

Q.P.



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCION

06-59312

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO

CARBOXAMIDAS OPTICAMENTE ACTIVAS Y SU EMPLEO PARA

LA LUCHA CONTRA LOS MICROORGANISMOS INDESEABLES

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

BAYER CROPSCIENCE AG

DOMICILIO

MONHEIM AM RHEIN, 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: 06-059312- -00000-0000

Fec: 2006-06-16 17:52:25 Dep: 2020 NUECREACIONES

Tra: 11 PATENTEYII

Eve: 376 FASENACIONALI

Act: 411 PRESENTACION

Folios: 148

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE:

1

☒ Patente de Invención.

☐ Patente de Modelo de Utilidad.

☒ Capítulo I.

☐ Capítulo II.

2

SOLICITANTE
(71)

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

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

Domicilio **Monheim, República Federal
de Alemania**

IDENTIFICACIÓN

C C

☐

NIT

☐

C E

☐

Otro

☐

Cual

Número

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

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

IDENTIFICACIÓN

C C

☒

NIT

☐

C E.

☐

Otro

☐

Cual

Número **438 019** T P **31.929**

4

INVENTOR (ES)
(72)

1. **Ralf DUNKEL**
9/11 Rue Pierre DuPont,
69001 Lyon,
Francia

3. **Helko RIECK**
29 Allee Buffon,
69110 Ste Foy-lès-Lyon,
Francia

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

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

9. **Anne SUTY-HEINZE**
Schlieper Str 29,
40764 Langenfeld,
República Federal de Alemania

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

4. **Benoit HARTMANN**
Färberstr 1,
40764 Langenfeld,
República Federal de Alemania

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

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

5

PCT (86)

Solicitud Internacional No **PCT/EP2004/013834**

Publicación Internacional No **WO 2005/058839 A1**

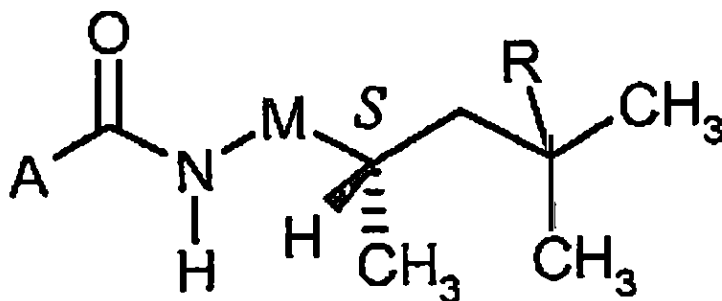
Fecha: **6 de diciembre de 2004**

Fecha: **30 de junio de 2005**

6	Título (54) <u>CARBOXAMIDAS ÓPTICAMENTE ACTIVAS Y SU EMPLEO PARA LA LUCHA CONTRA LOS MICROORGANISMOS INDESEABLES</u>		
7	Clasificación Internacional (51) <u>C07D 231/16</u>		
8	Prioridad SI ☒ NO ☐	(33) País de Origen <u>DE</u> <u>DE</u> <u>DE</u>	(32) Fecha <u>18 de diciembre de 2003</u> <u>28 de enero de 2004</u> <u>4 de febrero de 2004</u>
			(31) Número de Solicitud <u>103 59 511 2</u> <u>10 2004 004141 5</u> <u>10 2004 005 317 0</u>
9	Comprobante de pago No.: <u>06 – 42.205</u> Fecha: <u>5 de junio de 2006</u>		
10	Anexos: ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud ☐ 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. DOCUMENTO ANEXOS		

11

FIGURA CARACTERÍSTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE

EMILIO FERRERO

FIRMA :

C C 438 019 de Usaquén T P 31 929

JGG

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ **Publicación Internacional WO 2005/058839 A1**

Descripción:

Páginas 45 en el idioma original

Páginas 66 en español

Reivindicaciones: Número (s) 8

2. ☒ **Forma PCT/RO/101. PCT Request**
3. ☒ **Forma PCT/ISA/210. Informe de Búsqueda Internacional.**
4. ☒ **Extracto para la publicación.**

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

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

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER-OF-ATTORNEY 13549 10966

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

domiciado (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 exercise the representation, or to give a declaration given before a Notary Public in Colombia, or before a Notary or another Public Official, or a Colombian Consul abroad, and in case of impediment, the appropriate certificate shall suffice. If any of the appointees were to be definitely absent, the following alternate shall take his place. When the absence or impediment of the principal representative, or of the first or second alternate in their turn ceases, the representation can be taken again in their sequence, by the principal, the first or second alternate depending on case, and the mere fact or its exercise will suffice. The exercise of the representation by the first, second or third alternates in their turn shall end at such time.

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.

administrativo, contencioso administrativo y judicial, así como los
nales, 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

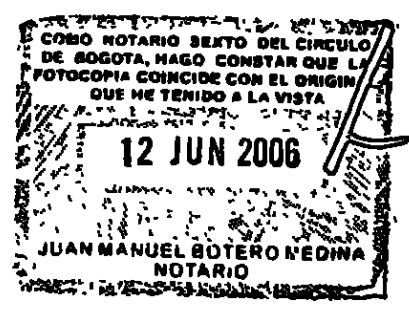
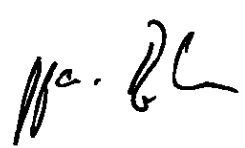
with or without jurisdiction, specially those administrative,
administrative contentious and judicial, as well as before
Arbitration Court, in all matters concerning the following a)
Obtainment of patents, utility models and industrial designs,
the registration of trademarks, collective, defensive and 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



7

AUTENTICACIÓN NOTARIAL (SOCIEDAD)

ascrito 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

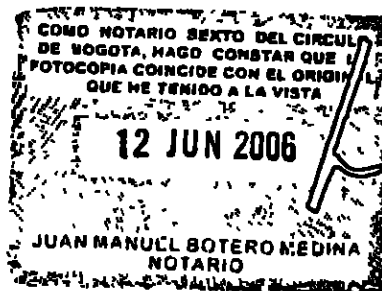
The Notary Public is aware and attests to the above facts upon
examination of the corresponding documents

Given and signed in Leverkusen

On 12th of February, 2003

El Notario Público
(Firma-sello)

The Notary Public
(Signature-seal)



8 8

URNr. 242/2003

Ich beglaube die vor mir vollzogenen Unterschriften :

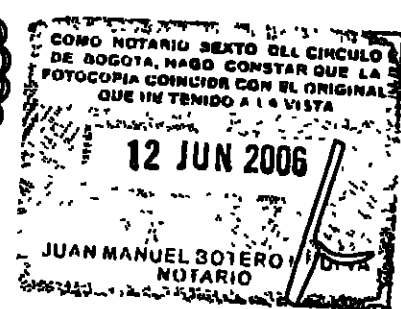
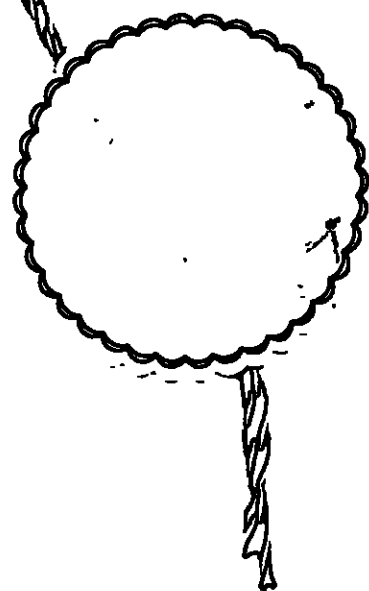
1. des Herrn Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,
2. des Herrn Dr. Axel Bader, geschäftsansässig
in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,

- persönlich bekannt -.

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

Leverkusen, den 12. Februar 2003

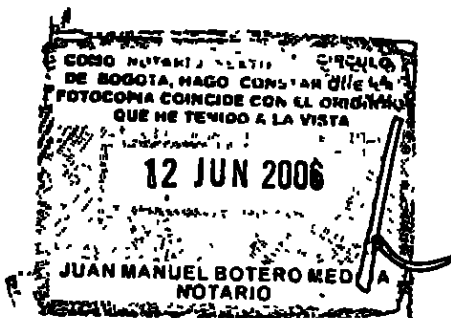

Notar



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

- 1 Land Bundesrepublik Deutschland
Diese öffentliche Urkunde
- 2 ist unterschrieben von Dirk Heiderhoff
- 3 in seiner Eigenschaft als Notar _____
- 4 sie ist versehen mit dem Stempel/Siegel des (der) Notars Dirk Heiderhoff
in Leverkusen
- Bestätigt 19. FEB 2003
6 am
5. in Köln
- 7 durch den Vizepräsidenten des Landgerichts Köln
8. unter Nr. 482/03
9. Stempel/Siegel:
10. Unterschrift: Larín Caliebe



Geb 9 100

Eur 13.-

528

68,08

9

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

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

Dado y firmado hoy 12 de febrero de 2003

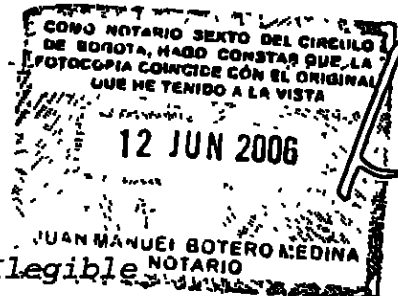
en Leverkusen

por Dr. Axel Brader, Dr. Ralf-Rüdiger Jesse

Bayer CropScience AG

Firma Ilegible

Firma Ilegible



(ANEXO)

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

Diego F. Vargas
DIEGO F. VARGAS Z.

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

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

Firma Ilegible
Notario Público

Sello

Se anexa autenticación notarial en alemán de las firmas anteriores.

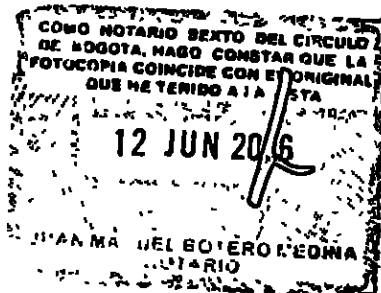
Respaldo:

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

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

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

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



CR SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

2003 MAR 18 P 12:24

JEFE DE LEGALACIONES
BOGOTA D.C.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTA FE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) ANTERIORMENTE FIR-
MA(S) FUE(S) POR [Firma]
IDENTIFICADOS CON C.C. No (s) [Firma]
ES(SON) AUTENTICA(S)
SANTA FE DE BOGOTA, 18 MAR 2003

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208992

ESTA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPLEA
LAS FUNCIONES INDICADAS

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
12 JUN 2006
JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO



4

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.-

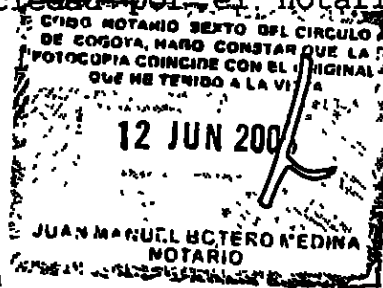
Traducción de los sellos y autenticaciones que aparecen en el documento de representación y poder, escrito en español e inglés, por medio del cual la firma Bayer CropScience AG, domiciliada en Alfred-Nobel-Str. 50, D 40789 Monheim, Alemania, otorga poder a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO,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

Edo.: firma ilegible

Sello redondo en tinta:

Dirk Heiderhoff, notario de Leverkusen



LUZ ARRIAGA DE HERBER
Traducción Oficial
Recibida en el Ministerio de Justicia

Protocolo notarial 242/2003

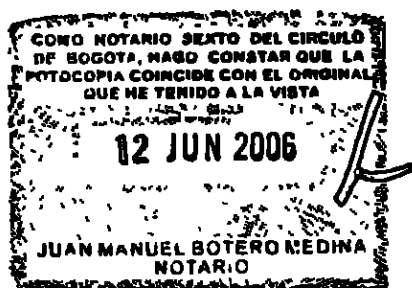
Certifico la autenticidad de la firma antecedentes puestas
ante mí por los señores

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,-

1122 APRIL 11 11:27 AM
IN-6011071 1122 22 11 OFICIAL
[Signature]
Resoluto, N. 6011071

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

RECEIVED
US 5-11-03
NOTARIAL PUBLIC
JAN 22 2004

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

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
10. Firma
12 JUN 2006
Fdo.: firma
JUAN MANUEL GARCIA PEREZ
NOTARIO

RECEIVED
JAN 22 2004
NOTARIAL PUBLIC
JAN 22 2004

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

Bogotá, 14 de marzo 2003.

1412 AUSTRIA - A. M. M. M. M. M.
Traducción Fiel y Oficial
Resolución de 1991, 14 de marzo

MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES

208993
COTA FIRMADA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESDE PERA
LAS FUNCIONES INDICADAS

NO SE ASUME
RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

18 MAR 18 P 12:24

JEFES DE LEGACIONES
BOGOTA D.C.

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

[Signature]

IDENTIFICADOS CON LA 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

12 JUN 2006

JUAN MANUEL BOTERO MEDINA
NOTARIO

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
30. Juni 2005 (30.06.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/058839 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 231/16,
409/12, 207/34, A01N 43/10, 43/56, 43/36

SUTY-HEINZE, Anne [FR/DE], Schlieper Str 29, 40764
Langenfeld (DE)

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/013834

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

(22) Internationales Anmeldedatum:
6 Dezember 2004 (06.12.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 59 511 2 18 Dezember 2003 (18.12.2003) DE
10 2004 004141 5 28 Januar 2004 (28.01.2004) DE
10 2004 005 317.0 4. Februar 2004 (04.02.2004) DE

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

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): DUNKEL, Ralf
[DE/DE], Krischerstr. 22, 40789 Monheim (DE) ELBE,
Hans-Ludwig [DE/DE], Dasnöckel 59, 42329 Wup-
pertal (DE) RIECK, Heiko [DE/FR], 9, rue Claude
Monet, F-69110 Ste Foy-lès-Lyon (FR) HARTMANN,
Benolt [FR/DE], Farberstr 1, 40764 Langenfeld (DE)
GREUL, Jörg, Nico [DE/DE], Am Sandberg 30a,
42799 Leichlingen (DE) WACHENDORFF-NEU-
MANN, Ulrike [DE/DE], Oberer Markweg 85, 56566
Neuwied (DE) DAHMEN, Peter [DE/DE], Alte-
brucker Str 61, 41470 Neuss (DE) KUCK, Karl-Helz
[DE/DE], Pastor-Löh-Str 30 a, 40764 Langenfeld (DE)

(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, FR, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, 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, LT, 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)

Veröffentlicht:

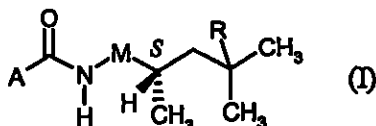
— mit internationalem Recherchenbericht
— vor Ablauf der für Änderungen der Ansprüche geltenden
Frist; Veröffentlichung wird wiederholt, falls Änderungen
entfallen

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

WO 2005/058839 A1

(54) Title: OPTICALLY ACTIVE CARBOXAMIDES AND USE THEREOF TO COMBAT UNDESIRABLE MICROORGANISMS

(54) Bezeichnung: OPTISCH AKTIVE CARBOXAMIDE UND DEREN VERWENDUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON UNER-
WUNSCHTEN MIKROORGANISMEN



(57) Abstract: Novel optically active carboxamides of formula (1) wherein R, M and A have the meanings cited in the description, several methods for the production of said substances and the use thereof to combat undesirable microorganisms, in addition to novel intermediate products and the production thereof

(57) Zusammenfassung: Neue optisch aktive Carboxamide der Formel (I) in wel-
cher R, M und A die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zum Herstellen dieser Stoffe und
deren Verwendung zum Bekämpfen von unerwünschten Mikroorganismen, sowie neue Zwischenprodukte und deren Herstellung

Optically active carboxamides

The present invention concerns new optically active carboxamides, several methods for their preparation and their use for the control of detrimental microorganisms.

5

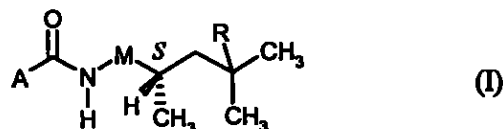
It is already known that numerous carboxamides possess fungicidal properties (c.f. e.g. WO 03/010149, WO 02/059086, WO 02/38542, WO 00/09482, DE-A 102 29 595, EP-A 0 591 699, EP-A 0 589 301 and EP-A 0 545 099). Thus, for example, the racemates of 5-fluoro-1,3-dimethyl-*N*-[2-(1,3,3-trimethylbutyl)phenyl]-1*H*-pyrazole-4-carboxamide are known from WO 03/010149 and those of *N*-[2-(1,3-dimethylbutyl)phenyl]-2-iodobenzamide from DE-A 102 29 595. The activity of these compounds is good, but in many cases leaves much to be desired when they are applied at low concentrations.

10

Owing to the numerous demands imposed upon modern pest control agents, for example those which affect level of activity, duration of activity, spectrum of activity, range of application, toxicity, combination with other active compounds, combination with formulation excipients or synthesis and owing to the possible appearance of resistance the development of such compounds can never be regarded as concluded. Consequently there is a continuous high demand for new compounds that provide in certain aspects at least partial advantages opposite the known compounds.

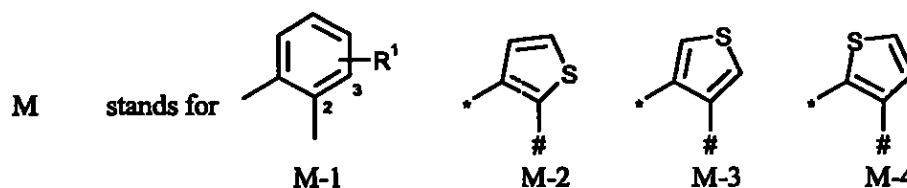
20

New optically active carboxamides of structure (I) have now been found



in which

R stands for hydrogen, fluorine, chlorine, methyl, ethyl or trifluoromethyl,

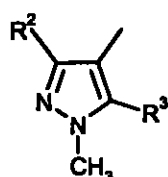


25

wherein the bonds marked with * is coupled with the amide and the bond marked with # is coupled with the alkyl side chain,

R¹ stands for hydrogen, fluorine, chlorine, methyl or trifluoromethyl,

30 A stands for the group of structure (A1)



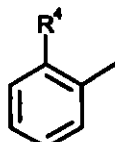
(A1), in which

R^2 stands for methyl, trifluoromethyl or difluoromethyl,

R^3 stands for hydrogen, fluorine or chlorine,

or

5 A stands for the group of structure (A2)

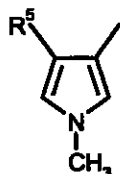


(A2), in which

R^4 stands for trifluoromethyl, chlorine, bromine or iodine,

or

A stands for the group of structure (A3)



(A3), in which

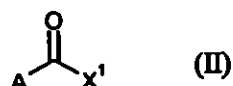
10

R^5 stands for methyl, trifluoromethyl or difluoromethyl.

The compounds of structure (I) possess *S* configuration [C atom labelled with *S* in structure (I)].

15 Furthermore it was found that optically active carboxamides of structure (I) are obtained when

a) carboxylic acid derivatives of structure (II)

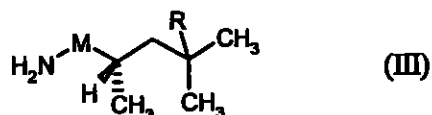


in which

A has the meanings defined above and

20 X^1 stands for halogen or hydroxy,

are reacted with an amine of structure (III)



(III)

in which R and M have the meanings defined above,

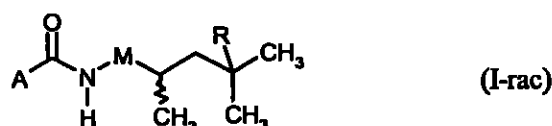
optionally in the presence of a catalyst, optionally in the presence of a condensation agent,

25 optionally in the presence of an acid binding agent and optionally in the presence of a diluent

17

or

b) racemic compounds of structure (I-rac)

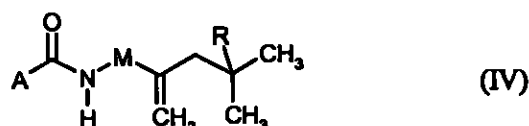


in which R, M and A have the meanings defined above,

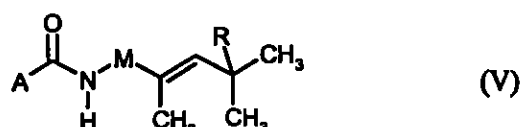
- 5 are chromatographed on a chiral silica gel stationary phase in the presence of an eluent or eluent mixture as the liquid phase,
or are fractionally crystallised with optically active acids under salt formation and subsequently the enantiomerically pure or enriched compounds of structure (I) is released,

or

10 c) compounds of structure (IV)



in which R, M and A have the meanings defined above,
or compounds of structure (V)



- 15 in which R, M and A have the meanings defined above,
or mixtures of both compounds are hydrogenated in the presence of an optically active catalyst or a catalyst with optically active ligand.

20 Finally it was found that the new optically active carboxamides of structure (I) possess very good microbicidal properties and are suitable for the control detrimental microorganisms both in plant protection and in the protection of materials.

The new optically active carboxamides of structure (I) are characterised opposite known compounds above all by improved action and lower application concentrations and thus lower adverse
25 environmental impact and reduced toxicity.

The optically active carboxamides of the invention are defined in general terms by structure (I). Preferred group definitions of the previously and hereinafter defined structures are given below. These definitions apply in equal measure to the final products of structure (I) as well as for all
30 intermediates.

- R stands preferably for hydrogen, methyl or ethyl.
- R stands more preferably for hydrogen or methyl.
- M stands preferably for M-1.
- 5 M stands furthermore preferably for M-2.
- M stands furthermore preferably for M-3.
- M stands furthermore preferably for M-4.
- M stands more preferably for M-1, whereby R¹ stands for hydrogen.
- M stands furthermore more preferably for M-2, whereby R¹ stands for hydrogen.
- 10 R¹ stands preferably for hydrogen.
- R¹ stands furthermore preferably for fluorine, whereby fluorine is more preferably at positions 4, 5 or 6, most preferably in positions 4 or 6, in particular in position 4 of the anilide group [c.f. structure (I) above].
- 15 A stands preferably for the group A1.
- A stands more preferably for A1 with the meaning 5-fluoro-1,3-dimethyl-1H-pyrazole-4-yl, 3-trifluoromethyl-1-methyl-1H-pyrazole-4-yl or 3-difluoromethyl-1-methyl-1H-pyrazole-4-yl.
- A stands most preferably for A1 with the meaning 5-fluoro-1,3-dimethyl-1H-pyrazole-4-yl.
- 20 A stands moreover preferably for the group A2.
- A stands more preferably for A2 with the meaning 2-trifluoromethylphenyl or 2-iodophenyl.
- A stands moreover preferably for the group A3.
- 25 A stands more preferably for A3 with the meaning 1,4-dimethyl-pyrazole-3-yl, 1-methyl-4-trifluoromethyl-pyrazole-3-yl or 1-methyl-4-difluoromethyl-pyrazole-3-yl.
- A stands most preferably for A3 with the meaning 1-methyl-4-trifluoromethyl-pyrazole-3-yl.
- R² stands preferably for methyl or trifluoromethyl.
- 30 R³ stands preferably for hydrogen or fluorine.
- R⁴ stands preferably for trifluoromethyl or iodine.
- R⁵ stands preferably for trifluoromethyl.
- 35

The group definitions or explanations defined in general or within preferred ranges in the above can, however, also be combined arbitrarily with one another, that is between the respective ranges and preferred ranges. This applies to the end product as well as to the precursors and intermediates.

- 5 The definitions specified can also be combined with one another as desired. Moreover, individual definitions may be omitted.

Preferred, more preferred and most preferred are compounds of structure (I) which in each case bear the substituents defined as preferred, more preferred or most preferred.

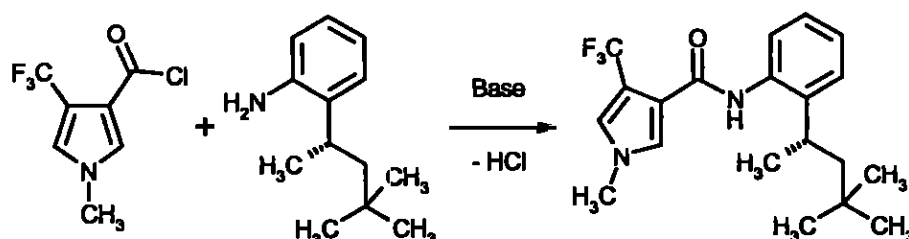
10

Description of the methods and intermediate products

Method (a)

If 1-methyl-4-(trifluoromethyl)-1*H*-pyrrole-3-carbonyl chloride and {2-[(1*S*)-1,3,3-trimethylbutyl]-phenyl}amine are used as starting materials method (a) of the invention can be illustrated by the

- 15 following reaction scheme:



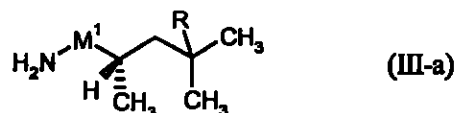
- The carboxylic acid derivatives necessary as starting materials for the implementation of method (a) of the invention are defined in general terms by structure (II). In this structure (II) A has preferably, more preferably or most preferably those meanings which have been defined already as preferred, more preferred and most preferred for A in connection with the description of compounds of structure (I) of the invention. X¹ stands preferably for chlorine, bromine or hydroxy, more preferably for chlorine.
- 20

- The carboxylic acid derivatives of structure (II) are known (c.f. WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 and EP-A 0 589 313)
- 25

- Furthermore, the amines necessary as starting materials for the implementation of method (a) of the invention are described in general terms by structure (III). In this structure (III) R and M have preferably, more preferably or most preferably those meanings which have been defined already as preferred, more preferred and most preferred for these groups in connection with the description of compounds of structure (I) of the invention.
- 30

The amines of structure (III) are new.

Amines of structure (III-a)



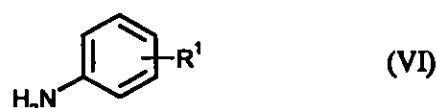
5 in which

R has the meanings defined above,

M¹ stands for M-1,

may be prepared for example in that

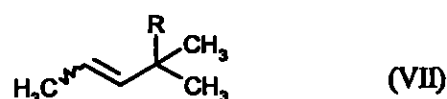
d) in a first step an aniline derivative of structure (VI)



10

in which R¹ has the meanings defined above,

is reacted with an alkene of structure (VII)

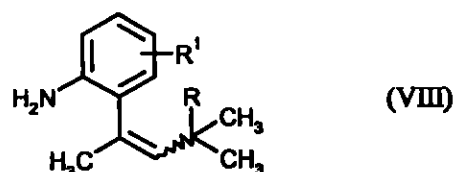


in which R has the meanings defined above,

15

in the presence of a catalyst, optionally in the presence of a base and optionally in the presence of a diluent,

and the alkenylaniline of structure (VIII) thus obtained

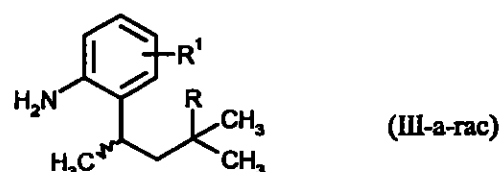


20

in which R and R¹ have the meanings defined above,

is hydrogenated in a second step optionally in the presence of a diluent and optionally in the presence of a catalyst,

and the racemic aniline derivative of structure (III-a-rac) thus obtained



25

in which R and R¹ have the meanings defined above

is chromatographed in a third step on a chiral silica gel stationary phase in the presence of an eluent or eluent mixture as liquid phase.

The hydrogenation of compounds of structure (VIII) can also be carried out optionally in the presence of an optically active catalyst or in the presence of a catalyst and an optically active ligand and thus provide optically active compounds of structure (III-a).

Compounds of structure (III-a-rac) can also be fractionally crystallised in the presence of optically active acids under salt formation, following which the enantiomerically pure or enriched compounds of structure (III-a) is released. In general all optically active acids are suitable for the formation of diastereomeric salts. Examples are: (1*S*)-(+)-camphor-10-sulphonic acid, (1*R*)-(-)-camphor-10-sulphonic acid, *S,S*-(-)-tartaric acid, *R,R*-(+)-tartaric acid, *R*-lactic acid, *S*-lactic acid or optically active amino acids, preferably naturally occurring optically active amino acids.

The aniline derivatives necessary as starting materials for the implementation of method (d) of the invention are defined in general terms by structure (VI). In this structure (VI) R^1 has preferably, more preferably or most preferably those meanings which have been defined already as preferred, more preferred and most preferred for these groups in connection with the description of compounds of structure (I) of the invention.

Aniline derivatives of structure (VI) are known.

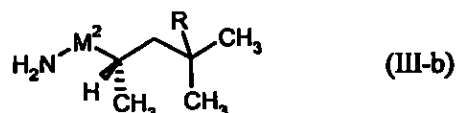
The alkenes necessary as starting materials for the implementation of method (d) of the invention are defined in general by structure (VII). In this structure (VII) R has preferably, more preferably or most preferably those meanings which have been described already as preferred, more preferred and most preferred for this group in connection with the description of compounds of structure (I) of the invention.

Alkenes of structure (VII) are known or can be obtained by known methods.

The alkenylaniline occurring as intermediates during implementation of method (d) of the invention are defined in general by structure (VIII). In this structure (VIII) R and R^1 have preferably, more preferably or most preferably those meanings which have been described already as preferred, more preferred and most preferred for these groups in connection with the description of compounds of structure (I) of the invention.

Alkenylanilines of structure (VIII) are known and/or can be obtained by known procedures.

The amines of structure (III-b)



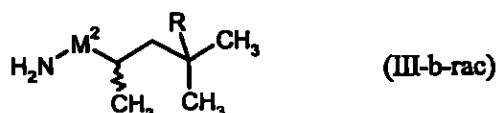
5 in which

R has the meanings defined above,

M² stands for M-2, M-3 or M-4,

may be obtained for example when

e) racemic amines of structure (III-b-rac)



10

in which R and M² have the meanings defined above

are chromatographed on a chiral silica gel stationary phase in the presence of an eluent or eluent mixture as liquid phase.

15 The racemic amines of structure (III-b-rac) are known and/or can be obtained by known methods (c.f. e.g. WO 02/38542, EP-A 1 036 793 and EP-A 0 737 682).

Method (b)

20 The racemic compounds necessary as starting materials for the implementation of method (b) of the invention are defined in general by structure (I-rac). In this structure R, M and A stand preferably, more preferably or most preferably for those meanings which have been described already as preferred, more preferred and most preferred for these groups in connection with the description of compounds of structure (I) of the invention.

25 The racemic compounds of structure (I-rac) used in the implementation of method (b) are known and may be prepared by known methods (c.f. e.g. WO 03/010149, WO 02/38542 and DE-A 102 29 595). Racemic compounds of structure (I-rac) can be obtained, for example, by the reaction of carboxylic acid derivatives of structure (II) with racemic compounds of structures (III-a-rac) or (III-b-rac) in analogy to Method (a) of the invention.

30

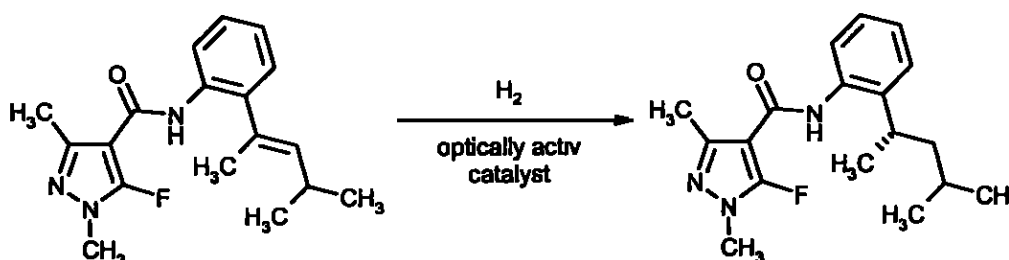
In the implementation of Method (b) of the invention the methods of preparative chromatography are used, preferably the method of High Performance Liquid Chromatography (HPLC). Here a chiral silica gel stationary phase is used. Chiracel OD[®] has proved to be particularly suitable for the

separation of compounds of structure (I-rac) into the two enantiomers. This separating material is commercially available. Other stationary phases may also be used as chromatographic material

- If compounds of structure (I-rac) are to be separated into the individual optically active compounds by fractional crystallisation all optically active acids are suitable for the formation of diastereomeric salts. Examples are: (1*S*)-(+)-camphor-10-sulphonic acid, (1*R*)-(-)-camphor-10-sulphonic acid, *S,S*-(-)-tartaric acid, *R,R*-(+)-tartaric acid, *R*-lactic acid, *S*-lactic acid or optically active amino acids, preferably naturally occurring optically active amino acids.

10 Method (c)

If *N*-[2-(1,3-Dimethylbut-1-en-1-yl)phenyl]-5-fluoro-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-4-carboxamide, hydrogen and an optically active catalyst are used as starting materials Method (c) of the invention may be illustrated by the following reaction scheme:

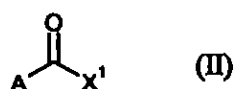


- The compounds necessary as starting materials for the implementation of method (c) of the invention are defined in general by structures (IV) and (V). In these structures R, M and A have preferably, more preferably or most preferably those meanings which have been described already as preferred, more preferred and most preferred for these groups in connection with the description of compounds of structure (I) of the invention.

20

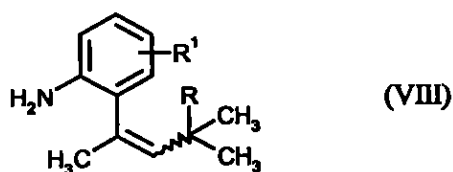
Compounds of structures (IV) and (V) (or mixtures of these compounds) are obtained when

- f) carboxylic acid derivatives of structure (II)

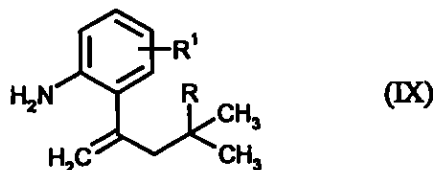


in which

- A has the meanings defined above and
 X¹ stands for halogen or hydroxy,
 are reacted either with an alkenylaniline of structure (VIII)



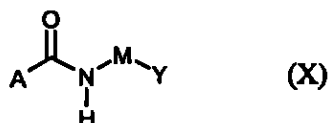
in which R and R¹ have the meanings defined above,
or with an alkenylaniline of structure (IX)



- 5 in which R and R¹ have the meanings defined above,
optionally in the presence of a catalyst, optionally in the presence of a condensation agent,
optionally in the presence of an acid binding agent and optionally in the presence of a diluent,

or

- g) carboxamides of structure (X)



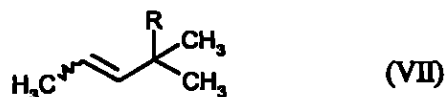
10

in which

M and A have the meanings defined above, and

Y stands for bromine or iodine,

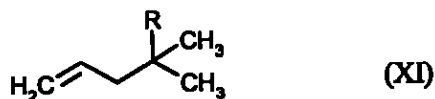
are reacted with an alkene of structure (VII)



15

in which R has the meanings defined above,

or with an alkene of structure (XI)



in which R has the meanings defined above,

- 20 in the presence of a catalyst, optionally in the presence of a base and optionally in the
presence of a diluent.

The carboxylic acid derivatives of structure (II) necessary as starting materials in the implementation of method (f) of the invention have already been described in connection with method (a).

25

The alkenylanilines of structure (VIII) also necessary as starting materials in the implementation of method (f) of the invention have already been described in connection with method (d).

5 The alkenylanilines alternatively necessary as starting materials for the implementation of method (f) of the reaction are defined in general by structure (IX). In this structure (IX) R and R¹ have preferably, more preferably or most preferably those meanings which have been described already as preferred, more preferred and most preferred for these groups in connection with the description of compounds of structure (I) of the invention.

10 Alkenylanilines of structure (IX) are known and/or can be obtained by known methods.

The carboxamides necessary as starting materials for the implementation of method (g) of the reaction are defined in general by structure (X). In this structure (X) M and A have preferably, more preferably or most preferably those meanings which have been described already as preferred, more preferred and most preferred for these groups in connection with the description of compounds of structure (I) of the invention.

20 Carboxamides of structure (X) are known and/or can be obtained by known methods (c f. WO 03/010149).

The alkenes of structure (VII) also necessary as starting materials for implementation of method (g) of the invention have already been described in connection with method (d).

25 The alkenes alternatively necessary as starting materials for the implementation of method (g) of the reaction are defined in general by structure (XI). In this structure (XI) R has preferably, more preferably or most preferably those meanings which have been described already as preferred, more preferred and most preferred for this group in connection with the description of compounds of structure (I) of the invention.

30 Alkenes of structure (XI) are known or can be obtained by known methods.

Reaction conditions

35 All inert organic solvents are suitable as diluents for implementation of the methods (a) and (f) of the invention. These include preferably aliphatic, alicyclic or aromatic hydrocarbons such as, for example, petroleum ether, hexane, heptane, cyclohexane, methylcyclohexane, benzene, toluene, xylene or decalin; halogenated hydrocarbons such as, for example, chlorobenzene, dichlorobenzene,

dichloromethane, chloroform, tetrachloromethane, dichloroethane or trichloroethane; ethers such as diethyl ether, diisopropyl ether, methyl-*tert*-butylether, methyl-*tert*-amyl ether, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimethoxyethane, 1,2-diethoxyethane or anisole, or amides such as *N,N*-dimethylformamide, *N,N*-dimethylacetamide, *N*-methylformanilide, *N*-methylpyrrolidone or hexamethylphosphoramide.

Methods (a) and (f) of the invention are carried out optionally in the presence of a suitable acid acceptor. All normal inorganic or organic bases are suitable. These include preferably alkaline earth or alkali hydrides, hydroxides, amides, alkoxides, acetates, carbonates or - hydrogen carbonates such as, for example, sodium hydride, sodium amide, sodium methylate, sodium ethylate, potassium *tert*-butylate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, ammonium hydroxide, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, ammonium acetate, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium hydrogen carbonate, sodium hydrogen carbonate or ammonium carbonate, as well as tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, tributylamine, *N,N*-dimethylaniline, *N,N*-dimethylbenzylamine, pyridine, *N*-methylpiperidine, *N*-methylmorpholine, *N,N*-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU).

Methods (a) and (f) of the invention are optionally carried out in the presence of a suitable condensation agent. All condensation agents normally suitable for such amidation reactions can be used, for example acid halide formers such as phosgene, phosphorus tribromide, phosphorus trichloride, phosphorus pentachloride, phosphorus oxychloride or thionyl chloride; anhydride formers such as ethyl chloroformate, methyl chloroformate, isopropyl chloroformate, isobutyl chloroformate or methane sulphonyl chloride; carbodimides such as *N,N'*-dicyclohexylcarbodiimide (DCC) or other standard condensation agents such as phosphorus pentoxide, polyphosphoric acid, *N,N'*-carbonyldiimidazole, 2-ethoxy-*N*-ethoxycarbonyl-1,2-dihydroquinoline (EEDQ), triphenyl phosphine/carbon tetrachloride or bromotripyrrolidinophosphonium hexafluorophosphate.

Methods (a) and (f) of the invention are optionally carried out in the presence of a catalyst, for example 4-dimethylaminopyridine, 1-hydroxybenzotriazole or dimethylformamide.

During the implementation of methods (a) and (f) of the invention the reaction temperature can be varied over a wide range. Normally temperatures of 0°C to 150°C, preferably 0°C to 80°C, are used.

For implementation of method (a) for the preparation of compounds of structure (I) 0.2 to 5 mol, preferably 0.5 to 2 mol, of the aniline derivative of structure (III) are normally used per mol of the carboxylic acid derivative of structure (II).

For implementation of method (f) for preparation of compounds of structures (IV) and (V) 0.2 to 5 mol, preferably 0.5 to 2 mol, of the alkenylaniline of structure (VIII) or (IX) are normally used per mol of the carboxylic acid derivative of structure (II).

- 5 All normal inert organic solvents, their mixtures, or their mixtures with water may be used as eluents in the implementation of method (b) of the invention. Preferably suitable are optionally halogenated aliphatic, alicyclic or aromatic hydrocarbons, such as petroleum ether, hexane, heptane, cyclohexane; dichloromethane, chloroform, alcohols such as methanol, ethanol, propanol; nitriles such as acetonitrile; esters such as methyl acetate or ethyl acetate. More preferable are aliphatic hydrocarbons
- 10 such as hexane or heptane and alcohols such as methanol or propanol, most preferable are *n*-heptane and isopropanol or their mixtures.

- During implementation of method (b) of the invention the reaction temperature can in each case be varied over a wide range. Normally temperatures between 10°C and 60°C, preferably between 10°C
- 15 und 40°C, are used, more preferably room temperature.

- During the implementation of Method (b) of the invention a ca. 1% solution of the racemic compound (I-rac) is used normally for chromatographic separation. However, it is also possible to use other concentrations. Work-up is carried out with normal procedures. The general procedure is that
- 20 the eluate is highly concentrated, solid material is filtered off and dried after washing with *n*-heptane. The residue is optionally freed from impurities possibly still present by chromatography. Mixtures of *n*-hexane or cyclohexene or cyclohexene and ethyl acetate are used as eluents, the composition of which must be adjusted to the respective compound to be purified.

- 25 All inert organic solvents are suitable as diluent in the implementation of the first step of method (d) of the invention as well as method (g) of the invention. These include preferably nitriles such as acetonitrile, propionitrile, *n*- or *i*-butyronitrile or benzonitrile, or amides such as *N,N*-dimethylformamide, *N,N*-dimethylacetamide, *N*-methylformanilide, *N*-methylpyrrolidone or hexamethylphosphoramide.

- 30 The first step of method (d) of the invention as well as method (g) of the invention are optionally carried out in the presence of a suitable acid acceptor. All normal inorganic and organic bases are suitable. These include preferably alkaline earth or alkali hydrides, hydroxides, amides, alkoxides, acetates, carbonates or hydrogen carbonates such as, for example, sodium hydride, sodium amide,
- 35 sodium methylate, sodium ethylate, potassium *tert*-butylate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, ammonium hydroxide, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, ammonium acetate,

sodium carbonate, potassium carbonate, potassium hydrogen carbonate, sodium hydrogen carbonate or ammonium carbonate, as well as tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, tributylamine, *N,N*-dimethylaniline, *N,N*-dimethylbenzylamine, pyridine, *N*-methylpiperidine, *N*-methylmorpholine, *N,N*-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or
5 diazabicycloundecene (DBU).

The first step of method (d) of the invention as well as method (g) of the invention are carried out in the presence of one or more catalysts. Particularly suitable are palladium salts or complexes. These include preferably palladium chloride, palladium acetate, tetrakis-(triphenylphosphine)palladium or
10 bis-(triphenylphosphine)palladium dichloride. A palladium complex can also be produced in the reaction mixture when a palladium salt and a complex ligand are added separately to the reaction. Suitable ligands are preferably organophosphorus compounds, for example triphenylphosphine, tri-*o*-tolylphosphine, 2,2'-bis(diphenylphosphino)-1,1'-binaphthyl, dicyclohexylphosphinebiphenyl, 1,4-bis-(diphenylphosphino)butane, bis(diphenylphosphino)ferrocene, di(*tert*-butylphosphino)biphenyl, di-
15 (cyclohexylphosphino)biphenyl, 2-dicyclohexylphosphino-2'-*N,N*-dimethylaminobiphenyl, tricyclohexylphosphine, tri-*tert*-butylphosphine. The ligands may also be omitted.

The first step of method (d) of the invention as well as method (g) of the invention are also optionally carried out in the presence of a further metal salts such as copper salts, for example copper(I) iodide.
20

During the implementation of the first step of method (d) of the invention as well as method (g) of the invention the reaction temperatures may be varied over a wide range. Normally temperatures of 20°C to 180°C, preferably temperatures of 50°C bis 150°C, are used.

25 For implementation of the first step of method (d) of the invention for preparation of the alkenylanilines of structure (VIII) 1 to 5 mol, preferably 1 to 3 mol, of the alkene of structure (VII) are normally used per mol of the aniline derivative of structure (VI).

For implementation of method (g) for preparation of compounds of structures (IV) and (V) 1 to 5
30 mol, preferably 1 to 3 mol, of alkene of structure (VII) or (XI) are normally used per mol carboxamide of structure (X).

All inert organic solvents are suitable as diluent in the implementation of method (c) of the invention as well as the second step (hydrogenation) of method (d) of the invention. These include preferably
35 aliphatic or alicyclic hydrocarbons such as, for example, petroleum ether, hexane, heptane, cyclohexane, methylcyclohexane or decalin; ethers such as diethyl ether, diisopropyl ether, methyl-*tert*-

butyl ether, methyl-*tert*-amyl ether, dioxan, tetrahydrofuran, 1,2-dimethoxyethane or 1,2-diethoxyethane; alcohols such as methanol, ethanol, *n*- or *iso*-propanol, *n*-, *iso*-, *sec*- or *tert*-butanol, ethane-1,2-diol, propane-1,2-diol, ethoxyethanol, methoxyethanol, diethylene glycol monomethyl ether, diethylene glycol monoethyl ether, their mixtures with water or pure water

5

The second step (hydrogenation) of method (d) of the invention is carried out in the presence of a catalyst. All catalysts usually used for hydrogenation are suitable. Examples are Raney nickel, palladium, ruthenium or platinum, optionally on a support such as, for example, active charcoal.

- 10 The chiral hydrogenation in the implementation of method (c) of the invention and in method (d) is carried out in the presence of an optically active ligand. Examples are the combination (*R,R*)-Me-DuPhos/RuCl₂[®] or (*S,S*)-Me-DuPhos/RuCl₂[®] (according to the desired enantiomer).

- 15 The hydrogenation in the second step of method (d) of the invention can also be carried out in the presence of triethylsilane instead of in the presence of hydrogen in combination with a catalyst.

During the implementation of method (c) of the invention as well as the second step of method (d) of the invention the reaction temperatures can be varied over a wide range. Normally temperatures of 0°C to 150°C are used, preferably at temperatures of 20°C to 100°C.

20

Method (c) of the invention as well as the second step of method (d) of the invention are carried out under a hydrogen pressure between 0.5 and 200 bar, preferably between 2 and 50 bar, more preferably between 3 and 10 bar.

- 25 In each case, all normal inert organic solvents and their mixtures or possibly also mixtures with water are suitable for the implementation of the third step of method (d) of the invention and method (e) of the invention. Preferably suitable are optionally halogenated aliphatic, alicyclic or aromatic hydrocarbons, such as petroleum ether, hexane, heptane, cyclohexane; dichloromethane, chloroform; alcohols such as methanol, ethanol, propanol; nitriles such as acetonitrile; esters such as methyl acetate or
30 ethyl acetate. More preferred are aliphatic hydrocarbons such as hexane or heptane and alcohols such as methanol or propanol, most preferred are *n*-heptane and isopropanol or their mixtures.

- During implementation of the third step of method (d) of the invention and of method (e) of the invention the reaction temperatures can in each case be varied over wide range. In general
35 temperatures between 10°C and 60°C are used, preferably between 10°C and 40°C, more preferably at room temperature.

During the implementation of the third step of method (d) of the invention and method (e) a ca. 1% solution of the racemic compound (III-a-rac) and (III-b-rac), respectively, is normally used for chromatographic separation. However, it is also possible to use other concentrations. Work-up follows standard procedures. Normally the eluate is highly concentrated, solid material is filtered off and
5 dried after washing with *n*-heptane. The residue is optionally freed from impurities possibly still present by chromatography. Mixtures of *n*-hexane or cyclohexane and ethyl acetate are used as eluents, the composition of which must be adjusted to the respective compound to be purified.

When not otherwise indicated all methods of the invention are normally carried out under normal
10 pressure. It is also possible, however, to work under increased or reduced pressure – generally between 0.1 and 10 bar.

The compounds of the invention exhibit high microbicidal activity and can be used for the control of detrimental microorganisms such as fungi and bacteria in plant protection and material protection.

15

Fungicides may be used in plant protection for the control of Plasmodiophoromycetes, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomycetes, Basidiomycetes and Deuteromycetes.

Bactericides may be used in plant protection for the control of Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae and Streptomycetaceae.

20

By way of illustration, but not restricting, a number of pathogens of fungal and bacterial diseases which fall within the generic terms defined above is named:

Xanthomonas species such as, e.g. *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

Pseudomonas species such as, e.g. *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

25

Erwinia species such as, e.g., *Erwinia amylovora*;

Pythium species such as, e.g., *Pythium ultimum*;

Phytophthora species such as, e.g., *Phytophthora infestans*,

Pseudoperonospora species such as, e.g., *Pseudoperonospora humuli* or

Pseudoperonospora cubensis;

30

Plasmopara species such as, e.g., *Plasmopara viticola*;

Bremia species such as, e.g., *Bremia lactucae*;

Peronospora species such as, e.g., *Peronospora pisi* oder *P. brassicae*;

Erysiphe species such as, e.g., *Erysiphe graminis*;

Sphaerotheca species such as, e.g., *Sphaerotheca fuliginea*;

35

Podosphaera species such as, e.g., *Podosphaera leucotricha*;

Venturia species such as, e.g., *Venturia inaequalis*;

- Pyrenophora species such as, e.g., *Pyrenophora teres* or *P. graminea*
(conidial form: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
Cochliobolus species such as, e.g., *Cochliobolus sativus*
(conidial form: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*);
- 5 *Uromyces* species such as, e.g., *Uromyces appendiculatus*;
Puccinia species such as, e.g., *Puccinia recondita*;
Sclerotinia species such as, e.g., *Sclerotinia sclerotiorum*;
Tilletia species such as, e.g., *Tilletia caries*;
Ustilago species such as, e.g., *Ustilago nuda* or *Ustilago avenae*;
- 10 *Pellicularia* species such as, e.g., *Pellicularia sasakii*;
Pyricularia species such as, e.g., *Pyricularia oryzae*;
Fusarium species such as, e.g., *Fusarium culmorum*;
Botrytis species such as, e.g., *Botrytis cinerea*;
Septoria species such as, e.g., *Septoria nodorum*;
- 15 *Leptosphaeria* species such as, e.g., *Leptosphaeria nodorum*;
Cercospora species, e.g., *Cercospora canescens*;
Alternaria species such as, e.g., *Alternaria brassicae*;
Pseudocercospora species such as, e.g., *Pseudocercospora herpotrichoides*,
Rhizoctonia species, such as, for example, *Rhizoctonia solani*.
- 20 The active compounds of the invention exhibit a high fortifying action in plants. They are thus suitable for the mobilisation of the plants' intrinsic resistance to infestation by detrimental microorganisms.
- 25 Within the present context plant fortifying (resistance inducing) compounds are understood to mean those compounds that are able to stimulate the defence mechanisms of plants such that the treated plants develop considerable resistance to detrimental microorganisms upon subsequent inoculation with these microorganisms.
- 30 In the present case detrimental microorganisms are understood to be phytopathogenic fungi, bacteria and viruses. The compounds of the invention can thus be used in order to protect plants against infestation by the named pathogens over a certain period of time. The time period within which protection is brought about ranges in general from 1 to 10 days, preferably 1 to 7 days after the treatment of the plants with the active compounds.
- 35 The good plant compatibility of the active compounds at the concentrations required for controlling

plant diseases permits a treatment of above surface parts of the plants, plant and seed stock and the soil.

Thus the active compounds of the invention can be used with high success for the control of cereal diseases such as, for example, Puccinia species and diseases in wine, fruit and vegetable cultivation
5 such as, for example, Botrytis, Venturia or Alternaria species.

The active compounds of the invention are also suitable to increase crop yields. They are moreover of low toxicity and exhibit a good plant compatibility.

10 At certain concentrations and applied quantities the active compounds of the invention can also be used as herbicides, for influencing plant growth and for the control of deadly pests . They can optionally also be used as intermediates and precursors for the synthesis of further active compounds.

According to the invention all plants and plant parts may be treated. By plants is meant all plants and
15 plant populations such as desirable and undesirable wild plants or cultivated plants (including naturally occurring cultivated plants). Cultivated plants can be plants that can be obtained by conventional breeding and optimisation methods or by bioengineering or genetic engineering methods or by combinations of such methods, including transgenic plants and including plants varieties protected or not protected by plant varieties protection rights. By plant parts is meant all
20 above ground and below ground parts and organs of the plants such as shoot, leaf, blossom and root, whereby as illustration leaves, needles, branches, trunks, blossoms, fruiting bodies, fruit and seed as well as roots, tubers, and rhizomes are listed. Harvested yields such as vegetative and generative propagation material, for example cuttings, tubers, rhizomes, shoots and seed also belong to plant parts.

25 The treatment according to the invention of plants and plant parts is carried out directly or by the action on their environment, habitat or storage facility with the normal treatment methods, e.g. by immersion, spraying, vaporising, misting, sprinkling, coating and with the propagation material, particularly with seeds, furthermore by single or multiple coating.

30 In material protection the compounds of the invention may be used for the protection of technical materials against infestation and destruction by detrimental microorganisms.

By technical materials is meant within the present context non-living materials which are produced
35 for technical use. For example, technical materials that may be protected from microbial alteration or destruction by the compounds of the invention can be adhesives, glues, paper and cardboard, textiles,

leather, wood, paint and plastic articles, cooling lubricants and other materials that can be attacked or destroyed by microorganisms. Within the concept of materials to be protected are also intended parts of production plants which may be impaired by the growth of microorganisms, such as cooling water cycles. Within the scope of the present invention technical materials mentioned are preferably
5 adhesives, glues, paper and cardboard, leather, wood, paint, cooling lubricants and heat exchanger fluids are specially mentioned, more preferably wood.

Microorganisms which can effect a degeneration or an alteration in technical materials include for example, bacteria, fungi, yeasts, algae and moulds. The active compounds of the invention act
10 preferably against fungi, especially mould fungi, wood discolouring and wood destroying fungi (Basidiomycetes) as well as moulds and algae.

Microorganisms of the following genres are named as examples:

- Alternaria, such as *Alternaria tenuis*,
- 15 Aspergillus, such as *Aspergillus niger*,
- Chaetomium, such as *Chaetomium globosum*,
- Coniophora, such as *Coniophora puetana*,
- Lentinus, such as *Lentinus tigrinus*,
- Penicillium, such as *Penicillium glaucum*,
- 20 Polyporus, such as *Polyporus versicolor*,
- Aureobasidium, such as *Aureobasidium pullulans*,
- Sclerophoma, such as *Sclerophoma pityophila*,
- Trichoderma, such as *Trichoderma viride*,
- Escherichia, such as *Escherichia coli*,
- 25 Pseudomonas, such as *Pseudomonas aeruginosa*,
- Staphylococcus, such as *Staphylococcus aureus*.

Depending upon their respective physical and/or chemical properties the active compounds can be converted into the usual formulations such as solutions, emulsions, suspensions, powders, foams,
30 pastes, granulates, aerosols, fine dispersion in polymeric materials and in coatings for seeds as well as cold and warm ULV spray formulations.

These formulations are prepared in the normal manner, e.g. by mixing the active compounds with diluents, that is liquid solvents, pressurised liquefied gases and/or solid supports, optionally with the
35 use of surfactants, that is emulsifiers and/or dispersants and/or foaming agents. Where water is used as diluent organic solvents can also be used as cosolvents. Suitable liquid solvents essentially suitable

- are: aromatics such as xylene, toluene or alkylnaphthalenes, chlorinated aromatics or chlorinated aliphatic hydrocarbons such as chlorobenzenes, chloroethylenes or methylene chloride, aliphatic hydrocarbons, such as cyclohexane, or paraffins, for example petroleum fractions, alcohols such as butanol or glycol as well as their ethers and esters, ketones such as acetone, ethylmethylketone, isobutylmethylketone or cyclohexanone, highly polar solvents such as dimethylformamide and dimethyl sulphoxide, as well as water. By liquefied gaseous diluents or supports are meant such liquids that are gaseous at normal temperature and under normal pressure, for example, aerosol propellants such as halohydrocarbons as well as butane, propane, nitrogen and carbon dioxide. Suitable as solid supports are, e.g., natural mineral flours such as kaolin, argillaceous earth, talc, chalk, quartz, attapulgite montmorillonite or diatomaceous earth and synthetic mineral flours such as highly dispersed silica, aluminium oxide, and silicates. Suitable solid supports for granulates are, for example, broken and fractionated natural stone such as calcite, pumice, marble, sepiolite, dolomite as well as synthetic granulates from inorganic and organic flours as well as granulates from organic material such as sawdust, coconut shells, corn cobs and tobacco stems. Suitable emulsifiers and/or foaming agents are, e.g., non-ionic and anionic emulsifiers such as fatty acid esters of polyoxyethylene, fatty alcohol ethers of polyoxyethylene, for example, alkylaryl polyglycol ethers, alkyl sulphonates, alkyl sulphates, aryl sulphonates and protein hydrolysates. Suitable dispersants are: e.g. lignin sulphite liquor and methyl cellulose.
- 20 Bonding agents such as carboxymethylcellulose, natural and synthetic powdery, granular or lactiferous polymers can be used in the formulation, such as gum Arabic, polyvinyl alcohol, polyvinyl acetate as well as natural phospholipids, such as cephalins and lecithins, and synthetic phospholipids. Further additives can be mineral and vegetable oils.
- 25 Colorants such as inorganic pigments, e.g. iron oxide, titanium oxide, ferrocyan blue and organic colorants such as alizarin, azo and metallophthalocyanin dyes and trace nutrients such as iron, manganese, boron, copper, cobalt, molybdenum and zinc salts can be used.

30 The formulations normally contain between 0.1 and 95% by weight active compound, preferably between 0.5 and 90%.

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

For example, the following compounds are suitable as mixture partners:

Fungicides:

- 2-phenylphenol; 8-hydroxyquinoline sulphate; acibenzolar-S-methyl; aldimorph; amidoalumet; ampropylfos; ampropylfos-potassium; andoprime; anilazine; azaconazole; azoxystrobin; benalaxyl;
- 5 benodanil; benomyl; benthiavalicarb-isopropyl; benzamacril; benzamacril-isobutyl; bilanafos; binapacryl; biphenyl; bitertanol; blasticidin-S; bromuconazole; bupirimate; buthiobate; butylamine; calcium polysulfide; capsimycin; captafol; captan; carbendazim; carboxin; carpropamid; carvone; chinomethionat; chlobenthazone; chlorfenazole; chloroneb; chlorothalonil; chlozolate; clozylacon; cyazofamid; cyflufenamid; cymoxanil; cyproconazole; cyprodinil; cyprofuram; dagger G; debacarb;
- 10 dichlofluanid; dichlone; dichlorophen; diclocymet; diclomezine; dicloran; diethofencarb; difenoconazole; diflumetorim; dimethirimol; dimethomorph; dimoxystrobin; dimiconazole; dimiconazole-M; dinocap; diphenylamine; dipyrithione; ditalimfos; dithianon; dodine; drazoxolon; edifenphos; epoxiconazole; ethaboxam; ethirimol; etridiazole; famoxadone; fenamidone; fenapanil; fenarimol; fenbuconazole; fenfuram; fenhexamid; fentropin; fenoxanil; fenpiclonil; fenpropidin;
- 15 fenpropimorph; ferbam; fluazinam; flubenzimine; fludioxonil; flumetover; flumorph; fluoromide; fluoxastrobin; fluquinconazole; flurprimidol; flusilazole; flusulfamide; flutolanil; flutriafol; folpet; fosetyl-Al; fosetyl-sodium; fuberidazole; furalaxyl; furametpyr; furcarbanil; furmecyclox; guazatine; hexachlorobenzene; hexaconazole; hymexazol; imazalil; imibenconazole; iminoctadine triacetate; iminoctadine tris(albesilate); iodocarb; ipconazole; iprobenfos; iprodione; iprovalicarb; irumamycin;
- 20 isoprothiolane; isovaldione; kasugamycin; kresoxim-methyl; mancozeb; maneb; mefenoxam; mepanipyrim; mepronil; metalaxyl; metalaxyl-M; metconazole; methasulfocarb; methfuroxam; metiram; metominostrobin; metsulfosax; mildiomicin; myclobutanil; myclozolin; natamycin; nicobifen; nitrothal-isopropyl; noviflumuron; nuarimol; ofurace; oryastrobin; oxadixyl; oxolinic acid; oxpoconazole; oxycarboxin; oxyfenthiin; paclobutrazol; pefurazoate; penconazole; pencycuron;
- 25 phosdiphen; phthalide; picoxystrobin; piperazin; polyoxins; polyoxorim; probenazole; prochloraz; procymidone; propamocarb; propanosine-sodium; propiconazole; propineb; proquinazid; prothioconazole; pyraclostrobin; pyrazophos; pyrifenoxy; pyrimethanil; pyroquilon; pyroxyfur; pyrrolnitrin; quinconazole; quinoxifen; quintozone; simeconazole; spiroxamine; sulphur; tebuconazole; tecloftalam; tecnazene; tetcyclacis; tetraconazole; thiabendazole; thicyofen;
- 30 thifluzamide; thiophanate-methyl; thiram; tioxydim; tolclofos-methyl; tolylfluanid; triadimefon; triadimenol; triazbutyl; triazoxide; tricyclamide; tricyclazole; tridemorph; trifloxystrobin; triflumizole; triforine; triticonazole; uniconazole; validamycin A; vinclozolin; zineb; ziram; zoxamide; (2*S*)-*N*-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propenyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulphonyl)-amino]-butanamide; 1-(1-naphthalenyl)-1*H*-pyrrole-2,5-dione; 2,3,5,6-tetrachloro-4-(methylsulpho-
- 35 nyl)pyridine; 2-amino-4-methyl-*N*-phenyl-5-thiazole carboxamide; 2-Chloro-*N*-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1*H*-inden-4-yl)-3-pyridine dicarbonitrile; Actino-

vate; *cis*-1-(4-chlorophenyl)-2-(1*H*-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol; methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1*H*-inden-1-yl)-1*H*-imidazole-5-carboxylate; monopotassium carbonate; *N*-(6-methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropane carboxamide; *N*-butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1-oxaspiro[4.5]decane-3-amine; sodium tetrathiocarbonate; and copper salts and preparations such as Bordeaux mixture; copper hydroxide; copper naphthenate; copper oxychloride; copper sulphate; cufraneb; copper oxide; mancopper; oxine-copper.

Bactericides:

bronopol, dichlorophen, nitrapyrin, nickel dimethyldithiocarbamate, kasugamycin, octhulinon, furan carboxylic acid, oxytetracyclin, probenazol, streptomycin, tecloftalam, copper sulphate and other copper preparations.

Insecticides / miticides / nematocides:

1. Acetylcholinesterase (AChE) inhibitors

1.1 Carbamates (e.g. alanycarb, aldicarb, aldoxycarb, allyxycarb, aminocarb, azamethiphos, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxycarboxim, carbaryl, carbofuran, carbosulfan, chloethocarb, coumaphos, cyanofenphos, cyanophos, dimetilan, ethiofencarb, fenobucarb, fenothiocarb, formetanate, furathiocarb, isoprocab, metam-sodium, methiocarb, methomyl, metolcarb, oxamyl, pirimicarb, promecarb, propoxur, thiocarb, Thiofanox, triazamate, trimethacarb, XMC, xylylcarb)

1.2 Organophosphates (e.g. acephate, azamethiphos, azinphos (-methyl, -ethyl), bromophos-ethyl, bromfenvinfos (-methyl), butathiofos, cadusafos, carbophenothion, chlorethoxyfos, chlorfenvinphos, chlormephos, chlorpyrifos (-methyl/-ethyl), coumaphos, cyanofenphos, cyanophos, Chlorfenvinphos, demeton-S-methyl, demeton-S-methylsulphon, dialifos, diazinon, dichlofenthion, dichlorvos/DDVP, dicrotophos, dimethoate, dimethylvinphos, dioxabenzofos, disulfoton, EPN, ethion, ethoprophos, etrimfos, famphur, fenamiphos, fenitrothion, fensulfothion, fenthion, flupyrazofos, fonofos, formothion, fosmethilan, fosthiazate, heptenophos, iodofenphos, iprobenfos, isazofos, isofenphos, isopropyl O-salicylate, isoxathion, malathion, mecarbam, methacrifos, methamidophos, methidathion, mevinphos, monocrotophos, naled, omethoate, oxydemeton-methyl, parathion (-methyl/-ethyl), phenthoate, phorate, phosalone, phosmet, phosphamidon, phosphocarb, phoxim, pirimiphos (-methyl/-ethyl), profenofos, propaphos, propetamphos, prothiofos, prothoate, pyraclofos, pyridaphenthion, pyridathion, quinalphos, sebufos, sulfotep, sulprofos, tebupirimfos, temephos, terbufos, tetrachlorvinphos, thiometon, triazophos, trichlorfon, vamidothion)

2. Sodium channel modulators / voltage dependent sodium channel blockers

2.1 Pyrethroides (e.g. acrinathrin, allethrin (d-*cis*-trans, d-trans), beta-cyfluthrin, bifenthrin, bioallethrin, bioallethrin S-cyclopentyl isomer, bioethanomethrin, biopermethrin, bioresmethrin, chlo-

- vaporthrin, cis-cypermethrin, cis-resmethrin, cis-permethrin, clopyrin, cycloprothrin, cyfluthrin, cyhalothrin, cypermethrin (alpha-, beta-, theta-, zeta-), cyphenothrin, DDT, deltamethrin, empenethrin (1R-isomer), esfenvalerate, etofenprox, fenfluthrin, fenpropathrin, fenpyrithrin, fenvalerate, flubrocycrin, flucythrinate, flufenprox, flumethrin, fluvalinate, fubfenprox, gamma-cyhalothrin, imiprothrin, kadethrin, lambda-cyhalothrin, metofluthrin, permethrin (cis-, trans-), phenothrin (1R-trans isomer), prallethrin, profluthrin, protrifenbutate, pyresmethrin, resmethrin, RU 15525, silafluofen, tau-fluvalinate, tefluthrin, terallethrin, tetramethrin (1R-isomer), tralomethrin, transfluthrin, ZXI 8901, pyrethrins (pyrethrum))
- 5 2.2 Oxadiazines (e.g. indoxacarb)
- 10 3. *Acetylcholine receptor agonists/antagonists*
- 3.1 Chloronicotines/neonicotinoids (e.g. acetamiprid, alothianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpyram, nithiazine, thiacloprid, thiamethoxam)
- 3.2 Nicotine, bensultap, cartap
4. *Acetylcholine receptor modulators*
- 15 4.1 Spinosyns (e.g. spinosad)
5. *GABA-controlled chloride channel antagonists*
- 5.1 Cyclodiene organochlorines (e.g. camphechlor, chlordane, endosulfan, gamma-HCH, HCH, heptachlor, lindane, methoxychlor)
- 5.2 Fiproles (e.g. Acetoprole, Ethiprole, Fipronil, Vaniliprole)
- 20 6. *Chloride channel activators*
- 6.1 Mectins (e.g. abamectin, avermectin, emamectin, emamectin benzoate, ivermectin, milbemectin, milbemycin)
7. *Juvenile hormone mimetics*
- (e.g. diofenolan, epofenonane, fenoxycarb, hydroprene, kinoprene, methoprene, pyriproxifen, triprene)
- 25 8. *Ecdysone agonists/disruptors*
- 8.1 Diacylhydrazine (e.g. chromafenozide, halofenozide, methoxyfenozide, tebufenozide)
9. *Chitin biosynthesis inhibitors*
- 9.1 Benzoyl ureas (e.g. bistrifluron, chlorfluazuron, diflubenzuron, fluazuron, flucycloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, penfluron, teflubenzuron, triflumuron)
- 30 9.2 Buprofezin
- 9.3 Cyromazine
10. *Oxidative phosphorylation inhibitors, ATP disruptors*
- 35 10.1 Diafenthiuron
- 10.2 Organotin (e.g. azocyclotin, cyhexatin, fenbutatin oxide)

- 11 Decouplers of oxidative phosphorylation by disruption of H-proton gradients*
- 11.1 Pyrroles (e.g. chlorfenapyr)
- 11.2 Dimetrophenols (e.g. binapacryl, dinobutor, dinocap, DNOC)
- 12. Site I electron transport inhibitors*
- 5 12.1 METT's (e.g. fenazaquin, fenpyroximate, pyrimidifen, pyridaben, tebufenpyrad, tolfenpyrad)
- 12.2 Hydramethylnone
- 12.3 Dicofol
- 13. Site II electron transport inhibitors*
- 13.1 Rotenones
- 10 *14. Site III electron transport inhibitors*
- 14.1 Acequinocyl, fluacrypyrim
- 15. Microbial insect intestinal membrane disruptors*
- Bacillus thuringiensis strains
- 16 Fat synthesis inhibitors*
- 15 16.1 Tetronic acids (e.g. spirodiclofen, spiromesifen)
- 16.2 Tetramic acids (e.g. 3-(2,5-dimethylphenyl)-8-methoxy-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl ethyl carbonate (alias: carbonic acid, 3-(2,5-dimethylphenyl)-8-methoxy-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl ethyl ester, CAS-Reg.-No.: 382608-10-8) and carbonic acid, cis-3-(2,5-dimethylphenyl)-8-methoxy-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl ethyl ester (CAS-Reg.-No.: 203313-25-1))
- 20 *17. Carboxamides*
- (z.B. flonicamid)
- 18 Octopaminergic agonists*
- (e.g. amtraz)
- 19. Magnesium-stimulated ATPase inhibitors*
- 25 (z.B. propargite)
- 20. Phthalamides*
- (e.g. N²-[1,1-Dimethyl-2-(methylsulfonyl)ethyl]-3-iodo-N¹-[2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluoromethyl)ethyl]phenyl]-1,2-benzene dicarboxamide (CAS-Reg.-No.: 272451-65-7))
- 21. Nereistoxin analogues*
- 30 (e.g. Thiocyclam hydrogen oxalate, thiosultap-sodium)
- 22. Biologics, hormones or pheromones*
- (e.g. azadirachtin, Bacillus spec., Beauveria spec., codlemone, Metarrhizium spec., Paecilomyces spec., Thuringiensin, Verticillium spec.)
- 23. Active compounds with unknown or non-specific mechanisms of action*
- 35 23.1 Fumigation agents (e.g. aluminium phosphide, methyl bromide, sulfuryl fluoride)
- 23.2 Selective antifeedants (e.g. cryolite, flonicamide, pymetrozine)

23.3 Mite growth inhibitors (e.g. clofentezine, etoxazole, hexythiazox)

23.4 Amidoflumet, benclothiaz, benzoximate, bifenazate, bromopropylate, buprofezin, chinomethu-
nat, chlordimeform, chlorobenzilate, chloropicrin, clothiazoben, cycloprene, dicyclanil, fenoxacrim,
fentrifamil, flubenzimine, flufenimer, flutenzin, gossypure, hydramethylnone, japonilure, metoxa-
5 diazone, petroleum, piperonyl butoxide, potassium oleate, pyridalyl, sulfluramid, tetradifon, tetrasul,
triarathene, verbutin

in addition the compound 3-methyl-phenyl-propyl carbamate (tsumacide Z), the compound 3-(5-
chloro-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluoroethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octane-3-carbonitrile (CAS-Reg.-Nr.
10 185982-80-3) and the corresponding 3-*endo*-isomer (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (c.f. WO-96/37494,
WO-98/25923), and preparations which contain insecticidal plant extracts, nematodes, fungi or
viruses.

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

Moreover, the compounds of structure (I) of the invention exhibit very good antimycotic activity.
They possess a very broad antimycotic spectrum of activity, especially against dermatophytes and
blastomyces, mildew and diphasic fungi (e.g. against *Candida* species such as *Candida albicans*,
20 *Candida glabrata*) and *Epidermophyton floccosum*, *Aspergillus* species such as *Aspergillus niger* and
Aspergillus fumigatus, *Trichophyton* species such as *Trichophyton mentagrophytes*, *Microsporon*
species such as *Microsporon canis* and *audouinii*. The listing of these fungi in no way represents a
limitation of the recordable mycotic spectrum, it has only illustrative character.

25 The active compounds can be used as such, in the form of its formulations or the embodiments
prepared from them, such as ready-for-use solutions, suspensions, wettable powders, pastes, soluble
powders, dusts and granulates. Application is carried out in the normal manner, e.g. by pouring,
spraying, nebulising, dusting, foaming, brushing, etc. It is further possible to apply the active
compounds by the ultra low volume process or inject the active compound itself into the soil. It can
30 also be used to treat the seeds of plants.

On using the active compounds as fungicides the amount applied can be varied over a large range
according to the method of application. In the treatment of plant parts the amount of active compound
applied lies generally between 0.1 and 10,000 g/ha, preferably between 10 and 1,000 g/ha. In the
35 treatment of seed the amount of active compound applied lies generally between 0.001 and 50 g per
kilogram seed, preferably between 0.01 and 10 g per kilogram seed. In the treatment of the soil the

amount of active compound used lies usually between 0.1 and 10,000 g/ha, preferably between 1 and 5,000 g/ha.

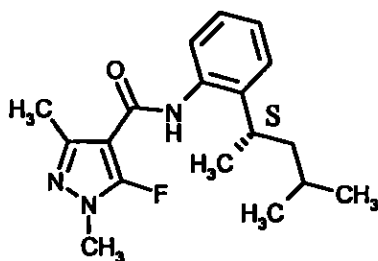
As already described above, according to the invention all plants and their parts can be treated. In a preferred embodiment plant species and plant varieties occurring in the wild or obtained by conventional biological breeding methods such as crossing or protoplas fusion and their parts are treated. In a further preferred embodiment transgenic plants and plant varieties that were obtained by genetic engineering methods, possibly in combination with conventional methods (genetically modified organisms), and their parts are treated. The term "part" and "parts of plants" or "plant parts" were defined above.

Specially preferred according to the invention plants or the respective plant varieties available commercially or in use are treated. By plant varieties is meant plants with new properties ("traits") that are bred both by conventional breeding, by mutagenesis or by recombinant DNA techniques. These can be varieties, strains, bio- or genotypes.

Depending upon the plant species or plant varieties, their position and conditions of growth (soil, climate, vegetation period, nutrition) superadditive (synergistic) effects can also occur by treatment according to the invention. Thus, for example, low application quantities and/or expansions of the spectrum of activity and/or an augmentation of the activity of the utilisable materials and agents of the invention, improved plant growth, increased tolerance towards high or low temperatures, increased tolerance to drought or to soil water or salt content, increased blossoming performance, easier harvesting, accelerated ripening, higher crop yields, improved quality and/or nutritional value of the harvested product, greater shelf-life, and/or processability of the harvested product are possible that go beyond the effects actually expected.

All plants which through genetic modification receive genetic material which impart these plants particularly advantageous properties ("traits") belong to the preferred transgenic plants or plant varieties (obtained by genetic engineering) to be treated according to the invention. Examples of such properties are improved plant growth, increased tolerance to high and low temperatures, increased tolerance to drought and to soil water and salt content, increased blossoming performance, easier harvesting, accelerated ripening, higher crop yields, higher quality and/or nutritional value of the harvested product, longer shelf-life, and/or processability of the harvested product. Further and particularly highlighted examples of such properties are increased resistance of the plants to animal and microbial pests such as to insects, mites, pathogenic plant fungi, bacteria and/or viruses as well as an increased tolerance of the plants to certain active herbicidal compounds. As examples of transgenic plants are mentioned the im-

- portant cultivated plants such as cereals (wheat, rice), maize, soya, potatoes, cotton, tobacco, rape as well as fruiting plants (with the fruits apples, pears, citrus fruits and grapes), whereby maize, soya, potatoes, cotton, tobacco and rape are specially mentioned. Particularly mentioned as properties ("traits") are the increased resistance of the plants to insects, arachnids, nematodes, and slugs and snails through the toxins formed in the plants, especially those that are produced with genetic material from *Bacillus Thuringiensis* (e.g. with the genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb and CryIF as well as their combinations) (hereinafter called "Bt plants"). Properties ("traits") also particularly mentioned are the increased resistance of plants to fungi, bacteria and viruses through systemically acquired resistance (SAR), systemin, phytoalexine, elicitors and resistance genes and correspondingly expressed proteins and toxins. Further specially mentioned properties ("traits") are the increased tolerance of the plants to certain active herbicidal compounds, e.g. imidazolines, sulphonyl ureas, glyphosates or phosphinotricin (e.g. "PAT" gene). The respective genes that impart the desired properties ("traits") can also be present in combination in the transgenic plants. Examples of "Bt plants" are maize varieties, cotton varieties, soya varieties and potato varieties which are marketed under the brand names YIELD GARD® (e.g. maize, cotton, soya), KnockOut® (e.g. maize), StarLink® (e.g. maize), Bollgard® (cotton), Nucoton® (cotton) and NewLeaf® (potatoes). Mentioned as examples of herbicide tolerant plants are maize varieties, cotton varieties, and soya varieties which are marketed under the brand names Roundup Ready® (tolerance to glyphosates e.g. maize, cotton, soya), Liberty Link® (tolerance to phosphinotricin, e.g. rape), IMI® (tolerance to imidazolinones) and STS® (tolerance to sulphonyl ureas e.g. maize). Mentioned as examples of herbicide resistant plants (bred conventionally for herbicide tolerance) are varieties also marketed under the name Clearfield® (e.g. maize). Naturally these statements apply also to plant varieties which will be developed or marketed in the future with these genetic properties ("traits") or those developed in the future.
- According to the invention the plants described can be treated especially advantageously with the compounds of general structure (I) or the active compound mixtures of the invention. The preferred ranges described above for the active compounds or their mixtures apply also for the treatment of these plants. Particularly mentioned is plant treatment with the compounds or mixtures especially described in the present text.
- The preparation and the use of the active compounds of the invention are described in the following examples.

Preparation examples**Example 1**

- 5 (+/-)-*N*-[2-(1,3-Dimethylbutyl)phenyl]-5-fluoro-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-4-carboxamide (200 mg) is dissolved in 25 ml *n*-heptane/isopropanol 9:1 (v/v = volume/volume). The solution is then fractionated by high performance liquid chromatography (HPLC) on the silica gel phase Chiralcel OD® [Manufacturer: Daicel (Japan), column dimensions: 500 mm × 40 mm (i.d.), particle size: 20 µm, flow rate: 40 ml/min] with *n*-heptane/isopropanol 9.1 (v/v) as eluent. To separate the whole amount 5ml proportions (each corresponding to 40 mg of the racemate) are applied to the column every 30 min. Detection of the compound is carried out with a UV detector at a wave length of 210 nm. After analytical investigation for enantiomeric purity the respective eluent fractions are combined and concentrated as far as possible in vacuum, the residues are filtered off and dried after washing with *n*-heptane. The crude product thus isolated is purified on silica gel (eluent: *n*-hexane/ethyl acetate 1:9 → 1:4, in each case v/v) .

87 mg of *N*-{2-[(1*S*)-1,3-dimethylbutyl]phenyl}-5-fluoro-1,3-dimethyl-1*H*-pyrazole-4-carboxamide are obtained (melting point 52-54°C, rotation $[\alpha]_D = +6,7$, $c = 0.87$; methanol, 20°C, *ee* value = 99 %).

20

The enantiomeric purity of the carboxamides of structure (I) were determined by analytical HPLC under the following conditions:

- | | |
|-------------------|-------------------------------------|
| Separating phase: | Chiralcel OD® (Daicel, Japan); 5 µm |
| 25 Column: | 250 mm × 4.6 mm (I.D.) |
| Eluent: | <i>n</i> -heptane/2-propanol 10:1 |
| Flow rate: | 0.5 ml/min |
| UV detection: | 210 nm |

- 30 In a manner analogous to Example 1 and in accordance with the details in the general procedure description the compounds of structure (I) listed in the following table are obtained.

Application examples**Example A****5 Podosphaera test (apple) / protective**

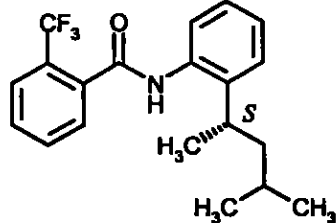
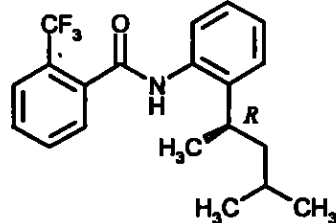
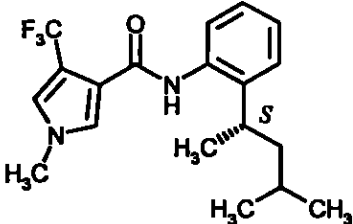
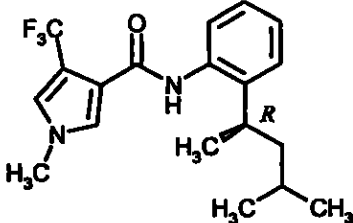
Solvent: 24.5 parts by weight acetone
 24.5 parts by weight dimethylacetamide
Emulsifier : 1 part by weight alkylaryl polyglycol ether

10

For the production of an appropriate active compound preparation 1 part by weight of active compound is mixed with the given amount of solvent and emulsifier and the concentrate is diluted to the desired concentration with water.

- 15 For the investigation for the protective activity young plants are sprayed with the active compound preparation in the amount specified. After drying of the spray coating the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of the apple mildew pathogen *Podosphaera leucotricha*. The plants are then placed in a greenhouse at ca. 23°C and a relative humidity of ca. 70%.
- 20 Evaluation is carried out 10 days after the inoculation. A level of activity of 0% corresponds to the level of activity of the control, whereas a level of activity of 100% means that no infestation is observed.

Table A
Podosphaera test (apple) / protective

Active compound	Amount of active compound applied in g/ha	Level of activity in %
Of the invention:		
	50	100
Comparison test:		
	50	20
Of the invention:		
	12.5	98
Comparison test:		
	12.5	28

Example B**Sphaerotheca test (cucumber) / protective**

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

- 10 For the production of an appropriate active compound preparation 1 part by weight of active compound is mixed with the given amount of solvent and emulsifier and the concentrate is diluted to the desired concentration with water.

- 15 For the investigation of the protective activity young cucumber plants are sprayed with the active compound preparation in the amount specified. After drying of the spray coating the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of *Sphaerotheca fuliginea*. The plants are then placed in a greenhouse at ca. 23°C and a relative humidity of ca. 70%.

- 20 Evaluation is carried out 7 days after the inoculation. A level of activity of 0% corresponds to the level of activity of the control, whereas a level of activity of 100% means that no infestation is observed.

Table B
Sphaerotheca test (cucumber) / protective

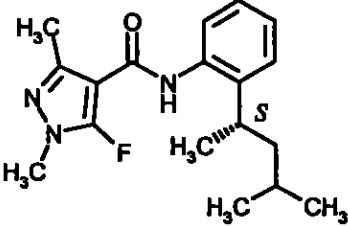
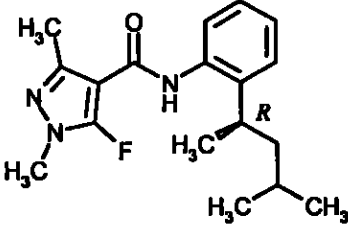
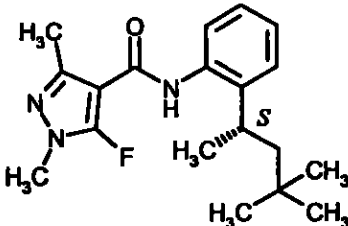
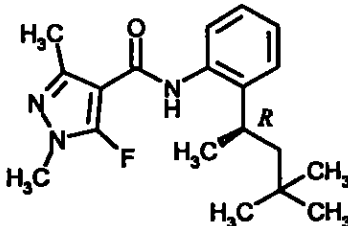
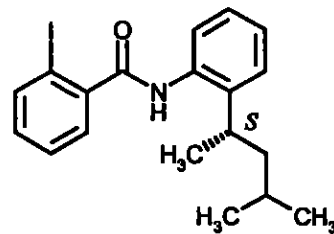
Active compound of the invention	Amount of active compound applied in g/ha	Level of activity in %
Of the invention:		
	25	96
Comparison test:		
	25	7
Of the invention:		
	25	94
Comparison test:		
	25	0

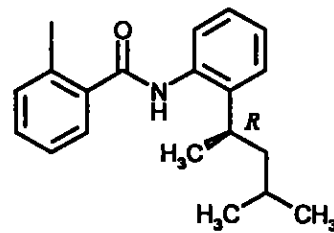
Table B
Sphaerotheca test (cucumber) / protective

Active compound of the invention	Amount of active compound applied in g/ha	Level of activity in %
-------------------------------------	---	---------------------------

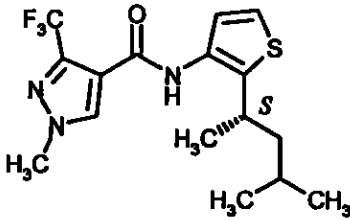
Of the invention:

	25	85
---	----	----

Comparison test:

	25	15
---	----	----

Of the invention:

	3.125	98
---	-------	----

Comparison test:

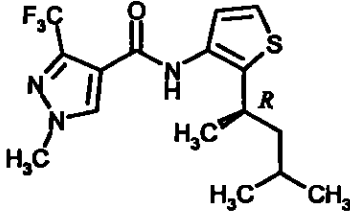
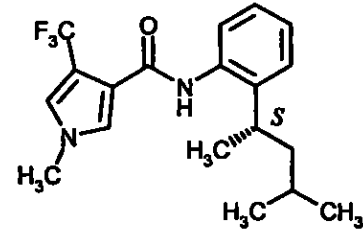
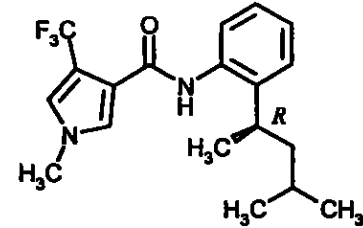
	3.125	35
---	-------	----

Table B
Sphaerotheca test (cucumber) / protective

Active compound of the invention	Amount of active compound applied in g/ha	Level of activity in %
Of the invention: 	50	91
Comparison test: 	50	23

Example C**Venturia test (apple) / protective**

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

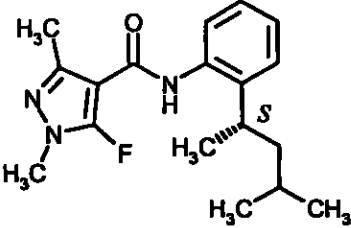
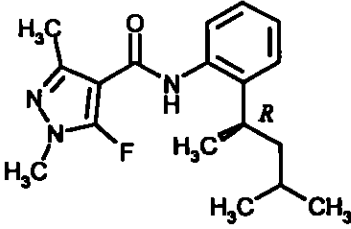
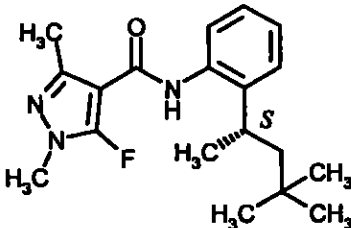
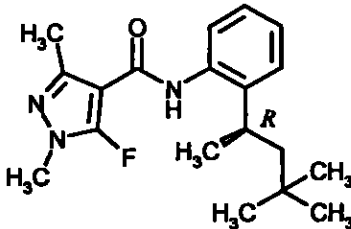
- 10 For the production of an appropriate active compound preparation 1 part by weight of active compound is mixed with the given amount of solvent and emulsifier and the concentrate is diluted to the desired concentration with water.

- 15 For the investigation of the protective activity young plants are sprayed with the active compound preparation in the amount specified. After drying of the spray coating the plants are inoculated with an aqueous conidial suspension of the apple scab pathogen *Venturia inaequalis* then left for 1 day in an incubator at ca. 20°C and a relative humidity of 100%.

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

- 20 Evaluation is carried out 10 days after the inoculation. A level of activity of 0% corresponds to the level of activity of the control, whereas a level of activity of 100% means that no infestation is observed.

Table C
Venturia test (apple) / protective

Active compound of the invention	Amount of active compound applied in g/ha	Level of activity in %
Of the invention:		
	25	100
Comparison test:		
	25	21
Of the invention:		
	25	100
Comparison test:		
	25	0

52

Table C
Venturia test (apple) / protective

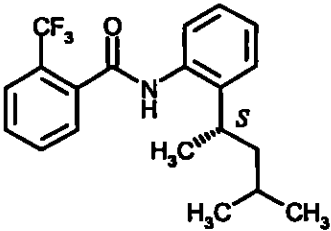
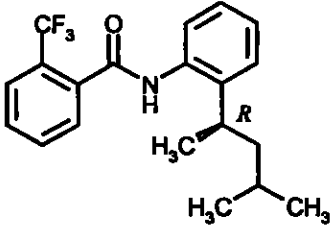
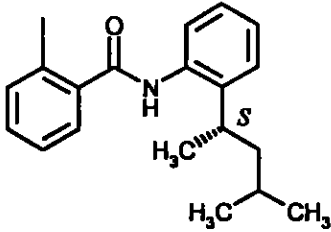
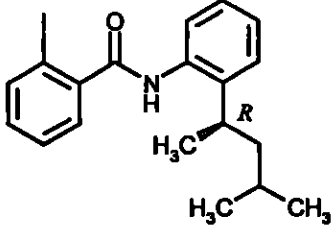
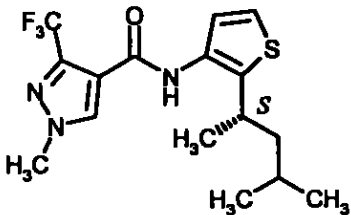
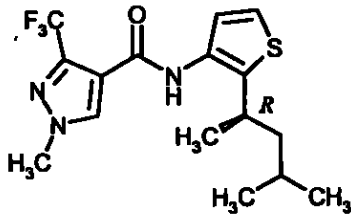
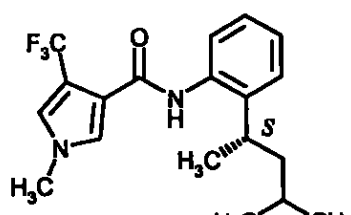
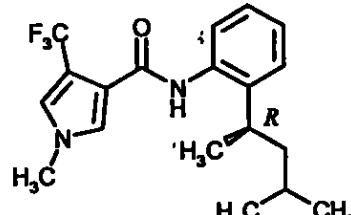
Active compound of the invention	Amount of active compound applied in g/ha	Level of activity in %
Of the invention:		
	25	100
Comparison test:		
	25	0
Of the invention:		
	25	100
Comparison test:		
	25	16

Table C
Venturia test (apple) / protective

Active compound of the invention	Amount of active compound applied in g/ha	Level of activity in %
Of the invention:		
	3.125	100
Comparison test:		
	3.125	7
Of the invention:		
	50	100
Comparison test:		
	50	20

Example D**Botrytis test (bean) / protective**

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

10 For the production of an appropriate active compound preparation 1 part by weight of active compound is mixed with the given amount of solvent and emulsifier and the concentrate is diluted to the desired concentration with water.

15 For the investigation the protective activity young plants are sprayed with the active compound preparation in the amount specified. After drying of the spray coating 2 small pieces of agar coated with *Botrytis cinera* are placed on each leaf. The inoculated plants are then placed in a darkened room at ca 20°C and a relative humidity of 100%.

20 The size of the infestation spots on the leaves are evaluated 2 days after the inoculation. A level of activity of 0% corresponds to the level of activity of the control, whereas a level of activity of 100% means that no infestation is observed.

Table D
Botrytis test (bean) / protective

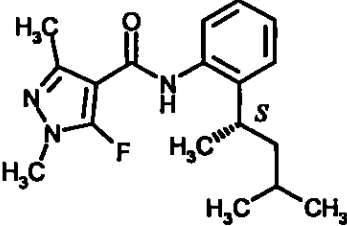
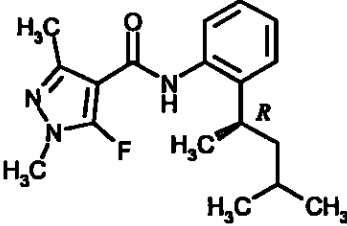
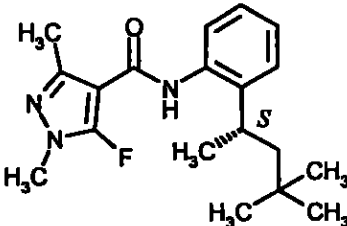
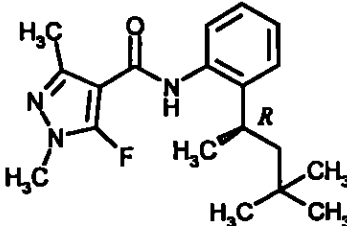
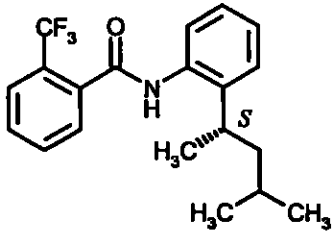
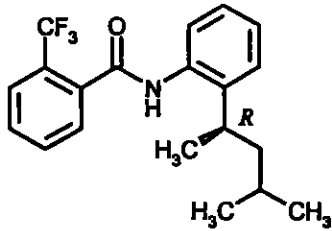
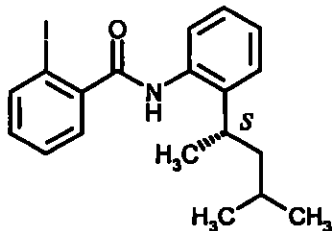
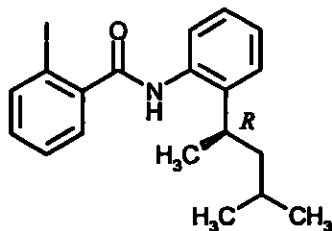
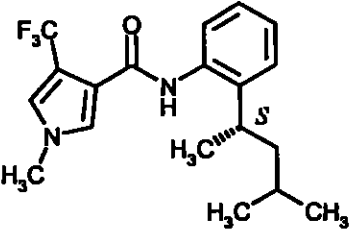
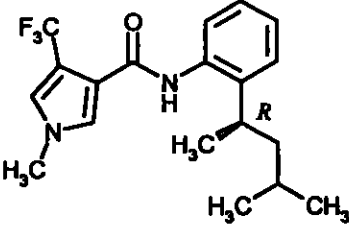
Active compound of the invention	Amount of active compound applied in g/ha	Level of activity in %
Of the invention:		
	250	100
Comparison test:		
	250	29
Of the invention:		
	250	100
Comparison test:		
	250	14

Table D
Botrytis test (bean) / protective

Active compound of the invention	Amount of active compound applied in g/ha	Level of activity in %
Of the invention:		
	250	90
Comparison test:		
	250	18
Of the invention:		
	250	86
Comparison test:		
	250	0

57

Table D
Botrytis test (bean) / protective

Active compound of the invention	Amount of active compound applied in g/ha	Level of activity in %
Of the invention: 	62.5	100
Comparison test: 	62.5	50

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

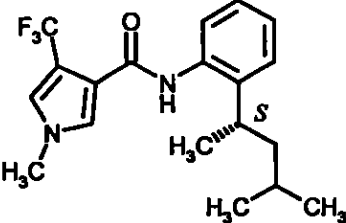
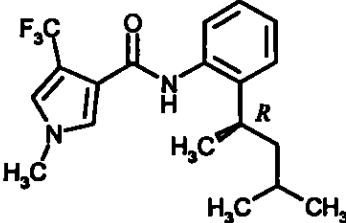
- 5 Solvent: 24.5 parts by weight acetone
 24.5 parts by weight dimethylacetamide
Emulsifier : 1 part by weight alkylaryl polyglycol ether

- 10 For the production of an appropriate active compound preparation 1 part by weight of active compound is mixed with the given amount of solvent and emulsifier and the concentrate is diluted to the desired concentration with water.

- 15 For the investigation of the protective activity young plants are sprayed with the active compound preparation in the amount specified. After drying of the spray coating the plants are inoculated with an aqueous spore suspension of *Alternaria solani*. The plants are then placed in an incubator at ca. 20°C and a relative humidity of 100%.

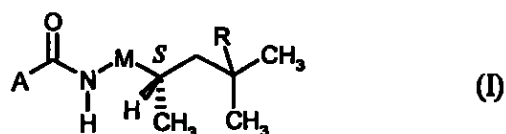
Evaluation is carried out 3 days after the inoculation. A level of activity of 0% corresponds the level of activity of the control, whereas a level of activity of 100% means that no infestation is observed.

Table E
Alternaria test (tomato) / protective

Active compound of the invention	Amount of active compound applied in g/ha	Level of activity in %
Of the invention: 	50	83
Comparison test: 	50	30

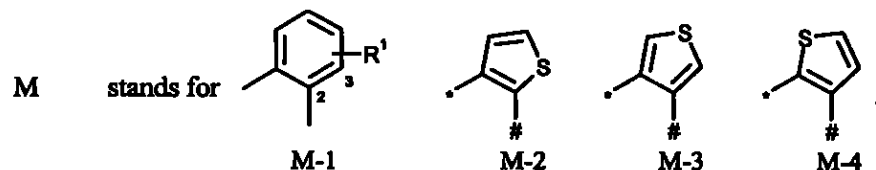
Patent claims

1. Optically active carboxamides of structure (I)



5 in which

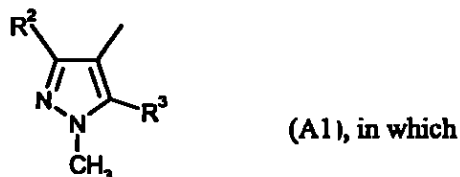
R stands for hydrogen, fluorine, chlorine, methyl, ethyl or trifluoromethyl,



wherein the bond marked with * is coupled with the amide and the bond marked with # is coupled with the alkyl side chain,

10 R¹ stands for hydrogen, fluorine, chlorine, methyl or trifluoromethyl,

A stands for the group of structure (A1)

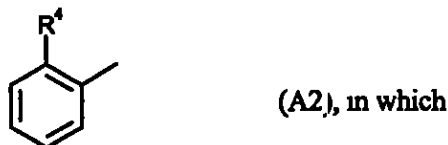


R² stands for methyl, trifluoromethyl or difluoromethyl,

15 R³ stands for hydrogen, fluorine or chlorine,

or

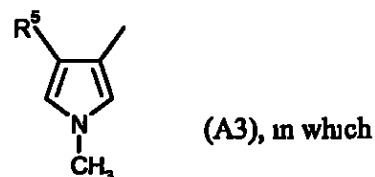
A stands for the group of structure (A2)



R⁴ stands for trifluoromethyl, chlorine, bromine or iodine,

20 or

A stands for the group of structure (A3)



R⁵ stands for methyl, trifluoromethyl or difluoromethyl.

2. Optically active carboxamides of structure (I) as claimed in claim 1, in which

R stands for hydrogen, methyl or ethyl,

M stands for M-1 or M-2,

R¹ stands for hydrogen, fluorine, chlorine, methyl or trifluoromethyl,

5 R² stands for methyl or trifluoromethyl,

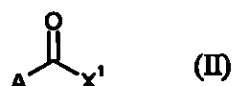
R³ stands for hydrogen or fluorine,

R⁴ stands for trifluoromethyl or iodine,

R⁵ stands for trifluoromethyl.

10 3. Method for the preparation of optically active carboxamides of structure (I) as claimed in claim 1 characterised in that

a) carboxylic acid derivates of structure (II)

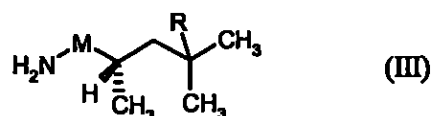


in which

15 A has the meanings defined in claim 1 and

X¹ stands for halogen or hydroxy,

is reacted with an amine of structure (III)

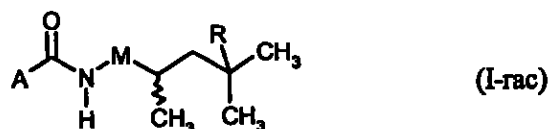


in which R and M have the meanings defined in claim 1,

20 optionally in the presence of a catalyst, optionally in the presence of a condensation agent, optionally in the presence of an acid binding agent and optionally in the presence of a diluent,

or

b) racemic compounds of structure (I-rac),



25

in which R, M and A have the meanings defined in claim 1,

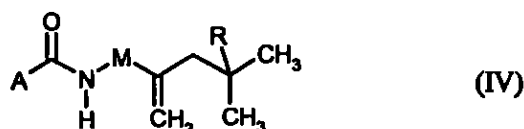
are chromatographed on a chiral silica gel stationary phase in the presence of an eluent or an eluent mixture as the liquid phase,

30

or is fractionally crystallised with optically active acids under salt formation and subsequently the enantiomerically pure or enriched compounds of structure (I) is released,

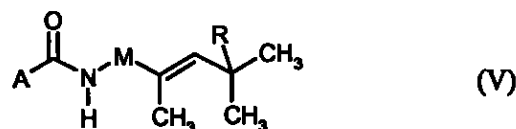
or

c) compounds of structure (IV)



in which R, M and A have the meanings defined in claim 1,

5 or compounds of structure (V)



in which R, M and A have the meanings defined in claim 1,

or a mixture of both compounds is hydrogenated in the presence of an optically active catalyst or a catalyst with an optically active ligand.

10

4. Agent for the control of detrimental microorganisms characterised by a content of at least one optically active carboxamides of structure (I) as claimed in claim 1 together with diluents and/or surfactants.

15 5. Use of optically active carboxamides of structure (I) as claimed in claim 1 for the control of detrimental microorganisms.

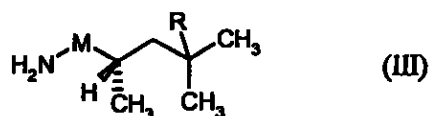
6. Method for the control of detrimental microorganisms characterised in that optically active carboxamides of structure (I) as claimed in claim 1 are applied to the microorganisms and/or their habitat.

20

7. Method for the preparation of agents to control detrimental microorganisms characterised in that optically active carboxamides of structure (I) as claimed in claim 1 are mixed with diluents and/or surfactants.

25

8. Amines of structure (III)

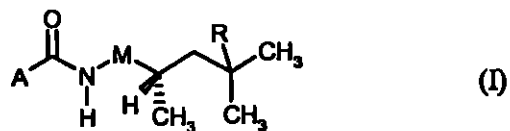


in which R and M have the meanings as defined in Claim 1.

Optically active carboxamides

Summary

New optically active carboxamides of structure (I)



in which R, M and A have the meanings defined in the description,

several methods for their preparation of these compounds and their use for the control of detrimental microorganisms as well as new intermediates and their preparation.

- 1 -

**CARBOXAMIDAS ÓPTICAMENTE ACTIVAS Y SU EMPLEO PARA LA
LUCHA CONTRA LOS MICROORGANISMOS INDESEABLES**

Campo de la invención

La presente invención se refiere a nuevas carboxamidas ópticamente activas, a
5 varios procedimientos para su obtención y a su empleo para la lucha contra los
microorganismos indeseables.

Antecedentes de la invención

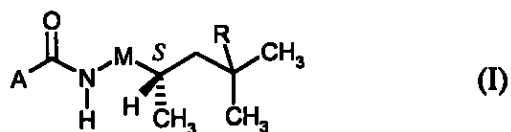
Se sabe ya, que un gran número de carboxamidas tiene propiedades fungicidas
(véanse las publicaciones, por ejemplo WO 03/010149, WO 02/059086, WO
10 02/38542, WO 00/09482, DE-A 102 29 595, EP-A 0 591 699, EP-A 0 589 301 y EP-
A 0 545 099). De este modo, se conocen, por ejemplo racematos de la 5-flúor-1,3-
dimetil-N-[2-(1,3,3-trimetilbutil)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida por la publicación
WO 03/010149 y la N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-2-yodobenzamida por la publicación
DE-A 102 29 595. La actividad de estos productos es buena, sin embargo deja mucho
15 que desear en algunos casos, con ocasión de cantidades pequeñas de aplicación.

Debido a las múltiples exigencias que se requieren de los modernos agentes
pesticidas, por ejemplo en lo que se refiere al nivel de actividad, a la duración de la
actividad, al espectro de la actividad, al espectro de la aplicación, a la toxicidad, a la
combinación con otros productos activos, a la combinación con agentes auxiliares de la
20 formulación o a la síntesis, y debido a la posible aparición de resistencias no puede
considerarse nunca como terminado el desarrollo de tales productos, y existe
permanentemente una elevada necesidad de nuevos compuestos que conlleven ventajas al
menos en aspectos parciales frente a los compuestos conocidos.

Descripción detallada de la invención

25 Se han encontrado ahora nuevas carboxamidas ópticamente activas de la fórmula

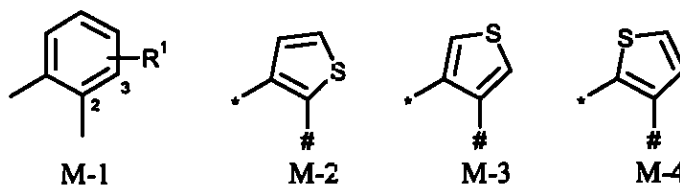
(I)



en la que

R significa hidrógeno, flúor, cloro, merilo, etilo o trifluórmétilo,

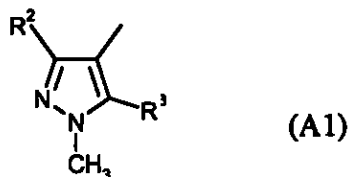
5 M significa



donde el enlace marcado con * está enlazado con la amida, mientras que el
enlace marcado con # está enlazado con la cadena de alquilo lateral,

R¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo o trifluórmétilo,

10 A significa el resto de la fórmula (A1)



en la que

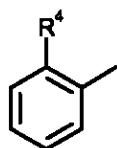
R² significa metilo, trifluórmétilo o difluórmétilo,

R³ significa hidrógeno, flúor o cloro,

15 o

A significa el resto de la fórmula (A2)

- 3 -



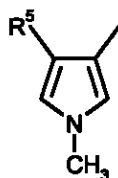
(A2)

en la que

R^4 significa trifluórmétilo, cloro, bromo o yodo,

o

5 A significa el resto de la fórmula (A3)



(A3)

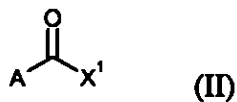
en la que

R^5 significa metilo, trifluórmétilo o difluórmétilo.

Los compuestos de la fórmula (I) tienen una configuración S [átomo de carbono
10 marcado con S en la fórmula (I)].

Se ha encontrado además que se obtienen las carboxamidas ópticamente activas
de la fórmula (I), sí

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



(II)

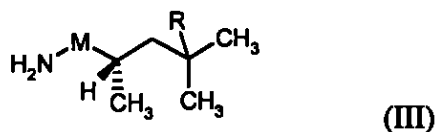
15 en la que

A tiene los significados anteriormente indicados y

X^1 significa halógeno o hidróxido,

con una amina de la fórmula (III)

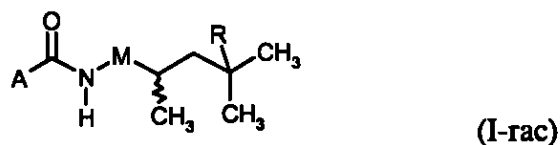
- 4 -



en la que R y M 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
 5 ácido y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

o

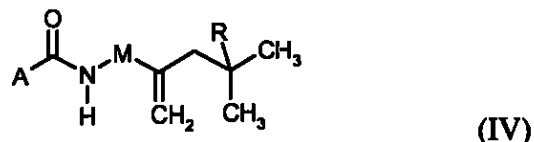
b) se cromatografían compuestos racémicos de la fórmula (I-rac)



en la que R, M y A tienen los significados anteriormente indicados,
 10 en una fase de gel de sílice estacionaria, quiral, en presencia de un eluyente o
 de una mezcla de eluyentes como fase líquida,
 o se cristalizan de manera fraccionada con ácidos ópticamente activos con
 formación de sales y, a continuación, se liberan los compuestos de la fórmula (I)
 enantiómericamente puros o enriquecidos,

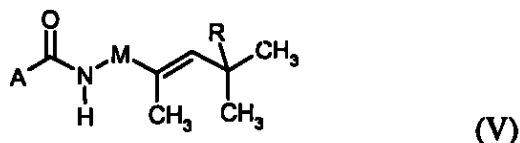
15 o

c) se hidrogenan compuestos de la fórmula (IV)



en la que R, M y A tienen los significados anteriormente indicados,
 o compuestos de la fórmula (V)

- 5 -



en la que R, M y A tienen los significados anteriormente indicados,
o mezclas de ambos compuestos, en presencia de un catalizador ópticamente
activo o bien de un catalizador con ligandos ópticamente activos.

5 Finalmente, se ha encontrado que las nuevas carboxamidas ópticamente activas
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 también en la protección de los materiales.

Las nuevas carboxamidas ópticamente activas, de la fórmula (I), se caracterizan,
10 frente a las carboxamidas conocidas, ante todo por una actividad mejorada, o bien por
menores cantidades de aplicación y, por lo tanto, menor carga para el medio ambiente
y por una toxicidad disminuida.

Las carboxamidas ópticamente activas, según la invención, están definidas, en
general, por medio de la fórmula (I). Las definiciones preferentes de los restos de las
15 fórmulas citadas en lo que antecede y que se citarán a continuación, han sido dadas a
continuación. Estas definiciones son válidas para los productos finales de la fórmula (I)
así como para todos los productos intermedios, de manera equivalente

- R significa, preferentemente, hidrógeno, metilo o etilo,
- R significa de forma especialmente preferente hidrógeno o metilo.
- 20 M significa preferentemente, M-1.
- M significa, además, preferentemente M-2.
- M significa, además, preferentemente M-3.
- M significa, además, preferentemente M-4.

- M significa, de forma especialmente preferente M-1, donde R¹ significa hidrógeno,
- M significa, además, de forma especialmente preferente M-2, donde R¹ significa hidrógeno.
- R¹ significa, preferentemente, hidrógeno.
- 5 R¹ significa, además, preferentemente flúor, encontrándose se el flúor de forma especialmente preferente en la posición 4, 5 o 6, de forma muv especialmente preferente en la posición 4 o 6, especialmente en la posición 4 del resto de anilida [véase la fórmula anterior (I)].
- A significa preferentemente el resto A1.
- 10 A significa de forma especialmente preferente A1 con el significado de 5-flúor-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-ilo, 3-trifluórmethyl-1-metil-1H-pirazol-4-il o 3-difluórmethyl-1-metil-1H-pirazol-4-ilo.
- A significa de forma muv especialmente preferente A1 con el significado de 5-flúor-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-ilo.
- 15 A significa, además, preferentemente el resto A2.
- A significa de forma especialmente preferente A2 con el significado de 2-trifluórmethylfenilo o 2-yodofenilo.
- A significa, además, preferentemente el resto A3.
- A significa, de forma especialmente preferente, A3 con el significado de 1,4-dimetil-pirazol-3-ilo, 1-metil-4-trifluórmethyl-pirazol-3-ilo o 1-metil-4-difluórmethyl-pirazol-3-ilo.
- 20 A significa de forma muv especialmente preferente A3 con el significado de 1-metil-4-trifluórmethyl-pirazol-3-ilo.
- R² significa, preferentemente, metilo o trifluórmethyl
- 25 R³ significa, preferentemente, hidrógeno o flúor.

- 7 -

R⁴ significa, preferentemente, trifluórmetil o yodo.

R⁵ significa, preferentemente, trifluórmetil.

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

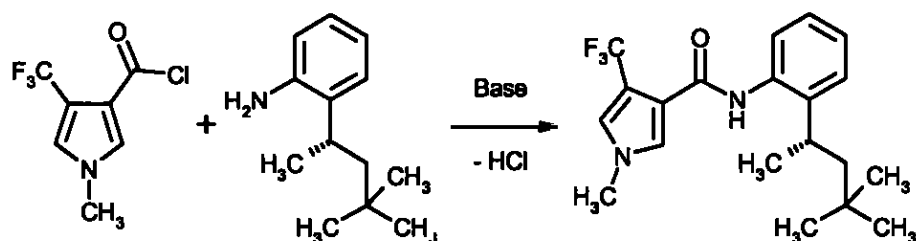
Las definiciones citadas pueden combinarse arbitrariamente entre sí. Además pueden incluso eliminarse algunas definiciones

Son preferentes, especialmente preferentes o muy especialmente preferentes los compuestos de la fórmula (I), que porten respectivamente los sustituyentes citados como preferentes, como especialmente preferentes o como muy especialmente preferentes.

15 Descripción del procedimiento y de los productos intermedios.

Procedimiento (a).

Sí se emplean el cloruro de 1-metil-4-(trifluórmetil)-1H-pirrol-3-carbonilo y la {2-[(1S)-1,3,3-trimetilbutil]fenil}-amina como productos de partida, podrá representarse el procedimiento (a) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



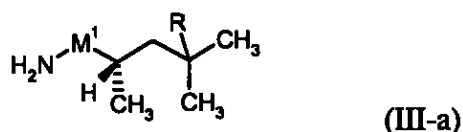
Los derivados de los ácidos carboxílicos, necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento (a), según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (II). En esta fórmula (II), A tiene preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy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

Los derivados de los ácidos carboxílicos de la fórmula (II) son conocidos (véanse las publicaciones WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 y EP-A 0 589 313).

Las aminas, necesarias, además, como productos de partida para la realización del procedimiento (a) según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (III). En esta fórmula (III), R y M tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Las aminas de la fórmula (III) son nuevas.

Las aminas de la fórmula (III-a)



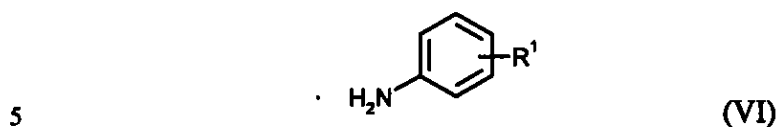
en la que

R tiene los significados anteriormente indicados,

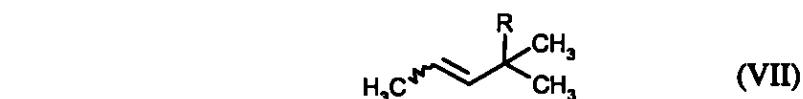
M¹ significa M-1,

pueden obtenerse por ejemplo sí

d) en una primera etapa se hace reaccionar un derivado de anilina de la fórmula (VI)



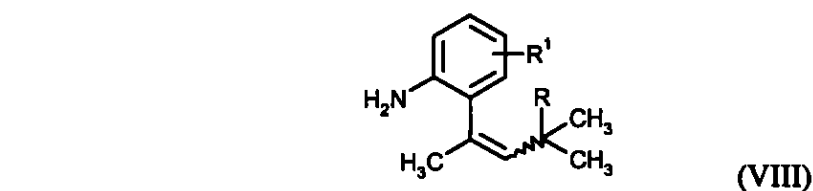
en la que R¹ tiene los significados anteriormente indicados,
con un alqueno de la fórmula (VII)



en la que R tiene los significados anteriormente indicados,

en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de una base y, en
caso dado, en presencia de un diluyente,

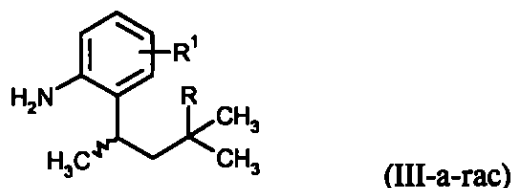
y la alquenoanilina, obtenida de este modo, de la fórmula (VIII)



en la que R y R¹ tienen los significados anteriormente indicados,

se hidrogena, en una segunda etapa, en caso dado en presencia de un diluyente
y, en caso dado, en presencia de un catalizador,

y el derivado de anilina racémico, obtenido de este modo, de la fórmula (III-a-rac)



en la que R y R¹ tienen los significados anteriormente indicados,
se cromatografían en una tercera etapa sobre una fase estacionaria de gel de
sílice, quirál, en presencia de un eluyente o de una mezcla de eluyentes, como
fase líquida.

La hidrogenación de los compuestos de la fórmula (VIII) puede llevarse a cabo,
en caso dado, también en presencia de un catalizador ópticamente activo, o bien en
presencia de un catalizador y de un ligando ópticamente activo y proporcionar, por lo
tanto, compuestos ópticamente activos de la fórmula (III-a).

Los compuestos de la fórmula (III-a-rac) pueden someterse a una cristalización
fraccionada también en presencia de ácidos ópticamente activos con formación de
sales, después de lo cual se liberan los compuestos enantiómericamente puros o
enriquecidos de la fórmula (III-a). Como ácidos para la formación de sales
diastereómeras son adecuados, en general, todos los ácidos ópticamente activos. De
manera ejemplificativa pueden citarse: el ácido (1S)-(+)-canfo-10-sulfónico, el ácido
(1R)-(-)-canfo-10-sulfónico, el ácido S,S-(-)-tartárico, el ácido R,R-(+)-tartárico, el
ácido R-láctico, el ácido S-láctico o aminoácidos ópticamente activos,
preferentemente aminoácidos ópticamente activos de origen natural.

Los derivados de anilina necesarios, como productos de partida, para la
realización del procedimiento (d) según la invención, están definidos, en general, por
medio de la fórmula (VI). En esta fórmula (VI), R¹ tiene preferentemente, de forma
especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos

significados que ya han sido indicados para este resto como preferentes, como especialmente preferentes o como muy especialmente preferentes en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I).

Los derivados de anilina de la fórmula (VI), son conocidos.

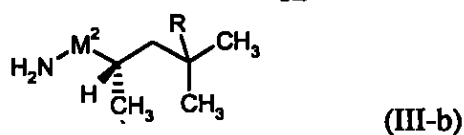
5 Los alquenos, necesarios además como productos de partida para la realización del procedimiento (d) según la invención están definidos, en general, por medio de la fórmula (VII). En esta fórmula (VII), R tiene preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido indicados para este resto como preferentes, como especialmente preferentes o
10 bien como muy especialmente preferentes en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los alquenos de la fórmula (VII) son conocidos o pueden obtenerse según procedimientos conocidos.

Las alquenoanilinas, a través de las cuales se pasa como productos intermedios
15 en la realización del procedimiento (d) según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (VIII). En esta fórmula (VIII), R y R¹ tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes en relación con
20 la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Las alquenoanilinas de la fórmula (VIII) son conocidas y/o pueden obtenerse según procedimientos conocidos.

Las aminas de la fórmula (III-b)



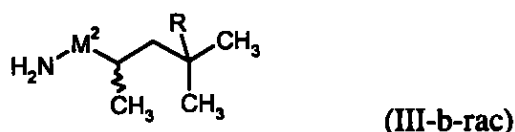
en la que

R tiene los significados anteriormente indicados,

M² significa M-2, M-3 o M-4,

5 pueden obtenerse por ejemplo, sí

e) se cromatografían aminas racémicas de la fórmula (III-b-rac)



en la que R y M² tienen los significados anteriormente indicados,

sobre una fase estacionaria de gel de sílice, quiral, en presencia de un eluyente

10 o de una mezcla de eluyentes como fase líquida.

Las aminas racémicas de la fórmula (III-b-rac) son conocidas y/o pueden obtenerse según procedimientos conocidos (véase por ejemplo las publicaciones WO 02/38542, EP-A 1 036 793 y EP-A 0 737 682).

Procedimiento (b).

15 Los compuestos racémicos, necesarios como productos de partida en la realización del procedimiento (b) según la invención están definidos, en general, por medio de la fórmula (I-rac). En esta fórmula, R, M y A tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, como
20 especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención

Los compuestos racémicos de la fórmula (I-rac), empleados en la realización del

procedimiento (b) según la invención son conocidos y pueden prepararse según procedimientos conocidos (véanse por ejemplo las publicaciones WO 03/010149, WO 02/38542 y DE-A 102 29 595). Los compuestos racémicos de la fórmula (I-rac) pueden obtenerse, por ejemplo, si se hacen reaccionar derivados de ácidos carboxílicos de la
5 fórmula (II) con compuestos racémicos de las fórmulas (III-a-rac) o (III-b-rac) en analogía con el procedimiento (a) según la invención

En la realización del procedimiento (b) según la invención se trabaja según métodos de la cromatografía preparativa, preferentemente según los métodos de la cromatografía líquida de alta resolución (HPLC). En este caso se utiliza una fase
10 estacionaria de gel de sílice, quiral. Como especialmente preferente para la separación de los compuestos de la fórmula (I-rac) en los dos enantiómeros se ha revelado Chiracel OD®. Este material de separación puede ser adquirido en el comercio. Sin embargo pueden emplearse también otras fases estacionarias como material para la cromatografía

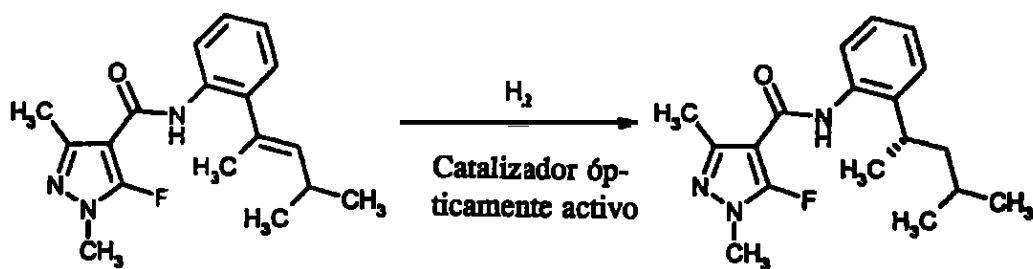
15 Cuando deban separarse los compuestos de la fórmula (I-rac) por medio de cristalización fraccionada en los compuestos ópticamente activos, individuales, son adecuados, en general, todos los ácidos ópticamente activos para la formación de las sales diastereómeras. De manera ejemplificativa pueden citarse: el ácido (1S)-(+)-canfo-10-sulfónico, el ácido (1R)-(-)-canfo-10-sulfónico, el ácido S,S-(-)-tartárico, el
20 ácido R,R-(+)-tartárico, el ácido R-láctico, el ácido S-láctico o aminoácidos ópticamente activos, preferentemente aminoácidos ópticamente activos de origen natural.

Procedimiento (c).

Sí se emplean la N-[2-(1,3-dimetilbut-1-en-1-il)fenil]-5-flúor-1,3-dimetil-1H-
25 pirazol-4-carboxamida, hidrógeno y un catalizador ópticamente activo como productos

- 14 -

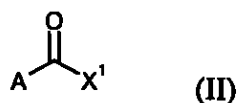
de partida, podrá representarse el procedimiento (c) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Los compuestos, necesarios como productos de partida en la realización del
 5 procedimiento (c) según la invención, están definidos, en general, por medio de las
 fórmulas (IV) y (V) En estas fórmulas, R, M y A tienen preferentemente, de forma
 especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos
 significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, como
 especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes en relación con
 10 la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los compuestos de la fórmula (IV) y (V) (o mezclas de estos compuestos) se
 obtienen, sí

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



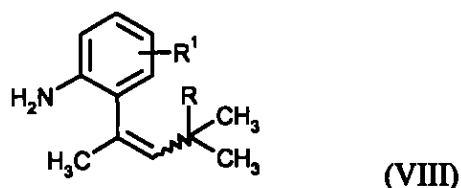
15 en la que

A tiene los significados anteriormente indicados y

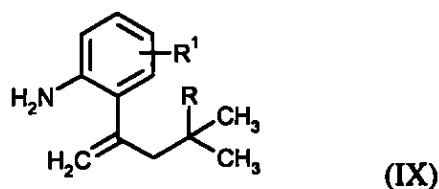
X¹ significa halógeno o hidroxilo,

bien con una alquenoanilina de la fórmula (VIII)

78



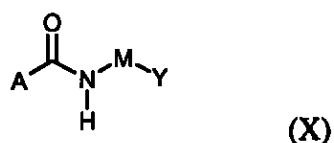
en la que R y R¹ tienen los significados anteriormente indicados,
o con una alquenoanilina de la fórmula (IX)



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

o

10 g) se hacen reaccionar carboxamidas de la fórmula (X)

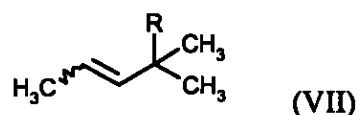


en la que

M y A tienen los significados anteriormente indicados, e

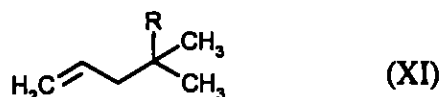
Y significa bromo o yodo,

15 con un alqueno de la fórmula (VII)



en la que R tiene los significados anteriormente indicados,

o con un alqueno de la fórmula (XI)



en la que R tiene los significados anteriormente indicados,

en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de una base y, en caso dado, en presencia de un diluyente.

5

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

Las alquenoanilinas de la fórmula (VIII), necesarias además como productos de partida para la realización del procedimiento (f) según la invención han sido descritas ya en relación con el procedimiento (d).

Las alquenoanilinas, necesarias como productos de partida alternativos para la realización del procedimiento (f) según la invención, están definidas en general, por medio de la fórmula (IX). En esta fórmula (IX), R y R¹ tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados para estos restos como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes en relación con la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Las alquenoanilinas de la fórmula (IX) son conocidas y/o pueden prepararse según procedimientos conocidos.

20

Las carboxamidas, necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento (g) según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (X). En esta fórmula (X), M y A tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos

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

Las carboxamidas de la fórmula (X) son conocidas y/o pueden prepararse según
5 procedimientos conocidos (véase la publicación WO 03/010149).

Los alquenos de la fórmula (VII), necesarios además como productos de partida para la realización del procedimiento (g) según la invención, han sido descritos ya en relación con el procedimiento (d).

Los alquenos, necesarios como productos de partida alternativos para la
10 realización del procedimiento (g) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (XI). En esta fórmula (XI), R tiene preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente, aquellos significados que ya han sido citados para este resto como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes en relación con
15 la descripción de los compuestos de la fórmula (I) según la invención.

Los alquenos de la fórmula (XI) son conocidos o pueden prepararse según procedimientos conocidos.

Condiciones de la reacción.

Como diluyentes para la realización de los procedimientos (a) y (f), según la
20 invención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen, preferentemente, los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como por ejemplo el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno o la decalina, los hidrocarburos halogenados, tales como, por ejemplo, el clorobenceno, el diclorobenceno, el
25 diclorometano, el cloroformo, el tetraclorometano, el dicloroetano o el tricloroetano;

los éteres, tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-terc.-butiléter, el metil-terc.-amiléter, el dioxano, el tetrahidrofurano, el 1,2-dimetoxietano, el 1,2-dietoxietano o el anisol o las amidas, tales como la N,N-dimetilformamida, la N,N-dimetilacetamida, la N-metilformanilida, la N-metilpirrolidona o la
5 hexametilfósforotriamida.

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

Los procedimientos (a) y (f), según la invención, se llevan a cabo, en caso
dado, en presencia de un agente de condensación adecuado. Como tales entran en
consideración todos los agentes de condensación empleables usualmente para este tipo
de reacciones de amidación. De manera ejemplificativa pueden citarse los formadores
25 de halogenuro de acilo tales como el fosgeno, el tribromuro de fósforo, el tricloruro de

fósforo, el pentacloruro de fósforo, el oxiclورو de fósforo o el cloruro de tionilo; los formadores de anhídridos tales como el cloroformiato de etilo, el cloroformiato de metilo, el cloroformiato de isopropilo, el cloroformiato de isobutilo o el cloruro de metanosulfonilo; las carbodiimidas, tal como la N,N'-diciclohexil carbodiimida (DCC) u otros agentes de condensación usuales, tales como el pentóxido de fósforo, el ácido polifosforoso, el N,N'-carbonildiimidazol, la 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), la trifenilfosfina / tetracloruro de carbono o el hexaflúorofosfato de bromotripirrolidinofosfonio.

Los procedimientos (a) y (f), según la invención se llevan 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.

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

Par la realización del procedimiento (a) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), se emplean, por mol del derivado del ácido carboxílico de la fórmula (II), en general desde 0,2 hasta 5 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 2 moles de derivado de anilina de la fórmula (III).

Para la realización del procedimiento (f) según la invención para la obtención de los compuestos de las fórmulas (IV) y (V) se emplean, por mol del derivado del ácido carboxílico de la fórmula (II), en general desde 0,2 hasta 5 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 2 moles de alquenoanilina de la fórmula (VIII) o (IX).

Como eluyentes entran en consideración en la realización del procedimiento (b) según la invención, respectivamente, todos los disolventes orgánicos usuales, inertes,

- 20 -

así como mezclas de los mismos, o también mezclas de éstos con agua. Preferentemente pueden emplearse los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados, tales como el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano; el diclorometano, el cloroformo; los alcoholes, tales como el metanol, el etanol, el propanol, los nitrilos, tales como el acetonitrilo; los ésteres tales como el acetato de metilo o el acetato de etilo. De forma especialmente preferente se emplean hidrocarburos alifáticos, tales como el hexano o el heptano, y los alcoholes, tales como el metanol o el propanol, de forma muy especialmente preferente el n-heptano y el isopropanol o bien mezclas de los mismos.

10 Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento (b) según la invención pueden variar respectivamente dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre 10°C y 60°C, preferentemente entre 10°C y 40°C, de forma especialmente preferente a temperatura ambiente

En la realización del procedimiento (b) según la invención se emplea, en general, una solución al 1 % aproximadamente del compuesto racémico (I-rac) para la separación cromatográfica. Sin embargo es posible también emplear otras concentraciones. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales. En general se procede de tal manera, que el eluato se concentra ampliamente por evaporación, los componentes sólidos se separan por filtración y tras el lavado con n-heptano se seca. El residuo se libera, en caso dado, mediante cromatografía de las impurezas eventualmente presentes todavía. En este caso se emplean como eluyentes mezclas formadas por el n-hexano o bien el ciclohexano con el acetato de etilo, cuya composición tiene que adaptarse respectivamente al compuesto a ser purificado.

Como diluyentes para la realización de la primera etapa del procedimiento (d), según la invención, así como del procedimiento (g), según la invención, entran en

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

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

La primera etapa del procedimiento (d), según la invención, así como el procedimiento (g), según la invención, se llevan a cabo en presencia de uno o varios catalizadores. Para ello son adecuados, especialmente, sales o complejos de paladio. En este caso entran en consideración preferentemente el cloruro de paladio, el acetato
25 de paladio, el tetraquis-(trifenilfosfina)-paladio o el dicloruro de bis-(trifenilfosfina)-

paladio. No obstante puede formarse también un complejo de paladio en la mezcla de la reacción, si se añade separadamente a la reacción una sal de paladio y un ligando complejo. Como ligandos entran en consideración, preferentemente, compuestos organofosforados. De manera ejemplificativa pueden citarse: la trifenilfosfina, la tri-
5 tolilfosfina, el 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftilo, el dicitclohexilfosfinabifenilo, el 1,4-bis(difenilfosfino)butano, el bisdifenilfosfinoferroceno, el di(terc.-butilfosfino)bifenilo, el di(ciclohexilfosfino)bifenilo, el 2-dicitclohexilfosfino-2'-N,N-dimetilaminobifenilo, la tricitclohexilfosfina, la tri-terc.-butilfosfina. No obstante puede desistirse también de los ligandos.

10 La primera etapa del procedimiento (d) según la invención así como el procedimiento (g) según la invención se llevan a cabo además en presencia de otra sal metálica, tales como sales de cobre, por ejemplo yoduro cuproso-(I).

Las temperaturas de la reacción en la realización de la primera etapa del procedimiento (d) según la invención así como del procedimiento (g) según la
15 invención pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas desde 20°C hasta 180°C, preferentemente a temperaturas desde 50°C hasta 150°C.

Para la realización de la primera etapa del procedimiento (d) según la invención para la obtención de las alquenoanilinas de la fórmula (VIII) se emplean, por mol del
20 derivado de anilina de la fórmula (VI), en general desde 1 hasta 5 moles, preferentemente desde 1 hasta 3 moles de alqueno de la fórmula (VII) o (XI).

Para la realización del procedimiento (g) según la invención, para la obtención de los compuestos de las fórmulas (IV) y (V) se emplean, por mol de la carboxamida de la fórmula (X), en general, desde 1 hasta 5 moles, preferentemente desde 1 hasta 3 moles
25 de alqueno de la fórmula (VII) o (XI).

Como diluyentes para la realización del procedimiento (c) según la invención, así como la segunda etapa (hidrogenación) del procedimiento (d) según la invención, entra en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen, preferentemente, los hidrocarburos alifáticos o alicíclicos, tales como, por ejemplo, el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano o la decalina; los éteres, tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-terc.-butiléter, el metil-terc.-amiléter, el dioxano, el tetrahidrofurano, el 1,2-dimetoxietano o el 1,2-dietoxietano; los alcoholes, tales como el metanol, el etanol, el n- o el iso-propanol, el n-, el iso-, el sec - o el terc.-butanol, el etanodiol, el propano-1,2-diol, el etoxietanol, el metoxietanol, el dietilenglicolmonometiléter, el dietilenglicolmonoetiléter, sus mezclas con agua o el agua pura.

La segunda etapa (hidrogenación) del procedimiento (d) según la invención se lleva a cabo en presencia de un catalizador. Como tales entran en consideración todos los catalizadores que se utilicen frecuentemente para las hidrogenaciones. De manera ejemplificativa pueden citarse: el níquel Raney, el paladio, el rutenio o el platino, en caso dado sobre un material de soporte, tal como por ejemplo el carbón activo.

La hidrogenación quiral en la realización del procedimiento (c) según la invención, así como en el procedimiento (d) se lleva a cabo en un disolvente ópticamente activo. De manera ejemplificativa puede citarse la combinación (*R,R*)-Me-DuPhos/RuCl₂[®] o (*S,S*)-Me-DuPhos/RuCl₂[®] (según el enantiómero deseado).

La hidrogenación en la segunda etapa del procedimiento (d) según la invención puede llevarse a cabo también en presencia de trietilsilano en lugar de hacerlo en presencia de hidrógeno en combinación con un catalizador.

Las temperaturas de la reacción, en la realización del procedimiento (c) según la invención, así como en la segunda etapa del procedimiento (d) según la invención,

pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas desde 0°C hasta 150°C, preferentemente a temperaturas desde 20°C hasta 100°C.

El procedimiento (c) según la invención así como la segunda etapa del procedimiento (d) según la invención se llevan a cabo bajo una presión de hidrógeno
5 comprendida entre 0,5 y 200 bares, preferentemente entre 2 y 50 bares, de forma especialmente preferente entre 3 y 10 bares.

Como eluyentes entran en consideración, en la realización de la tercera etapa del procedimiento (d) según la invención o bien del procedimiento (e) según la invención, respectivamente todos los disolventes orgánicos inertes, usuales, así como mezclas de
10 los mismos o incluso en caso dado mezclas con agua. Preferentemente pueden emplearse los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, en caso dado halogenados, tales como el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano; el diclorometano, el cloroformo; los alcoholes, tales como el metanol, el etanol, el propanol; los nitrilos, tales como el acetonitrilo; los ésteres tales como el acetato de
15 metilo o el acetato de etilo. De forma especialmente preferente se emplean los hidrocarburos alifáticos, tales como el hexano o el heptano, y los alcoholes, tales como el metanol o el propanol, de forma muy especialmente preferente el n-heptano y el isopropanol, o bien mezclas de los mismos.

Las temperaturas de la reacción en la realización de la tercera etapa del
20 procedimiento (d) según la invención o bien del procedimiento (e) según la invención pueden variar, respectivamente, dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre 10°C y 60°C, preferentemente entre 10°C y 40°C, de forma especialmente preferente a temperatura ambiente.

En la realización de la tercera etapa del procedimiento (d) según la invención o
25 bien del procedimiento (e) según la invención, se emplea, en general, una solución al 1

- 25 -

% aproximadamente el compuesto racémico (III-a-rac) o bien (III-b-rac) para la separación cromatográfica. No obstante es posible también emplear otras concentraciones. La elaboración se lleva a cabo según métodos usuales. En general se procede de tal manera, que el eluato se concentra ampliamente por evaporación, los
5 componentes sólidos se separan por filtración y, tras lavado con n-heptano, se seca. El residuo se libera en caso dado mediante cromatografía de las impurezas eventualmente presentes todavía. En este caso se emplearán como eluyentes mezclas formadas por n-hexano o bien ciclohexano y acetato de etilo, cuya composición tiene que adaptarse respectivamente al compuesto a ser purificado.

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

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

Los agentes fungicidas se emplean en la protección de las plantas para la lucha contra los Plasmodiophoromycetes, los Oomycetes, los Chytridiomycetes, los Zygomycetes, los Ascomycetes, los Basidiomycetes y los Deuteromycetes.

20 Los agentes bactericidas se emplean en la protección de las plantas para combatir Pseudomonadaceae, Rhizobiaceae, Enterobacteriaceae, Corynebacteriaceae y Streptomycetaceae.

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

- 26 -

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

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

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

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

Debe entenderse por microorganismos indeseables, en el caso presente, hongos fitopatógenos, bacterias y virus. Los productos según la invención pueden emplearse, por lo tanto, para generar resistencia en las plantas, dentro de un lapso de tiempo
20 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 los productos activos.

La buena compatibilidad con las plantas y los productos activos a las
25 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 viñedos, de frutales y de hortalizas, tal como, por ejemplo, contra tipos de Botrytis, de 5 Venturia o de Alternaria.

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

10 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. Estos pueden emplearse en caso dado, también, a modo de productos intermedios y de producto de partida para la síntesis de otros productos activos.

15 Según la invención, pueden tratarse todas las plantas y las partes de las plantas. Por plantas se entenderá n en este caso todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas (con inclusión de las plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener mediante los métodos convencionales y cultivo y de optimación o por medio de métodos 20 biotecnológicos y de ingeniería genética, 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, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, 25 troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, 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 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

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

Como microorganismos, que pueden provocar la descomposición o la modificación

- 30 -

de los materiales técnicos, pueden citarse a modo de ejemplos bacterias, hongos, levaduras, algas y organismos mucilaginosos. Preferentemente los productos activos según la invención actúan contra hongos, especialmente contra mohos, hongos coloreadores y destructores de la madera (Basidiomycetes) así como contra organismos

5 mucilaginosos y algas.

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*,
- 10 Coniophora, tal como *Coniophora puetana*,
- Lentinus, tal como *Lentinus tigrinus*,
- Penicillium, tal como *Penicillium glaucum*,
- Polyporus, tal como *Polyporus versicolor*,
- Aureobasidium, tal como *Aureobasidium pullulans*,
- 15 Sclerophoma, tal como *Sclerophoma pityophila*,
- Trichoderma, tal como *Trichoderma viride*,
- Escherichia, tal como *Escherichia coli*,
- Pseudomonas, tal como *Pseudomonas aeruginosa*,
- Staphylococcus, tal como *Staphylococcus aureus*

- 20 Los productos activos pueden transformarse, en función de sus respectivas 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
- 25 (ULV).

Estas formulaciones se preparan de forma conocida, por ejemplo por mezclado de los productos activos con agentes extendedores, es decir disolventes líquidos, gases licuados, que se encuentran a presión y/o materiales de soporte sólidos, en caso dado con empleo de agentes tensioactivos, es decir emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes generadores de espuma. Cuando se utilice el agua como agente extendedor, podrá n
5 emplearse, también, disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos entran en consideración fundamentalmente: los hidrocarburos aromáticos, tales como el xileno, el tolueno, o las alquilnaftalinas, los hidrocarburos aromáticos clorados o los hidrocarburos alifáticos clorados, tales como el
10 clorobencenos, el cloroetileno o el cloruro de metileno, los hidrocarburos alifáticos tales como el ciclohexano o las parafinas, por ejemplo las fracciones de petróleo, los alcoholes, tales como el butanol o el glicol, así como los éteres y los ésteres, las cetonas tales como la acetona, la metiletilcetona, la metilisobutilcetona o la ciclohexanona, los disolventes fuertemente polares, tales como la dimetilformamida y el dimetilsulfóxido así como el
15 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 los gases propulsores para aerosoles, tales como los hidrocarburos halogenados así como el butano, el propano, el nitrógeno y el dióxido de carbono. Como materiales de soporte sólidos entran en consideración, por ejemplo, las harinas minerales naturales, tales
20 como los caolines, las arcillas, el talco, las cretas, el cuarzo, la attapulgita, la montmorillonita, o la tierra de diatomeas y las harinas minerales sintéticas, tales como el ácido silícico altamente dispersado, el óxido de aluminio y los silicatos. Como materiales de soporte sólido para granulados entran en consideración: por ejemplo los minerales quebrados y fraccionados tales como la calcita, la piedra pómez, el mármol, la sepiolita,
25 la dolomita, así como granulados sintéticos constituidos a partir de las harinas

85

- 32 -

inorgánicas y orgánicas así como los granulados constituidos a partir de material orgánico tales como el serrín, las cáscaras de nueces de coco, las panochas de maíz y los tallos de tabaco. Como agentes emulsionantes y/o generadores de espuma entran en consideración: por ejemplo los emulsionantes no iónicos y aniónicos, tales como los ésteres
5 de los ácidos grasos polioxietilenados, los éteres de alcoholes grasos polioxietilenados, por ejemplo el alquilaril-poliglicoléter, los sulfonatos de alquilo, los sulfatos de alquilo, los sulfatos de arilo, así como los hidrolizados de albúmina. Como dispersantes entran en consideración, por ejemplo las lejías sulfúricas de lignina y la metilcelulosa.

En las formulaciones pueden emplearse adhesivos tales como la
10 carboximetilcelulosa, los polímeros naturales y sintéticos pulverulentos, granulados o en forma de látex, tales como la goma arábiga, el alcohol polivinílico, el acetato de polivinilo así como los fosfolípidos naturales, tales como la cefalina y la lecitina y los fosfolípidos sintéticos. Otros aditivos pueden ser los aceites minerales y vegetales.

Pueden emplearse colorantes tales como los pigmentos inorgánicos, por ejemplo
15 el óxido de hierro, el óxido de titanio, el azul de ferrocianuro y los colorantes orgánicos tales como los colorantes de alizarina, los azoicos y los de ftalocianina metálicos y los materiales nutrientes en trazas, tales como las 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
20 producto activo, preferentemente entre 0,5 y 90 %.

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
25 que la actividad de la mezcla es mayor que la actividad de los componentes individuales

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

Fungicidas:

- 2-fenilfenol; sulfato de 8-hidroxiquinolina; Acibenzolar-S-metilo; Aldimorph;
- 5 Amidoflomet; Ampropylfos; Ampropylfos-potasio; Andoprim; Anilazine;
- Azaconazole; Azoxystrobin; Benalaxyl; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-
- isopropilo; Benzamacril; Benzamacril-isobutilo; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl;
- Bitertanol; Blasticidin-S, Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamine;
- polisulfuro de calcio; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin;
- 10 Carpropamid, Carvone; Chinomethionat, Chlobenthiazone; Chlorfenazole; Chloroneb;
- Chlorothalonil; Chlozolate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil;
- Cyproconazole; Cyprodinil, Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid;
- Dichlone; Dichlorophen, Diclocymet; Diclomezine, Dicloran; Diethofencarb;
- Difenoconazole, Diflumetorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin;
- 15 Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos;
- Dithianon, Dodine; Drazoxolon; Edifenphos, Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol;
- Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole;
- Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenciclonil; Fenpropidin;
- Fenpropimorph; Ferbam, Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover;
- 20 Flumorph; Fluoromide, Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole;
- Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodio; Fuberidazole;
- Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Furmecyclox; Guazatine; Hexachlorobenzene;
- Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetato;
- Iminoctadine tris(albesilato); Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione;
- 25 Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-

metilo; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrım; Mepronil; Metalaxyl;
Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram;
Metominostrobin; Metsulfovax, Mildiomyacin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin;
Nicobifen; Nitrothal-isopropilo; Noviflumuron; Nuarimol, Ofurace; Orysastrobin;
5 Oxadixyl; ácid o oxolín ico; Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin; Paclobutrazol;
Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen, Phthalide; Picoxystrobin;
Piperalin; Polyoxins, Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz, Procymidone;
Propamocarb; Propanosine-sodio; Propiconazole; Propineb; Proquinazid;
Prothioconazole; Pyraclostrobin, Pyrazophos; Pyrifenox; Pyrimethanil; Pyroquilon;
10 Pyroxyfur, Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxifen; Quintozene; Simeconazole;
Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis;
Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-metilo; Thiram;
Tioxymid; Tolclofos-metilo; Tolyfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil;
Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole,
15 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-
tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina; 2-amino-4-metilo-N-fenil-5-tiazolcarboxamida;
2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida; 3,4,5-
20 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-dimetiletıl)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amina;
tetratiocarbonato de sodio; así como sales de cobre y preparaciones de cobre, tales
25 como mezclas de Bordeaux; hidróxido de cobre; naftenato de cobre; oxicloruro de

47

- 35 -

cobre; sulfato de cobre; Cufraneb; óxido de cobre; Mancopper; oxina de cobre.

Bactericidas:

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, dimetilditiocarbamato de níquel, Kasugamycin, Octhilinon, ácido furanocarboxílico, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin,

5 Tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre

Insecticidas/ acaricidas/ nematocidas:

1. Inhibidores de acetilcolinaesterasa (AChE)

1.1 Carbamatos (por ejemplo Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb, Allyxycarb, Aminocarb, Azamethiphos, Bendiocarb, Benfuracarb, Bufencarb, Butacarb, Butocarboxim, Butoxycarboxim, Carbaryl, Carbofuran, Carbosulfan, Chloethocarb, Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Dimetilan, Ethiofencarb, Fenobucarb, Fenothiocarb, Formetanate, Furathiocarb, Isoprocab, Metam-sodio, Methiocarb, Methomyl, Metolcarb, Oxamyl, Pirimicarb, Promecarb, Propoxur, Thiodicarb, Thiofanox, Triazamate, Trimethacarb, XMC, Xylcarb).

15 1.2 Organofosfatos (por ejemplo Acephate, Azamethiphos, Azinphos (-metilo, -etilo), Bromophos-etilo, Bromfenvinfos (-metilo), Butathiofos, Cadusafos, Carbophenothion, Chlorethoxyfos, Chlorfenvinfos, Chlormephos, Chlorpyrifos (-metilo/-etilo), Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Chlorfenvinfos, Demeton-S-metilo, Demeton-S-metilsulfona, Dialifos, Diazinon, Dichlofenthion, Dichlorvos/DDVP, 20 Dicrotophos, Dimethoate, Dimethylvinphos, Dioxabenzofos, Disulfoton, EPN, Ethion, Ethoprophos, Etrimfos, Famphur, Fenamiphos, Fenitrothion, Fensulfothion, Fenthion, Flupyrzofos, Fonofos, Formothion, Fosmethilan, Fosthiazate, Heptenophos, Iodofenphos, Iprobenfos, Isazofos, Isofenphos, salicilato de O-isopropilo, Isoxathion, Malathion, Mecarbam, Methacrifos, Methamidophos, Methidathion, Mevinphos, 25 Monocrotophos, Naled, Omethoate, Oxydemeton-metilo, Parathion (-metilo/-etilo),

Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phosphocarb, Phoxim, Pirimiphos (-metilo/-etilo), Profenofos, Propaphos, Propetamphos, Prothiofos, Prothoate, Pyraclofos, Pyridaphenthion, Pyridathion, Quinalphos, Sebufos, Sulfotep, Sulprofos, Tebupirimfos, Temephos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Thiometon, 5 Triazophos, Triclorfon, Vamidothion).

2. Moduladores del canal de sodio /bloqueantes del canal de sodio en función de la tensión

2.1 Piretroides (por ejemplo Acrinathrin, Allethrin (d-cis-trans, d-trans), Beta-Cyfluthrin, Bifenthrin, Bioallethrin, Bioallethrin-S-ciclopentilo-isómero, 10 Bioethanomethrin, Biopermethrin, Bioresmethrin, Chlovaporthrin, Cis-Cypermethrin, Cis-Resmethrin, Cis-Permethrin, Clocythrin, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cypermethrin (alfa-, beta-, theta-, zeta-), Cyphenothrin, DDT, Deltamethrin, Empenthrin (isómero 1R), Esfenvalerate, Etofenprox, Fenfluthrin, Fenpropathrin, Fenpyrithrin, Fenvalerate, Flubrocycrin, Flucythrinate, Flufenprox, Flumethrin, 15 Fluvalinate, Fubfenprox, Gamma-Cyhalothrin, Imiprothrin, Kadethrin, Lambda-Cyhalothrin, Metofluthrin, Permethrin (cis-, trans-), Phenothrin (isómero 1R-trans), Prallethrin, Profluthrin, Protrifenbute, Pyresmethrin, Resmethrin, RU 15525, Silafluofen, Tau-Fluvalinate, Tefluthrin, Terallethrin, Tetramethrin (isómero 1R), Tralomethrin, Transfluthrin, ZXI 8901, Pyrethrins (pyrethrum)).

20 2.2 Oxadiazinas (por ejemplo Indoxacarb).

3. Agonistas /-antagonistas del receptor de la acetilcolina

3.1 Cloronicotinilos/ neonicotinoides (por ejemplo Acetamiprid, Clothianidin, Dinotefuran, Imidacloprid, Nitenpyram, Nithiazine, Thiacloprid, Thiamethoxam)

3.2 Nicotine, Bensultap, Cartap.

25 4. moduladores del receptor de la acetilcolina

4.1 Espinosinas (por ejemplo Spinosad).

5. Antagonistas del canal de cloruro controlados por GABA

5.1 Organocloruros ciclodiénicos (por ejemplo Camphechlor, Chlordane, Endosulfan, Gamma-HCH, HCH, Heptachlor, Lindane, Methoxychlor).

5.2 Fiproles (por ejemplo Acetoprole, Ethiprole, Fipronil, Vaniliprole).

6. Activadores del canal de cloruro

6.1 Mectinas (por ejemplo Abamectin, Avermectin, Emamectin, Emamectin-benzoate, Ivermectin, Milbemectin, Milbemycin).

7. Miméticos de la hormona juvenil

10 (por ejemplo Diofenolan, Epofenonane, Fenoxycarb, Hydroprene, Kinoprene, Methoprene, Pyriproxifen, Triprene).

8. Agonistas / disruptores de Ecdyson

8.1 Diacilhidrazinas (por ejemplo Chromafenozide, Halofenozide, Methoxyfenozide, Tebufenozide).

15 *9. Inhibidores de la biosíntesis de la quitina*

9.1 Benzoilureas (por ejemplo Bistrifluron, Chlofluazuron, Diflubenzuron, Fluazuron, Flucycloxuron, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Lufenuron, Novaluron, Noviflumuron, Penfluron, Teflubenzuron, Triflumuron).

9.2 Buprofezin.

20 9.3 Cyromazine.

10. Inhibidores de la fosforilación oxidante, disruptores de ATP

10.1 Diafenthiuron.

10.2 Organotinas (por ejemplo Azocyclotin, Cyhexatin, Fenbutatin-óxido).

11. Desacopladores de la fosforilación oxidante mediante interrupción del gradiente

25 *protónico de H*

11.1 Pirroles (por ejemplo Chlorfenapyr)

11.2 Dinitrofenoles (por ejemplo Binapacryl, Dinobuton, Dinocap, DNOC).

12. Inhibidores del transporte electrónico en el lado I

12.1 METI's (por ejemplo Fenazaquin, Fenpyroximate, Pyrimidifen, Pyridaben,
5 Tebufenpyrad, Tolfenpyrad).

12.2 Hydramethylnone.

12.3 Dicofol.

13. Inhibidores del transporte electrónico en el lado II

13.1 Rotenone.

10 *14. Inhibidores del transporte electrónico en el lado III*

14.1 Acequinocyl, Fluacrypyrim.

15. Disruptores microbianos de la membrana intestinal de los insectos

Cepas de *Bacillus thuringiensis*

16. Inhibidores de la síntesis de las grasas

15 16.1 Ácidos tetrínicos (por ejemplo Spirodiclofen, Spiromesifen).

16.2 Ácidos tetrámicos [por ejemplo carbonato de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-
oxo-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-4-il etilo (alias: Carbonic acid, 3-(2,5-dimethylphenyl)-
8-methoxy-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl ethyl ester, CAS-Reg.-No.: 382608-10-
8) and Carbonic acid, cis-3-(2,5-dimethylphenyl)-8-methoxy-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-
20 3-en-4-yl ethyl ester (CAS-Reg.-No.: 203313-25-1)]

17. Carboxamidas

(por ejemplo Flonicamid)

18. Agonistas octopaminérgicos.

(por ejemplo Amitraz).

25 *19. Inhibidores de la ATPasa estimulados por magnesio*

(por ejemplo Propargite).

20. *Ftalamidas.*

(por ejemplo N²-[1,1-dimetil-2-(metilsulfonil)etil]-3-yodo-N¹-[2-metil-4-[1,2,2,2-tetraflúor-1-(trifluormetil)etil]fenil]-1,2-bencenodicarboxamida (CAS-Reg.-No.:

5 272451-65-7))

21. *Análogos de la nereistoxina*

(por ejemplo Thiocyclam hidrógenooxalato, Thiosultap-sodio)

22. *Productos biológicos, hormonas o feromonas*

(por ejemplo Azadirachtin, Bacillus spec., Beauveria spec., Codlemone, Metarrhizium spec., Paecilomyces spec., Thuringiensin, Verticillium spec.).

10

23. *Productos activos con mecanismos de actuación no conocidos o que no son específicos*

23.1 Agentes para gaseado (por ejemplo fosfuro de aluminio, bromuro de metilo, fluoruro de sulfurilo).

15

23.2 Inhibidores selectivos de la ingesta (por ejemplo Cryolite, Flonicamid, Pymetrozine)

23.3 Inhibidores del crecimiento de los ácaros (por ejemplo Clofentezine, Etoxazole, Hexythiazox).

23.4 Amidoflumet, Benclothiaz, Benzoximate, Bifenazate, Bromopropylate, Buprofezin, Chinomethuonate, Chlordimeform, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Clothiazoben, Cycloprene, Dicyclanil, Fenoxacrim, Fentrifanil, Flubenzimine, Flufenimer, Flutenzin, Gossyplure, Hydramethylnone, Japonilure, Metoxadiazone, Petroleum, Piperonyl butoxide, oleato de potasio, Pyridalyl, Sulfluramid, Tetradifon, Tetrasul, Triarathene, Verbutin,

20

25 además el compuesto 3-metil-fenil-propilcarbarnato (Tsumacide Z), el compuesto 3-

(5-cloro-3-piridinil)-8-(2,2,2-trifluoretil)-8-azabicyclo[3 2.1]octan-3-carbonitrilo (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) y el correspondiente 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, nematodos, hongos o virus.

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

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

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

25 Cuando se emplean los productos activos según la invención como fungicidas

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

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

De 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 mutagenesis o por técnicas recombinantes de DNA. Estas pueden ser variedades, biotipos o genotipos.

Según los tipos de plantas o bien las variedades de las plantas, de su localización y de las condiciones de crecimiento (terreno, clima, periodo de vegetación, alimentación)

pueden presentarse también por medio del tratamiento según la invención efectos sobreaditivos (“sinérgicos”). De este modo son posibles, por ejemplo, menores cantidades de aplicación y/o ampliaciones del espectro de actividad y/o un reforzamiento del efecto de los, productos empleables según la invención, mejor crecimiento de las plantas, mayor tolerancia frente a temperaturas elevadas o bajas, mayor tolerancia contra la sequía o contra el contenido en sal del agua o bien del terreno, mayor rendimiento floral, recolección más fácil, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de las cosechas, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recolectados, mayor 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 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 mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas se citaran las

106
106

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 ("características") se señalará especialmente la mayor
5 resistencia de las plantas frente a los insectos, a los arácnidos, a los nematodos 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, Cry3Bb y CryIF así como por sus combinaciones),
10 (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 propiedades ("características") deben señalarse
15 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. Como ejemplos de "plantas Bt"
20 pueden citarse variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de papa, que se comercializan bajo las marcas 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 pueden citarse variedades de maíz,
25 variedades de algodón y variedades de soja, que se comercializan bajo las marcas

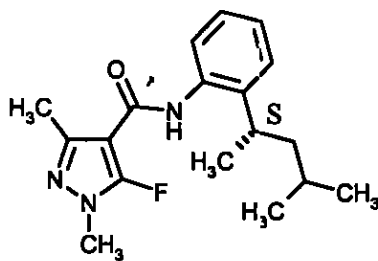
registradas Roundup Ready® (tolerancia contra Glyphosate, por ejemplo maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia contra Phosphinothricin, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia contra imidazolinonas) y STS® (tolerancia contra sulfonilureas por ejemplo maíz). Como plantas resistentes a los herbicidas (cultivadas convencionalmente con relación a la tolerancia a los herbicidas) 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").

10 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
15 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.

20 Ejemplo 1.



Se disuelve la (+/-)-N-[2-(1,3-dimetiltubil)fenil]-5-flúor-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (200 mg) en 25 ml de n-heptano/isopropanol 9:1 (v/v = volúmen/volúmen). A continuación se somete la solución a una cromatografía fraccionante sobre fase de gel de sílice Chiracel OD® [fabricante: Daicel (Japón),
5 dimensión de la columna: 500 mm x 40 mm (I.D.), tamaño de las partículas: 20 µm, caudal: 40 ml/minuto] con n-heptano/isopropanol 9:1 (v/v) como eluyente según el principio de la cromatografía líquida de alta resolución (HPLC). Para la separación de toda la cantidad se añaden cada 30 minutos, respectivamente, 5 ml (lo que corresponde respectivamente a 40 mg del racemato) sobre la columna. La detección de los
10 compuestos se lleva a cabo por medio de un detector UV con una longitud de onda de 210 nm. Las fracciones del eluato se combinan correspondientemente tras el ensayo analítico con respecto a la pureza enantiómera, se concentran por evaporación del modo más amplio posible en vacío, el residuo se separa por filtración y se seca tras lavado con n-heptano. El producto en bruto, obtenido de este modo, se purifica sobre gel de
15 sílice (eluente: n-hexano/acetato de etilo, 1:9 → 1:4, respectivamente v/v).

Se obtienen 87 mg de la N-{2-[1S)-1,3-dimetilbutil]fenil}-5-flúor-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (punto de fusión 52-54°C, índice de rotación $[\alpha]_D = +6,7$, $c = 0,87$; metanol, 20°C, valor ee = 99 %).

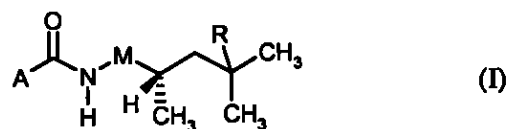
La pureza enantiómera de las carboxamidas de la fórmula (I) se determinó
20 mediante HPLC analítica con las siguientes condiciones:

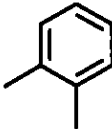
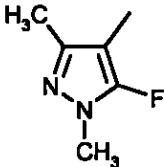
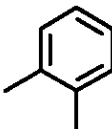
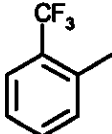
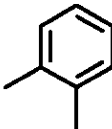
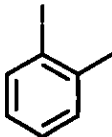
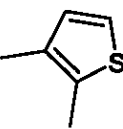
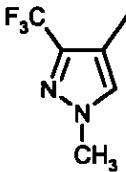
Fase separadora:	Chiracel OD® (Daicel, Japón); 5 µm
Columna:	250 mm x 4,6 mm (I.D.)
Eluyente:	n-heptano/2-propanol 10:1
Caudal:	0,5 ml/minuto
25 Detección UV:	210 nm

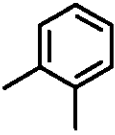
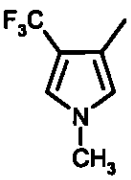
De manera análoga a la del ejemplo 1 así como de acuerdo con las indicaciones dadas en las descripciones generales de los procedimientos se obtienen los compuestos de la fórmula (I) indicados en la tabla 1 siguiente

Tabla 1

5



Ejem.	R	M	A	Log P (pH 2,3)	Índice de rotación $[\alpha]_D$	Valor ee
2	CH ₃			3,55	-5,2 (c = 0,7, CHCl ₃ , 20°C)	99 %
3	H			4,10	- 8,8 (c = 0,7; CHCl ₃ ; 20°C)	99 %
4	H			4,12	- 5,0 (c = 0,9, CHCl ₃ ; 20°C)	97 %
5	H			3,60	+4,3 (c = 0,3; CH ₃ OH; 20°C)	95 %

Ejem.	R	M	A	Log P (pH 2,3)	Índice de rotación[α] _D	Valor ee
6	H			3,83	-4,0 (c = 0,5; CH ₃ OH; 20°C)	99 %

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 inversión de fases (C 18). Temperatura 43°C.

La determinación se llevó a cabo en el intervalo ácido a 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 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.

Ejemplo A

Ensayo con Podosphaera (manzano) / protector

- Disolvente:** 24,5 Partes en peso de acetona
24,5 Partes en peso de dimetilacetamida.
- Emulsionante:** 1 Parte en peso de alquil-aril-poliglicoléter.

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
5 preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Tras el secado del recubrimiento, aplicado por pulverización, se inoculan las plantas con una suspensión acuosa de esporas del patógeno del midiu del manzano *Podosphaera leucotricha*. Las plantas se disponen, a continuación, en el invernadero aproximadamente a 23°C y con una humedad relativa del aire de aproximadamente el
10 70 %.

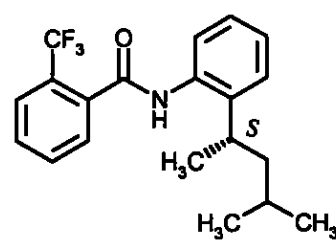
La evaluación se lleva a cabo a los 10 días desde la inoculación. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se ha observado ataque.

Tabla A

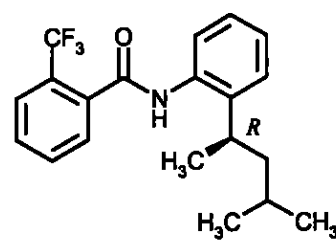
Ensayo con Podosphaera (manzano) / protector

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

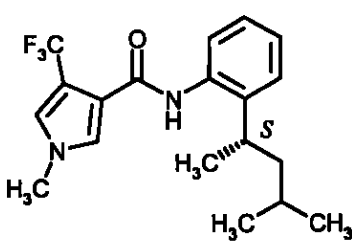
Según la invención:

	50	100
---	----	-----

Ensayo comparativo:

	50	20
--	----	----

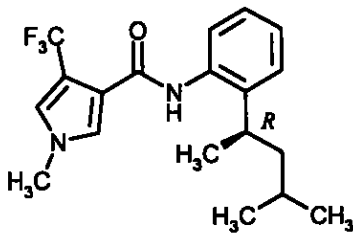
Según la invención:

	12,5	98
---	------	----

Ensayo con Podosphaera (manzano) / protector

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

Ensayo comparativo:



12,5

28



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

Disolvente: 24,5 Partes en peso de acetona.

24,5 Partes en peso de dimetilacetamida.

5 **Emulsionante:** 1 Parte en peso de alquil-aril-poliglicoléter.

Para la obtención de una preparación 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 de pepino con la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Tras el secado del recubrimiento aplicado por pulverización se inoculan las plantas con una suspensión acuosa de esporas de *Sphaerotheca fuliginea*. Las plantas se disponen, a continuación, en un invernadero a 23°C, con una humedad relativa del aire de aproximadamente el 70 %.

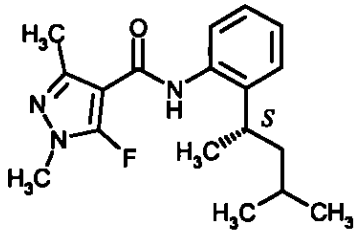
15 La evaluación se lleva a cabo a los 7 días desde la inoculación. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se ha observado ataque.

Tabla B

Ensayo con Sphaerotheca (pepinos) / protector

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

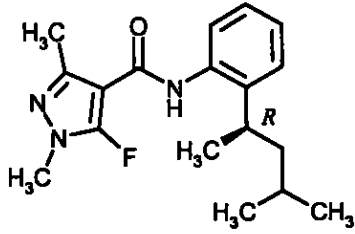
Según la invención:



25

96

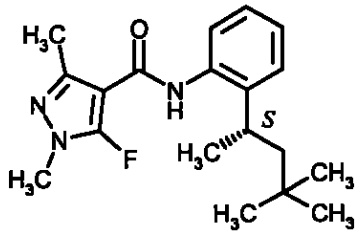
Ensayo comparativo:



25

7

Según la invención:

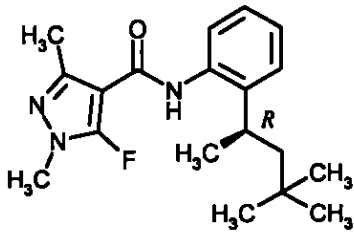


25

94

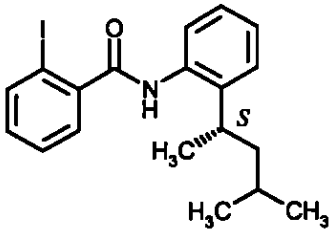
Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
------------------------------------	--	-------------------------

Ensayo comparativo:



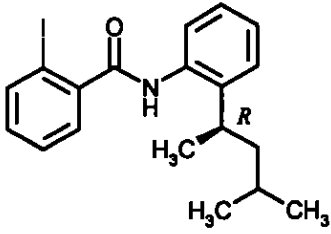
25 0

Según la invención.



25 85

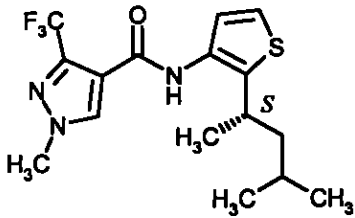
Ensayo comparativo:



25 15

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

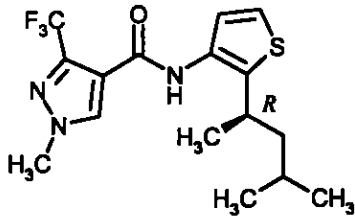
Según la invención:



3,125

98

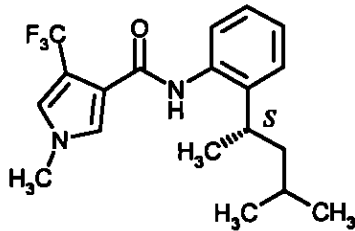
Ensayo comparativo:



3,125

35

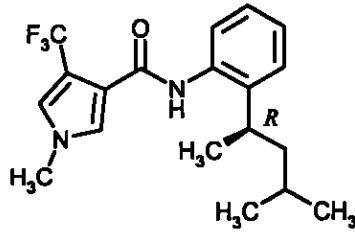
Según la invención:



50

91

Ensayo comparativo:



50

23

Ejemplo C

Ensayo con Venturia (manzano) / protector

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

5 **Emulsionante:** 1 Parte en peso de alquil-aril-poliglicoléter.

Para la obtención de una preparación 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. Tras el secado del 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.

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

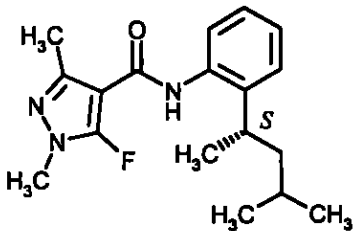
La evaluación se lleva a cabo a los 10 días desde la inoculación. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se ha observado ataque.

Tabla C

Ensayo con Venturia (manzano) / protector

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

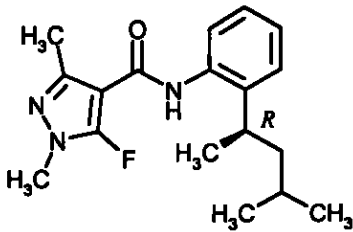
Según la invención:



25

100

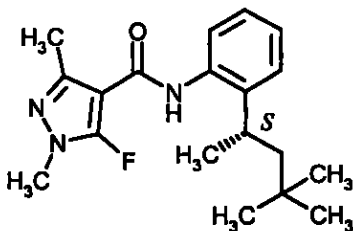
Ensayo comparativo:



25

21

Según la invención:



25

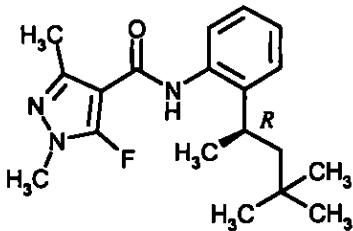
100

720
120

Ensayo con Venturia (manzano) / protector

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

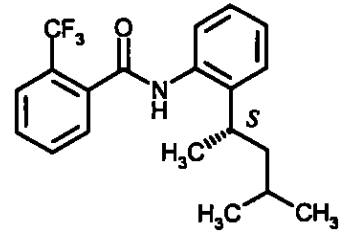
Ensayo comparativo:



25

0

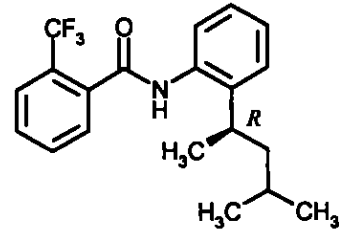
Según la invención:



25

100

Ensayo comparativo:



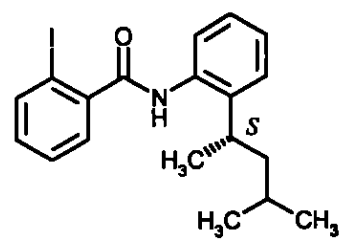
25

0

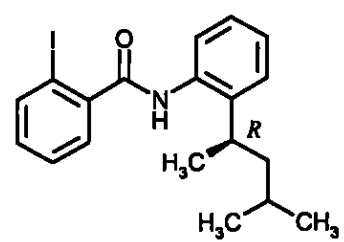
Ensayo con Venturia (manzano) / protector

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

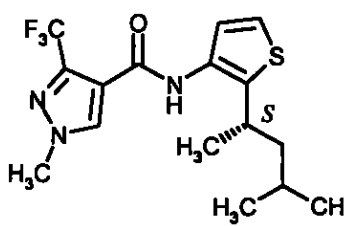
Según la invención.

	25	100
---	----	-----

Ensayo comparativo:

	25	16
--	----	----

Según la invención:

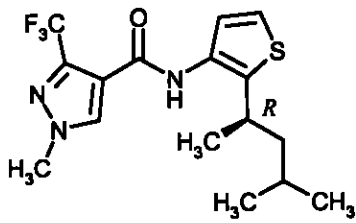
	3,125	100
---	-------	-----

123
122

Ensayo con Venturia (manzano) / protector

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

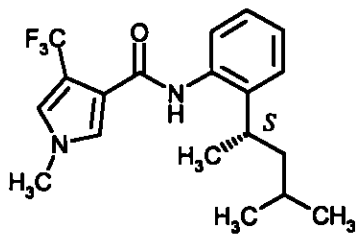
Ensayo comparativo:



3,125

7

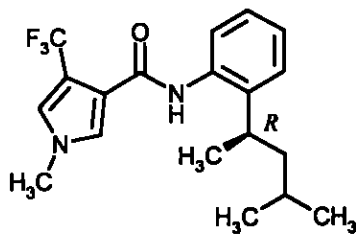
Según la invención:



50

100

Ensayo comparativo:



50

20

Ejemplo D**Ensayo con Botrytis (judías) / protector**

Disolvente: 24,5 Partes en peso de acetona.

24,5 Partes en peso de dimetilacetamida.

5 **Emulsionante:** 1 Parte en peso de alquil-aril-poliglicoléter.

Para la obtención de una preparación 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. Tras el secado del recubrimiento, aplicado por pulverización, se disponen, sobre cada hoja, 2 trocitos de agar recubiertos con Botrytis cinerea. Las plantas inoculadas se disponen en una cámara oscurecida aproximadamente a 20°C y con una humedad relativa del aire del 100 %.

15 La evaluación se lleva a cabo a los 2 días desde la inoculación por medio de la magnitud de las manchas producidas por el ataque. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se ha observado ataque.

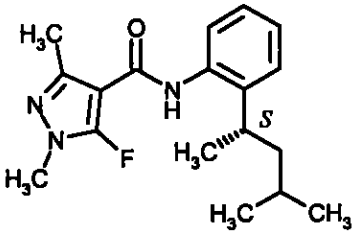
124

Tabla D

Ensayo con Botrytis (judías) / protector

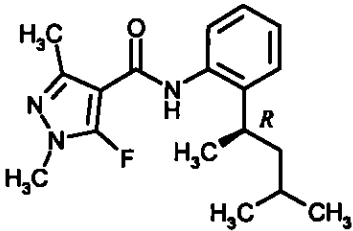
Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
------------------------------------	--	-------------------------

Según la invención:



250 100

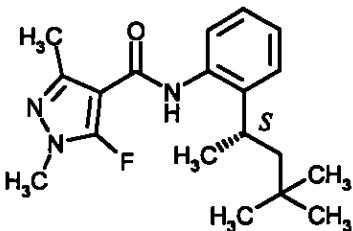
Ensayo comparativo:



250 29

7

Según la invención:

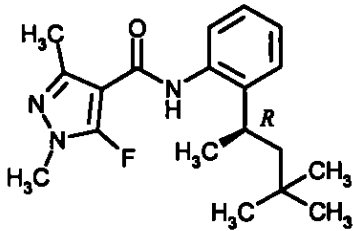


250 100

Ensayo con Botrytis (judías) / protector

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

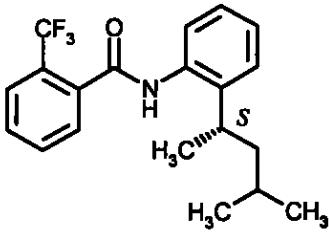
Ensayo comparativo.



250

14

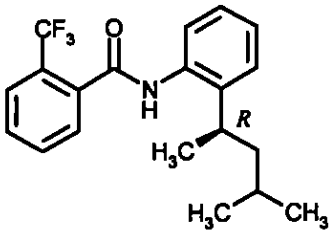
Según la invención:



250

90

Ensayo comparativo:



250

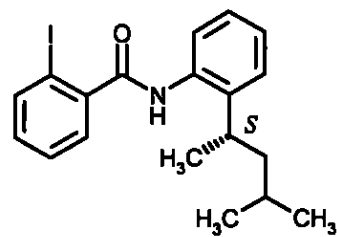
18

126

Ensayo con Botrytis (judías) / protector

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

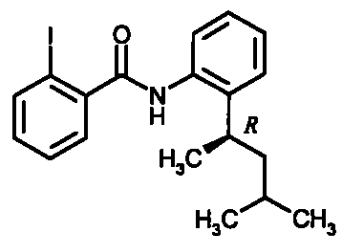
Según la invención



250

86

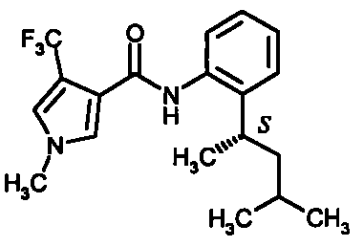
Ensayo comparativo:



250

0

Según la invención:



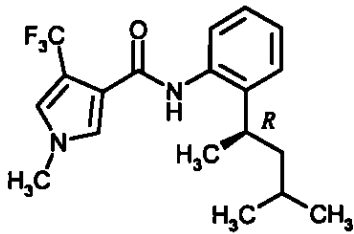
62,5

100

Ensayo con Botrytis (judías) / protector

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

Ensayo comparativo:



62,5

50

Ejemplo E**Ensayo con Alternaria (tomate) / protector**

Disolvente: 24,5 Partes en peso de acetona.

24,5 Partes en peso de dimetilacetamida.

5 **Emulsionante:** 1 Parte en peso de alquil-aril-poliglicoléter.

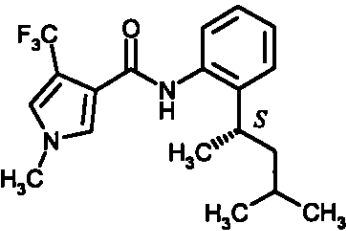
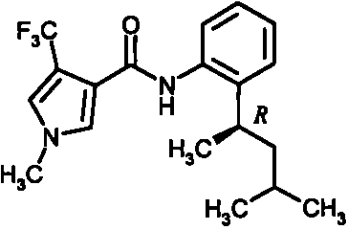
Para la obtención de una preparación de producto activo conveniente se mezcla 1 parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada

10 Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Tras el secado del recubrimiento, aplicado por pulverización, se inoculan las plantas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria solani*. Las plantas se disponen a continuación en una cabina de incubación aproximadamente a 20°C y con una humedad relativa del aire del 100 %.

15 La evaluación se lleva a cabo a los 3 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.

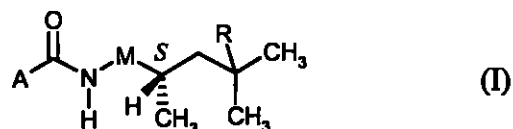
Tabla E

Ensayo con Alternaria (tomate) / protector

Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
Según la invención:		
	50	83
Ensayo comparativo:		
	50	30

REIVINDICACIONES

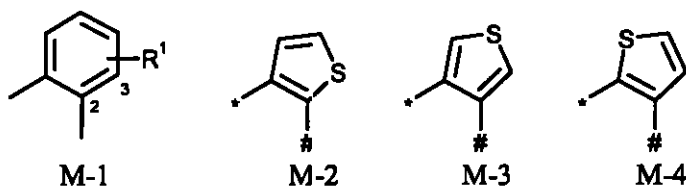
1.- Carboxamidas ópticamente activas de la fórmula (I)



en la que

5 R significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo, etilo o trifluórmétilo,

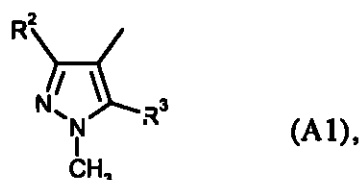
M significa



donde el enlace marcado con * está enlazado con la amida, mientras que el enlace marcado con # está enlazado con la cadena de alquilo lateral,

10 R¹ significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo o trifluórmétilo,

A significa el resto de la fórmula (A1)



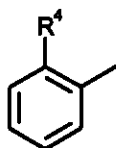
en la que

R² significa metilo, trifluórmétilo o difluórmétilo,

15 R³ significa hidrógeno, flúor o cloro,

o

A significa el resto de la fórmula (A2)



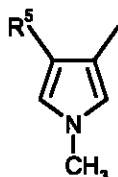
(A2),

en la que

R^4 significa trifluórmétilo, cloro, bromo o yodo,

o

5 A significa el resto de la fórmula (A3)



(A3),

en la que

R^5 significa metilo, trifluórmétilo o difluórmétilo.

2.- Carboxamidas ópticamente activas de la fórmula (I) según la reivindicación 1,

10 en la que

R significa hidrógeno, metilo o etilo,

M significa M-1 o M-2,

R^1 significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo o trifluórmétilo,

R^2 significa metilo o trifluórmétilo,

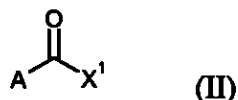
15 R^3 significa hidrógeno o flúor,

R^4 significa trifluórmétilo o yodo,

R^5 significa trifluórmétilo.

3.- Procedimiento para la obtención de carboxamidas ópticamente activas de la fórmula (I), según la reivindicación 1, caracterizado porque

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

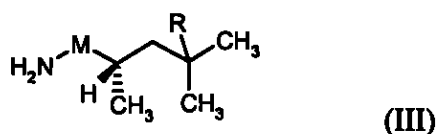


en la que

A tiene los significados indicados en la reivindicación 1 y

X¹ significa halógeno o hidróxido,

5 con una amina de la fórmula (III)



en la que R y M tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

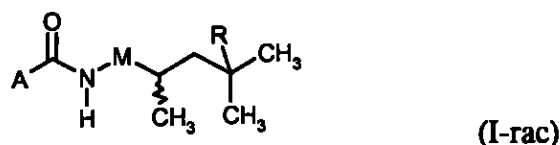
en caso dado en presencia de un catalizador, en caso dado en presencia de un

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

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

o

b) se cromatografían compuestos racémicos de la fórmula (I-rac)



en la que R, M y A tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

15 en una fase de gel de sílice estacionaria, quiral, en presencia de un eluyente o

de una mezcla de eluyentes como fase líquida,

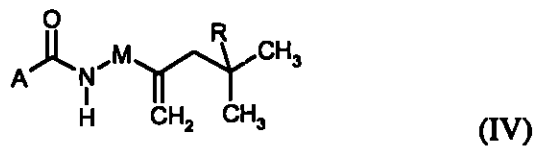
o se cristalizan de manera fraccionada con ácidos ópticamente activos con

formación de sales y, a continuación, se liberan los compuestos de la fórmula (I)

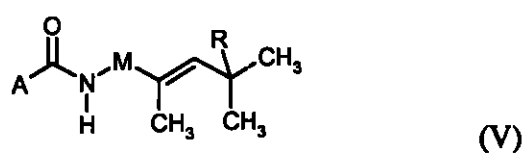
enantiónicamente puros o enriquecidos,

20 o

c) se hidrogenan compuestos de la fórmula (IV)



en la que R, M y A tienen los significados indicados en la reivindicación 1,
o compuestos de la fórmula(V)



5 en la que R, M y A tienen los significados indicados en la reivindicación 1,
o mezclas de ambos compuestos, en presencia de un catalizador ópticamente
activo o bien de un catalizador con ligandos ópticamente activos.

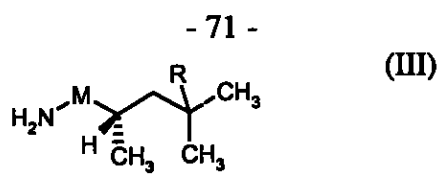
4.- Agentes para la lucha contra los microorganismos indeseables,
caracterizados porque tienen un contenido en al menos una carboxamida ópticamente
10 activa de la fórmula (I), según la reivindicación 1, junto a agentes extendedores y/o
productos tensioactivos.

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

6.- Procedimiento para la lucha contra los microorganismos indeseables,
15 caracterizado porque se aplican carboxamidas ópticamente activas 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
microorganismos indeseables, caracterizado porque se mezclan carboxamidas
ópticamente activas de la fórmula (I), según la reivindicación 1, con agentes
20 extendedores y/o con productos tensioactivos.

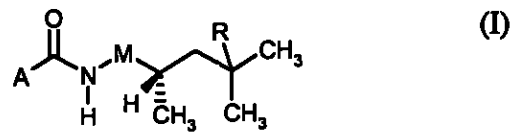
8.- Aminas de la fórmula (III),



en la que R y M tienen los significados indicados en la reivindicación 1.

- 72 -
RESUMEN

Nuevas carboxamidas, ópticamente activas, de la fórmula (I)



en la que R, M y A tienen los significados indicados en la descripción,

- 5 varios procedimientos para la obtención de estos productos y su empleo para la lucha
contra los microorganismos indeseables, así como nuevos productos intermedios y su
obtención.

10

15

20

136
136

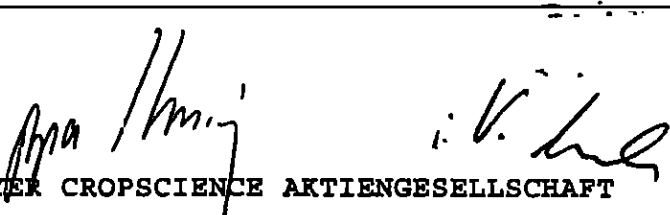
0	Vom Anmeldeamt auszufüllen		NEUANMELDUNG
0-1	Internationales Aktenzeichen		08. Dez. 2004
0-2	Internationales Anmeldedatum		
0-3	Name des Anmeldeamts und "PCT International Application"		
0-4	Formular - PCT/RO/101 PCT-Antrag		
0-4-1	erstellt durch Benutzung von	PCT-SAFE [EASY mode] Version 3.50 (Build 0002.158)	
0-5	Antragssuchen Der Unterzeichnete beantragt, daß die vorliegende internationale Anmeldung nach dem Vertrag über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet des Patentwesens behandelt wird		
0-6	(Vom Anmelder gewähltes) Anmeldeamt	Europäisches Patentamt (EPA) (RO/EP)	
0-7	Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts	BCS033010-WO	
I	Bezeichnung der Erfindung	OPTISCH AKTIVE CARBOXAMIDE	
II	Anmelder		
II-1	Diese Person ist	nur Anmelder	
II-2	Anmelder für	Alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US.	
II-4	Name	BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT	
II-5	Anschrift	Alfred-Nobel-Str. 50 40789 Monheim Deutschland	
II-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE	
II-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE	
II-8	Telefonnr	02143029033	
II-9	Telefaxnr	02143053482	
III-1	Anmelder und/oder Erfinder		
III-1-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder	
III-1-2	Anmelder für	Nur US	
III-1-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	DUNKEL, Ralf	9/11 Rue Pierre Dupont
III-1-5	Anschrift	~~Kriecherstr. 22~~ ~~40789 Monheim~~ ~~Deutschland~~	69001 Lyon Frankreich
III-1-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE	
III-1-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE FR	

III-2	Anmelder und/oder Erfinder	
III-2-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-2-2	Anmelder für	Nur US
III-2-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	ELBE, Hans-Ludwig
III-2-5	Anschrift	Dasnöckel 59 42329 Wuppertal Deutschland
III-2-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-2-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-3	Anmelder und/oder Erfinder	
III-3-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-3-2	Anmelder für	Nur US
III-3-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	RIECK, Heiko
III-3-5	Anschrift	~~9, rue Claude Monet~~ 29 Allée Buffon 69110 Ste. Foy-lès-Lyon Frankreich
III-3-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-3-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	FR
III-4	Anmelder und/oder Erfinder	
III-4-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-4-2	Anmelder für	Nur US
III-4-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	HARTMANN, Benoit
III-4-5	Anschrift	Färberstr. 1 40764 Langenfeld Deutschland
III-4-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	FR
III-4-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-5	Anmelder und/oder Erfinder	
III-5-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-5-2	Anmelder für	Nur US
III-5-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	GREUL, Jörg, Nico
III-5-5	Anschrift	Am Sardberg 30a 42799 Leichlingen Deutschland
III-5-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-5-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

III-6	Anmelder und/oder Erfinder	
III-6-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-6-2	Anmelder für	Nur US
III-6-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike
III-6-5	Anschrift	Oberer Markenweg 85 56566 Neuwied Deutschland
III-6-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-6-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-7	Anmelder und/oder Erfinder	
III-7-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-7-2	Anmelder für	Nur US
III-7-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	DAHMEN, Peter
III-7-5	Anschrift	Altebrücker Str. 61 41470 Neuss Deutschland
III-7-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-7-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-8	Anmelder und/oder Erfinder	
III-8-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-8-2	Anmelder für	Nur US
III-8-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	KUCK, Karl-Heinz
III-8-5	Anschrift	Pastor-Löh-Str. 30 a 40764 Langenfeld Deutschland
III-8-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	DE
III-8-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE
III-9	Anmelder und/oder Erfinder	
III-9-1	Diese Person ist	Anmelder und Erfinder
III-9-2	Anmelder für	Nur US
III-9-4	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	SUTY-HEINZE, Anne
III-9-5	Anschrift	Schlieper Str. 29 40764 Langenfeld Deutschland
III-9-6	Staatsangehörigkeit (Staat)	FR
III-9-7	Sitz/Wohnsitz (Staat)	DE

IV-1	Anwalt oder gemeinsamer Vertreter, oder besondere Zustellanschrift Die unten bezeichnete Person ist/wird hiermit bestellt, um den (die) Anmelder vor den internationalen Behörden zu vertreten, und zwar als	gemeinsamer Vertreter
IV-1-1	Name	BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT
IV-1-2	Anschrift	Law and Patents, Patents and Licensing 51368 Leverkusen Deutschland
IV-1-3	Telefonnr	02143071166
IV-1-4	Telefaxnr	02143053482
V	BESTIMMUNGEN	
V-1	Die Einreichung dieses Antrags umfaßt gemäß Regel 4.9 Absatz a die Bestimmung aller Vertragsstaaten, für die der PCT am internationalen Anmeldedatum verbindlich ist, und, insoweit verfügbar, für jede Art von Schutzrecht und sowohl für ein regionales als auch für ein nationales Patent	
VI-1	Priorität einer früheren nationalen Anmeldung beansprucht	
VI-1-1	Anmeldedatum	18. Dezember 2003 (18.12.2003)
VI-1-2	Nummer	10359511.2
VI-1-3	Staat	DE
VI-2	Priorität einer früheren nationalen Anmeldung beansprucht	
VI-2-1	Anmeldedatum	28. Januar 2004 (28.01.2004)
VI-2-2	Nummer	102004004141.5
VI-2-3	Staat	DE
VI-3	Priorität einer früheren nationalen Anmeldung beansprucht	
VI-3-1	Anmeldedatum	04. Februar 2004 (04.02.2004)
VI-3-2	Nummer	102004005317.0
VI-3-3	Staat	DE
VII-1	Gewählte Internationale Recherchenbehörde	Europäisches Patentamt (EPA) (ISA/EP)

140
140

VIII	Erklärungen	Anzahl der Erklärungen	
VIII-1	Erklärung hinsichtlich der Identität des Erfinders	-	
VIII-2	Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, ein Patent zu beantragen und zu erhalten	-	
VIII-3	Erklärung hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, zum Zeitpunkt des internationalen Anmeldedatums, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen	-	
VIII-4	Erfindererklärung (nur im Hinblick auf die Bestimmung der Vereinigten Staaten von Amerika)	-	
VIII-5	Erklärung hinsichtlich unschädlicher Offenbarungen oder Ausnahmen von der Neuheitsschadlichkeit	-	
IX	Kontrollliste	Anzahl der Blätter	Elektronische Datei(en) beigefügt
IX-1	Antrag (inklusive Erklärungsblätter)	6	✓
IX-2	Beschreibung	47	-
IX-3	Ansprüche	3	-
IX-4	Zusammenfassung	1	✓
IX-5	Zeichnung(en)	0	-
IX-7	INSGESAMT	57	
	Beigefugte Unterlagen	Unterlage(n) in Papierform beigefügt	Elektronische Datei(en) beigefügt
IX-8	Blatt für die Gebührenberechnung	✓	-
IX-9	Original einer gesonderten Vollmacht	✓	-
IX-13	Prioritätsbeleg(e)	Unterlage(n) VI-1 VI-2 VI-3	-
IX-17	PCT-SAFE Datenträger	-	✓
IX-19	Nr. der Abb. der Zeichn., die mit der Zusammenf. veröffentlicht werden soll		
IX-20	Sprache der int. Anmeldung	Deutsch	
X-1	Unterschrift des Anmelders, des Anwalts oder des Gemeinsamen Vertreters		
X-1-1	Name (FAMILIENNAME, Vorname)	BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT	
X-1-2	Name der unterzeichnenden Person	ppa. D. Krieg i.V. Dr. Nowak	
X-1-3	Eigenschaft		

24
141

VOM ANMELDEAMT AUSZUFÜLLEN

10-1	Datum des tatsächlichen Eingangs dieser internationalen Anmeldung	
10-2	Zeichnung(en)	
10-2-1	Eingegangen	
10-2-2	Nicht eingegangen	
10-3	Geändertes Eingangsdatum aufgrund nachträglich, jedoch fristgerecht eingeg. Unterlage(n) oder Zeichnung(en) zur Vervollständigung dieser int. Anmeldung	
10-4	Datum des fristgerechten Eingangs der Berichtigung nach PCT Artikel 11(2)	
10-5	Internationale Recherchenbehörde	ISA/EP
10-6	Übermittlung des Recherchenexemplars bis zur Zahlung der Recherchegebühr aufgeschoben	

VOM INTERNATIONALEN BÜRO AUSZUFÜLLEN

11-1	Datum des Eingangs des Aktenexemplars beim Internationalen Büro	
------	---	--

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/013834

A CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07D231/16 C07D409/12 C07D207/34 A01N43/10 A01N43/56
A01N43/36

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 C07D

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

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

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No
X	WO 03/010149 A1 (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, GERMANY) 6 February 2003 (2003-02-06) cited in the application page 2, lines 21-26; claims 1-20; examples 1-21, I-41, 1-44	1-8
X	WO 02/38542 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS A.-G., SWITZ.) 16 May 2002 (2002-05-16) cited in the application page 2, paragraph 4; claim 1; examples 2,3; tables 1,3,6	1-8
X	EP 0 737 682 A (MITSUI TOATSU CHEMICALS, INCORPORATED, JAPAN) 16 October 1996 (1996-10-16) examples 1 2, 1.166; tables 1,5	1-8
	----- -/--	

☒ 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.
- *&* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

13 April 2005

Date of mailing of the international search report

25/04/2005

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

Schuemacher, A

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP2004/013834

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 03010149	A1	06-02-2003	DE 10136065 A1 BR 0211482 A CN 1533380 A EP 1414803 A1 HU 0401478 A2 JP 2005501044 T MX PA04000622 A US 2004204470 A1	13-02-2003 17-08-2004 29-09-2004 06-05-2004 29-11-2004 13-01-2005 20-04-2004 14-10-2004
WO 0238542	A1	16-05-2002	AU 2366802 A BR 0115200 A CA 2426033 A1 CN 1484637 A EG 23122 A EP 1341757 A1 HU 0302471 A2 JP 2004513163 T PL 362930 A1 ZA 200303012 A	21-05-2002 17-02-2004 16-05-2002 24-03-2004 28-04-2004 10-09-2003 28-11-2003 30-04-2004 02-11-2004 20-05-2004
EP 0737682	A	16-10-1996	CA 2173788 A1 CN 1146993 A ,C DE 69618370 D1 DE 69618370 T2 EP 0737682 A1 ES 2169773 T3 JP 3164762 B2 JP 9235282 A JP 3385264 B2 JP 2001151770 A KR 201426 B1 US 5747518 A	12-10-1996 09-04-1997 14-02-2002 26-09-2002 16-10-1996 16-07-2002 08-05-2001 09-09-1997 10-03-2003 05-06-2001 15-06-1999 05-05-1998
WO 2004005242	A1	15-01-2004	DE 10229595 A1 AU 2003245975 A1 EP 1519913 A1	15-01-2004 23-01-2004 06-04-2005

144

144

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D231/16 C07D409/12 C07D207/34 A01N43/10 A01N43/56 A01N43/36

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

B. RESEARCHIERTE GEBIETE

Researchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 C07D

Researchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter das researchierte Gebiete fallen

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

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	WO 03/010149 A1 (BAYER AKTIENGESellschaft, GERMANY) 6. Februar 2003 (2003-02-06) in der Anmeldung erwähnt Seite 2, Zeilen 21-26; Ansprüche 1-20; Beispiele I-21, I-41, I-44	1-8
X	WO 02/38542 A1 (SYNGENTA PARTICIPATIONS A.-G., SWITZ.) 16. Mai 2002 (2002-05-16) in der Anmeldung erwähnt Seite 2, Absatz 4; Anspruch 1; Beispiele 2,3; Tabellen 1,3,6	1-8
X	EP 0 737 682 A (MITSUI TOATSU CHEMICALS, INCORPORATED, JAPAN) 16. Oktober 1996 (1996-10-16) Beispiele 1.2, 1.166; Tabellen 1,5	1-8
	-/--	

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen

A* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

E* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

L* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

O* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

P* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

T* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

X* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung: die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

Y* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung: die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

Z* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

13. April 2005

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

25/04/2005

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

Schuemacher, A

Formblatt PCT/ISA210 (Blatt 2) (Januar 2004)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/013834

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P,X	WO 2004/005242 A1 (BAYER CROPSCIENCE AG, GERMANY) 15. Januar 2004 (2004-01-15) in der Anmeldung erwähnt das ganze Dokument	1-8

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP2004/013834

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 03010149 A1	06-02-2003	DE 10136065 A1	13-02-2003
		BR 0211482 A	17-08-2004
		CN 1533380 A	29-09-2004
		EP 1414803 A1	06-05-2004
		HU 0401478 A2	29-11-2004
		JP 2005501044 T	13-01-2005
		MX PA04000622 A	20-04-2004
		US 2004204470 A1	14-10-2004
WO 0238542 A1	16-05-2002	AU 2366802 A	21-05-2002
		BR 0115200 A	17-02-2004
		CA 2426033 A1	16-05-2002
		CN 1484637 A	24-03-2004
		EG 23122 A	28-04-2004
		EP 1341757 A1	10-09-2003
		HU 0302471 A2	28-11-2003
		JP 2004513163 T	30-04-2004
		PL 362930 A1	02-11-2004
		ZA 200303012 A	20-05-2004
EP 0737682 A	16-10-1996	CA 2173788 A1	12-10-1996
		CN 1146993 A ,C	09-04-1997
		DE 69618370 D1	14-02-2002
		DE 69618370 T2	26-09-2002
		EP 0737682 A1	16-10-1996
		ES 2169773 T3	16-07-2002
		JP 3164762 B2	08-05-2001
		JP 9235282 A	09-09-1997
		JP 3385264 B2	10-03-2003
		JP 2001151770 A	05-06-2001
		KR 201426 B1	15-06-1999
		US 5747518 A	05-05-1998
WO 2004005242 A1	15-01-2004	DE 10229595 A1	15-01-2004
		AU 2003245975 A1	23-01-2004
		EP 1519913 A1	06-04-2005

Extracto de P. Folio 146

Expediente No		06059312.	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.		
Observaciones: Arte Final.			

147 14A

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-059312- -00000-0000
Fes 2006-06-16 17 52.23 Dep 2020 NUECREACIONES
Tra 11 PATENTEIYI
Eve 378 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folio 6.148

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 42,205
LHA : JUNIO 5 DE 2006

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	55274899	05/06/2006	46,343,000.00

***** CONCEPTO *****

NT. RENTISTICO	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 : 

060 13549-891-071-5

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT

PATENTE DE INVENCION



MODELO DE UTILIDAD []

- ♦ Indicación de que se solicita la concesión de una patente []
- ♦ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ♦ Descripción de la invención []
- ♦ Dibujos de ser estos pertinentes []
- ♦ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

DISEÑO INDUSTRIAL []

- ♦ Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial []
- ♦ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ♦ Representación gráfica 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 un Esquema de Trazado []
- ♦ Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud []
- ♦ Representación gráfica del esquema trazado []
- ♦ Comprobante de pago de las tasas establecidas []

COMPLETA []

INCOMPLETA []

Firma Responsable

Fecha 16 JUN. 2006

Carrera 13 No. 27-00 Piso 5, 7 y 10
Conmutador: 3 82 08 40
Fax 350 52 20
E-mail: info@sic.gov.co
www.sic.gov.co
Bogotá, D C , Colombia

149 280

11-1

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

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

REFERENCIA	Radicación No.	6 59312
	Solicitud internacional	EP2004/013834
	Fecha inicio fase nacional	18/07/2006
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	8071

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No.10 de 2001.

ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de
fecha 20 JUL 2006
adpall

.. 1

..



280706