141, 154 KostO

Valor EUROS 3.000,-

Derechos Art. 32,45

EUROS 10,-



f. Botero

13

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

APOSTILLA

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: República Federal de Alemania

Este documento público

2. Ha sido firmado por Dirk Heiderhoff

3. Actuando en calidad de notario

4. Lleva el sello del notario Dirk Heiderhoff, notario

Leverkusen

Certificado

5. en Colonia

6. El 17 de febrero 2003

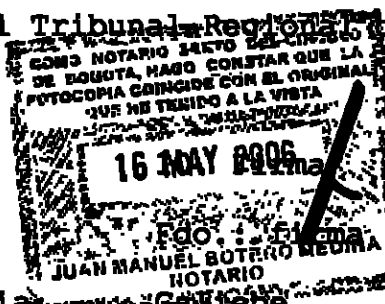
7 por el Vicepresidente del Tribunal Regional de Colonia

8. bajo el No 482/03

9. Sello

El Presidente del

Tribunal Regional de Colonia



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

Bogotá, 14 de marzo 2003.

[Handwritten signature]
1012 APOSTILLA DEL TRIBUNAL REGIONAL DE BOGOTA
Fdo. Juan Manuel Botero Medina
NOTARIO

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208993

J. Pinzón de la
TODA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPENA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2003 MAR 18 P 12:24

JEFES DE DEPARTAMENTOS
BOGOTÁ D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTA FE DE
BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE LOS ANTERIORES FIR-
MAS FUERON PUESTAS CON
Guillermo José
7 febrero
IDENTIFICADOS CON C.C. NO.(S)
ES(SON) AUTENTICAS;
SANTA FE DE BOGOTÁ, 18 MAR 2003



COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
16 MAY 2006
JUAN MANUEL J. J. J. J. J.

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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
2. Juni 2005 (02.06.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/049624 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07F 7/08

(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER CROPSCIENCE
AKTIENGESELLSCHAFT; Law and Patents, Patents
and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/012590

(22) Internationales Anmeldedatum:
6. November 2004 (06.11.2004)

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
10354607.3 21. November 2003 (21.11.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme
von US): BAYER CROPSCIENCE AKTIENGE-
SELLSCHAFT [DE/DE]; Alfred-Nobel-Str. 50, 40789
Monheim (DE).

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SI, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, 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) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): DUNKEL, Ralf
[DE/DE]; Krieger Str. 22, 40789 Monheim (DE); ZELBE,
Hans-Ludwig [DE/DE]; Dammkeel 59, 42329 Wuppertal
(DE); HARTMANN, Berndt [FR/DE]; Fürberstr. 1, 40764
Langenfeld (DE); KLAUSENER, Alexander [DE/FR]; 16
rue Jean-Marie Loelich, 69009 Lyon (FR); GREUL, Jörg,
Nico [DE/DE]; Am Sandberg 30a, 42799 Leichlingen
(DE); WACHENDORFF-NEUMANN, Ulfried [DE/DE];
Oberer Markzenweg 15, 56566 Neuwied (DE); DAHMEN,
Peter [DE/DE]; Alsbriicker Str. 61, 41470 Neuss (DE).
KUCK, Karl-Helm [DE/DE]; Pastor-Löh-Str. 30 a,
40764 Langenfeld (DE).

Veröffentlicht:

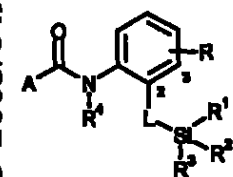
mit internationalem Recherchebericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Ab-
kürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der
PCT-Gazette verwiesen.

WO 2005/049624 A1

(54) Title: SILYLATED CARBOXAMIDES

(54) Bezeichnung: SILYLIERTE CARBOXAMIDE



(I)

(57) Abstract: The invention relates to novel silylated carboxamides of formula (I), wherein R, L, R¹, R², R³, R⁴ and A have the meaning cited in the description. The invention also relates to several methods for the production of said compounds and the use thereof in combating undesired micro-organisms.

(57) Zusammenfassung: Neue silylierte Carboxamide der Formel (I), in welcher R, L, R¹, R², R³, R⁴ und A die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zum Herstellen dieser Verbindungen und ihre Verwendung zum Bekämpfen unerwünschter Mikroorganismen.

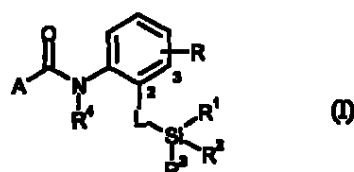
Silylierte Carboxamide

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

5

Es ist bereits bekannt, dass zahlreiche Carboxamide fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. z.B. WO 03/080628, WO 03/010149, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099). Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber in manchen Fällen, z.B. bei niedrigen Aufwandmengen zu wünschen übrig.

10 Es wurden nun neue silylierte Carboxamide der Formel (I)

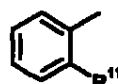


gefunden, in welcher

- R für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,
- L für eine direkte Bindung oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes geradkettiges oder verzweigtes Alkyl (Alkandiy), Alkenyl (Alkendiyl) oder Alkynyl (Alkindiy) steht,
- 15 R^1 und R^2 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkylthio- C_1 - C_6 -alkyl oder C_1 - C_6 -Halogenalkyl stehen,
- R^3 für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -Alkylthio- C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkynyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_2 - C_6 -Halogenalkenyl, C_2 - C_6 -Halogenalkynyl, C_2 - C_6 -Cycloalkyl, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Phenylalkyl steht,
- 20 R^4 für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -Cycloalkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylthio, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, C_2 - C_6 -Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, 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; Halogen-(C_1 - C_3 -alkyl)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl, Halogen-(C_1 - C_3 -alkoxy)carbonyl- C_1 - C_3 -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
- 25 (C_1 - C_6 -Alkyl)carbonyl, (C_1 - C_6 -Alkoxy)carbonyl, (C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl)carbonyl, (C_2 - C_6 -Cycloalkyl)carbonyl; (C_1 - C_6 -Halogenalkyl)carbonyl, (C_1 - C_6 -Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen- C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl)carbonyl, (C_2 - C_6 -Halogenocycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ oder $-CH_2NR^8R^9$ steht,
- 30

- R^5 für Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Alkoxy, C_1-C_6 -Alkoxy- C_1-C_6 -alkyl, C_3-C_6 -Cycloalkyl; C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_1-C_6 -Halogenalkoxy, Halogen- C_1-C_6 -alkoxy- C_1-C_6 -alkyl, C_3-C_6 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,
- R^6 und R^7 unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Alkoxy- C_1-C_6 -alkyl, C_3-C_6 -Cycloalkyl; C_1-C_6 -Halogenalkyl, Halogen- C_1-C_6 -alkoxy- C_1-C_6 -alkyl, C_3-C_6 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- R^6 und R^7 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1-C_6 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁰ enthalten kann,
- R^8 und R^9 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1-C_6 -Alkyl, C_3-C_6 -Cycloalkyl; C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_3-C_6 -Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- R^8 und R^9 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1-C_6 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁰ enthalten kann,
- R^{10} für Wasserstoff oder C_1-C_6 -Alkyl steht,

A für den Rest der Formel (A1)

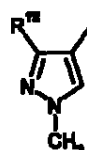


(A1) steht, in welcher

- R^{11} für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C_1-C_6 -Alkyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl, C_1-C_6 -Halogenalkoxy oder C_1-C_6 -Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A2)

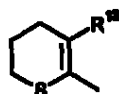


(A2) steht, in welcher

- R^{12} für Chlor, Iod oder Dichlormethyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A3)

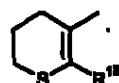


(A3) steht, in welcher

R¹² für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)

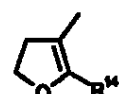


(A4) steht, in welcher

R¹³ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)

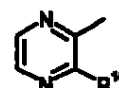


(A5) steht, in welcher

R¹⁴ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A6)

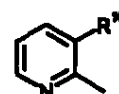


(A6) steht, in welcher

R¹⁵ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)

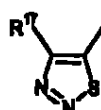


(A7) steht, in welcher

R¹⁶ für Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A8)

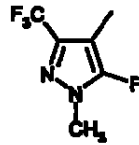


(A8) steht, in welcher

R¹⁷ für C₁-C₄-Alkyl steht,

oder

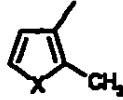
A für den Rest der Formel (A9)



(A9) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)



(A10) steht, in welcher

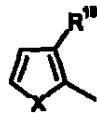
5

in welcher

X für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



(A11) steht, in welcher

10

in welcher

X für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

R¹⁸ für Iod oder Methyl steht.

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

20

Weiterhin wurde gefunden, dass man silylierte Carbonsäure-derivate der Formel (I) erhält, indem man

a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)



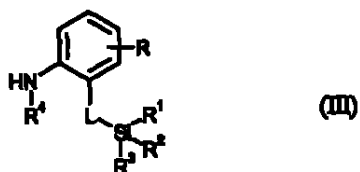
(II)

in welcher

25

X¹ für Halogen oder Hydroxy steht und

A die oben angegebenen Bedeutungen hat,
mit Aminen der Formel (III)

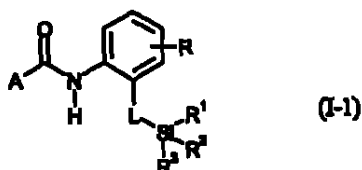


in welcher R, L, R¹, R², R³ und R⁴ die oben angegebenen Bedeutungen haben,
gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators, gegebenenfalls in Gegenwart eines Kondensationsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in

5

oder

b) silylierte Carboxamide der Formel (I-1)



in welcher R, L, R¹, R², R³ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,
mit Halogeniden der Formel (VIII)

10



in welcher

X² für Chlor, Brom oder Iod steht,

R⁴ für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkylsulfanyl, C₁-C₈-Alkylsulfonyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Halogenalkylthio, C₁-C₈-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₈-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₈-alkyl, (C₁-C₈-Alkyl)carbonyl-C₁-C₈-alkyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₈-alkyl; Halogen-(C₁-C₈-alkyl)carbonyl-C₁-C₈-alkyl, Halogen-(C₁-C₈-alkoxy)carbonyl-C₁-C₈-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl)carbonyl, (C₂-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₈-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl)carbonyl, (C₂-C₈-Halogenocycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹ steht, wobei R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ die oben angegebenen Bedeutungen haben,

25

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

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

- 5 Die erfindungsgemäßen silylierten Carbonsamide sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugte Restdefinitionen der vorstehenden und nachfolgend genannten Formeln sind im Folgenden angegeben. Diese Definitionen gelten für die Endprodukte der Formel (I) wie für alle Zwischenprodukte gleichermaßen.
- 10 R steht bevorzugt für Wasserstoff.
 R steht außerdem bevorzugt für Fluor, wobei Fluor besonders bevorzugt in 4-, 5- oder 6-Position, ganz besonders bevorzugt in 4- oder 6-Position, insbesondere in 4-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].
 R steht außerdem bevorzugt für Chlor, wobei Chlor besonders bevorzugt in 5-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].
- 15 R steht außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].
 R steht außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 4- oder 5-Position des Anilidrestes steht [vgl. oben Formel (I)].
- 20 L steht bevorzugt für eine direkte Bindung oder für gegebenenfalls durch Halogen substituiertes geradkettiges oder verzweigtes C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl oder C_2 - C_6 -Alkynyl.
 L steht besonders bevorzugt für eine direkte Bindung oder für $-CH_2-$, $-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_3-$, $-CH(Me)-$, $-CH(Me)CH_2-$, $-CH_2CH(Me)-$, $-CH(Me)CH(Me)-$, $-C(Me)_2CH_2-$,
 25 $-CH(Me)-(CH_2)_2-$, $-CH(Me)-(CH_2)_3-$, $-CH=CH-$, $-C(Me)=CH-$ oder $-C\equiv C-$.
 L steht ganz besonders bevorzugt für $-(CH_2)_2-$, $-(CH_2)_3-$, $-CH(Me)-$, $-CH(Me)CH_2-$, $-CH(Me)-(CH_2)_2-$, $-CH(Me)-(CH_2)_3-$, $-CH=CH-$, $-C(Me)=CH-$ oder $-C\equiv C-$.
- R^1 und R^2 stehen unabhängig voneinander bevorzugt für C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_7 -Alkoxy-
 30 C_1 - C_7 -alkyl oder C_1 - C_7 -Alkylthio- C_1 - C_7 -alkyl.
 R^1 und R^2 stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl, Methylthioethyl oder Ethylthioethyl.
 R^1 und R^2 stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Methyl, Methoxy,
 35 Methoxymethyl oder Methylthiomethyl.
 R^1 und R^2 stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Methyl.

- R³** steht bevorzugt für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₃-Alkylthio-C₁-C₂-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl.
- R³** steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, sec-, iso- oder tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, n-, sec-, iso- oder tert-Butoxy, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl, Methylthioethyl, Ethylthioethyl, Cyclopropyl, Phenyl oder Benzyl.
- R³** steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, iso- oder tert-Butyl, Methoxy, iso-Propoxy, iso- oder tert-Butoxy, Methoxymethyl, Methylthiomethyl oder Phenyl.
- 10 R³** steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, iso- oder tert-Butyl, Methoxy, iso-Propoxy, iso- oder tert-Butoxy.
- R³** steht hervorgehoben für Methyl.
- 15 R⁴** steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfinyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkylthio, C₁-C₆-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₂-alkyl, C₃-C₆-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₂-alkyl, (C₁-C₃-Alkyl)carbonyl-C₁-C₂-alkyl, (C₁-C₃-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₂-alkyl; Halogen-(C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₂-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₂-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
- 20** (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₂-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Halogenocycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹.
- 25 R⁴** steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO-CH₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CH₃, -(CH₂)₂-CO-CH(CH₃)₂, -CH₂-CO₂CH₃, -CH₂-CO₂CH₂CH₃, -CH₂-CO₂CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH(CH₃)₂, -CH₂-CO-CF₃, -CH₂-CO-CCl₃, -CH₂-CO-CH₂CF₃, -CH₂-CO-CH₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CF₃.
- 30**
- 35**

- $-(CH_2)_2-CO-CH_2OCH_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CF_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CH_2OCH_3$,
 $-CH_2-CO_2OCH_2OCH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CF_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2OCH_3$,
 $-(CH_2)_2-CO_2OCH_2OCH_3$;
 Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl,
 5 Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluoromethylcarbonyl, Trifluoromethoxycarbonyl, oder $-C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ oder $-CH_2NR^6R^7$.
 R⁴ steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Methoxymethyl, Formyl,
 $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$,
 $-C(=O)CHO$, $-C(=O)C(=O)CH_3$, $-C(=O)C(=O)CH_2OCH_3$, $-C(=O)CO_2CH_3$,
 10 $-C(=O)CO_2CH_2CH_3$.
 R⁴ steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff.
 R⁵ steht bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
 15 R⁵ steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, tert-Butoxy, Methoxymethyl, Cyclopropyl; Trifluormethyl, Trifluormethoxy.
 20 R⁶ und R⁷ stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₆-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₆-alkyl, C₃-C₆-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
 R⁶ und R⁷ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁰ enthalten kann.
 25 R⁶ und R⁷ stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl.
 30 R⁶ und R⁷ bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R¹⁰ substituiert sein kann.
 35

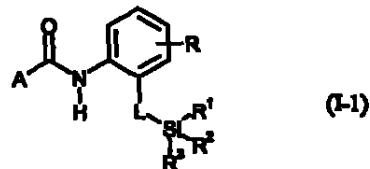
- R^8 und R^9 stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_3 - C_6 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- R^8 und R^9 bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_6 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁰ enthalten kann.
- R^8 und R^9 stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl.
- R^8 und R^9 bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R¹⁰ substituiert sein kann.
- R^{10} steht bevorzugt für Wasserstoff oder C_1 - C_6 -Alkyl.
- R^{10} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl.
- A steht bevorzugt für einen der oben angegebenen Reste A1, A2, A5 oder A7.
- A steht außerdem bevorzugt für A6, A10 oder A11.
- A steht besonders bevorzugt für den Rest A1.
- A steht außerdem besonders bevorzugt für den Rest A2.
- A steht außerdem besonders bevorzugt für den Rest A5.
- A steht außerdem besonders bevorzugt für den Rest A6.
- A steht außerdem besonders bevorzugt für den Rest A7.
- A steht außerdem besonders bevorzugt für den Rest A10.
- A steht außerdem besonders bevorzugt für den Rest A11.
- R^{11} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkoxy oder C_1 - C_6 -Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

- 5 **R¹¹** steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trichlormethoxy, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio oder Trichlormethylthio.
- R¹¹** steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.
- R¹¹** steht insbesondere bevorzugt für Chlor, Brom, Iod, Methyl, Difluormethyl oder Trifluormethyl.
- 10 **R¹²** steht bevorzugt für Iod.
- R¹²** steht außerdem bevorzugt für Chlor.
- R¹²** steht außerdem bevorzugt für Dichlormethyl.
- 15 **R¹³** steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R¹³** steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- R¹³** steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- 20 **R¹⁴** steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R¹⁴** steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.
- 25 **R¹⁴** steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R¹⁴** steht insbesondere bevorzugt für Methyl oder Trifluormethyl.
- 30 **R¹⁵** steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C₁-C₂-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.
- R¹⁵** steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl.
- 35 **R¹⁶** steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C₁-C₂-Halogenalkyl oder C₁-C₂-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

- R¹⁶** steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl.
- R¹⁶** steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.
- R¹⁷** steht bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl.
- R¹⁷** steht besonders bevorzugt Methyl oder Ethyl.
- X** steht bevorzugt für O (Sauerstoff).
- X** steht außerdem bevorzugt für S (Schwefel).
- R¹⁸** steht bevorzugt für Iod.
- R¹⁸** steht außerdem bevorzugt für Methyl.

15

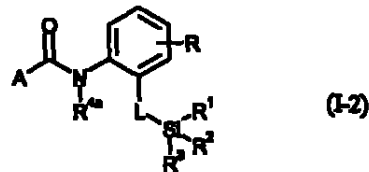
Außerdem hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I-1)



in welcher R, L, R¹, R², R³ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

20

Außerdem hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I-2)



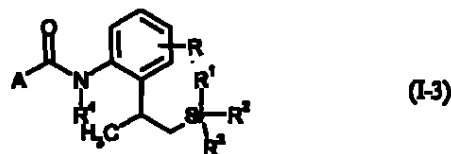
in welcher R, L, R¹, R², R³, R⁴ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

- R^{4a}** steht bevorzugt für C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkylsulfinyl, C₁-C₈-Alkylsulfonyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-Cycloalkyl; C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Halogenalkylthio, C₁-C₈-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₈-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₈-alkyl, (C₁-C₈-Alkyl)carbonyl-C₁-C₈-alkyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₈-alkyl; Halogen-

25

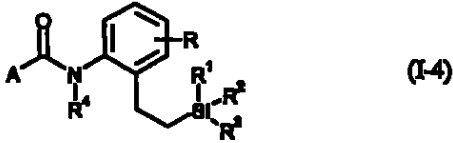
- (C₁-C₃-alkyl)carbonyl-C₁-C₃-alkyl, Halogen-(C₁-C₃-alkoxy)carbonyl-C₁-C₃-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
- (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₆-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Halogenalkoxy)carbonyl,
- 5 (Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Halogen-cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹, wobei R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ die oben angegebenen Bedeutungen haben.
- R^{4a} steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl,
- 10 Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO-CH₂CH₃, -(CH₂)₂-CO-CH(CH₃)₂, -CH₂-CO₂CH₃, -CH₂-CO₂CH₂CH₃, -CH₂-CO₂CH(CH₃)₂, -(CH₂)₂-CO₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CH₃, -(CH₂)₂-CO₂CH(CH₃)₂, -CH₂-CO-CF₃, -CH₂-CO-CCl₃, -CH₂-CO-CH₂CF₃, -CH₂-CO-CH₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CF₃, -(CH₂)₂-CO-CH₂CCl₃, -CH₂-CO₂CH₂CF₃, -CH₂-CO₂CH₂CCl₃, -CH₂-CO₂CF₂CF₃, -CH₂-CO₂CF₂CCl₃, -CH₂-CO₂CCl₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CF₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CF₂CF₃, -(CH₂)₂-CO₂CH₂CCl₃, -(CH₂)₂-CO₂CCl₂CCl₃;
- 15 Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluormethylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹, wobei R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ die oben angegebenen Bedeutungen haben.
- 25 R^{4a} steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Methoxymethyl, Formyl, -CH₂-CHO, -(CH₂)₂-CHO, -CH₂-CO-CH₃, -CH₂-CO-CH₂CH₃, -CH₂-CO-CH(CH₃)₂, -C(=O)CHO, -C(=O)C(=O)CH₃, -C(=O)C(=O)CH₂OCH₃, -C(=O)CO₂CH₃, -C(=O)CO₂CH₂CH₃.

- 30 Außerdem hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I-3)



in welcher R, R¹, R², R³, R⁴ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Außerdem hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I-4)



in welcher R, R¹, R², R³, R⁴ und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

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

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

10

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

- 15 Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen bzw. Erläuterungen können zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.

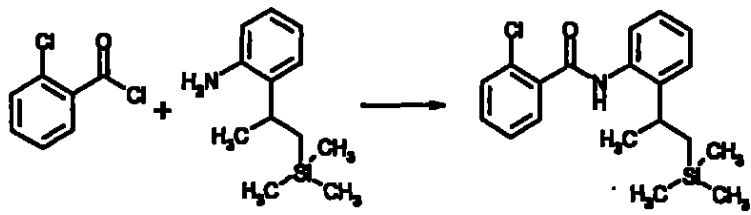
Erläuterungen der Verfahren und Zwischenprodukte

20

Verfahren (a)

Verwendet man beispielsweise 2-Chlorbenzoylchlorid und (2-[1-Methyl-2-(trimethylsilyl)ethyl]phenyl)amin als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

25



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Carbonsäure-Derivate sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) hat A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits

im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden. X^1 steht bevorzugt für Chlor, Brom oder Hydroxy.

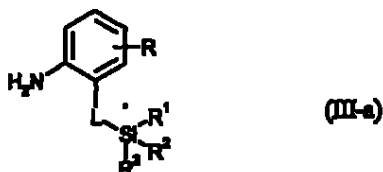
- 5 Carbonsäure-Derivate der Formel (II) sind bekannt und/oder können nach bekannten Methoden erhalten werden (vgl. WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301, EP-A 0 589 313 und DE-A 103 25 439.0).

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

15

Die Amine der Formel (III) sind bekannt und/oder können auf bekannte Weise erhalten werden (vgl. WO 03/080628 und die Herstellungsbeispiele).

- Amine der Formel (III), in welcher R^4 nicht für Wasserstoff steht, können beispielsweise erhalten werden, indem man Amine der Formel (III-a)



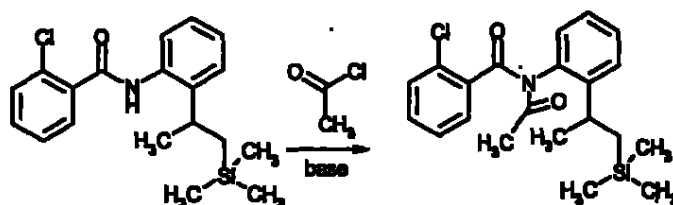
in welcher R, L, R^1 , R^2 und R^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben, mit Halogeniden der Formel (VIII)



- 25 in welcher X^2 und R^4 die oben angegebenen Bedeutungen haben, umsetzt [die Reaktionsbedingungen des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) gelten entsprechend].

Verfahren (b)

- 30 Verwendet man 2-Chlor-N-(2-[1-methyl-2-(trimethylsilyl)ethyl]phenyl)benzamid und Acetylchlorid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten silylierten Carboxamide sind durch die Formel (I-1) allgemein definiert. In dieser Formel (I-1) haben R, L, R¹, R², R³, R⁴ und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Die Verbindungen der Formel (I-1) sind erfindungsgemäße Verbindungen und können nach dem Verfahren (a) hergestellt werden.

Reaktionsbedingungen

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-tert-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonnitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformamid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

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

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

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

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Kondensationsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Amidierungsreaktionen verwendbaren Kondensationsmittel infrage. Beispielshaft genannt seien Säurehalogenidbildner wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid oder Thionylchlorid; Anhydridbildner wie Chlormeisensäureethylester, Chlormeisensäuremethylester, Chlormeisensäureisopropylester, Chlormeisensäureisobutylester oder Methansulfonylchlorid; Carbodiimide, wie N,N-Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder andere übliche Kondensationsmittel, wie Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol, 2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EDQ), Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff oder Brom-tripyrrolidimphosphonium-hexafluorophosphat.

Das erfindungsgemäße Verfahren (a) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Beispielsweise genannt seien 4-Dimethylaminopyridin, 1-Hydroxy-benzotriazol oder Dimethylformamid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 120°C, besonders bevorzugt bei Temperaturen von 10°C bis 80°C.

5

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

- 10 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Carbonsäure-Derivates der Formel (II) im Allgemeinen 0,8 bis 15 Mol, vorzugsweise 0,8 bis 8 Mol an Amin der Formel (III) und 1 bis 3 Mol eines Säurebindemittels ein.

- 15 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) setzt man pro Mol an silyliertem Carboxamid der Formel (I-1) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, bevorzugt 0,5 bis 2 Mol eines Halogenids der Formel (VIII) ein.

- Wenn nicht anders angegeben, werden alle erfindungsgemäßen Verfahren im Allgemeinen unter
20 Normaldruck durchgeführt. Es ist jedoch auch möglich, unter erhöhtem oder vermindertem Druck – im Allgemeinen zwischen 0,1 bar und 10 bar – zu arbeiten.

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

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

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

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

- 35 Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;
Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

- Erwinia-Arten, wie beispielsweise *Erwinia amylovora*;
 Pythium-Arten, wie beispielsweise *Pythium ultimum*;
 Phytophthora-Arten, wie beispielsweise *Phytophthora infestans*;
 Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudoperonospora humuli* oder
 5 *Pseudoperonospora cubensis*;
 Plasmopara-Arten, wie beispielsweise *Plasmopara viticola*;
 Bremia-Arten, wie beispielsweise *Bremia lactucae*;
 Peronospora-Arten, wie beispielsweise *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;
 Erysiphe-Arten, wie beispielsweise *Erysiphe graminis*;
 10 Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise *Sphaerotheca fuliginea*;
 Podosphaera-Arten, wie beispielsweise *Podosphaera leucotricha*;
 Venturia-Arten, wie beispielsweise *Venturia inaequalis*;
 Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise *Pyrenophora teres* oder *P. graminea*
 (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);
 15 Coeliobolus-Arten, wie beispielsweise *Coeliobolus sativus*
 (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);
 Uromyces-Arten, wie beispielsweise *Uromyces appendiculatus*;
 Puccinia-Arten, wie beispielsweise *Puccinia recondita*;
 Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise *Sclerotinia sclerotiorum*;
 20 Tilletia-Arten, wie beispielsweise *Tilletia caries*;
 Ustilago-Arten, wie beispielsweise *Ustilago nuda* oder *Ustilago avenae*;
 Pellicularia-Arten, wie beispielsweise *Pellicularia sasakii*;
 Pyricularia-Arten, wie beispielsweise *Pyricularia oryzae*;
 Fusarium-Arten, wie beispielsweise *Fusarium culmorum*;
 25 Botrytis-Arten, wie beispielsweise *Botrytis cinerea*;
 Septoria-Arten, wie beispielsweise *Septoria nodorum*;
 Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise *Leptosphaeria nodorum*;
 Cercospora-Arten, wie beispielsweise *Cercospora canescens*;
 Alternaria-Arten, wie beispielsweise *Alternaria brassicae*;
 30 Pseudocercospora-Arten, wie beispielsweise *Pseudocercospora harpotrichoides*,
 Rhizoctonia-Arten, wie beispielsweise *Rhizoctonia solani*.

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

- 35 Mikroorganismen.

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

5

Unter unerwünschten Mikroorganismen sind im vorliegenden Fall phytopathogene Pilze, Bakterien und Viren zu verstehen. Die erfindungsgemäßen Stoffe können also eingesetzt werden, um Pflanzen innerhalb eines gewissen Zeitraumes nach der Behandlung gegen den Befall durch die genannten Schadereger zu schützen. Der Zeitraum, innerhalb dessen Schutz herbeigeführt wird, erstreckt sich im allgemeinen von 1 bis 10 Tage, vorzugsweise 1 bis 7 Tage nach der Behandlung der Pflanzen mit den Wirkstoffen.

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

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

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

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

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle

oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Spross, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stängel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

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

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

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

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:

- Alternaria, wie Alternaria tenuis,
- Aspergillus, wie Aspergillus niger,
- Chaetomium, wie Chaetomium globosum,

- Coniophora, wie Coniophora picturata,
 Lentinus, wie Lentinus tigrinus,
 Penicillium, wie Penicillium glaucum,
 Polyporus, wie Polyporus versicolor,
 5 Aureobasidium, wie Aureobasidium pullulans,
 Sclerophoma, wie Sclerophoma pityophila,
 Trichoderma, wie Trichoderma viride,
 Escherichia, wie Escherichia coli,
 Pseudomonas, wie Pseudomonas aeruginosa,
 10 Staphylococcus, wie Staphylococcus aureus.

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

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

Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen infrage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylaryl-polyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiemittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

5

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

10

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

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

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

20

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen infrage:

- 25 **Fungizide:**

2-Phenylphenol; 8-Hydroxychinolinsulfat; Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidofumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprime; Anilazine; Azoxystrobin; Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamocil; Benzamocil-isobutyl; Bifenafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitartrat; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Butiobate; Butylamin; Calcium polysulfide; Capsinmycin; Captan; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazole; Chlorfenzole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolinate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyproflumaz; Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlorone; Dichlorophen; Diolocymet; Diclomazine; Diclolan; Diethofencarb; Difenoconazole; Diflufenoxim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Dimiconazole; Dimiconazole-M; Dinocap; 35 Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithionon; Dodine; Drazoxolon; Edifenphos; Epoxiconazole; Ethabonum; Ethirimol; Etridiazole; Fenoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole;

- Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Flusazinam; Flubenzimidine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoramide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamid; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbamil; Furnecyclox; Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesil); Iodocarb; Ipreconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irunamycin; Isoprothiolane; Isovaldione; Kasugamycin; Kresoxim-methyl; Mancozeb; Maneb; Metaximzone; Mepanipyridin; Mexproil; Metaxyl; Metaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfluroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfosax; Miltionmycin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl;
- 10 Noviflumuron; Nusimol; Ofurace; Oryastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxpocconazole; Oxy-carbo-xin; Oxyfenbutin; Paclobutrazol; Pefurazate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propamoxine-sodium; Propiconazole; Propinab; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclastrobin; Pyrazophos; Pyrisfenox; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyflur; Pyrrolitrine; Quinconazole; Quinoxifen; Quintozan;
- 15 Simeconazole; Spiraxamine; Sulfur; Tebuconazole; Teclofalam; Tecnazene; Tetrazolacis; Tetraconazole; Thiebendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-methyl; Tolyflumid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triflorine; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorphenyl)-2-propinyl]oxy]-3-methoxyphenyl]-ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamid; 1-(1-Naphthalenyl)-1H-pyrazol-2,5-dion; 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin; 2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolcarboxamid; 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid; 3,4,5-Trichlor-2,6-pyridindicarbo-
- 20 nitril; Actinovate; cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol; Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat; Monokaliumcarbonat; N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropencarboxamid; N-Butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amin; Natrium-tetraethiocarbonat; sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; Kupferhydroxid; Kupfernaphthenat; Kupferoxychlorid; Kupfersulfat; Cufraneb; Kupferoxid; Mancooper; Oxine-copper.
- 25

Bakterizide:

- 30 Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin, Oethilicon; Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Teclofalam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

- 35 Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin, Allethrin 1R-isomers, Alpha-

- 9768, Novahuron, Noviflumuron, OK-5101, OK-S201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxazaryl, Oxydemeton-methyl, Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-methyl, Parathion (-ethyl), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-6045, Phenothrin (1R-trans isomer), Phenothate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butoxide, Pirimicarb, 5 Pirimiphos-methyl, Pirimiphos-ethyl, Prallethrin, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propargite, Pro-petamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbuta, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyrethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen, Quinalphos, Reamethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad, Spirodiclofen, Spiromesifen, Sulfuramid, Sulfotep, Sulpro- 10 fos, SZI-121, Tau-Fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Teflu-thrin, Temephos, Temvinphos, Terbam, Terbufos, Tetrahydrovinphos, Tetradifen, Tetramethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiacloprid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatrithos, Thioacylam hydrogen oxalate, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosulfap-sodium, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralocyrthrin, Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Tri- 15 azophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, Vamiprole, Verbutin, Verticillium leonii, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, Xylylcarb, ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901, die Verbindung 3-Methyl-phenyl-propylcarbamat (Tammicide Z), die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluor-ethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3- 20 endo-Isomere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO-96/37494, WO-98/25923), sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren enthalten.

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

25

- Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphaseische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, 30 Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

- 35 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, wie gebrauchsfertige Lösungen, Suspensionen, Spritzpulver, Pasten, Kälische

Pulver, Stäubemittel und Granulate angewendet werden. Die Anwendung geschieht in üblicher Weise, z.B. durch Gießen, Verspritzen, Versprühen, Verstreuen, Verstäuben, Verschäumen, Bestreuen usw. Es ist ferner möglich, die Wirkstoffe nach dem Ultra-Low-Volume-Verfahren auszubringen oder die Wirkstoffzubereitung oder den Wirkstoff selbst in den Boden zu injizieren. Es kann auch das Saatgut der Pflanzen behandelt werden.

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

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

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

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch überadditive („synergistische“) Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen

Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

5

- Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhalten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits“) verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum,
- 10 erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen
- 15 gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Apfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel,
- 20 Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus Thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den
- 25 Pflanzen erzeugt werden (im Folgenden „Bt Pflanzen“). Als Eigenschaften („Traits“) werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits“) werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, z.B. Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. „PAT“-
- 30 Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits“) verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für „Bt Pflanzen“ seien Maisorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B.
- 35 Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotex® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maisorten, Baumwollsorten und

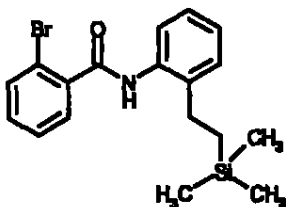
Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien
5 auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits“).

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

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

Herstellungbeispiele

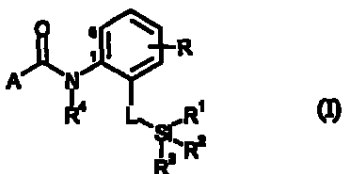
Beispiel 1



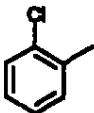
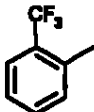
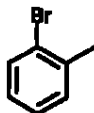
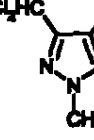
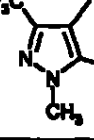
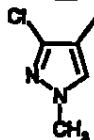
5 425 mg 2-(2-Trimethylsilyl-ethyl)-phenylamin (2.2 mmol) und 438 mg (2.0 mmol) 2-Bromobenzoylchlorid wurden in 20 ml Acetonitril gelöst und 332 mg (2.4 mmol) Kaliumcarbonat zugegeben. Das Reaktionsgemisch wurde 18 h bei Raumtemperatur gerührt, dann 20 ml Wasser zugegeben und mit Essigsäureethylester extrahiert und über Natriumsulfat getrocknet. Nach Entfernung des Lösungsmittels und stütenschromatographischer Reinigung über Kieselgel 60 (Laufmittel: Methylchlorid) wurden 405 mg (54 % der Theorie) an 2-Brom-N-[2-(2-trimethylsilyl-ethyl)-phenyl]-benzamid erhalten [LogP (pH 2.3) = 4.32].

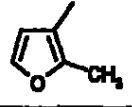
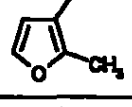
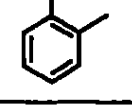
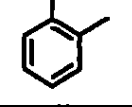
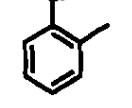
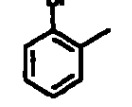
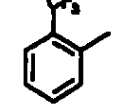
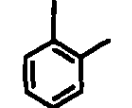
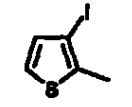
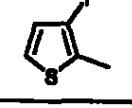
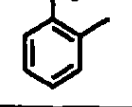
Analog Beispiel 1 sowie entsprechend den Angaben in der allgemeinen Beschreibung der erfindungs-
 15 geübten Herstellverfahren (a) und (b) wurden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 genannten Verbindungen der Formel (I) erhalten:

Tabelle 1



Bsp.	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
2	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.67
3	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.63
4	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.40

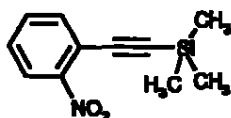
Bsp.	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
5	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.29
6	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.37
7	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.58
8	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.68
9	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.95
10	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.19
11	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.73
12	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		5.05
13	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.43
14	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.89
15	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3.94

Bsp.	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
16	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.03
17	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.33
18	H	*-CH=CH-#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.76
19	H	*-CH=CH-#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.97
20	H	*-CH=CH-#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.86
21	H	*-CH=CH-#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.83
22	4-F	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.61
23	4-F	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.64
24	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.85
25	4-F	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.79
26	4-F	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4.39

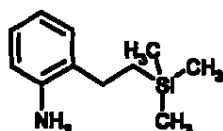
Die mit Stern (*) markierte Bindung ist mit dem den Anilinrest verknüpft, die mit Raute (#) markierte Bindung mit dem Silicium-Substituenten verbunden.

Herstellung von Ausgangsstoffen der Formel (III)Beispiel (III-1)

- 5 17.7 g Anilin (0.19 mol), 50 g Allyltrimethylsilan (0.44 mol), 1.5 g Aluminiumtrichlorid (0.01 mol) und 0.5 g Aluminiumpulver (0.02 mol) wurden gemischt und im Autoklaven für 10 h bei 255°C gerührt. Nach Abkühlen auf Raumtemperatur wurden zuerst 100 ml Toluol, dann 40 ml einer 40%igen NaOH-Lösung in Wasser und 100 ml Wasser zugegeben und 15 min bei 35°C gerührt. Nach dem Abkühlen wurde mit Toluol extrahiert, mit Wasser gewaschen, über Kaliumcarbonat
- 10 getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Nach Destillation (55°C-60°C, 0.08 mbar) erhielt man 1.4 g 2-(1-Methyl-2-trimethylsilyl-ethyl)-phenylamin [LogP (pH 2.3) = 3.05].

Beispiel (III-2)Stufe 1

- 15 4 g (20 mmol) ortho-Bromonitrobenzol, 842 mg (1.2 mmol) Bis(triphenylphosphin)palladium(II)chlorid und 230 mg (1.2 mmol) Kupfer(I)diodid wurden in 40 ml Triethylamin unter Argon vorgelegt. Anschließend wurde bei Raumtemperatur innerhalb von 10 min 2.95 g (30 mmol) Trimethylsilylacetylen zuge tropft und 2 Tage bei Raumtemperatur gerührt. Das Reaktionsgemisch wurde auf 50 ml Wasser gegossen, 3 mal mit je 50 ml Diethylether extrahiert, über Natriumsulfat getrocknet und eingedampft.
- 20 Nach säulenchromatographischer Reinigung über Kieselgel 60 (Laufmittel: Cyclohexan/Ethylacetat 3:1) wurden 4.2 g (96 % der Theorie) an Trimethyl-(2-nitro-phenylethynyl)-silan erhalten [LogP (pH 2.3) = 4.12].

Stufe 2

- 10.9 g (50 mmol) Trimethyl-(2-nitro-phenylethynyl)-silan wurden in 200 ml Methanol gelöst und 0.5 g Palladium-Kohle (5 %) zugegeben. Anschließend wurde im Autoklaven 12 h bei 4 bar hydriert. Nach Entfernung des Lösungsmittels und säulenchromatographischer Reinigung über Kieselgel 60

(Laufmittel: Methylenchlorid) wurden 4.1 g an 2-(2-Trimethylsilyl-ethyl)-phenylamin erhalten [LogP (pH 2.3) = 2.58].

- 5 Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.
Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich (pH 2,3): 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.
- 10 Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren LogP-Werte bekannt sind (Bestimmung der LogP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).
Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

AnwendungsbeispieleBeispiel A**5 Venturia-Test (Apfel) / protektiv**

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

10

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

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

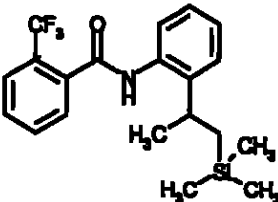
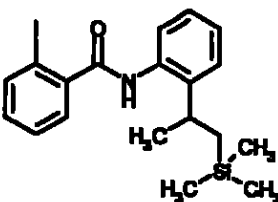
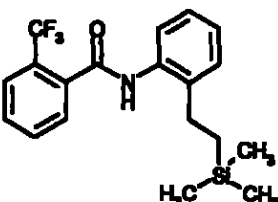
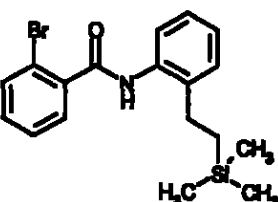
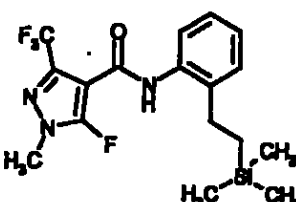
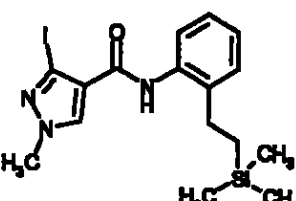
20 Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 21°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 90 % aufgestellt.

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

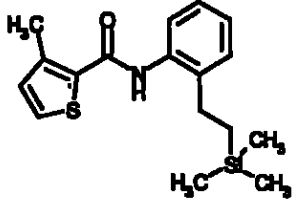
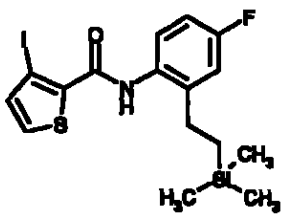
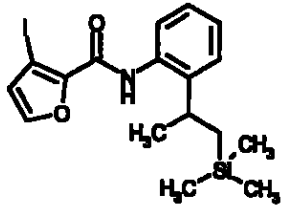
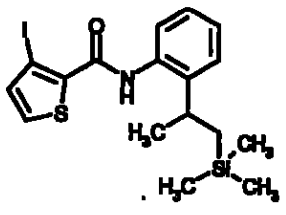
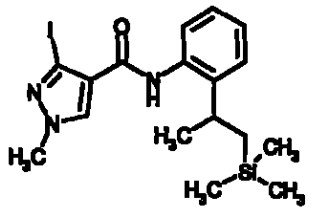
25 Befall beobachtet wird.

Tabelle A

Venturia-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	100	99
	100	100
	100	84
	100	87
	100	100
	100	100

Venturia-Test (Apfel) / protaktiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100
	100	99

Beispiel B**Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv**

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

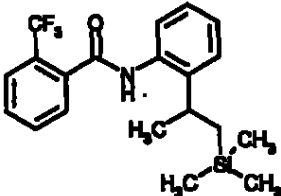
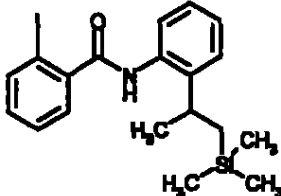
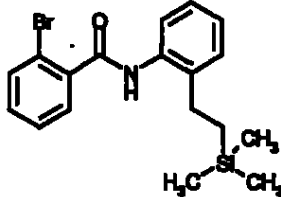
10 Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit bespritzt man junge Gurkepflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge. 1 Tag nach der Behandlung werden die Pflanzen mit einer Sporensuspension von *Sphaerotheca fuliginea* inokuliert. Anschließend werden die Pflanzen in einem Gewächshaus bei 70 % relativer Luftfeuchtigkeit und einer Temperatur von 23°C aufgestellt.

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

Tabelle B

Sphaerotheca-Test (Gurke) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	750	100
	750	100
	750	100

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

- 5 Lösungsmittel: 50 Gewichtsteile N,N-Dimethylacetamid
 Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

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

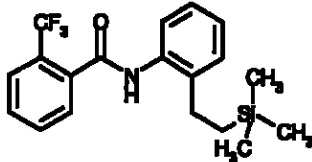
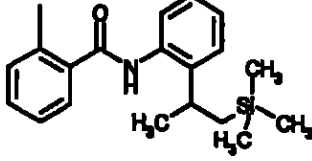
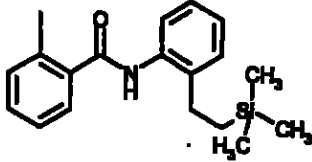
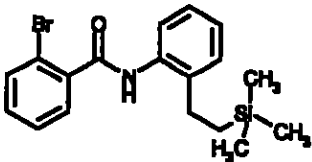
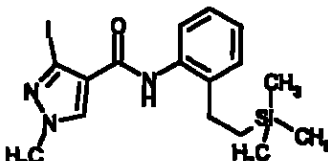
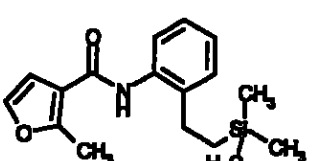
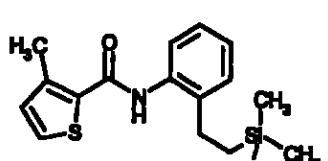
15 Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandsmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Konidien suspension von *Puccinia recondita* besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und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

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

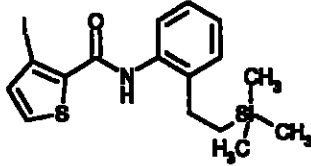
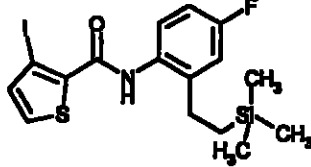
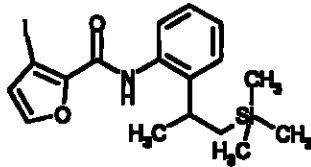
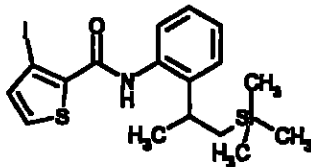
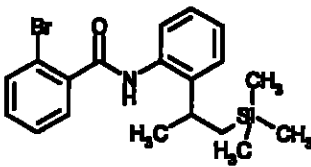
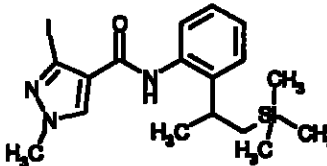
20 10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabelle C

Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

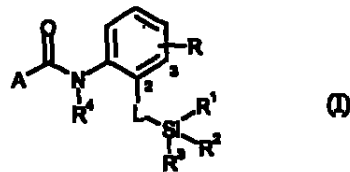
Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	93
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

Patentansprüche

1. Silylierte Carboxamide der Formel (I)



5 in welcher

R für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

L für eine direkte Bindung oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes geradkettiges oder verzweigtes Alkyl (Alkandiy), Alkenyl (Alkendiyl) oder Alkinylen (Alkindiy) steht,

10

R¹ und R² unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₁-C₈-alkyl oder C₁-C₈-Halogenalkyl stehen,

R³ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-Alkylthio-C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-Alkenyl, C₂-C₈-Alkinyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₂-C₈-Halogenalkyl, C₂-C₈-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, oder für jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenyl oder Phenylalkyl steht,

15

R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkylsulfinyl, C₁-C₈-Alkylsulfonyl, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Halogenalkylthio, C₁-C₈-Halogenalkylsulfinyl, C₁-C₈-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-Halogenalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C₁-C₈-alkyl, (C₁-C₈-Alkyl)carbonyl-C₁-C₈-alkyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl-C₁-C₈-alkyl; Halogen-(C₁-C₈-alkyl)carbonyl-C₁-C₈-alkyl, Halogen-(C₁-C₈-alkoxy)carbonyl-C₁-C₈-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

20

(C₁-C₈-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl)carbonyl, (C₂-C₈-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₈-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₈-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl)carbonyl, (C₂-C₈-Halogenalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(=O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹ steht,

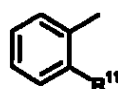
25

30

R⁵ für Wasserstoff, C₁-C₈-Alkyl, C₁-C₈-Alkoxy, C₁-C₈-Alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₈-Halogenalkyl, C₁-C₈-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl, C₂-C₈-Halogenalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

- R^6 und R^7 unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Alkoxy- C_1 - C_8 -alkyl, C_2 - C_8 -Cycloalkyl; C_1 - C_8 -Halogenalkyl, Halogen- C_1 - C_8 -alkoxy- C_1 - C_8 -alkyl, C_2 - C_8 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- 5 R^6 und R^7 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_8 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^{10} enthalten kann,
- 10 R^8 und R^9 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1 - C_8 -Alkyl, C_2 - C_8 -Cycloalkyl; C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_2 - C_8 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- R^8 und R^9 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1 - C_8 -Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden,
- 15 wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^{10} enthalten kann,
- R^{10} für Wasserstoff oder C_1 - C_8 -Alkyl steht,

- 20 A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht, in welcher

R^{11} für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C_1 - C_8 -Alkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkyl, C_1 - C_8 -Halogenalkoxy oder C_1 - C_8 -Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

25 oder

- A für den Rest der Formel (A2)

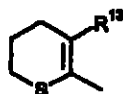


(A2) steht, in welcher

R^{12} für Chlor, Iod oder Dichlormethyl steht,

oder

- 30 A für den Rest der Formel (A3)

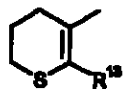


(A3) steht, in welcher

R¹³ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)

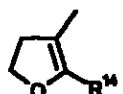


(A4) steht, in welcher

R¹³ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)

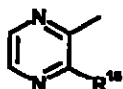


(A5) steht, in welcher

R¹⁴ für C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A6)

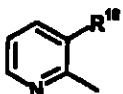


(A6) steht, in welcher

R¹⁵ für Wasserstoff, Halogen, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)

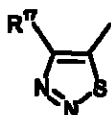


(A7) steht, in welcher

R¹⁶ für Halogen, Hydroxy, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio oder C₁-C₄-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A8)

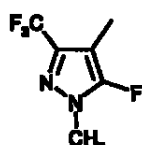


(A8) steht, in welcher

R¹⁷ für C₁-C₄-Alkyl steht,

oder

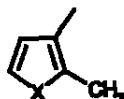
A für den Rest der Formel (A9)



(A9) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)



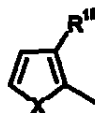
(A10) steht, in welcher

5

X für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



(A11) steht, in welcher

10

X für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

R¹⁸ für Iod oder Methyl steht.

2. Silylierte Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass

R für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl oder Trifluormethyl steht,

15

L für eine direkte Bindung oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen substituier-
tes geradkettiges oder verzweigtes C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkanylen oder C₂-C₆-Alki-
nylen steht,

R¹ und R² unabhängig voneinander für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkoxy-C₁-C₂-
alkyl oder C₁-C₃-Alkylthio-C₁-C₂-alkyl stehen,

20

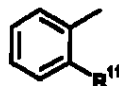
R³ für C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₂-Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, C₁-C₂-Alkylthio-C₁-C₂-
alkyl, C₂-C₆-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl steht,

R⁴ für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₆-Alkylsulfonyl, C₁-C₂-
Alkoxy-C₁-C₂-alkyl, C₂-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Halogenalkylthio,
C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, C₁-C₆-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C₁-C₂-alkoxy-C₁-
C₂-alkyl, C₂-C₆-Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Brom-
atomen; Formyl, Formyl-C₁-C₂-alkyl, (C₁-C₂-Alkyl)carbonyl-C₁-C₂-alkyl, (C₁-C₂-
Alkoxy)carbonyl-C₁-C₂-alkyl; Halogen-(C₁-C₂-alkyl)carbonyl-C₁-C₂-alkyl, Halogen-
(C₁-C₂-alkoxy)carbonyl-C₁-C₂-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder
Bromatomen;

25

- (C₁-C₆-Alkyl)carbonyl, (C₁-C₆-Alkoxy)carbonyl, (C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Cycloalkyl)carbonyl; (C₁-C₄-Halogenalkyl)carbonyl, (C₁-C₄-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl)carbonyl, (C₃-C₆-Halogen-cycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder
- 5 $-C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ oder $-CH_2NR^8R^9$ steht,
- R^5 für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,
- 10 R^6 und R^7 unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, Halogen-C₁-C₃-alkoxy-C₁-C₃-alkyl, C₃-C₆-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- R^6 und R^7 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen bilden, wobei
- 15 der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁰ enthalten kann,
- R^8 und R^9 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl; C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₆-Halogen-cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,
- 20 R^8 und R^9 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C₁-C₆-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR¹⁰ enthalten kann,
- 25 R^{10} für Wasserstoff oder C₁-C₆-Alkyl steht,

A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht, in welcher

30 R^{11} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₂-Halogenalkyl, C₁-C₂-Halogenalkoxy oder C₁-C₂-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

35 A für den Rest der Formel (A2)

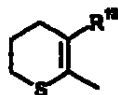


(A2) steht, in welcher

R^{12} für Chlor, Iod oder Dichlormethyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A3)



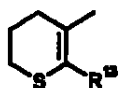
(A3) steht, in welcher

5

R^{13} für Methyl, Ethyl oder C_1-C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)



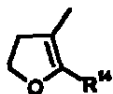
(A4) steht, in welcher

10

R^{13} für Methyl, Ethyl oder C_1-C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)



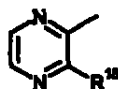
(A5) steht, in welcher

15

R^{14} für Methyl, Ethyl oder C_1-C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A6)



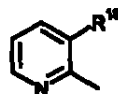
(A6) steht, in welcher

20

R^{15} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2 -Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)



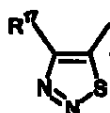
(A7) steht, in welcher

25

R^{16} für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, C_1 - C_4 -Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C_1 - C_2 -Halogenalkyl oder C_1 - C_2 -Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

5 oder

A für den Rest der Formel (A8)



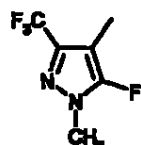
(A8) steht, in welcher

R^{17} für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl steht,

oder

10

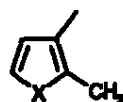
A für den Rest der Formel (A9)



(A9) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)



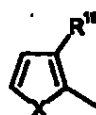
(A10) steht, in welcher

15

X für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



(A11) steht, in welcher

X für O (Sauerstoff) oder S (Schwefel) steht,

20

R^{18} für Iod oder Methyl steht.

3. Verfahren zum Herstellen von silylierten Carbonsäure-derivaten der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, dass man

a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)



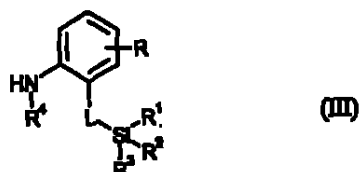
(II)

25

in welcher

X^1 für Halogen oder Hydroxy steht und

A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,
mit Aminen der Formel (III)

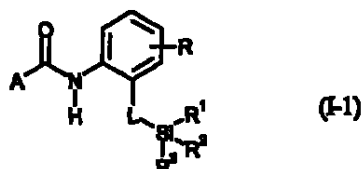


5 in welcher R, L, R^1 , R^2 , R^3 und R^4 die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

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

10 oder

b) silylierte Carbonsamide der Formel (I-1)



in welcher R, L, R^1 , R^2 , R^3 und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

15 mit Halogeniden der Formel (VIII)



in welcher

X^2 für Chlor, Brom oder Iod steht,

20 R^4 für C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Alkylsulfonyl, C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl; C_1 - C_6 -Halogenalkyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylthio, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfinyl, C_1 - C_6 -Halogenalkylsulfonyl, Halogen- C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -Halogenocycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl- C_1 - C_6 -alkyl, (C_1 - C_6 -Alkyl)-carbonyl- C_1 - C_6 -alkyl, (C_1 - C_6 -Alkoxy)carbonyl- C_1 - C_6 -alkyl; Halogen-(C_1 - C_6 -alkyl)carbonyl- C_1 - C_6 -alkyl, Halogen-(C_1 - C_6 -alkoxy)carbonyl- C_1 - C_6 -alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;

25

(C_1 - C_6 -Alkyl)carbonyl, (C_1 - C_6 -Alkoxy)carbonyl, (C_1 - C_6 -Alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl)carbonyl, (C_3 - C_6 -Cycloalkyl)carbonyl; (C_1 - C_6 -Halogenalkyl)carbonyl, (C_1 - C_6 -Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen- C_1 - C_6 -alkoxy- C_1 - C_6 -alkyl)carbo-

nyl, (C₁-C₈-Halogenocycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder -C(=O)C(-O)R⁵, -CONR⁶R⁷ oder -CH₂NR⁸R⁹ steht, wobei R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ und R⁹ die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

5 in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

4. Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem silylierten Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.
- 10 5. Verwendung von silylierten Carboxamiden der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen.
6. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man silylierten Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.
- 15 7. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man silylierten Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.
- 20

BCS 03 3034-CO

- 1 -

CARBOXAMIDAS SILILADAS.**Campo de la invención**

La presente invención se refiere a nuevas carboxamidas sililadas, a varios procedimientos para su obtención y a su empleo para la lucha contra los

5 microorganismos indeseables.

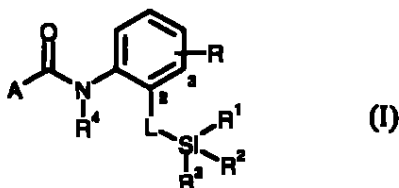
Antecedentes de la invención

Se sabe ya que un gran número de carboxamidas tienen propiedades fungicidas (véanse por ejemplo las publicaciones WO 03/080628, WO 03/010149, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099). La actividad de estos productos es buena pero, sin embargo, deja

10 mucho que desear en algunos casos por ejemplo con ocasión de cantidades de aplicación bajas.

Descripción detallada de la invención

Se han encontrado ahora nuevas carboxamidas sililadas de la fórmula (I)



15 en la que

R significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo, iso-propilo, metiltio o trifluórmétilo,

L significa un enlace directo o significa alquileo (alcanodiilo), alquenileno (alquenodiilo), o alquinileno (alquinodiilo) de cadena lineal o de cadena ramificada, substituidos respectivamente en caso dado,

20 R^1 y R^2 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 6 átomos

- 2 -

de carbono,

- R³** significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquienilo con 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 8 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquienilo con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, o significa fenilo o fenilalquilo substituidos respectivamente en caso dado,
- 10 R⁴** significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; halógeno-(alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógeno-(alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo;
- 20**
- 25** (alquilo con 1 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos

- 3 -

- de carbono)carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)carbonilo, (halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono)carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono)carbonilo con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; o significa $-C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ o $-CH_2NR^8R^9$,
- 5 R^5 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,
- 10 R^6 y R^7 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,
- 15 R^6 y R^7 significan además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo 5 a 8 átomos en el anillo saturado, substituido en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^{10} ,
- 20 R^6 y R^7 significan además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo 5 a 8 átomos en el anillo saturado, substituido en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^{10} ,
- 25 R^8 y R^9 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con

- 4 -

1 a 8 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^8 y R^9 significan además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo con 5 a 8 átomos en el anillo saturado, substituido en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^{10} ,

R^{10} significa hidrógeno o alquilo con 1 a 6 átomos de carbono,

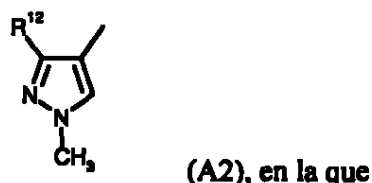
A significa el resto de la fórmula (A1)



R^{11} significa hidrógeno, halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de halógeno,

15 o

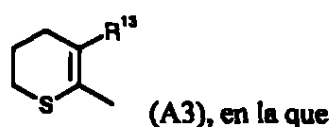
A significa el resto de la fórmula (A2)



R^{12} significa cloro, yodo o diclorometilo,

o

20 A significa el resto de la fórmula (A3)



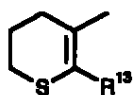
- 5 -

R¹³ significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A4)

5



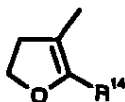
(A4), en la que

R¹³ significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A5)

10



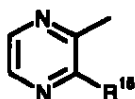
(A5), en la que

R¹⁴ significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A6)

15

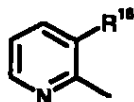


(A6), en la que

R¹⁵ significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

20 **A** significa el resto de la fórmula (A7)



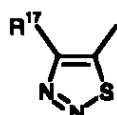
(A7), en la que

- 6 -

R^{16} significa halógeno, hidroxilo, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A8)

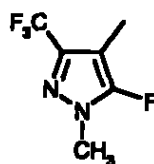


(A8), en la que

R^{17} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

10 o

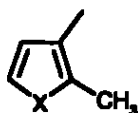
A significa el resto de la fórmula (A9)



(A9),

o

A significa el resto de la fórmula (A10)

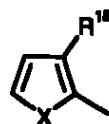


(A10), en la que

X significa O (oxígeno) o S (azufre),

o

A significa el resto de la fórmula (A11)



(A11), en la que

- 7 -

X significa O (oxígeno) o S (azufre),

R¹⁸ significa yodo o metilo.

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

Se ha encontrado, además, que se obtienen las carboxamidas sililadas de la fórmula (I), si

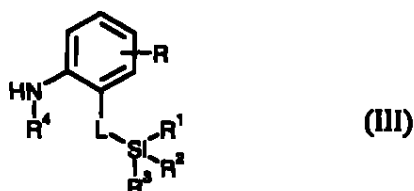
a) se hacen reaccionar derivados de ácidos carboxílicos de la fórmula (II)



en la que

X¹ significa halógeno o hidroxilo y

A tiene los significados anteriormente indicados, con aminas de la fórmula (III)

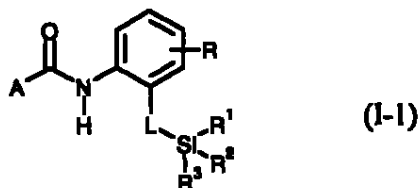


en la que R, L, R¹, R², R³ y R⁴ tienen los significados anteriormente indicados, en caso dado en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un agente de condensación, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

o

b) se hacen reaccionar carboxamidas sililadas de la fórmula (I-1)

- 8 -



en la que R, L, R¹, R², R³ y A tienen los significados anteriormente indicados,
con halogenuros de la fórmula (VIII)



5 en la que

X² significa cloro, bromo o yodo,

R^{4a} significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6
átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con
1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo
10 con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de
carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono,
halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono,
halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con
1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
15 halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1
hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con
1 a 3 átomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-
alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de
carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; halógeno-(alquilo
20 con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono,
halógeno-(alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3
átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 átomos de flúor, de
cloro y/o de bromo;

- 9 -

(alquilo con 1 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono)carbonilo; (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)carbonilo, (halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono)carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono)carbonilo con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; o significa $-C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ o $-CH_2NR^8R^9$, donde R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 tienen los significados anteriormente indicados, en presencia de una base y en presencia de un diluyente.

Finalmente se ha encontrado que las nuevas carboxamidas sililadas de la fórmula (I) tienen propiedades microbidas muy buenas y que pueden emplearse para la lucha contra los microorganismos indeseables tanto en la protección de las plantas como en la protección de los materiales.

Las carboxamidas sililadas, según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (I). Las definiciones preferentes de los restos de las fórmulas citadas anteriormente y que se citarán a continuación están dadas seguidamente. Estas definiciones son válidas igualmente para los productos finales de la fórmula (I) y para todos los productos intermedios.

R significa preferentemente hidrógeno.

R significa, además, preferentemente, flúor, encontrándose el flúor de forma especialmente preferente en la posición 4, 5 o 6, de forma muy especialmente preferente en la posición 4 o 6, en particular en la posición 4 del resto de anilida [véase la fórmula (I) anterior].

R significa, además, preferentemente cloro, encontrándose el cloro de forma

- 10 -

- especialmente preferente en la posición 5 del resto de anilida [véase la fórmula (I) anterior].
- R significa, además, preferentemente metilo, encontrándose el metilo de forma especialmente preferente en la posición 3 del resto de anilida [véase la fórmula (I) anterior].
- 5 R significa, además, preferentemente trifluórmétilo, encontrándose el trifluórmétilo de forma especialmente preferente en la posición 4 o en la posición 5 del resto de anilida [véase la fórmula (I) anterior].
- L significa preferentemente un enlace directo, o significa alquileo con 1 a 6 átomos
10 de carbono, alquénileo con 2 a 6 átomos de carbono o alquínileo con 2 a 6 átomos de carbono de cadena lineal o de cadena ramificada, substituidos en caso dado por halógeno.
- L significa de forma especialmente preferente un enlace directo o significa -CH₂-,
-(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, -CH(Me)-, -CH(Me)CH₂-, -CH₂CH(Me)-, -CH(Me)CH(Me)-, -
15 C(Me)₂CH₂-, -CH(Me)-(CH₂)₂-, -CH(Me)-(CH₂)₃-, -CH=CH-, -C(Me)=CH- o -
C≡C-.
- L significa de forma muy especialmente preferente -(CH₂)₂-, -(CH₂)₃-, -CH(Me)-, -
CH(Me)CH₂-, -CH(Me)-(CH₂)₂-, -CH(Me)-(CH₂)₃-, -CH=CH-, -C(Me)=CH- o -
C≡C-.
- 20 R¹ y R² significan, independientemente entre sí, preferentemente alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono o alquiltio con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono.
- R¹ y R² significan, independientemente entre sí, de forma especialmente preferente metilo,
25 etilo, metoxi, etoxi, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, metiltiométilo, etiltiométilo, metiltioetilo o etiltioetilo.

- 11 -

R¹ y R² significan, independientemente entre sí, de forma muy especialmente preferente metilo, metoxi, metoximetilo o metiltiommetilo.

R¹ y R² significan, respectivamente, de forma particularmente preferente, metilo.

5 R³ significa preferentemente alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, fenilo o bencilo.

10 R³ significa de forma especialmente preferente metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, sec-, iso- o terc.-butilo, metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, n-, sec-, iso- o terc.-butoxi, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, metiltiommetilo, etiltiommetilo, metiltioetilo, etiltioetilo, ciclopropilo, fenilo o bencilo.

R³ significa de forma muy especialmente preferente metilo, etilo, n- o iso-propilo, iso- o terc.-butilo, metoxi, iso-propoxi, iso- o terc.-butoxi, metoximetilo, metiltiommetilo o fenilo.

15 R³ significa de forma particularmente preferentemente metilo, etilo, n- o iso-propilo, iso- o terc.-butilo, metoxi, iso-propoxi, iso- o terc.-butoxi.

R³ significa señaladamente metilo.

20 R⁴ significa preferentemente hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, 25 halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con 1 a 3 átomos

- 12 -

- de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; halógeno-(alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógeno-(alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo;
- (alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono)carbonilo;
- (halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono)carbonilo con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; o significa $-C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ o $-CH_2NR^8R^9$.
- R⁴** significa de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o iso-propilsulfinilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o iso-propilsulfonilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, trifluóormetilo, triclorometilo, trifluóoretilo, difluóormetiltio, difluóorclorometiltio, trifluóormetiltio, trifluóormetilsulfinilo, trifluóormetilsulfonilo, trifluóormetoximetilo; formilo, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO-CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO-CF_3$, $-CH_2-CO-CCl_3$, $-CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CF_3$,

- 13 -

$-(CH_2)_2-CO-CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CF_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CCl_3$,
 $-CH_2-CO_2CCl_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CF_2CF_3$,
 $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CCl_2CCl_3$;

metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, iso-propilcarbonilo, terc.-
 5 butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, terc.-butoxicarbonilo,
 ciclopropilcarbonilo; trifluormetilcarbonilo, trifluormetoxicarbonilo, o -
 $C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ o $-CH_2NR^8R^9$.

R^4 significa de forma muy especialmente preferente hidrógeno, metilo, metoximetilo,
 formilo, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$,
 10 $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-C(=O)CHO$, $-C(=O)C(=O)CH_3$, $-C(=O)C(=O)CH_2OCH_3$,
 $-C(=O)CO_2CH_3$, $-C(=O)CO_2CH_2CH_3$.

R^4 significa de forma particularmente preferente hidrógeno.

R^5 significa preferentemente hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi
 con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3
 15 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con
 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-
 alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono,
 halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9
 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

20 R^5 significa de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-
 propilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, terc.-butoxi, metoximetilo,
 ciclopropilo; trifluormetilo; trifluormetoxi.

R^6 y R^7 significan, independientemente entre sí, preferentemente hidrógeno, alquilo
 con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3
 25 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con
 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con

- 14 -

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

5 R^6 y R^7 significan, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, preferentemente un heterociclo con 5 o 6 átomos en el anillo, saturado, substituido en caso dado de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR¹⁰.

10 R^6 y R^7 significan, independientemente entre sí, de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluórmethyl, triclorometilo, trifluóretilo, trifluórmethylmetoximetilo.

15 R^6 y R^7 forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, de forma especialmente preferente un heterociclo saturado, substituido en caso dado de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo o por metilo, de la serie formada por morfolina, tiomorfolina o piperazina, pudiendo estar substituida la piperazina sobre el segundo átomo de nitrógeno por R¹⁰.

20 R^8 y R^9 significan, independientemente entre sí, preferentemente hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

25 R^8 y R^9 forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, preferentemente un heterociclo con 5 o 6 átomos en el anillo, saturado, substituido en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes

- 15 -

por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR¹⁰.

- R⁸ y R⁹ significan, independientemente entre sí, de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluórmethyl, triclorometilo, trifluóretilo, trifluórmethylmetoximetilo.
- 5 R⁸ y R⁹ forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, de forma especialmente preferente un heterociclo saturado, substituido en caso dado de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo o por metilo, de la serie formada por morfolina, tiomorfolina o piperazina, pudiendo estar substituida la piperazina sobre el
- 10 segundo átomo de nitrógeno por R¹⁰.
- R¹⁰ significa preferentemente hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.
- 15 R¹⁰ significa de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo.
- A significa preferentemente uno de los restos anteriormente indicados A1, A2, A5 o A7.
- A significa, además, preferentemente, A6, A10 o A11.
- 20 A significa de forma especialmente preferente, el resto A1.
- A significa, además, de forma especialmente preferente, el resto A2.
- A significa, además, de forma especialmente preferente, el resto A5.
- A significa, además, de forma especialmente preferente, el resto A6.
- A significa, además, de forma especialmente preferente, el resto A7.
- 25 A significa, además, de forma especialmente preferente, el resto A10.
- A significa, además, de forma especialmente preferente, el resto A11.

- 16 -

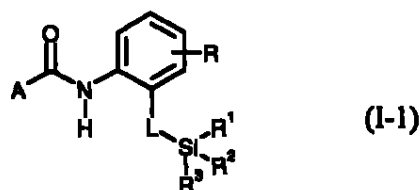
- R¹¹ significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxí, ciano, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono o halógenoalquiltio con 1 a 2 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.
- 5 R¹¹ significa de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxí, ciano, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec.-butilo, terc.-butilo, difluórmtilo, trifluórmtilo, difluórclorometilo, triclorometilo, trifluórmtoxi, difluórmtoxi, difluórclorometoxi, triclorometoxi, trifluórmtiltio, difluórmtiltio, difluórclorometiltio o triclorometiltio.
- 10 R¹¹ significa de forma muy especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, difluórmtilo, trifluórmtilo o triclorometilo.
- R¹¹ significa de forma particularmente preferente cloro, bromo, yodo, metilo, difluórmtilo o trifluórmtilo.
- R¹² significa preferentemente yodo.
- 15 R¹² significa, además, preferentemente cloro.
- R¹² significa, además, preferentemente diclorometilo.
- R¹³ significa preferentemente metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.
- R¹³ significa de forma especialmente preferente metilo, etilo, trifluórmtilo, difluórmtilo, difluórclorometilo o triclorometilo.
- 20 R¹³ significa de forma muy especialmente preferente metilo, trifluórmtilo, difluórmtilo o triclorometilo.
- R¹⁴ significa preferentemente metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.
- 25 R¹⁴ significa de forma especialmente preferente metilo, etilo, trifluórmtilo, difluórmtilo, difluórclorometilo o triclorometilo.

- 17 -

- R¹⁴ significa de forma muy especialmente preferente metilo, trifluórmétilo, difluórmétilo o triclorometilo.
- R¹⁴ significa de forma particularmente preferente metilo o trifluórmétilo.
- R¹⁵ significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o
5 halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.
- R¹⁵ significa de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo o trifluórmétilo.
- R¹⁶ significa preferentemente flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, alquilo con 1 a 4
10 átomos de carbono, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluórmétiltio, trifluórmétiltio, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono o halógenoalcóxi con 1 a 2 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.
- R¹⁶ significa de forma especialmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec.-butilo, terc.-butilo,
15 trifluórmétilo, difluórmétilo, difluórclorometilo, triclorometilo.
- R¹⁶ significa de forma muy especialmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, trifluórmétilo, difluórmétilo o triclorometilo.
- R¹⁷ significa preferentemente metilo, etilo, n-propilo o iso-propilo.
- R¹⁷ significa de forma especialmente preferente metilo o etilo.
- 20 X significa preferentemente O (oxígeno).
- X significa, además, preferentemente S (azufre).
- R¹⁸ significa preferentemente yodo.
- R¹⁸ significa, además, preferentemente metilo.

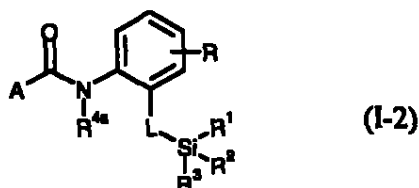
Además, deben señalarse los compuestos de la fórmula (I-1)

- 18 -



en la que R, L, R¹, R², R³ y A tienen los significados anteriormente indicados.

Además, deben señalarse los compuestos de la fórmula (I-2)



5 en la que R, L, R¹, R², R³, R^{4a} y A tienen los significados anteriormente indicados.

R^{4a} significa preferentemente alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro, y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; halógeno-(alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógeno-(alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, con, respectivamente 1 hasta 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; (alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 átomos de

- 19 -

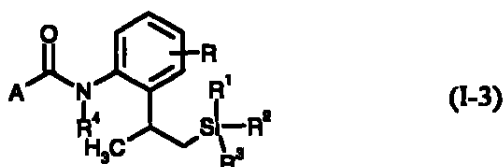
- carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono)carbonilo; (halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono)carbonilo con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; o significa $-C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ o $-CH_2NR^8R^9$, donde R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 tienen los significados anteriormente indicados.
- R^{4a}** significa de forma especialmente preferente metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o isopropilsulfinilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o isopropilsulfonilo, n-, iso-, sec.- o terc.-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, trifluórmétilo, triclorometilo, trifluóretilo, difluórmétiltio, difluorclorometiltio, trifluórmétiltio, trifluórmétilsulfinilo, trifluórmétilsulfonilo, trifluórmétoximetilo; formilo, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO-CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO-CF_3$, $-CH_2-CO-CCl_3$, $-CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CF_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CCl_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CF_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CCl_2CCl_3$; metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, iso-propilcarbonilo, terc.-butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, terc.-butoxicarbonilo, ciclopropilcarbonilo; trifluórmétilcarbonilo, trifluórmétoxicarbonilo, o -

- 20 -

$C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ o $-CH_2NR^8R^9$, donde R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 tienen los significados anteriormente indicados.

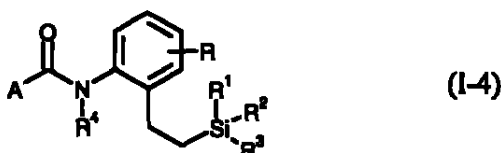
R^{4a} significa de forma muy especialmente preferente metilo, metoximetilo, formilo, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$,
 5 $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-C(=O)CHO$, $-C(=O)C(=O)CH_3$, $-C(=O)C(=O)CH_2OCH_3$,
 $-C(=O)CO_2CH_3$, $-C(=O)CO_2CH_2CH_3$.

Además, deben señalarse los compuestos de la fórmula (1-3)



en la que R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y A tienen los significados anteriormente indicados.

10 Además, deben señalarse los compuestos de la fórmula (1-4)



en la que R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y A tienen los significados anteriormente indicados.

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

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

Los restos substituidos por halógeno, tales como, por ejemplo halógenoalquilo,
 20 están halogenados una o varias veces. En el caso de una halogenación múltiple, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes. En este caso halógeno significa flúor, cloro, bromo o yodo, especialmente significa flúor, cloro o bromo.

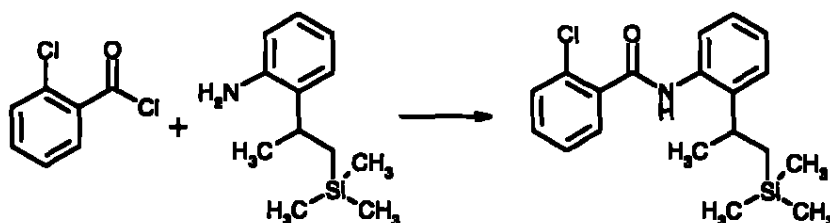
- 21 -

Las definiciones de los restos o bien las explicaciones dadas anteriormente de manera general, o indicadas en los intervalos preferentes, pueden combinarse también arbitrariamente entre sí, es decir entre los intervalos correspondientes y los intervalos preferentes. Éstas son válidas para los productos finales así como, de manera correspondiente, para los productos de partida y para los productos intermedios.

Explicación de los procedimientos y de los productos intermedios

Procedimiento (a)

Si se emplean, por ejemplo, el cloruro de 2-clorobenzoilo y la {2-[1-metil-2-(trimetilsilil)etil]fenil}amina como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (a) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.



Los derivados de los ácidos carboxílicos, necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento (a) según la invención, están definidos en general por medio de la fórmula (II). En esta fórmula (II), A tiene preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido indicados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para este resto en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención. Preferentemente X¹ significa cloro, bromo o hidroxilo.

Los derivados de los ácidos carboxílicos de la fórmula (II) son conocidos y/o pueden prepararse según métodos conocidos (véanse las publicaciones WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301, EP-A 0 589 313 y DE-A 103 25 439.0).

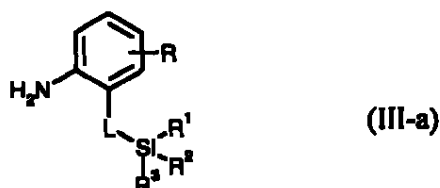
Las aminas, necesarias además como productos de partida para la realización del

- 22 -

procedimiento (a) según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (III). En esta fórmula (III), R, L, R¹, R², R³ y R⁴ tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido indicados como preferentes, como especialmente preferentes
5 o bien como muy especialmente preferentes para estos restos en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Las aminas de la fórmula (III) son conocidas y/o pueden prepararse según procedimientos conocidos (véase la publicación WO 03/080628 y los ejemplos de obtención).

10 Las aminas de la fórmula (III), en la que R⁴ no significa hidrógeno, pueden obtenerse, por ejemplo, si se hacen reaccionar aminas de la fórmula (III-a)



en la que R, L, R¹, R² y R³ tienen los significados anteriormente indicados, con halogenuros de la fórmula (VIII)

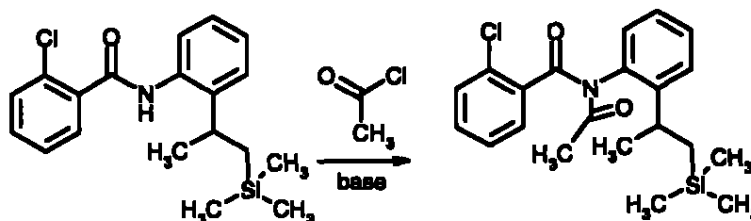
15 $R^{4a}-X^2$ (VIII)

en la que X² y R^{4a} tienen los significados anteriormente indicados [las condiciones de la reacción del procedimiento según la invención (b) son válidas de manera correspondiente].

Procedimiento (b)

Si se emplean la 2-cloro-N-{2-[1-metil-2-(trimetilsilil)etil]fenil}benzamida y el
20 cloruro de acetilo como productos de partida, podrá representarse el desarrollo del procedimiento (b) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente.

- 23 -



Las carboxamidas sililadas, necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento (b) según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (I-1). En esta fórmula (I-1), R, L, R¹, R², R³, R⁴ y A tienen

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

Los compuestos de la fórmula (I-1) son compuestos de la invención y pueden

10 prepararse según el procedimiento (a).

Condiciones de la reacción

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

15 ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados, tales como, por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-t-butiléter, metil-terc.-amiléter, dioxano, tetrahydrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-

20 dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o i-butironitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o hexametilfósforotriamida; sus mezclas con agua o agua pura.

- 24 -

Como diluyentes para la realización del procedimiento (b) según la invención entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen, preferentemente, los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como, por ejemplo, éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, 5 tolueno, xileno o decalina; hidrocarburos halogenados, tales como, por ejemplo, clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetraclorometano, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-t-butiléter, metil-terc.-amiléter, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-10 dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o hexametilfósforotriamida.

El procedimiento (a) según la invención se lleva a cabo, en caso dado, en presencia de un aceptor de ácido adecuado. Como tales entran en consideración todas las bases inorgánicas u orgánicas usuales. A éstas pertenecen, preferentemente, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos o de metales 15 alcalinotérreos, tales como, por ejemplo, hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metilato de sodio, etilato de sodio, terc.-butilato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio o carbonato de amonio, así como aminas terciarias tales como trimetilamina, 20 trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

El procedimiento (b) según la invención se lleva a cabo, en caso dado, en presencia de una base adecuada. Como tales entran en consideración todas las bases inorgánicas u 25 orgánicas usuales. A éstas pertenecen, preferentemente, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metales alcalinos o de metales

- 25 -

alcalinotérreos, tales como, por ejemplo, hidruro de sodio, amida de sodio, diisopropilamida de litio, metilato de sodio, etilato de sodio, terc.-butilato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, acetato de amonio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, hidróxido de amonio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio o carbonato de cesio; así como
5 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).

10 El procedimiento (a) según la invención se lleva a cabo, en caso dado, en presencia de un agente de condensación adecuado. Como tales entran en consideración todos los agentes de condensación empleables usualmente para este tipo de reacciones de amidación. De manera ejemplificativa pueden citarse los formadores de halogenuro de acilo tales como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, oxiclورو de fósforo o cloruro de tionilo; formadores de anhídrido tales como cloroformiato de etilo,
15 cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de isobutilo o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas, tal como la N,N'-dicyclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes de condensación usuales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonildiimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ),
20 (EEDQ), trifenilfosfina/tetracloruro de carbono o hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidino-fosfonio.

El procedimiento (a), según la invención se lleva a cabo, en caso dado, en presencia de un catalizador. De manera ejemplificativa pueden citarse la 4-dimetilaminopiridina, el 1-hidroxi-benzotriazol o la dimetilformamida.

25 Las temperaturas de la reacción, en la realización del procedimiento (a) según la invención pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas

- 26 -

desde 0°C hasta 150°C, preferentemente entre 0°C hasta 120°C y, de forma especialmente preferente, a temperaturas desde 10°C hasta 80°C.

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

Para la realización del procedimiento (a) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), se emplean, por mol del derivado de ácido carboxílico de la fórmula (II), en general, desde 0,8 hasta 15 moles, preferentemente desde 0,8 hasta 8 moles de la amina de la fórmula (III) y desde 1 hasta 3 moles de un agente aceptor de
10 ácido.

Para la realización del procedimiento (b) según la invención, se emplean, por mol de carboxamida sililada de la fórmula (I-1), en general, desde 0,2 hasta 5 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 2 moles de un halogenuro de la fórmula (VIII).

Cuando no se diga otra cosa, se llevarán a cabo todos los procedimientos según la
15 invención, en general, bajo presión normal. No obstante es posible, también, trabajar bajo presión más elevada o a presión más reducida -en general comprendida entre 0,1 bar y 10 bares-.

Los productos según la invención presentan un potente efecto microbicida y pueden emplearse en la práctica para combatir microorganismos indeseables, tales como hongos y
20 bacterias, en la protección de las plantas y en la protección de los materiales.

Los agentes fungicidas se emplean en la protección de las plantas para la lucha contra los plasmodioforomicetes, oomicetes, quitridiomicetes, zigomicetes, ascomicetes, basidiomicetes y deuteromicetes.

Los agentes bactericidas se emplean en la protección de las plantas para combatir
25 pseudomonadaceos, rizobiaceos, enterobacteriaceos, corinebacteriaceos y estreptomicetaceos.

- 27 -

Pueden citarse a modo de ejemplo, pero sin ningún carácter limitativo, algunos patógenos de enfermedades fúngicas y bacterianas, que entran dentro de las definiciones generales anteriormente enumeradas:

- tipos de *Xanthomonas*, tales como por ejemplo *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;
- 5 tipos *Pseudomonas*, tales como por ejemplo *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
- tipos de *Erwinia*, tales como por ejemplo *Erwinia amylovora*;
- tipos de *Pythium*, tal como por ejemplo *Pythium ultimum*;
- tipos de *Phytophthora*, tal como por ejemplo *Phytophthora infestans*;
- tipos de *Pseudoperonospora*, tales como por ejemplo *Pseudoperonospora humuli* o
- 10 *Pseudoperonospora cubensis*;
- tipos de *Plasmopara*, tal como por ejemplo *Plasmopara viticola*;
- tipos de *Bremia*, tal como por ejemplo *Bremia lactucae*;
- tipos de *Peronospora*, tales como por ejemplo *Peronospora pisi* o *P. brassicae*;
- tipos de *Erysiphe*, tal como por ejemplo *Erysiphe graminis*;
- 15 tipos de *Sphaerotheca*, tal como por ejemplo *Sphaerotheca fuliginea*;
- tipos de *Podosphaera*, tal como por ejemplo *Podosphaera leucotricha*;
- tipos de *Venturia*, tal como por ejemplo *Venturia inaequalis*;
- tipos de *Pyrenophora*, tal como por ejemplo *Pyrenophora teres* o *P. graminea*;
- (forma de conidios, *Drechslera*, sinónimo: *Helminthosporium*);
- 20 tipos de *Cochliobolus*, tal como por ejemplo *Cochliobolus sativus*
- (forma de conidios, *Drechslera*, sinónimo: *Helminthosporium*);
- tipos de *Uromyces*, tal como por ejemplo *Uromyces appendiculatus*;
- tipos de *Puccinia*, tal como por ejemplo *Puccinia recondita*;
- tipos de *Sclerotinia*, tal como por ejemplo *Sclerotinia sclerotiorum*;
- 25 tipos de *Tilletia*, tal como por ejemplo *Tilletia caries*;
- tipos de *Ustilago*, tal como por ejemplo *Ustilago nuda* o *Ustilago avenae*;

- 28 -

- tipos de *Pellicularia*, tal como por ejemplo *Pellicularia sasakii*;
- tipos de *Pyricularia*, tal como por ejemplo *Pyricularia oryzae*;
- tipos de *Fusarium*, tal como por ejemplo *Fusarium culmorum*;
- tipos de *Botrytis*, tal como por ejemplo *Botrytis cinerea*;
- 5 tipos de *Septoria*, tal como por ejemplo *Septoria nodorum*;
- tipos de *Leptosphaeria*, tal como por ejemplo *Leptosphaeria nodorum*;
- tipos de *Cercospora*, tal como por ejemplo *Cercospora canescens*;
- tipos de *Alternaria*, tal como por ejemplo *Alternaria brassicae*;
- tipos de *Pseudocercospora*, tal como por ejemplo *Pseudocercospora herpotrichoides*,
- 10 tipos de *Rhizoctonia*, tal como por ejemplo *Rhizoctonia solani*.

Los productos activos según la invención presentan también un potente efecto reforzador en las plantas. Éstos son adecuados, por lo tanto, para movilizar las fuerzas de resistencia propias de las plantas contra el ataque de los microorganismos indeseables.

- Se entenderán en este contexto por productos reforzadores de las plantas (inductores
- 15 de resistencia) aquellas sustancias que sean capaces de estimular el sistema inmunológico de las plantas de tal manera que, las plantas tratadas desarrollen una amplia resistencia contra los microorganismos cuando se produzca una inoculación ulterior con estos microorganismos indeseables.

- Entre los microorganismos indeseables deben entenderse en el caso presente
- 20 hongos fitopatógenos, bacterias y virus. Los productos según la invención pueden emplearse, por lo tanto, para generar resistencia en las plantas, dentro de un lapso de tiempo determinado a partir del tratamiento, contra el ataque debido a los patógenos citados. El lapso de tiempo, dentro del cual se provoca su resistencia, se extiende, en general, desde 1 hasta 10 días, preferentemente desde 1 hasta 7 días desde el tratamiento de las plantas con
- 25 los productos activos.

La buena compatibilidad con las plantas de los productos activos a las

- 29 -

concentraciones necesarias para la lucha contra las enfermedades de las plantas permite un tratamiento de las partes aéreas de las plantas, de plantones y semillas y del suelo.

En este caso pueden emplearse los productos activos, según la invención, con un éxito especialmente bueno para la lucha contra las enfermedades de los cereales, tales como, por ejemplo, contra tipos de Puccinia y de las enfermedades de las plantaciones de
5 viñedos, de frutales y de hortalizas, tal como, por ejemplo, contra tipos de Botrytis, de Venturia o de Alternaria.

Los productos activos según la invención son adecuados también para aumentar el rendimiento de las cosechas. Además tienen una baja toxicidad y presentan una buena
10 compatibilidad para con las plantas.

Los productos activos, según la invención, pueden emplearse, en caso dado, en determinadas concentraciones y cantidades de aplicación, también como herbicidas, para influenciar el crecimiento de las plantas, así como para la lucha contra las plagas animales. Éstos pueden emplearse en caso dado, también, a modo de productos intermedios y de
15 productos de partida para la síntesis de otros productos activos.

Según la invención pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Por plantas se entenderán en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los
20 métodos convencionales de cultivo y de optimación o por medio de métodos biotecnológicos y de ingeniería genética o combinaciones de estos métodos, con inclusión de las plantas transgénicas y con inclusión de las variedades de plantas que pueden ser protegidas o no por medio del derecho de protección de variedades vegetales. Por partes de las plantas deben entenderse todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas,
25 tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces,

- 30 -

tubérculos y rizomas. A las partes de las plantas pertenecen también las cosechas así como material de reproducción vegetativo y generativo, por ejemplo plantones, tubérculos, rizomas, acodos y semillas.

El tratamiento, según la invención, de plantas y partes de las plantas con los
5 productos activos se lleva a cabo de forma directa o por acción sobre el medio ambiente, el biotopo o el recinto de almacenamiento según los métodos de tratamientos usuales, por ejemplo mediante inmersión, pulverizado, evaporación, nebulizado, esparcido, aplicación a brocha y, en el caso del material de reproducción, especialmente en el caso de las semillas, además por recubrimiento con una o varias capas.

10 Los productos, según la invención, pueden emplearse en la protección de los materiales industriales contra el ataque y la destrucción debidos a los microorganismos indeseables.

Se entenderán por materiales industriales en el presente contexto los materiales no vivos, que hayan sido elaborados para el empleo en la técnica. A modo de ejemplo los
15 materiales técnicos, que quedarían protegidos contra las modificaciones o destrucciones microbianas por medio de los productos activos según la invención, son pegamentos, colas, papel y cartón, textiles, cuero, madera, pinturas y artículos de material sintético, lubricantes en frío y otros materiales. En el ámbito de los materiales a ser protegidos pueden citarse también partes de instalaciones de producción, por ejemplo circuitos
20 cerrados de agua de refrigeración, que puedan quedar perjudicados por la multiplicación de los microorganismos. En el ámbito de la presente invención pueden citarse a modo de materiales técnicos preferentemente pegamentos, colas, papel y cartones, cuero, madera, pinturas, lubricantes en frío y líquidos caloportadores, de forma especialmente preferente la madera.

25 Como microorganismos, que pueden provocar la descomposición o la modificación de los materiales técnicos, pueden citarse a modo de ejemplos bacterias, hongos, levaduras,

- 31 -

algas y organismos mucilaginosos. Preferentemente los productos activos según la invención actúan contra hongos, especialmente contra mohos, hongos coloreadores y destructores de la madera (Basidiomycetes) así como contra organismos mucilaginosos y algas.

5 A modo de ejemplo pueden citarse los microorganismos de los tipos siguientes:

Alternaria, tal como Alternaria tenuis,

Aspergillus, tal como Aspergillus niger,

Chaetomium, tal como Chaetomium globosum,

Coniophora, tal como Coniophora puetana,

10 Lentinus, tal como Lentinus tigrinus,

Penicillium, tal como Penicillium glaucum,

Polyporus, tal como Polyporus versicolor,

Aureobasidium, tal como Aureobasidium pullulans,

Sclerophoma, tal como Sclerophoma pityophila,

15 Trichoderma, tal como Trichoderma viride,

Escherichia, tal como Escherichia coli,

Pseudomonas, tal como Pseudomonas aeruginosa,

Staphylococcus, tal como Staphylococcus aureus.

Los productos activos pueden transformarse, en función de sus respectivas
20 propiedades físicas y/o químicas, en las formulaciones usuales tales como soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, pastas, granulados, aerosoles, microencapsulados en materiales polímeros y en masas de recubrimiento para semillas, así como formulaciones de nebulizado en frío y en caliente en volumen ultra-bajo (ULV).

Estas formulaciones se preparan de forma conocida, por ejemplo por mezclado de
25 los productos activos con agentes extendedores, es decir disolventes líquidos, gases licuados, que se encuentran a presión y/o materiales de soporte sólidos, en caso dado con

empleo de agentes tensioactivos, es decir emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes generadores de espuma. En el caso del empleo de agua como agente extendedor pueden emplearse también disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran en consideración fundamentalmente: hidrocarburos aromáticos, tales como

5 xileno, tolueno, o alquilnaftalinas, hidrocarburos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo fracciones de petróleo, alcoholes, tales como butanol o glicol, así como éteres y ésteres, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes

10 fuertemente polares, tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido así como agua. Por agentes extendedores o materiales de soporte gaseosos licuados se quieren indicar aquellos que son gaseosos a temperatura normal y bajo presión normal, por ejemplo gases propulsores para aerosol, tales como los hidrocarburos halogenados así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono. Como materiales de soporte sólidos entran en

15 consideración: por ejemplo, harinas minerales naturales, tales como caolines, arcillas, talco, cretas, cuarzo, attapulgita, montmorillonita o tierra de diatoméas y harinas minerales sintéticas, tales como ácido silícico altamente dispersado, óxido de aluminio y silicatos. Como materiales de soporte sólido para granulados entran en consideración: por ejemplo minerales quebrados y fracciones tal como calcita, piedra pómez, mármol, sepiolita,

20 dolomita, así como granulados sintéticos constituidos a partir de harinas inorgánicas y orgánicas así como granulados constituidos a partir de material orgánico tales como serrín, cáscaras de nueces de coco, panochas de maíz y tallos de tabaco. Como agentes emulsionantes y/o generadores de espuma entran en consideración: por ejemplo emulsionantes no iónicos y aniónicos, tales como ésteres de ácidos grasos

25 polioxietilenados, éteres de alcoholes grasos polioxietilenados, por ejemplo alquilarilpoliglicoléter, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, así como

hidrolizados de albúmina. Como dispersantes entran en consideración: por ejemplo lejías sulfíticas de lignina y metilcelulosa.

Pueden emplearse en las formulaciones adhesivos tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulares o en forma de látex, tales como
5 goma arábica, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo así como fosfolípidos naturales, tales como cefalina y lecitina y fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser aceites minerales y vegetales.

Pueden emplearse colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio, azul de ferrocianuro y colorantes orgánicos tales como
10 colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálicos y materiales nutrientes en trazas, tales como sales de hierro, de manganeso, de boro, de cobre, de cobalto, de molibdeno, de cinc.

Las formulaciones contienen en general entre 0,1 y 95 por ciento en peso de producto activo, preferentemente entre 0,5 y 90 %.

15 Los productos activos según la invención pueden presentarse como tales o en sus formulaciones también en mezcla con fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematocidas o insecticidas conocidos, para ampliar, de este modo, por ejemplo el espectro de actividad o el desarrollo de la resistencia. En muchos casos se obtienen efectos sinérgicos, es decir que la actividad de la mezcla es mayor que la actividad de los componentes individuales.

20 Como componentes de mezcla entran en consideración, por ejemplo, los compuestos siguientes:

Fungicidas:

2-fenilfenol; sulfato de 8-hidroxiquinolina; Acibenzolar-S-metilo; Aldimorph;
Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potasio; Andoprim; Anilazine; Azaconazole;
25 Azoxystrobin; Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Bentiavalicarb-isopropilo; Benzamacril; Benzamacril-isobutilo; Bilanafos; Binapacril; Biphenyl; Bitertanol;

- Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; butilamina; polisulfuro de calcio; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazone; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole;
- 5 Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenconazole; Diflometorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; difenilaminas; Dipyrrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon; Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone;
- 10 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-sodio; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil;
- 15 Furmecyclox; Guazatine; hexaclorobenceno; Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetato; Iminoctadine tris(albesil; Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-metilo; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrin; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb;
- 20 Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomyacin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropilo; Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; ácido oxolínico; Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin; Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz;
- 25 Procymidone; Propamocarb; Propanosine-sodio; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifeno; Pyrimethanil; Pyroquilon;

- 35 -

- Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxifen; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; azufre; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-metilo; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-metilo; Tolyfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil;
- 5 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-metilo-2-[(metil-sulfonil)amino]-butanoamida; 1-(1-naftalenil)-1H-pirrol-2,5-diona; 2,3,5,6-tetracoloro-4-(metilsulfonil)-piridina; 2-amino-4-metilo-N-fenil-5-tiazolcarboxamida; 2-
- 10 cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida; 3,4,5-tricloro-2,6-piridindicarbonitrilo; Actinovate; cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol; 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo; carbonato monopotásico; N-(6-metoxi-3-piridinil)-ciclopropanocarboxamida; N-butil-8-(1,1-dimetiletil)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amina; tetratiocarbonato de sodio; así
- 15 como sales de cobre y preparaciones de cobre, tales como mezclas de Bordeaux; hidróxido de cobre; naftenato de cobre; oxiclورو de cobre; sulfato de cobre; Cufraneb; óxido de cobre; Mancopper; oxina de cobre.

Bactericidas:

- Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, dimetilditiocarbamato de níquel, Kasugamycin,
- 20 Othilinson, ácido furanocarboxílico, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Insecticidas/ acaricidas/ nematocidas:

- Abamectin, ABG-9008, Acephate, Acequinocyl, Acetamiprid, Acetoprole, Acrinathrin, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allethrin,
- 25 Allethrin isómero 1R, Alpha-Cypermethrin (Alphamethrin), Amidoflumet, Aminocarb, Amitraz, Avermectin, AZ-60541, Azadirachtin, Azamethiphos, Azinphos-metilo,

- 36 -

- Azinphos-etilo, Azocyclotin, *Bacillus popilliae*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* cepa EG-2348, *Bacillus thuringiensis* cepa GC-91, *Bacillus thuringiensis* cepa NCTC-11821, Baculoviren, *Beauveria bassiana*, *Beauveria tenella*, Bendiocarb, Benfuracarb, Bensultap, Benzoximate, Beta-Cyfluthrin,
- 5 Beta-Cypermethrin, Bifenazate, Bifenthrin, Binapacryl, Bioallethrin, Bioallethrin-S-ciclopentilo-isómero, Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Bistrifluron, BPMC, Brofenprox, Bromophos-etilo, bromopropilato, Bromfenvinfos (-metilo), BTG-504, BTG-505, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Butylpyridaben, Cadusafos, Camphechlor, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion,
- 10 Carbosulfan, Cartap, CGA-50439, Chinomethionat, Chlordane, Chlordimeform, Chloethocarb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Chlorproxyfen, Chlorpyrifos-metilo, Chlorpyrifos (-etilo), Chlovaporthrin, Chromafenozide, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Clothianidin,
- 15 Clothiazoben, Codlemone, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin, *Cydia pomonella*, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyphenothrin (isómero 1R-trans), Cyromazine, DDT, Deltamethrin, Demeton-S-metilo, Demeton-S-metilsulfona, Diafenthiuron, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos, Dicofol, Dicrotophos, Dicyclanil, Diflubenzuron, Dimethoate, Dimethylvinphos,
- 20 Dinobuton, Dinocap, Dinotefuran, Diofenolan, Disulfoton, Docusat-sodio, Dofenapyn, DOWCO-439, Eflusilanate, Eamectin, Eamectin-benzoato, Empenthrin (isómero 1R), Endosulfan, *Entomophthora* spp., EPN, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethiprole, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos, Famphur, Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin óxido, Fenfluthrin, Fenitrothion, Fenobucarb, Fenothiocarb,
- 25 Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fensulfothion, Fenthion, Fentrifanil, Fenvalerate, Fipronil, Flonicamid, Fluacrypyrim,

- 37 -

- Fluazuron, Flubenzimine, Flubrocyclothrinate, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenerim, Flufenoxuron, Flufenprox, Flumethrin, Flupyrzofos, Flutenzin (Flufenzine), Fluvalinate, Fonofos, Formetanate, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox (Fluproxyfen), Furathiocarb, Gamma-HCH, Gossyplure, Grandlure, granulovirus,
- 5 Halfenprox, Halofenozide, HCH, HCN-801, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydramethylnone, Hydroprene, IKA-2002, Imidacloprid, Imiprothrin, Indoxacarb, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, Isoprocarb, Isoxathion, Ivermectin, Japonilure, Kadethrin, poliedrovirus nucleares, Kinoprene, Lambda-Cyhalothrin, Lindane, Lufenuron, Malathion, Mecarbam, Mesulfenfos, Metaldehyd, Metam-sodio,
- 10 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,
- 15 NNI-0250, NNI-9768, Novaluron, Noviflumuron, OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, Omethoate, Oxamyl, Oxydemeton-metilo, Paecilomyces fumosoroseus, Parathion-metilo, Parathion (-etilo), Permethrin (cis-, trans-), Petroleum, PH-6045, Phenothrin (isómero 1R-trans), Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Piperonyl butóxido, Pirimicarb, Pirimiphos-
- 20 metilo, Pirimiphos-etilo, Prallethrin, Profenofos, Promecarb, Propaphos, Propargite, Propetamphos, Propoxur, Prothiofos, Prothoate, Protrifenbute, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridalyl, Pyridaphenthion, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen, Quinalphos, Resmethrin, RH-5849, Ribavirin, RU-12457, RU-15525, S-421, S-1833, Salithion, Sebufos, SI-0009, Silafluofen, Spinosad,
- 25 Spirodiclofen, Spiromesifen, Sulfluramid, Sulfotep, Sulprofos, SZI-121, Tau-Fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimfos, Teflubenzuron, Tefluthrin,

- 38 -

Temephos, Temivinphos, Terbam, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Tetradifon, Tetramethrin, Tetramethrin (isómero 1R), Tetrasul, Theta-Cypermethrin, Thiaclopid, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatriphos, Thiocyclam hidrógeno oxalato, Thiodicarb, Thiofanox, Thiometon, Thiosultap-sodio, Thuringiensin, Tolfenpyrad, Tralocythrin, 5 Tralomethrin, Transfluthrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb, Vamidothion, Vaniliprole, Verbutin, Verticillium lecanii, WL-108477, WL-40027, YI-5201, YI-5301, YI-5302, XMC, Xylylcarb, ZA-3274, Zeta-Cypermethrin, Zolaprofos, ZXI-8901, el compuesto 3-metil-fenil-propilcarbamato (Tsumacide Z), el compuesto 3-(5-cloro-3-piridinil)-8- 10 (2,2,2-trifluoretil)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitrilo (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) y el correspondiente 3-endo-isómero (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (véase la publicación WO-96/37494, WO-98/25923), así como preparados, que contienen extractos vegetales de acción insecticida, nemátodos, hongos o virus.

También es posible una mezcla con otros productos activos conocidos, tales como 15 herbicidas o con abonos y reguladores del crecimiento, protectores o bien productos semiquímicos.

Además, los compuestos según la invención de la fórmula (I) presentan también efectos antimicóticos muy buenos. Tienen un espectro de actividad antimicótica muy amplio, especialmente contra dermatofitos y blastomicetos, mohos y contra hongos 20 difásicos (por ejemplo contra especies de Candida, tal como Candida albicans, Candida glabrata) así como Epidermophyton floccosum, especies de Aspergillus, tales como Aspergillus niger y Aspergillus fumigas, especies de Trichophyton, tal como Trichophyton mentagrophytes, especies de Microsporon, tal como Microsporon canis y audouinii. La enumeración de estos hongos no representa en modo alguno una limitación 25 del espectro micótico a ser considerado sino que tiene únicamente un carácter orientativo.

- 39 -

Los productos activos se pueden emplear en forma de sus formulaciones o de las formas de aplicación preparadas a partir de las mismas tales como soluciones, suspensiones, polvos pulverizables, pastas, polvos solubles, agentes de empolvado y granulados listos para su utilización. La aplicación se efectúa de manera usual, por ejemplo
5 mediante regado, pulverizado, empolvado, esparcido, espolvoreado, espumado, aplicación a brocha etc. Además es posible aplicar los productos activos según el procedimiento de volumen ultrabajo o inyectar en el suelo la preparación del producto activo o el propio producto activo. Igualmente pueden tratarse las semillas de las plantas.

Cuando se emplean los productos activos según la invención como fungicidas las
10 cantidades de aplicación pueden variar dentro de amplios límites según el tipo de la aplicación. Cuando se tratan las partes de las plantas, las cantidades de aplicación de producto activo se encuentran, en general, entre 0,1 y 10.000 g/ha, preferentemente entre 10 y 1.000 g/ha. En el caso del tratamiento de las semillas las cantidades de aplicación del producto activo se encuentran, en general, entre 0,001 y 50 g por kilogramo de
15 semillas, preferentemente entre 0,01 y 10 g por kilogramo de semillas. En el caso del tratamiento del terreno, las cantidades de aplicación de producto activo se encuentran, en general, entre 0,1 y 10.000 g/ha, preferentemente entre 1 y 5.000 g /ha.

Tal como ya se ha indicado anteriormente, pueden tratarse según la invención todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente se tratan plantas y
20 variedades de plantas así como sus partes de origen silvestre o que se obtienen por métodos de cultivo biológicos convencionales, tales como cruzamiento o fusión de protoplastos. En otra forma preferente de realización se tratan plantas y variedades de plantas transgénicas, que hayan sido obtenidas según métodos de ingeniería genética en caso dado en combinación con métodos convencionales (Genetically Modified Organisms -organismos
25 genéticamente modificados-) y sus partes. La expresión "partes" o bien "partes de plantas" o "componentes de plantas" ha sido anteriormente explicada.

- 40 -

De forma especialmente preferente se tratan plantas, según la invención, de las variedades de plantas usuales en el mercado o que se encuentran en utilización. Por variedades de plantas se entienden plantas con nuevas propiedades ("características"), que se han cultivado tanto por medio de cultivo convencional, como por mutagénesis o por técnicas recombinantes de DNA. Éstas pueden ser variedades, biotipos o genotipos.

Según los tipos de plantas o bien las variedades de las plantas, de su localización y de las condiciones de crecimiento (terreno, clima, período de vegetación, alimentación) pueden presentarse también por medio del tratamiento según la invención efectos sobreaditivos ("sinérgicos"). De este modo son posibles, por ejemplo, menores cantidades de aplicación y/o ampliaciones del espectro de actividad y/o un reforzamiento del efecto de los productos empleables según la invención, mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas elevadas o bajas, mayor tolerancia contra la sequía o contra el contenido en sal del agua o bien del terreno, mayor rendimiento floral, recolección más fácil, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de las cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor capacidad de almacenamiento y/o de transformación de los productos recolectados, que van mas allá del efecto esperable propiamente dicho.

A las plantas o bien variedades de plantas transgénicas (obtenidas mediante ingeniería genética) a ser tratadas, preferentemente según la invención, pertenecen todas las plantas, que han adquirido material genético mediante modificación por ingeniería genética, que proporcionan a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("características"). Ejemplos de tales propiedades son, un mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas altas o bajas, mayor tolerancia frente a la sequía o contra el contenido en sal del agua o bien del terreno, mayor rendimiento floral, recolección más fácil, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de las cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos

- 41 -

recolectados, mayor capacidad de almacenamiento y/o de transformación de los productos recolectados. Otros ejemplos, especialmente señalables para tales propiedades son la mayor resistencia de las plantas frente a las plagas animales y microbianas, tal como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus así como una

5 mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas se citarán las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, papa, algodón, tabaco, colza así como plantaciones de frutales (con los frutos manzana, pera, cítricos y uva), debiéndose señalar especialmente maíz, soja, papa, algodón, tabaco y colza. Como propiedades

10 ("características") se señalará especialmente la mayor resistencia de las plantas frente a los insectos, a los arácnidos, a los nemátodos y a los caracoles por medio de las toxinas generadas en las plantas, especialmente aquellas que se generan en las plantas por el material genético procedente de *Bacillus Thuringiensis* (por ejemplo por medio de los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab,

15 Cry3Bb y CryIF así como por sus combinaciones), (denominadas a continuación "plantas Bt"). Como propiedades ("características") deben señalarse además, especialmente, la mayor resistencia de las plantas frente a los hongos, las bacterias y los virus mediante resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexina, elicitores así como genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas correspondientes. Como

20 propiedades ("características") deben señalarse además, especialmente, la mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, Glyphosate o Phosphinotricin (por ejemplo gen "PAT"). Los genes que proporcionan las respectivas propiedades ("características") deseadas pueden estar presentes también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas.

25 Como ejemplos de "plantas Bt" pueden citarse variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de papa, que se comercializan bajo las marcas

- 42 -

registradas YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por
ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn
(algodón) y NewLeaf® (papa). Como ejemplos de plantas tolerantes de los herbicidas
5 pueden citarse variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja, que se
comercializan bajo las marcas registradas Roundup Ready® (tolerancia contra
Glyphosate, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia contra
Phosphinothricin, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia contra imidazolinonas) y STS
(tolerancia contra sulfonilureas por ejemplo maíz). Como plantas resistentes a los
herbicidas (cultivadas convencionalmente con relación a la tolerancia a los herbicidas)
10 pueden citarse también las variedades comercializadas para la denominación
Clearfield® (por ejemplo maíz). Evidentemente estas manifestaciones son válidas
también para las variedades de plantas desarrolladas en el futuro o bien que se
comercialicen o se desarrollen en el futuro con estas propiedades genéticas
("características").

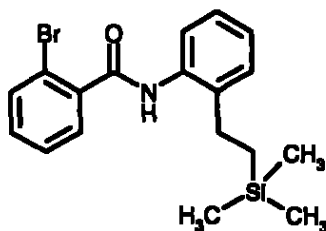
15 Las plantas indicadas pueden tratarse de forma especialmente ventajosa según la
invención con los compuestos de la fórmula general (I) o bien de las mezclas de los
productos activos según la invención. Los sectores preferentes, anteriormente citados, en
el caso de los productos activos o bien de las mezclas, son válidos también para el
tratamiento de estas plantas. Debe señalarse de manera especial el tratamiento de las
20 plantas con los compuestos o bien con las mezclas indicadas especialmente en el
presente texto.

La obtención y el empleo de los productos activos según la invención se
desprenden de los ejemplos siguientes.

Ejemplos de obtención

25 **Ejemplo 1**

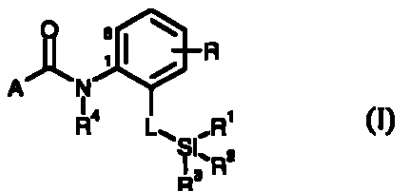
- 43 -



Se disolvieron 425 mg de 2-(2-trimetilsilil-etil)-fenilamina (2,2 mmoles) y 438 mg (2,0 mmoles) de cloruro de 2-bromobenzoilo en 20 ml de acetonitrilo y se añadieron 332 mg (2,4 mmoles) de carbonato de potasio. La mezcla de la reacción se agitó durante 18 horas a temperatura ambiente, a continuación se añadieron 20 ml de agua y se extrajo con acetato de etilo y se secó sobre sulfato de sodio. Tras eliminación del disolvente y purificación mediante cromatografía en columna a través de gel de sílice 60 (eluyente: cloruro de metileno) se obtuvieron 405 mg (54 % de la teoría) de la 2-bromo-*N*-[2-(2-trimetilsilil-etil)-fenil]-benzamida [LogP (pH 2,3) = 4,32].

De manera análoga a la del ejemplo 1, así como de acuerdo con las indicaciones en la descripción general de los procedimientos de obtención (a) y (b) según la invención, se obtuvieron, también, los compuestos de la fórmula (I), citados en la tabla 1 siguiente:

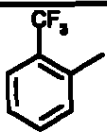
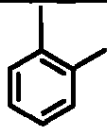
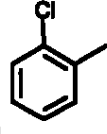
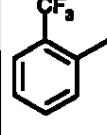
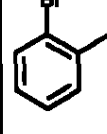
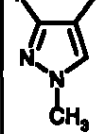
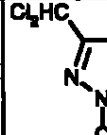
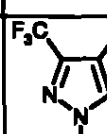
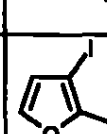
Tabla 1



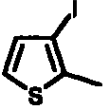
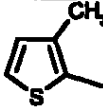
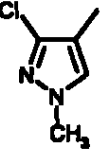
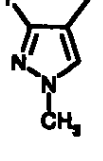
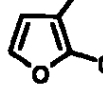
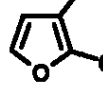
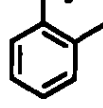
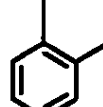
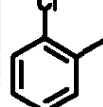
15

Ejem	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
2	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,67

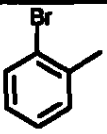
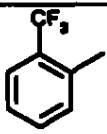
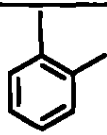
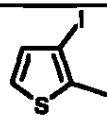
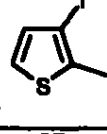
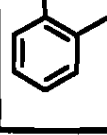
- 44 -

Ejem	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
3	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,63
4	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,40
5	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,29
6	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,37
7	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,58
8	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3,68
9	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3,95
10	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,19
11	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,73

- 45 -

Ejem	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
12	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		5,05
13	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,43
14	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3,89
15	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		3,94
16	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,03
17	H	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,33
18	H	*-CH≡CH-#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,78
19	H	*-CH≡CH-#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,97
20	H	*-CH≡CH-#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,96

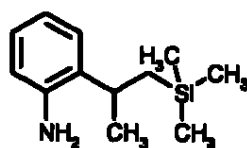
- 46 -

Ejem	R	L	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	A	logP
21	H	*-CH=CH-#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,93
22	4-F	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,61
23	4-F	*-CH(CH ₃)-CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,64
24	H	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,85
25	4-F	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,79
26	4-F	*-CH ₂ -CH ₂ -#	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H		4,39

El enlace marcado con un asterisco (*) está enlazado con el resto de anilina, el enlace marcado con rombos (#) está enlazado con el sustituyente de silicio.

Obtención de los productos de partida de la fórmula (III)

5 Ejemplo (III-1)



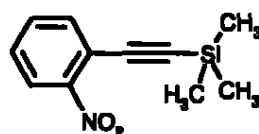
Se mezclaron 17,7 g de anilina (0,19 moles), 50 g de aliltrimetilsilano (0,44

- 47 -

moles), 1,5 g de tricloruro de aluminio (0,01 moles) y 0,5 g de polvo de aluminio (0,02 moles) y se agitaron en el autoclave durante 10 horas a 255°C. Tras refrigeración hasta la temperatura ambiente se añadieron, en primer lugar 100 ml de tolueno, a continuación 40 ml de una solución de NaOH al 40 % en agua y 100 ml de agua y se agitó durante 15 minutos a 35°C. Tras la refrigeración se extrajo con tolueno, se lavó con agua, se secó sobre carbonato de potasio y se eliminó el disolvente en vacío. Tras destilación (55°C-60°C, 0,08 mbares) se obtuvieron 1,4 g de la 2-(1-metil-2-trimetilsilil-etil)-fenilamina [LogP (pH 2,3) = 3,05].

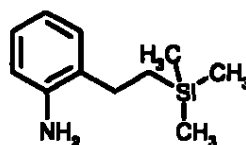
Ejemplo (III-2)

10 *Primera etapa*



Se dispusieron 4 g (20 mmoles) de orto-bromonitrobenceno, 842 mg (1,2 mmoles) de cloruro de bis(trifenilfosfina)paladio(II) y 230 mg (1,2 mmoles) de yoduro cuproso(I), en 40 ml de trietilamina bajo argón. A continuación se añadieron, gota a gota, a temperatura ambiente, en el transcurso de 10 minutos, 2,95 g (30 mmoles) de trimetilsililacetileno y se agitó durante 2 días a temperatura ambiente. La mezcla de la reacción se vertió sobre 50 ml de agua, se extrajo 3 veces con 50 ml, cada vez, de dietiléter, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró por evaporación. Tras purificación mediante cromatografía en columna a través de gel de sílice 60 (eluyente: 15 ciclohexano/acetato de etilo 3:1) se obtuvieron 4,2 g (96 % de la teoría) de trimetil-(2-nitro-feniletinil)-silano [LogP (pH 2,3) = 4,12].

Segunda etapa



- 48 -

Se disolvieron 10,9 g (50 mmoles) de trimetil-(2-nitro-feniletinil)-silano, en 200 ml de metanol y se añadieron 0,5 g de paladio-carbón (al 5 %). A continuación se hidrógeno en el autoclave durante 12 horas a 4 bares. Tras eliminación del disolvente y purificación mediante cromatografía en columna a través de gel de sílice 60 (eluyente: 5 cloruro de metileno) se obtuvieron 4,1 g de la 2-(2-trimetilsilil-etil)-fenilamina [LogP (pH 2,3) = 2,58].

La determinación de los valores logP indicados en las tablas y en los ejemplos de obtención precedentes, se llevó a cabo según la Directiva EEC 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) sobre una columna con 10 inversión de fases (C 18). Temperatura 43°C.

La determinación se llevó a cabo en el intervalo ácido (pH 2,3): con ácido fosfórico acuoso al 0,1 % y acetonitrilo como eluyentes; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo.

La calibración se llevó a cabo con alcan-2-onas no ramificadas (con 3 hasta 16 15 átomos de carbono), cuyos valores logP son conocidos (determinación de los valores logP por medio de los tiempos de retención por interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

Los valores lambda máximos se determinaron por medio de los espectros de UV desde 200 nm hasta 400 nm en los máximos de las señales de cromatografía.

20 Ejemplos de aplicación:

Ejemplo A

Ensayo con Venturia (manzano) / protector

Disolvente: 24,5 Partes en peso de acetona
24,5 Partes en peso de dimetilacetamida

25 Emulsionante: 1 Parte en peso de alquil-aril-poliglicoléter

Para la obtención de una preparación de producto activo conveniente se mezcla 1

- 49 -

parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Tras el secado del
5 recubrimiento, aplicado por pulverización, se inoculan las plantas con una suspensión acuosa de conidios del patógeno de la antracnosis del manzano *Venturia inaequalis* y permanecen a continuación 1 día aproximadamente a 20°C y con una humedad relativa del aire del 100 % en una cabina de incubación.

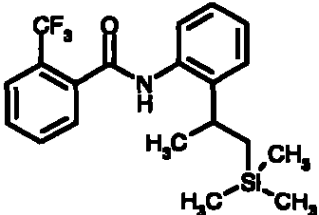
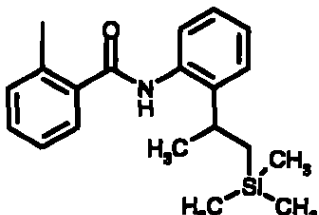
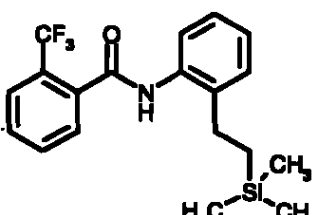
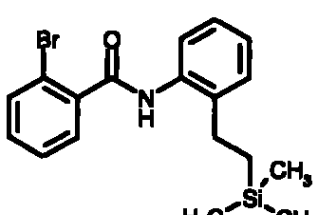
Las plantas se disponen, a continuación, en el invernadero, aproximadamente a
10 21°C y con una humedad relativa del aire de aproximadamente el 90 %.

Al cabo de 10 días, desde la inoculación, se lleva a cabo la evaluación. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se observa ataque.

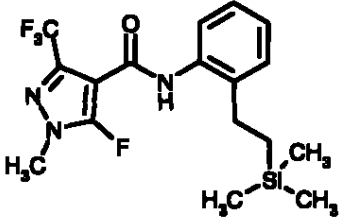
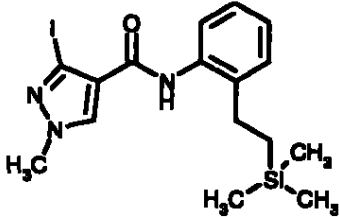
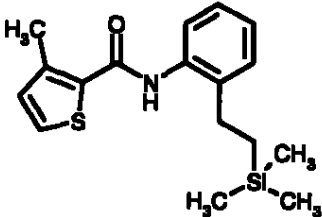
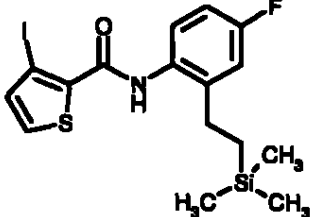
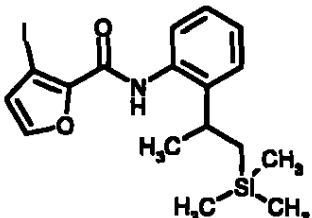
- 50 -

Tabla A

Ensayo con Venturia (manzano) / protector

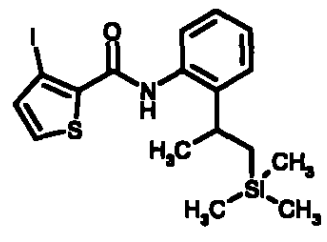
Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
	100	99
	100	100
	100	84
	100	87

Ensayo con Venturia (manzano) / protector

Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100
	100	100

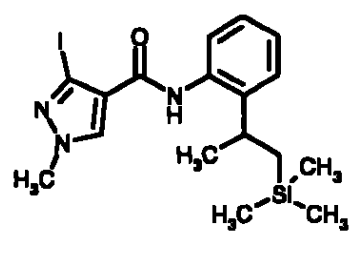
Ensayo con Venturia (manzano) / protector

Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
------------------------------------	--	----------------------------



100

100



100

99

Ejemplo B**Ensayo con Sphaerotheca (pepinos) / protector**

Disolvente: 49 Partes en peso de N,N-dimetilformamida

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter

- 5 Para la obtención de una preparación de producto activo conveniente se mezcla 1 parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

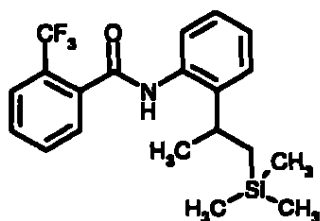
- 10 Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Las plantas se inoculan 1 día después del tratamiento, con una suspensión de esporas del patógeno de *Sphaerotheca fulginea*. Las plantas se disponen, a continuación, en un invernadero a 23°C, con una humedad relativa del aire de aproximadamente el 70 %.

- 15 La evaluación se lleva a cabo a los 7 días desde la inoculación. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se ha observado ataque.

- 54 -

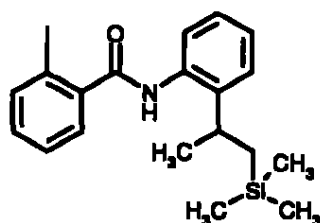
Tabla B**Ensayo con Sphaerotheca (pepino) / protector**

Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
------------------------------------	--	----------------------------



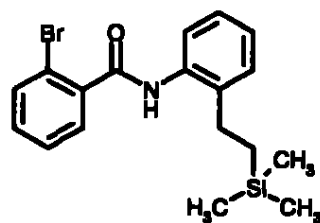
750

100



750

100



750

100

Ejemplo C**Ensayo con Puccinia (trigo) / protector**

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

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

- 5 Para la obtención de una preparación de producto activo conveniente se mezcla 1 parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

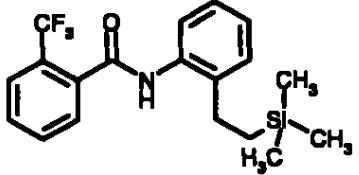
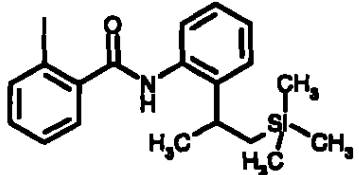
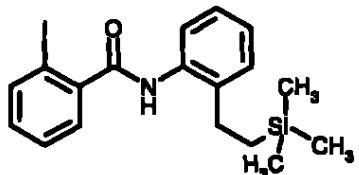
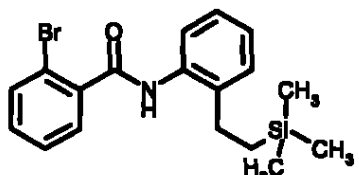
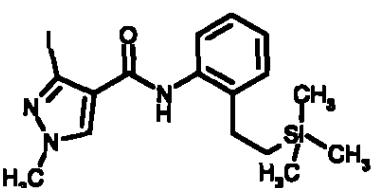
- Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo con la cantidad de aplicación indicada. Tras secado del
10 recubrimiento aplicado por inyección, se pulverizan las plantas con una suspensión de conidios de Puccinia recondita. Las plantas permanecen 48 horas a 20°C y con una humedad relativa del aire del 100 % en una cabina de incubación.

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

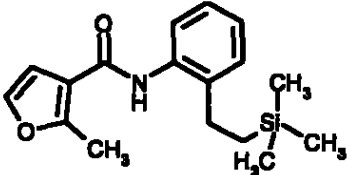
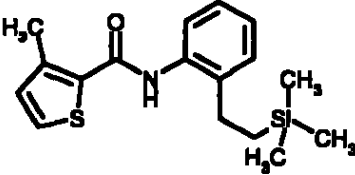
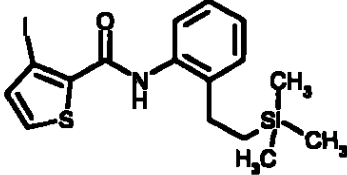
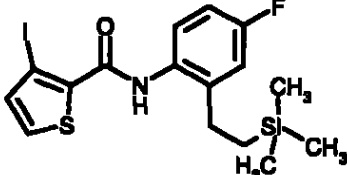
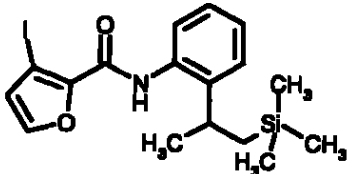
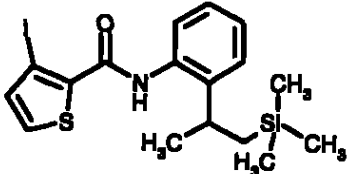
 La evaluación se lleva a cabo a los 10 días desde la inoculación. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se ha observado ataque.

Tabla C

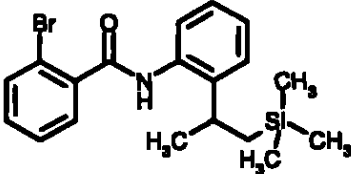
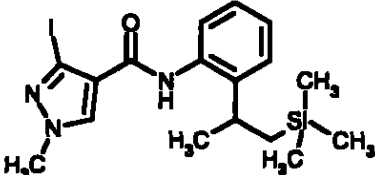
Ensayo con Puccinia (trigo) / protector

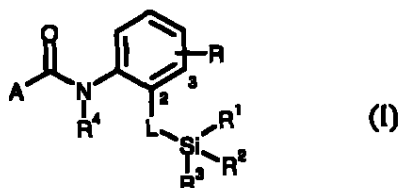
Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad %
	500	93
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

Ensayo con Puccinia (trigo) / protector

Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad %
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100
	500	100

Ensayo con Puccinia (trigo) / protector

Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad %
	500	100
	500	100

REIVINDICACIONES**1.- Carboxamidas sililadas de la fórmula (I)**

en la que

- 5 **R** significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo, iso-propilo, metiltio o trifluormetilo,
- L** significa un enlace directo o significa alquileo (alcanodiilo), alquenileno (alquenodiilo), o alquinileno (alquinodiilo) de cadena lineal o de cadena ramificada, substituidos respectivamente en caso dado,
- 10 **R¹ y R²** significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono,
- 15 **R³** significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 8 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenilo con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquinilo con 2 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, o significa fenilo o fenilalquilo substituidos respectivamente en caso dado,
- 20 **R⁴** significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8

- 60 -

- átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- 5 halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; halógeno-(alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-
- 10 alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógeno-(alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo;
- (alquilo con 1 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos
- 15 de carbono)carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)carbonilo, (halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono)carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono)carbonilo con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de
- 20 cloro y/o de bromo; o significa $-C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ o $-CH_2NR^8R^9$,
- R^5 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, halógeno-alcoxi
- 25 con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9

átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

5 R^6 y R^7 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 8 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

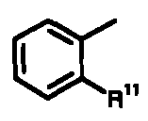
10 R^6 y R^7 significan además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo 5 a 8 átomos en el anillo saturado, substituido en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^{10} ,

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

20 R^8 y R^9 significan además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo con 5 a 8 átomos en el anillo saturado, substituido en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^{10} ,

R^{10} significa hidrógeno o alquilo con 1 a 6 átomos de carbono,

A significa el resto de la fórmula (A1)



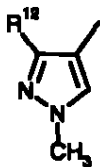
25 R^{11} significa hidrógeno, halógeno, hidroxí, ciano, alquilo con 1 a 6 átomos de

- 62 -

carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de halógeno,

o

5 A significa el resto de la fórmula (A2)

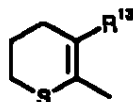


(A2), en la que

R¹² significa cloro, yodo o diclorometilo,

o

A significa el resto de la fórmula (A3)



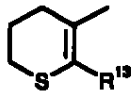
(A3), en la que

10

R¹³ significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A4)



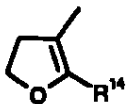
(A4), en la que

15

R¹³ significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A5)



(A5), en la que

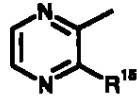
20

- 63 -

R^{14} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A6)



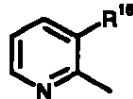
5

(A6), en la que

R^{15} significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 a 5 átomos de halógeno,

o

10 A significa el resto de la fórmula (A7)



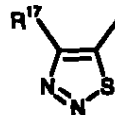
(A7), en la que

15

R^{16} significa halógeno, hidroxilo, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A8)



(A8), en la que

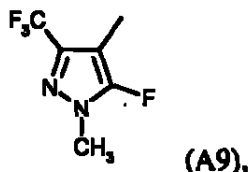
20

R^{17} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

o

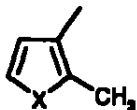
A significa el resto de la fórmula (A9)

- 64 -



o

A significa el resto de la fórmula (A10)

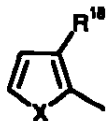


(A10), en la que

5 X significa O (oxígeno) o S (azufre),

o

A significa el resto de la fórmula (A11)



(A11), en la que

X significa O (oxígeno) o S (azufre),

10 R¹⁸ significa yodo o metilo.

2.- Carboxamidas sililadas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, caracterizadas porque

R significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo o trifluórmethyl,

15 L significa un enlace directo o significa alquileo, alquenileno con 1 a 6 átomos de carbono, alquenileno con 2 a 6 átomos de carbono o alquinileno con 2 a 6 átomos de carbono, de cadena lineal o de cadena ramificada, substituidos respectivamente en caso dado por halógeno,

20 R¹ y R² significan, independientemente entre sí, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-
alquilo con 1 a 3 átomos de carbono o alquiltio con 1 a 3 átomos de carbono-
alquilo con 1 a 3 átomos de carbono

- 65 -

- R³** significa alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono, fenilo o bencilo,
- 5 R⁴** significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono,
- 10** halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono,
- 15** (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; halógeno-(alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógeno-(alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo;
- 20** (alquilo con 1 a 6 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono)carbonilo, (halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-
- 25** alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono)carbonilo con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de

- 66 -

cloro y/o de bromo; o significa $-C(=O)C(=O)R^5$, $-\text{CONR}^6R^7$ o $-\text{CH}_2\text{NR}^8R^9$,

- R⁵** significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,
- R⁶ y R⁷** significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,
- R⁶ y R⁷** significan además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo 5 a 6 átomos en el anillo saturado, substituido en caso dado una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR¹⁰,
- R⁸ y R⁹** significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,
- R⁸ y R⁹** significan además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo con 5 a 6 átomos en el anillo saturado, substituido en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno

- 67 -

o por alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR¹⁰,

R¹⁰ significa hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

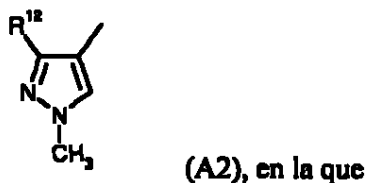
A significa el resto de la fórmula (A1)



R¹¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, ciano, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono o halógenoalquiltio con 1 a 2 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de halógeno,

10 o

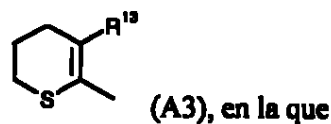
A significa el resto de la fórmula (A2)



R¹² significa cloro, yodo o diclorometilo,

o

15 A significa el resto de la fórmula (A3)

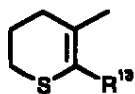


R¹³ significa metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 a 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

20 A significa el resto de la fórmula (A4)

- 68 -

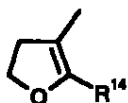


(A4), en la que

R^{13} significa metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 a 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

5 A significa el resto de la fórmula (A5)

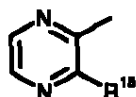


(A5), en la que

R^{14} significa metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 a 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

10 A significa el resto de la fórmula (A6)

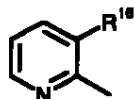


(A6), en la que

R^{15} significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 a 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

15 A significa el resto de la fórmula (A7)



(A7), en la que

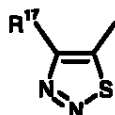
R^{16} significa flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxilo, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluormetilo, trifluormetiltio, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono o halógenoalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

20

- 69 -

o

A significa el resto de la fórmula (A8)

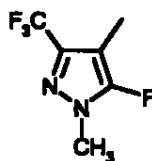


(A8), en la que

R¹⁷ significa metilo, etilo, n-propilo o iso-propilo,

5 o

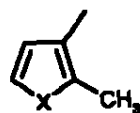
A significa el resto de la fórmula (A9)



(A9),

o

A significa el resto de la fórmula (A10)



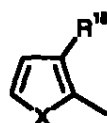
10

(A10), en la que

X significa O (oxígeno) o S (azufre),

o

A significa el resto de la fórmula (A11)



(A11), en la que

15

X significa O (oxígeno) o S (azufre),

R¹⁸ significa yodo o metilo.

3.- Procedimiento para la obtención de carboxamidas sililadas de la fórmula (I)

según la reivindicación 1, caracterizado porque

a) se hacen reaccionar derivados de ácidos carboxílicos de la fórmula (II)

- 70 -

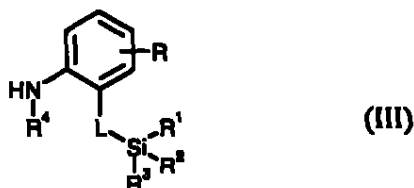


en la que

X^1 significa halógeno o hidroxilo y

A tiene los significados anteriormente indicados,

5 con aminas de la fórmula (III)



en la que R, L, R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen los significados anteriormente indicados,

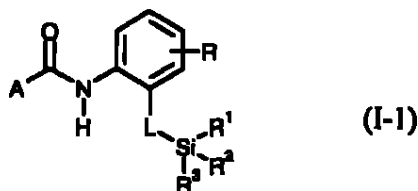
en caso dado en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un

agente de condensación, en caso dado en presencia de un agente aceptor de ácido

10 y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

o

b) se hacen reaccionar carboxamidas sililadas de la fórmula (I-1)



en la que R, L, R^1 , R^2 , R^3 y A tienen los significados anteriormente indicados,

15 con halogenuros de la fórmula (VIII)



en la que

X^2 significa cloro, bromo o yodo,

R^{4a} significa alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6

20 átomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átomos de carbono, alcoxi con

- 71 -

- 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono; halógeno-(alquilo con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, halógeno-(alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo;
- (alquilo con 1 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono)carbonilo; (halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono)carbonilo, (halógenoalcoxi con 1 a 6 átomos de carbono)carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono)carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 8 átomos de carbono)carbonilo con, respectivamente, 1 hasta 9 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo; o significa $-C(=O)C(=O)R^5$, $-CONR^6R^7$ o $-CH_2NR^8R^9$, donde R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y R^9 tienen los significados anteriormente indicados, en presencia de una base y en presencia de un diluyente.

- 72 -

4.- Agentes para la lucha contra los microorganismos indeseables, caracterizados porque tienen un contenido en al menos una carboxamida sililada de la fórmula (I), según la reivindicación 1, además de agentes extendedores y/o productos tensioactivos.

5.- Empleo de carboxamidas sililadas de la fórmula (I), según la reivindicación 1,
5 para la lucha contra los microorganismos indeseables.

6.- Procedimiento para la lucha contra los microorganismos indeseables, caracterizado porque se aplican carboxamidas sililadas de la fórmula (I), según la reivindicación 1, sobre los microorganismos y/o sobre su medio ambiente.

7.- Procedimiento para la obtención de agentes para la lucha contra los
10 microorganismos indeseables, caracterizado porque se mezclan carboxamidas sililadas de la fórmula (I), según la reivindicación 1, con extendedores y/o con productos tensioactivos.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PC1/EP2004/012590

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07F7/08

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 C07F

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; COSTA, MIRCO ET AL: "Synthesis of 4H-3,1-Benzoxazines, Quinazolin-2-ones, and Quinolin-4-ones by Palladium-Catalyzed Oxidative Carbonylation of 2-Ethynylaniline Derivatives" XP002315416 retrieved from STN Database accession no. 2004:189014 abstract & JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, 69(7), 2469-2477 CODEN: JOCEAH; ISSN: 0022-3263, 2004, ----- -/-	1,2

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
 E earlier document but published on or after the international filing date
 L document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
 O document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
 P document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
 X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
 Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
 G document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

27 January 2005

Date of mailing of the international search report

18/02/2005

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel: (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Richter, H

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/012590

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; BARTOLI, GIUSEPPE ET AL: "A new approach to the synthesis of 2-substituted indoles: reaction of dimetallated ortho-trimethylsilylmethylanilides with esters" XP002315417 retrieved from STN Database accession no. 1990:423608 abstract & TETRAHEDRON , 46(4), 1379-84 CODEN: TETRAB; ISSN: 0040-4020, 1990,	1,2
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; SAKAMOTO, TAKAO ET AL: "Condensed heteroaromatic ring systems. XII. Synthesis of indole derivatives from ethyl 2-bromocarbanilates" XP002315418 retrieved from STN Database accession no. 1988:75166 abstract & CHEMICAL & PHARMACEUTICAL BULLETIN , 35(5), 1823-8 CODEN: CPBTAL; ISSN: 0009-2363, 1987,	1,2
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; HELLWINKEL, DIETER ET AL: "Carbanionically induced '1,3I-migrations of .pI.- and coordinatively unsaturated groups" XP002315419 retrieved from STN Database accession no. 1984:5549 abstract & CHEMISCHE BERICHTE , 116(10), 3375-405 CODEN: CHBEAM; ISSN: 0009-2940, 1983,	1,2
Y	EP 0 538 231 A (MONSANTO CO., USA) 21 Apr 11 1993 (1993-04-21) page 69; claims 2,610; examples 120,121	1,2,4-7
A	EP 0 545 099 A2 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 9 June 1993 (1993-06-09) cited in the application pages 8-11; claims 1,8,11; example 5	1-7
-/-		

Form PCTAB/210 (continuation of second sheet) (January 2004)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PC1/EP2004/012590

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 03/080628 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG; EHRENFREUND, JOSEF; JUNG, PIERRE, JOSEPH,) 2 October 2003 (2003-10-02) cited in the application	1-7
Y	LUKEVICS E.: "Biological Activity of Nitrogen containing Organosilicon Compounds" NOBEL SYMP., no. 40, 1978, pages 435-445, XP002312113 page 436, line 8 - line 14	1,2,4-7

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No.

PCT/EP2004/012590

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0538231	A	21-04-1993	AT 201958 T 15-06-2001
			AU 664392 B2 16-11-1995
			AU 2809392 A 21-05-1993
			CA 2119155 A1 29-04-1993
			CZ 9400887 A3 17-08-1994
			DE 69231872 D1 19-07-2001
			DE 69231872 T2 28-03-2002
			DK 538231 T3 27-08-2001
			EP 1088481 A2 04-04-2001
			EP 0538231 A1 21-04-1993
			ES 2159507 T3 16-10-2001
			GR 3036478 T3 30-11-2001
			HU 66952 A2 30-01-1995
			LT 193 A ,B 25-10-1994
			LV 10020 A ,B 10-05-1994
			MX 9206009 A1 01-11-1993
			NZ 244771 A 28-03-1995
			PL 170837 B1 31-01-1997
			PT 538231 T 30-10-2001
			SK 44894 A3 12-04-1995
			US 5998466 A 07-12-1999
			US RE36562 E 08-02-2000
			WO 9307751 A1 29-04-1993
			US 6248894 B1 19-06-2001
			US 6252078 B1 26-06-2001
			US 6166057 A 26-12-2000
			US 6133252 A 17-10-2000
			US 5498630 A 12-03-1996
			US 5849723 A 15-12-1998
			US 5693667 A 02-12-1997
			US 5705513 A 06-01-1998
			US 5834447 A 10-11-1998
			US 6410558 B1 25-06-2002
			US 2001046975 A1 29-11-2001
			US 6028101 A 22-02-2000
			ZA 9208024 A 27-08-1993
			CN 1085221 A ,B 13-04-1994
			CN 1225364 A 11-08-1999
			CN 1225365 A 11-08-1999
			HR 921338 B1 30-04-2002
			SI 9300030 A 30-06-1994
			US 5811411 A 22-09-1998
EP 0545099	A2	09-06-1993	AT 149487 T 15-03-1997
			AU 656243 B2 27-01-1995
			AU 2855492 A 27-05-1993
			CA 2081935 A1 23-05-1993
			CZ 9203448 A3 13-10-1993
			CZ 289478 B6 16-01-2002
			DE 59208113 D1 10-04-1997
			DK 545099 T3 24-03-1997
			ES 2098421 T3 01-05-1997
			GR 3023336 T3 29-08-1997
			HU 62861 A2 28-06-1993
			IL 103614 A 24-09-1998
			JP 3202079 B2 27-08-2001
			JP 5221994 A 31-08-1993
			JP 2001253802 A 18-09-2001

Form PCT/ISBA/910 (patent family search) (January 2004)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/012590

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
EP 0545099	A2		JP 2001316210 A	13-11-2001
			KR 267518 B1	16-10-2000
			NZ 245194 A	27-02-1996
			PL 296677 A1	18-10-1993
			SK 344892 A3	08-03-1995
			US 5480897 A	02-01-1996
			US 5556988 A	17-09-1996
			US 5589493 A	31-12-1996
			US 5330995 A	19-07-1994
			ZA 9208977 A	19-05-1994
WO 03080628	A1	02-10-2003	BR 0308759 A	28-12-2004
			CA 2477396 A1	02-10-2003
			EP 1490378 A1	29-12-2004

Form PCT/IS24/13 (patent family annex) (January 2004)

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 C07F7/08

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RESEARCHIERTE GEBIETE
Researchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationsymbole)
IPK 7 C07F

Researchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)
EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P,X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; COSTA, MIRCO ET AL: "Synthesis of 4H-3,1-Benzoxazines, Quinazolin-2-ones, and Quinolin-4-ones by Palladium-Catalyzed Oxidative Carbonylation of 2-Ethynylaniline Derivatives" XP002315416 gefunden im STN Database accession no. 2004:189014 Zusammenfassung & JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, 69(7), 2469-2477 CODEN: JOCEAH; ISSN: 0022-3263, 2004, ----- -/-	1,2

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
A Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
E Älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
L Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
O Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
P Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist
T Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
X Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden
Y Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
Z Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche
27. Januar 2005

Abschließdatum des internationalen Recherchenberichts
18/02/2005

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Beauftragter

Richter, H

Formblatt PCT/ISA/210 (Blatt 2) (Januar 2004)

Seite 1 von 3

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationale Aktenzeichen

PCT/EP2004/012590

C.(Fortsetzung) ALS WESSENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; BARTOLI, GIUSEPPE ET AL: "A new approach to the synthesis of 2-substituted indoles: reaction of dimetallated ortho-trimethylsilylmethylanilides with esters" XP002315417 gefunden im STN Database accession no. 1990:423608 Zusammenfassung & TETRAHEDRON, 46(4), 1379-84 CODEN: TETRAB; ISSN: 0040-4020, 1990,	1,2
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; SAKAMOTO, TAKAO ET AL: "Condensed heteroaromatic ring systems. XII. Synthesis of indole derivatives from ethyl 2-bromocarbanilates" XP002315418 gefunden im STN Database accession no. 1988:75166 Zusammenfassung & CHEMICAL & PHARMACEUTICAL BULLETIN, 35(5), 1823-8 CODEN: CPBTAL; ISSN: 0009-2363, 1987,	1,2
X	DATABASE CA 'Online! CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; HELLWINKEL, DIETER ET AL: "Carbanionically induced '1,3'-migrations of .pl.- and coordinatively unsaturated groups" XP002315419 gefunden im STN Database accession no. 1984:5549 Zusammenfassung & CHEMISCHE BERICHTE, 116(10), 3375-405 CODEN: CHBEAM; ISSN: 0009-2940, 1983,	1,2
Y	EP 0 538 231 A (MONSANTO CO., USA) 21. April 1993 (1993-04-21) Seite 69; Ansprüche 2,610; Beispiele 120,121	1,2,4-7
A	EP 0 545 099 A2 (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 9. Juni 1993 (1993-06-09) in der Anmeldung erwähnt Seiten 8-11; Ansprüche 1,8,11; Beispiel 5	1-7
-/-		

Formblatt PCT/ANM10 (Fortsetzung von Blatt 1) (Januar 1994)

C.(Fortsetzung) ALS WESSENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Behr. Anspruch Nr.
A	WO 03/080628 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS AG; EHRENFREUND, JOSEF; JUNG, PIERRE, JOSEPH,) 2. Oktober 2003 (2003-10-02) in der Anmeldung erwähnt	1-7
Y	LUKEVICS E.: "Biological Activity of Nitrogen containing Organosilicon Compounds" NOBEL SYMP., Nr. 40, 1978, Seiten 435-445, XP002312113 Seite 436, Zeile 8 - Zeile 14	1,2,4-7

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Abrechnungs-

PCT/EP2004/012590

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
EP 0538231 A	21-04-1993	AT 201958 T	15-06-2001
		AU 664392 B2	16-11-1995
		AU 2809392 A	21-05-1993
		CA 2119155 A1	29-04-1993
		CZ 9400887 A3	17-08-1994
		DE 69231872 D1	19-07-2001
		DE 69231872 T2	28-03-2002
		DK 538231 T3	27-08-2001
		EP 1088481 A2	04-04-2001
		EP 0538231 A1	21-04-1993
		ES 2159507 T3	16-10-2001
		GR 3036478 T3	30-11-2001
		HU 66952 A2	30-01-1995
		LT 193 A ,B	25-10-1994
		LV 10020 A ,B	10-05-1994
		MX 9206009 A1	01-11-1993
		NZ 244771 A	28-03-1995
		PL 170837 B1	31-01-1997
		PT 538231 T	30-10-2001
		SK 44894 A3	12-04-1995
		US 5998466 A	07-12-1999
		US RE36562 E	08-02-2000
		WO 9307751 A1	29-04-1993
		US 6248894 B1	19-06-2001
		US 6252078 B1	26-06-2001
		US 6166057 A	26-12-2000
		US 6133252 A	17-10-2000
		US 5498630 A	12-03-1996
		US 5849723 A	15-12-1998
		US 5693667 A	02-12-1997
		US 5705513 A	06-01-1998
		US 5834447 A	10-11-1998
		US 6410558 B1	25-06-2002
		US 2001046975 A1	29-11-2001
		US 6028101 A	22-02-2000
		ZA 9208024 A	27-08-1993
		CN 1085221 A ,B	13-04-1994
		CN 1225364 A	11-08-1999
		CN 1225365 A	11-08-1999
		HR 921338 B1	30-04-2002
		SI 9300030 A	30-06-1994
		US 5811411 A	22-09-1998
EP 0545099 A2	09-06-1993	AT 149487 T	15-03-1997
		AU 656243 B2	27-01-1995
		AU 2855492 A	27-05-1993
		CA 2081935 A1	23-05-1993
		CZ 9203448 A3	13-10-1993
		CZ 289478 B6	16-01-2002
		DE 59208113 D1	10-04-1997
		DK 545099 T3	24-03-1997
		ES 2098421 T3	01-05-1997
		GR 3023336 T3	29-08-1997
		HU 62861 A2	28-06-1993
		IL 103614 A	24-09-1998
		JP 3202079 B2	27-08-2001
		JP 5221994 A	31-08-1993
		JP 2001253802 A	18-09-2001

Formblatt PCT/ISA210 (Anfang Patentfamilie) (Januar 2004)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT
Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Abkürzungen
PCT/EP2004/012590

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung	
EP 0545099	A2	JP 2001316210 A	13-11-2001	
		KR 267518 B1	16-10-2000	
		NZ 245194 A	27-02-1996	
		PL 296677 A1	18-10-1993	
		SK 344892 A3	08-03-1995	
		US 5480897 A	02-01-1996	
		US 5556988 A	17-09-1996	
		US 5589493 A	31-12-1996	
		US 5330995 A	19-07-1994	
		ZA 9208977 A	19-05-1994	
WO 03080628	A1	02-10-2003	BR 0308759 A	28-12-2004
			CA 2477396 A1	02-10-2003
			EP 1490378 A1	29-12-2004

Extrato folio 147

FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS

Royal
Technologies S.A.
Calle 10 No. 100, San José, Costa Rica

147

Expediente No		06047183	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		
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS: ☒	1	2

Observaciones: un sobre q contiene arte final.

149
148

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-047183-00000-0000
Fec: 2006-05-17 10:29:03 Dep. 2020 NUECREACIONES
Tm: 11 PATENTEMII
Ene: 378 FASENACIONALI
AN 411 PRESENTACION FOLIO 120

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 36.138
FECHA : MAYO 15 DE 2006

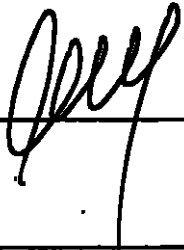
***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	54982575	15/05/2006	47,972,500.

***** CONCEPTO *****

CANT. HISTORICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01-01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	463,000.00
	TOTAL :	\$ 463,000.00

SON: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

Col 13749-841-066-5



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

149

Delegatura de Propiedad Industrial División de Nuevas Creaciones

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACIÓN Y AGILIZACIÓN DEL TRAMITE

	USUARIO	RADICADOR
PATENTE DE INVENCION ☒ MODELO DE UTILIDAD ()	()	()
-Indicación de que se solicita la concesión de una patente.	☒	()
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	☒	()
-Descripción de la invención.	☒	()
-Dibujos de ser estos pertinentes.	()	()
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	☒	()
COMPLETA () INCOMPLETA ()	()	()
DISEÑO INDUSTRIAL ()		
-Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial.	()	()
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	()	()
-Representación gráfica y 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 se solicita el registro de Diseño Industrial.	()	()
-Datos de identificación del solicitante o de la persona que se presenta la solicitud.	()	()
-Representación gráfica del Esquema Trazado.	()	()
-Comprobante de Pago de las tasas establecidas.	()	()
COMPLETA () INCOMPLETA ()	()	()

Firma Responsable:

Fecha:



17/06/06

150

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCI

Bogotá,
2020

Doctor(a)
FERRERO EMILIO
Apoderado(a) y/o Representante de
BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT

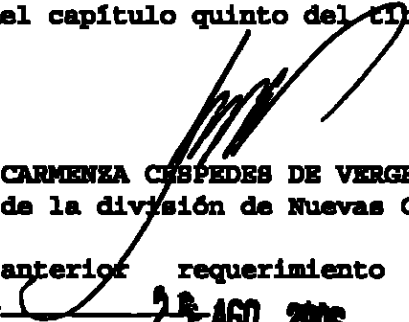
REFERENCIA	Radicación No.	6 47183
	Solicitud internacional	EP2004/012590
	Fecha inicio fase nacional	21/06/2006
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	UUUU 9418

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 CÉSPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 23-AGO. 2006
adpall

12
250806

C

C