Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD

PATENTE DE INVENCIÓN

21. **EXPEDIENTE No.** 06-77161

54. **TÍTULO** DERIVADOS DE N-(2-(HIDROXIMETIL)FENIL)-1H-PIRAZOL-4-CARBOXAMIDA Y COMPUESTOS EMPARENTADOS COMO PRODUCTOS ACTIVOS MICROBICIDAS PARA EL EMPLEO EN LA PROTECCION DE LAS PLANTAS Y DE LOS MATERIALES

51. **CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL**

71. **SOLICITANTE** BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT

DOMICILIO MONHEIM, REPUBLICA FEDERAL DE ALEMANIA

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

22. **BOGOTÁ, D. C.,** 05-01-2006

(FORMA P-10)

90971 -Imprenta nacional de Colombia- 2004

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-077161- -00000-0000
Fec 2006-08-04 16:03:42 Dep 2020 NUECREACIONES1
Tra 11 PATENTEIVII
Bre 376 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folios 240

FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL

1 SOLICITUD DE:

☒ 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 República Federal de Alemania

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

Domicilio 40789 Monheim
República Federal de Alemania

IDENTIFICACIÓN

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

3 REPRESENTANTE O APODERADO

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

IDENTIFICACIÓN

C.C. ☒ NIT ☐
C.E ☐ Otro ☐
Cual ____
Número 438.019 T.P 31 929

4 INVENTOR (ES) (72)

1. **Ralf DUNKEL**
   9/11 Pierre Dupont
   69001 lyon
   Francia
2. **Hans-ludwig ELBE**
   Dasnockel 59,
   42329 Wuppertal
   República Federal de Alemania
3. **Benoit HARTMANN**
   Farberstrasse 1,
   40764 Langenfeld,
   República Federal de Alemania
4. **Jörg Nico GREUL**
   Am Sandberg 30 a,
   42799 Leichlingen,
   República Federal de Alemania
5. **Stefan HERRMANN**
   Vimeburgstrasse 4 a,
   40764 Langenfeld,
   República Federal de Alemania
6. **Ulrike WACHENDORFF-NEUMANN**
   Oberer Markenweg 85,
   56566 Neuwied,
   República Federal de Alemania
7. **Peter DAHMEN**
   Altebruckerstrasse 61,
   41470 Neuss
   República Federal de Alemania
8. **Karl-Heinz KUCK**
   Pastor-Loh Strasse 30 a,
   40764 Langenfeld
   República Federal de Alemania

5 PCT (86)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2005/000633 Fecha: 22 de enero de 2005
Publicación Internacional No. WO 2005/074686 A1 Fecha: 18 de agosto de 2005

(6) **TÍTULO (54)**

DERIVADOS DE N-(2-(HIDROXIMETIL)FENIL)-1H-PIRAZOL-4-CARBOXAMIDA Y COMPUESTOS EMPARENTADOS COMO PRODUCTOS ACTIVOS MICROBICIDAS PARA EL EMPLEO EN LA PROTECCIÓN DE LAS PLANTAS Y DE LOS MATERIALES.

(7) **Clasificación Internacional (51)** A01N 43/56

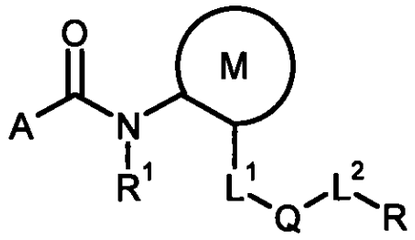
(8) **Prioridad** SI☒ NO☐	(33) País de Origen	(32) Fecha	(31) Número de Solicitud
	DE	6 de febrero de 2004	102004005787.7

(9) **Comprobante de pago No.:** 06-51.927 **Fecha:** 10 de julio de 2006

(10) **Anexos:**

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud por $ 463 000 oo
- ☐ Comprobante de pago por reivindicación de prioridad
- ☒ Documento que acredita la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica
- ☒ Poderes, si fuere el caso.
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante
- ☐ Declaraciones
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar efectuado por la IPEA.
- ☐ Traducción del examen preliminar efectuado por la IPEA
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas.
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico.
- ☒ Arte final 12x12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud.
- ☒ Otros: VER HOJA DE DOCUMENTOS 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

NNJ

DOCUMENTOS ANEXOS

1. ☒ Publicación Internacional WO 2005/074686 A1

   Descripción:

   Páginas 92 en el idioma original

   Páginas 136 en español

   Reivindicaciones: Número (9)

   Figuras: Número (s)

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

3. ☒ Extracto de publicación.

NO SE REALIZARON MODIFICACIONES EN LA FASE INTERNACIONAL

CAVELIER
ABOGADOS
EDIFICIO SISKI
CARRERA 4a N° 72-35
BOGOTA, 8 - COLOMBIA

179

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

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

REPRESENTACION Y PODER

REPRESENTATION AND POWER- OF- ATTORNEY

13549
10966

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

domiciliado (s) en/of Alfred-Nobel-Str. 50,
40789 Monheim, Germany, hereby ratify the patent application No. 03.005.574 filed by Emilio FERRERO on January 28, 2003 and

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

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

DE BOGOTA, HACE CONSTAR QUE LA FIRMA QUE APARECE AL REVERSO
QUEDÓ IMPRESA EN SU PRESENCIA
27 JUL 2006

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,

© CAVELIER ABOGADOS

-istrativo, 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

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

21 JUL 2006

PABLO [illegible] DE BARAJAS

TENTICACION 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 - The Notary Public
(Firma-sello) (Signature-seal)

DIRK HEIDERHOFF
NOTAR IN LEVERKUSEN

COMO NOTARIO SEXTO (6) DEL CIRCULO DE BOGOTÁ, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA

21 JUL 2006

PABLO MEJORADA RAJAS
NOTARIO

8

URNr. 242/2003

Ich beglaubige die vor mir vollzogenen Unterschriften :

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

2. des Herrn Dr. Axel Bader, geschäftsansässig in D 51368 Leverkusen, Bayerwerk, Germany,

- persönlich bekannt -.

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

Leverkusen, den 12. Februar 2003

Notar

COMO NOTARIO SEXTO (E) DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE ME TENIDO A LA VISTA
21 JUL 2006
NOTARIO

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
5. in Köln 6. am 17. FEB 2003
7. durch den Vizepräsidenten des Landgerichts Köln
8. unter Nr 482/03
9. Stempel/Siegel:
10. Unterschrift. Caliebe

Der Präsident des Landgerichts Köln 6

COMO NOTARIO SEXTO (E) DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
21 JUL 2006
PABLO MENDEZ CARVAJAS
NOTARIO

10.-
10.-
Geb § 100 Eur 13.-
528
33,28

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*

COMO NOTARIO (E) DEL CIRCULO DE BOGOTA HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA CORRESPONDE CON EL ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
21 JUL 2006
[illegible] BARAJAS

(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 Z.
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAÑOL - INGLES – INGLES - ESPAÑOL
RES. 0001 DE ENERO 4 DE 19991
MINISTERIO DE JUSTICIA

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

Firma Ilegible
Notario Público *Sello*

Se anexa autenticación notarial en alemán de las firmas anteriores.

Respaldo:

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

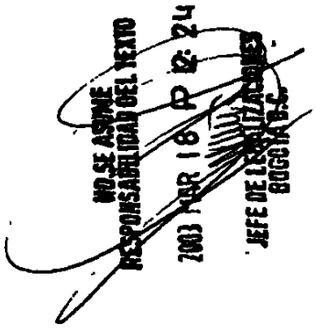
Es traducción fiel y completa de la cual se deja copia en esta oficina para su confrontación.

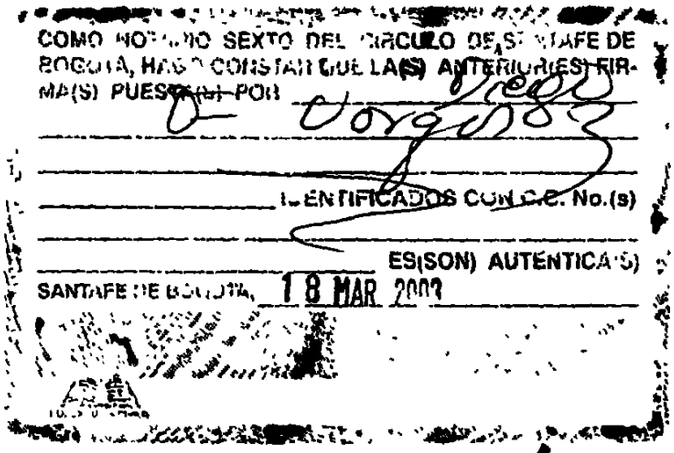
DVZ/ID-4268/WPCL002G/COLO 13549-841-002-0

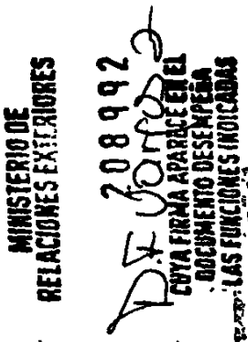
DIEGO F. VARGAS
TRADUCTOR E INTERPRETE OFICIAL
ESPAÑOL - INGLES – INGLES - ESPAÑOL
RES 0001 DE ENERO 4 DE 1999
MINISTERIO DE JUSTICIA

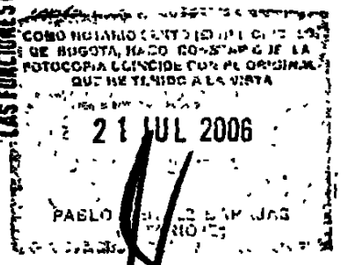
COMO NUEVO (2) DEL DIPLOMA
DE BOGOTA D.C. COTEJAR CON LA
FOTOCOPIA QUE PRESENTO CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA

21 JUL 2006


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


COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE
BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) ANTERIOR(ES) FIR-
MA(S) PUESTA(S) POR
IDENTIFICADOS CON C.C. No.(s)
ES(SON) AUTENTICA(S)
SANTAFE DE BOGOTA, 18 MAR 2003


MINISTERIO DE
RELACIONES EXTERIORES
208992
CUYA FIRMA APARECE EN EL
DOCUMENTO DESEMPEÑA
LAS FUNCIONES INDICADAS


COMO NOTARIO (ENCARGADO) DEL CIRCULO
DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL
QUE HE TENIDO A LA VISTA
21 JUL 2006
PABLO



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.-

---

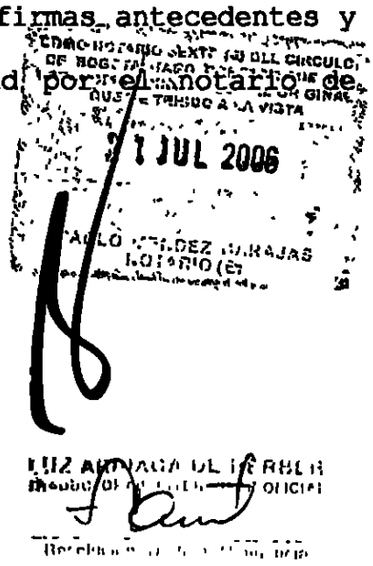
Traducción de los sellos y autenticaciones que aparecen en el documento de representación y poder, escrito en español e inglés, por medio del cual la firma Bayer CropScience AG, domiciliada en Alfred-Nobel-Str. 50, D 40789 Monheim, Alemania, otorga poder a EMILIO FERRERO, tpa. 31929; GONZALO PERDOMO,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

Fdo.: firma ilegible

Sello redondo en tinta:

Dirk Heiderhoff, notario de Leverkusen



LUZ ARRIAGA DE HERBER

Protocolo notarial 242/2003

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

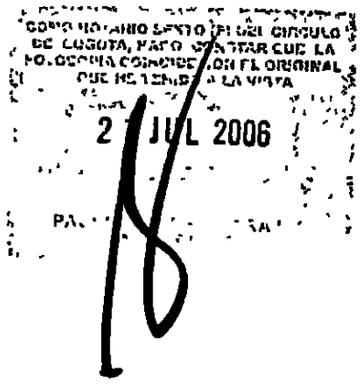
1. Dr. Ralf-Rüdiger Jesse, con domicilio comercial en D-51368, Bayerwerk, Alemania,
2. Dr. Axel Bader, con domicilio comercial en D-51368, Bayerwerk, Alemania,

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,-



13

Derechos Art. 58	EUROS 10,-
Derechos Art. 150	Euros 13,-
IVA	EUROS 5,28
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 e

   Leverkusen

Certificado

5. en Colonia 6. El 17 de febrero 2003

7 por el Vicepresidente del Tribunal Regional de Colonia

8. bajo el No 482/03

9. Sello 10. Firma

El Presidente del Fdo. firma ilegible

Tribunal Regional de Colonia Caliebe

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

Bogotá, 14 de marzo 2003.

COMO NOTARIO SEXTO DEL CIRCULO DE SANTAFE DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA(S) FIRMA(S) PUESTA(S) POR

IDENTIFICADO(S) CON C.C. No.(s)

ES(SON) AUTENTICO(S)

SANTAFE DE BOGOTA, 18 MAR 2003

NO SE ASUME RESPONSABILIDAD DEL TEXTO

MAR 18 P 12:24

JEFE DE LEGALIZACIONES BOGOTA D.C.

MINISTERIO DE RELACIONES EXTERIORES

208993

ESTA FIRMA APARECE EN EL DOCUMENTO DESEMPEÑA LAS FUNCIONES INDICADAS

COMO NOTARIO SEXTO(6) DEL CIRCULO DE BOGOTA, HAGO CONSTAR QUE LA FOTOCOPIA COINCIDE CON EL ORIGINAL QUE FUE TENIDO A LA VISTA

21 JUL 2006

EL SECRETARIO

14

BCS 03-3097

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

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
18. August 2005 (18.08.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/074686 A1

not. JS

(51) Internationale Patentklassifikation[7]: A01N 43/56, C07D 231/16, 231/14

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/000633

(22) Internationales Anmeldedatum: 22. Januar 2005 (22.01.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
102004005787.7 6 Februar 2004 (06.02.2004) DE

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

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder *(nur für US)*: DUNKEL, Ralf [DE/DE]; Krischer Str. 22, 40789 Monheim (DE). ELBE, Hans-Ludwig [DE/DE]; Dasnöckel 59, 42329 Wuppertal (DE). HARTMANN, Benoit [FR/DE]; Färberstr. 1, 40764 Langenfeld (DE). GREUL, Jörg, Nico [DE/DE]; Am Sandberg 30 a, 42799 Leichlingen (DE). HERRMANN, Stefan [DE/DE], Vimeburgstr 4 a, 40764 Langenfeld (DE). WACHENDORFF-NEUMANN, Ulrike [DE/DE]; Oberer Markenweg 85, 56566 Neuwied (DE). DAHMEN, Peter [DE/DE], Altebruckerstr. 61, 41470 Neuss (DE). KUCK, Karl-Heinz [DE/DE], Pastor-Löh-Str 30 a, 40764 Langenfeld (DE)

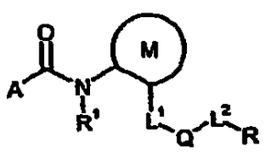
(74) Gemeinsamer Vertreter: BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT; Business Planning and Administration, Law and Patents, Patents and Licensing, 51368 Leverkusen (DE).

(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,

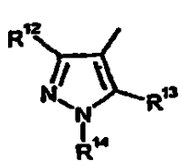
[Fortsetzung auf der nachsten Seite]

(54) Title: N-(2-(HYDROXYMETHYL) PHENYL)-1H-PYRAZOLE-4-CARBOXAMIDE DERIVATIVES AND RELATED COMPOUNDS AS MICROBICIDAL ACTIVE INGREDIENTS FOR PHYTO-PROTECTION AND THE PROTECTION OF MATERIALS

(54) Bezeichnung: N-(2- (HYDROXYMETHYL) PHENYL) -1H-PYRAZOL-4-CORBOXAMID DERIVATE UND VERWANDTE VERBINDUNGEN ALS MIKROBIZIDE WIRKSTOFFE ZUR ANWENDUNG IM PFLANZEN- UND MATERIALSHUTS



(I)



(A1)

(57) Abstract: The invention relates to novel carboxamides of formula (I), in which M represents a phenyl ring, pyridine ring or pyrimidine, pyridazine or pyrazine ring, respectively monosubstituted by R^5, or represents a thiazole ring substituted by R^{5-A}, R^5 represents hydrogen, fluorine, chlorine, methyl, isopropyl, methylthio or trifluoromethyl; R^5 can also represent methoxy; R^{5-A} represents hydrogen, methyl, methylthio or trifluoromethyl, L^1 represents C_1-C_{10} alkene (alkanediyl), Q represents O, S, SO, SO_2 or NR^9, L^2 represents a direct bond, $SiR^{10}R^{11}$ or CO, R represents hydrogen, C_1-C_8 alkyl, C_1-C_8 alkoxy, C_1-C_4 alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4 alkylthio-C_1- C_4-alkyl, C_2-C_8 alkenyl, C_2-C_8 alkynyl, C_1-C_6 haloalkyl, C_2-C_6- haloalkenyl, C_2-C_6 haloalkynyl or C_3-C_6 cycloalkyl; A represents the group of formula (AI), the remaining substituents are defined in claim 1. The inventive substances have a powerful microbicidal action and can be used to control undesirable micro-organisms such as fungi and bacteria in the phyto-protection and material protection fields.

(57) Zusammenfassung: Neue Carboxamide der Formel (1), in welcher M für einen jeweils einfach durch R^5 substituierten Phenyl-, Pyridin- oder Pyrimidin-, Pyridazin oder Pyrazin-Ring oder für einen durch R^{5-A} substituierten Thiazol-Ring steht, R^5für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht, R^5 ausserdem für Methoxy steht, R^{5-A} für Wasserstoff, Methyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht, L^1 für C_1-C_{10}-Alkylen (Alkandiyl) steht, Q für O, S, SO, SO_2 oder NR^9 steht, L^2 für eine direkte Bindung, $SiR^{10}R^{11}$ oder CO steht, R für Wasserstoff, C_1-C_8 Alkyl, C_1-C_8-Alkoxy,C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_4 Alkylthio-C_1 C_4-alkyl, C_2-C_8-Alkenyl, C_2-C_8-Alkinyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_2-C_6- Halogenalkenyl, C_2-C_6-Halogenalkinyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl steht, A für den Rest der Formel (A 1) steht. Die anderen Substituenten sind in Anspruch 1 definiert, Die erfindungsgemässen Stoffe weisen eine starke mikrobizide Wirkung auf und können zur Bekämpfung von unerwünschten Mikroorganismen, wie Pilzen und Bakterien, im Pflanzenschutz und im Materialschutz eingesetzt werden.

WO 2005/074686 A1

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

(84) **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*

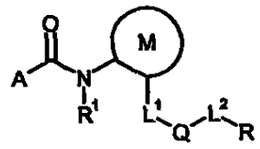
Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen

N-(2-(HYDROXYMETHYL)PHENYL)-1H-PYRAZOL-4-CARBOXAMID DERIVATE UND VERWANDTE VERBINDUNGEN ALS MIKROBIZIDE WIRKSTOFFE ZUR ANWENDUNG IM PFLANZEN- UND MATERIALSCHUTZ

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

Es ist bereits bekannt, dass zahlreiche Carboxamide fungizide Eigenschaften besitzen (vgl. z.B. WO 03/010149, WO 02/059086, EP-A 0 824 099, EP-A 0 737 682, EP-A 0 591 699, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099, DE-A 24 09 011, DE-A 20 06 472, JP-A 2001-302605, JP-A 10-251240, JP-A 8-176112, JP-A 8-92223 und JP-A 53-72823). So sind bereits zahlreiche Alkylcarboxamide bekannt geworden, die im Alkylteil nicht substituiert sind, wie beispielsweise N-Allyl-N-[2-(1,3-dimethylbutyl)phenyl]-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid aus WO 02/059086, N-[2-(1,3-Dimethylbutyl)phenyl]-2,4-dimethyl-1,3-thiazol-5-carboxamid aus EP-A 0 824 099 und 5-Fluor-1,3-dimethyl-N-[2-(1,3,3-trimethylbutyl)phenyl]-1H-pyrazol-4-carboxamid aus WO 03/010149. Die Wirksamkeit dieser Stoffe ist gut, lässt aber in manchen Fällen, z.B. bei niedrigen Aufwandmengen zu wünschen übrig.

Es wurden nun neue Carboxamide der Formel (I)



(I)

gefunden, in welcher

R^1 für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_1-C_6-Alkylsulfinyl, C_1-C_6-Alkylsulfonyl, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Cycloalkyl; C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkylthio, C_1-C_4-Halogenalkylsulfinyl, C_1-C_4-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkyl)carbonyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl; Halogen-(C_1-C_3-alkyl)carbonyl-C_1-C_3-alkyl, Halogen-(C_1-C_3-alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
(C_1-C_8-Alkyl)carbonyl, (C_1-C_8-Alkoxy)carbonyl, (C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl)carbonyl, (C_3-C_8-Cycloalkyl)carbonyl; (C_1-C_6-Halogenalkyl)carbonyl, (C_1-C_6-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl)carbonyl, (C_3-C_8-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$ steht,

R^2 für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_1-C_8-Alkoxy, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Cycloalkyl; C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R^3 und R^4 unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Cycloalkyl; C_1-C_8-Halogenalkyl, Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Halogen-

cycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R^3 und R^4 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1-C_4-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann,

R^5 und R^6 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_3-C_8-Cycloalkyl; C_1-C_8-Halogenalkyl, C_3-C_8-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R^5 und R^6 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1-C_4-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann,

R^7 für Wasserstoff oder C_1-C_6-Alkyl steht,

M für einen jeweils einfach durch R^8 substituierten Phenyl-, Pyridin- oder Pyrimidin-, Pyridazin oder Pyrazin-Ring oder für einen durch R^{8-A} substituierten Thiazol-Ring steht,

R^8 für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

R^8 außerdem für Methoxy steht,

R^{8-A} für Wasserstoff, Methyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

L^1 für C_1-C_{10}-Alkylen (Alkandiyl) steht,

Q für O, S, SO, SO_2 oder NR^9 steht,

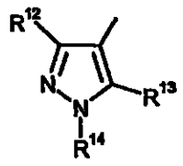
L^2 für eine direkte Bindung, $SiR^{10}R^{11}$ oder CO steht,

R für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_1-C_8-Alkoxy, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Alkylthio-C_1-C_4-alkyl, C_2-C_8-Alkenyl, C_2-C_8-Alkinyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_2-C_6-Halogenalkenyl, C_2-C_6-Halogenalkinyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl steht,

R^9 für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Alkylthio-C_1-C_4-alkyl, C_2-C_8-Alkenyl, C_2-C_8-Alkinyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_2-C_6-Halogenalkenyl, C_2-C_6-Halogenalkinyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl steht,

R^{10} und R^{11} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_1-C_8-Alkoxy, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Alkylthio-C_1-C_4-alkyl oder C_1-C_6-Halogenalkyl stehen,

A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht, in welcher

R^{12} für Wasserstoff, Cyano, Halogen, Nitro, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, C_3-C_6-Cycloalkyl, C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkoxy oder C_1-C_4-Halo-

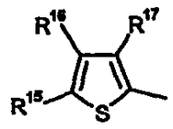
genalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, Aminocarbonyl oder Aminocarbonyl-C_1-C_4-alkyl steht,

R^{13} für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy oder C_1-C_4-Alkylthio steht,

R^{14} für Wasserstoff, C_1-C_4-Alkyl, Hydroxy-C_1-C_4-alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, C_1-C_4-Alkylthio-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkylthio-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Halogenalkoxy-C_1-C_4-alkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, oder Phenyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A2)



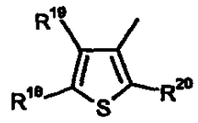
(A2) steht, in welcher

R^{15} und R^{16} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{17} für Halogen, Cyano oder C_1-C_4-Alkyl, oder C_1-C_4-Halogenalkyl oder C_1-C_4-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A3)



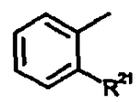
(A3) steht, in welcher

R^{18} und R^{19} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{20} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)

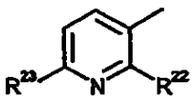


(A4) steht, in welcher

R^{21} für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkoxy oder C_1-C_4-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)



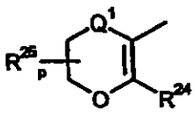
(A5) steht, in welcher

R^{22} für Halogen, Hydroxy, Cyano, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkylthio oder C_1-C_4-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{23} für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, C_1-C_4-Alkylsulphinyl oder C_1-C_4-Alkylsulphonyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A6)



(A6) steht, in welcher

R^{24} für C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

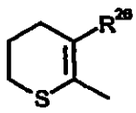
R^{25} für C_1-C_4-Alkyl steht,

Q^1 für S (Schwefel), SO, SO_2 oder CH_2 steht,

p für 0, 1 oder 2, wobei R^{25} für identische oder verschiedene Reste steht, wenn p für 2 steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)

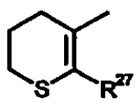


(A7) steht, in welcher

R^{26} für C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A8)

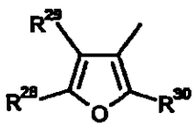


(A8) steht, in welcher

R^{27} für C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A9)



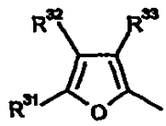
(A9) steht, in welcher

R^{28} und R^{29} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen,

R^{30} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)



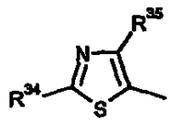
(A10) steht, in welcher

R^{31} und R^{32} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, Nitro, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl having 1 bis 5 Halogenatomen stehen,

R^{33} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



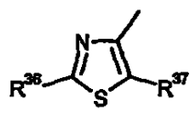
(A11) steht, in welcher

R^{34} für Wasserstoff, Halogen, Amino, C_1-C_4-Alkylamino, Di-(C_1-C_4-alkyl)amino, Cyano, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{35} für Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A12)



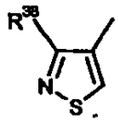
(A12) steht, in welcher

R^{36} für Wasserstoff, Halogen, Amino, C_1-C_4-Alkylamino, Di-(C_1-C_4-alkyl)amino, Cyano, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{37} für Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A13)

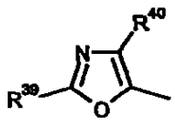


(A13) steht, in welcher

R^{38} für Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A14)



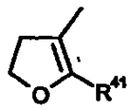
(A14) steht, in welcher

R^{39} für Wasserstoff oder C_1-C_6-Alkyl steht,

R^{40} für Halogen oder C_1-C_6-Alkyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A15)

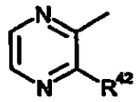


(A15) steht, in welcher

R^{41} für C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A16)

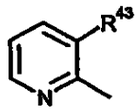


(A16) steht, in welcher

R^{42} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A17)

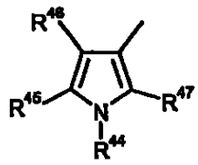


(A17) steht, in welcher

R^{43} für Halogen, Hydroxy, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_6-Alkylthio, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkylthio oder C_1-C_6-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A18)



(A18) steht, in welcher

R^{44} für Wasserstoff, Cyano, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen, C_1-C_6-Alkoxy-C_1-C_6-alkyl, Hydroxy-C_1-C_6-alkyl, C_1-C_6-Alkylsulfonyl, Di(C_1-C_6-alkyl)aminosulfonyl, C_1-C_6-Alkylcarbonyl oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylsulfonyl oder Benzoyl steht,

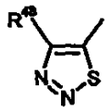
R^{45} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{46} für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{47} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A19)



(A19) steht, in welcher

R^{48} für C_1-C_4-Alkyl steht,

wobei R nicht für Alkoxy steht, wenn L^2 für eine direkte Bindung steht.

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

(a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)



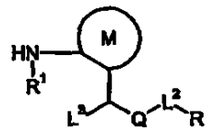
(II)

in welcher

A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X^1 für Halogen oder Hydroxy steht,

mit Anilin-Derivaten der Formel (III)



(III)

in welcher

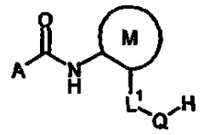
R^1, M, Q, L^2 und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,

L^3 für Wasserstoff oder C_1-C_5-Alkyl steht,

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

oder

(b) Carboxamide der Formel (IV)



(IV)

in welcher M, L^1, Q und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit einer Verbindung der Formel (V)



(V)

in welcher

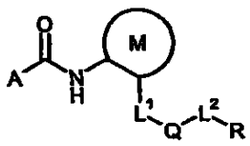
L^2 und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,

Y für Halogen, Triflat (Trifluormethylsulfonyl), Mesylat (Methylsulfonyl) oder Tosylat (4-Methylphenylsulfonyl) steht,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

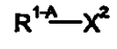
(c) Carboxamide der Formel (I-a)



(I-a)

in welcher M, L^1, Q, L^2, R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogeniden der Formel (VI)



(VI)

in welcher

X^2 für Chlor, Brom oder Iod steht,

R^{1-A} für C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkylsulfinyl, C_1-C_6-Alkylsulfonyl, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Cycloalkyl; C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkylthio, C_1-C_4-Halogenalkylsulfinyl, C_1-C_4-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkyl)carbonyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl; Halogen-(C_1-C_3-alkyl)carbonyl-C_1-C_3-alkyl, Halogen-(C_1-C_3-alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C_1-C_8-Alkyl)carbonyl, (C_1-C_8-Alkoxy)carbonyl, (C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl)carbonyl, (C_3-C_8-Cycloalkyl)carbonyl; (C_1-C_6-Halogenalkyl)carbonyl, (C_1-C_6-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl)carbonyl, (C_3-C_8-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$ steht,

wobei R^2, R^3, R^4, R^5 und R^6 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Schließlich wurde gefunden, dass die neuen Carboxamide der Formel (I) sehr gute mikrobizide Eigenschaften besitzen und zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen sowohl im Pflan-

zenschutz als auch im Materialschutz verwendbar sind.

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

Die erfindungsgemäßen Carboxamide sind durch die Formel (I) allgemein definiert. Bevorzugte Restedefinitionen der vorstehenden und nachfolgend genannten Formeln sind im Folgenden angegeben. Diese Definitionen gelten für die Endprodukte der Formel (I) wie für alle Zwischenprodukte gleichermaßen.

R^1 steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkylsulfinyl, C_1-C_6-Alkylsulfonyl, C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl; C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkylthio, C_1-C_4-Halogenalkylsulfinyl, C_1-C_4-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C_1-C_3-alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_6-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkyl)carbonyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl; Halogen-(C_1-C_3-alkyl)carbonyl-C_1-C_3-alkyl, Halogen-(C_1-C_3-alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
(C_1-C_6-Alkyl)carbonyl, (C_1-C_4-Alkoxy)carbonyl, (C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl)carbonyl, (C_3-C_6-Cycloalkyl)carbonyl; (C_1-C_4-Halogenalkyl)carbonyl, (C_1-C_4-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C_1-C_3-alkoxy-C_1-C_3-alkyl)carbonyl, (C_3-C_6-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$.

R^1 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO-CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO-CF_3$, $-CH_2-CO-CCl_3$, $-CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CCl_3$,

$-CH_2-CO_2CH_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CF_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CCl_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CF_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CCl_2CCl_3$; Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluormethylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$.

R^1 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Methoxymethyl, Formyl, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-C(=O)CHO$, $-C(=O)C(=O)CH_3$, $-C(=O)C(=O)CH_2OCH_3$, $-C(=O)CO_2CH_3$, $-C(=O)CO_2CH_2CH_3$.

R^2 steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl; C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkoxy, Halogen-C_1-C_3-alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_6-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R^2 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, tert-Butoxy, Methoxymethyl, Cyclopropyl; Trifluormethyl, Trifluormethoxy.

R^3 und R^4 stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl; C_1-C_4-Halogenalkyl, Halogen-C_1-C_3-alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_6-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R^3 und R^4 bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1-C_4-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann.

R^3 und R^4 stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl.

R^3 und R^4 bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R^7 substituiert sein kann.

R^5 und R^6 stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl; C_1-C_4-Halogenalkyl, C_3-C_6-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R^5 und R^6 bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1-C_4-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann.

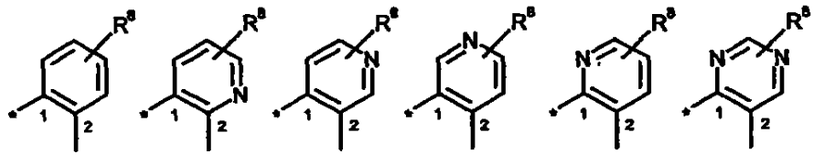
R^5 und R^6 stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl; Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Trifluormethoxymethyl.

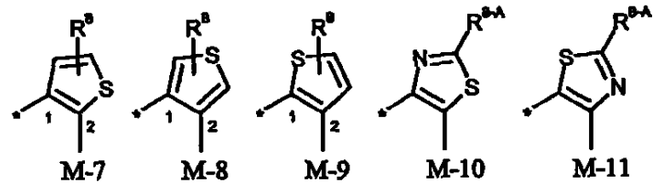
R^5 und R^6 bilden außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituierten gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Thiomorpholin oder Piperazin, wobei das Piperazin am zweiten Stickstoffatom durch R^7 substituiert sein kann.

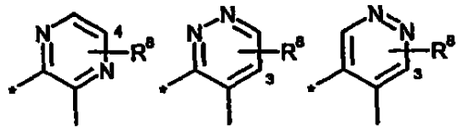
R^7 steht bevorzugt für Wasserstoff oder C_1-C_4-Alkyl.

R^7 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl.

M steht bevorzugt für einen der folgenden Cyclen







wobei die mit „*" markierte Bindung mit dem Amid verknüpft ist.

M steht besonders bevorzugt für einen Cyclus ausgewählt aus M-1, M-2, M-3, M-6, M-7, M-10 oder M-11.

M steht außerdem besonders bevorzugt für eine Cyclus ausgewählt aus M-1, M-2, M-3, M-4, M-5, M-6 oder M-10, M-11.

M steht ganz besonders bevorzugt für den Cyclus M-1.

M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-2.

M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-3.

M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-6.

M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-7.

M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-10.

M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für den Heterocyclus M-11.

R^8 steht bevorzugt für Wasserstoff.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-1 steht, außerdem bevorzugt für Fluor, wobei Fluor besonders bevorzugt in 4-, 5- oder 6-Position, ganz besonders bevorzugt in 4- oder 6-Position, insbesondere in 4-Position steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-1 steht, außerdem bevorzugt für Chlor, wobei Chlor besonders bevorzugt in 4- oder 6-Position steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-1 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position und außerdem besonders bevorzugt in 4-Position steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-1 steht, außerdem bevorzugt für Methoxy, wobei Methoxy besonders bevorzugt in 4-Position steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-1 steht, außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 4- oder 6-Position steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-2, M-3, M-4 oder M-5 steht, außerdem bevorzugt für Fluor, wobei Fluor besonders bevorzugt in 6-Position (M-2, M-3) oder in 3-Position (M-4, M-5) steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-2, M-3, M-4 oder M-5 steht, außerdem bevorzugt für Chlor, wobei Chlor besonders bevorzugt in 6-Position (M-2, M-3) oder in 3-Position (M-4, M-5) steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-2, M-3, M-4 oder M-5 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 4-Position (M-2) oder in 3-Position (M-3, M-4, M-5) steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-6 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-6 steht, außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-7, M-8 oder M-9 steht, außerdem bevorzugt für Chlor, wobei Chlor besonders bevorzugt in 5-Position (M-7, M-8) oder in 3-Position (M-9) steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-7, M-8 oder M-9 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 5-Position (M-7, M-8) oder in 3-Position (M-9) steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-12 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 4-Position steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-12 steht, außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 4-Position steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-13 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-13 steht, außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-14 steht, außerdem bevorzugt für Methyl, wobei Methyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.

R^8 steht für den Fall, dass M für M-14 steht, außerdem bevorzugt für Trifluormethyl, wobei Trifluormethyl besonders bevorzugt in 3-Position steht.

R^{8-A} steht bevorzugt für Wasserstoff.

R^{8-A} steht außerdem bevorzugt für Methyl.

R^{8-A} steht außerdem bevorzugt für Trifluormethyl.

L^1 steht bevorzugt für C_1-C_6-Alkylen (Alkandiyl).

L^1 steht besonders bevorzugt für $-CH_2-$, $-CH(CH_3)-$ oder $-(CH_2)_2C(CH_3)_2-$.

L^1 steht außerdem besonders bevorzugt für $-(CH_2)_2-$.

Q steht bevorzugt für O.

Q steht außerdem bevorzugt für S.

Q steht außerdem bevorzugt für SO.

Q steht außerdem bevorzugt für SO_2.

Q steht außerdem bevorzugt für NR^9, besonders bevorzugt für NH.

L^2 steht bevorzugt für eine direkte Bindung.

L^2 steht außerdem bevorzugt für $SiR^{10}R^{11}$.

L^2 steht außerdem bevorzugt für CO.

R steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_1-C_3-Alkylthio-C_1-C_3-alkyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl.

R steht außerdem bevorzugt für C_1-C_4-Halogenalkyl.

R steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, sec-, iso- oder tert-Butyl, Methoxy, Ethoxy, n- oder iso-Propoxy, n-, sec-, iso- oder tert-Butoxy, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl, Methylthioethyl, Ethylthioethyl oder Cyclopropyl.

R steht außerdem besonders bevorzugt für 1-Methylbutyl, C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- oder Bromatomen, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

R steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, iso- oder tert-Butyl, Methoxy, iso-Propoxy, iso- oder tert-Butoxy, Methoxymethyl oder Methylthiomethyl.

R steht außerdem ganz besonders bevorzugt für sec-Butyl, 1-Methylbutyl, Dichlormethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

R steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, iso- oder tert-Butyl, Methoxy, iso-Propoxy, iso- oder tert-Butoxy.

R steht außerdem insbesondere bevorzugt für sec-Butyl oder 1-Methylbutyl.

R^9 steht bevorzugt für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_1-C_3-Alkylthio-C_1-C_3-alkyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl.

R^9 steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, sec-, iso- oder tert-Butyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl, Methylthioethyl, Ethylthioethyl oder Cyclopropyl.

R^9 steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, iso- oder tert-Butyl, Methoxymethyl oder Methylthiomethyl.

R^9 steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.

R^{10} und R^{11} stehen unabhängig voneinander bevorzugt für C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl oder C_1-C_3-Alkylthio-C_1-C_3-alkyl.

R^{10} und R^{11} stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxyethyl, Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl, Methylthioethyl oder Ethylthioethyl.

R^{10} und R^{11} stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Methyl, Methoxy, Methoxymethyl oder Methylthiomethyl.

R^{10} und R^{11} stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Methyl.

A steht bevorzugt für einen der Reste A1, A2, A3, A4, A5, A6, A9, A10, A11, A12, A17 oder A18.

A steht besonders bevorzugt für einen der Reste

A1, A2, A4, A5, A6, A9, A11, A16, A17, A18.

A ganz besonders bevorzugt für den Rest A1.

A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A2.

A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A4.

A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A5.

A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A6.

A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A9.

A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A11.

A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A16.

A außerdem ganz besonders bevorzugt für den Rest A18.

R^{12} steht bevorzugt für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Cyclopropyl, C_1-C_2-Halogenalkyl, C_1-C_2-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Aminocarbonyl, Aminocarbonylmethyl oder Aminocarbonylethyl.

R^{12} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Monofluormethyl, Monofluorethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Dichlormethyl, Cyclopropyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethylthio oder Difluormethylthio.

R^{12} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, iso-Propyl, Monofluormethyl, Monofluorethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{12} steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder 1-Fluorethyl.

R^{13} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio oder Ethylthio.

R^{13} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod oder Methyl.

R^{13} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor oder Methyl.

R^{14} steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder Phenyl.

R^{14} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl oder Phenyl.

R^{14} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Trifluormethyl oder Phenyl.

R^{14} steht insbesondere bevorzugt für Methyl.

R^{15} und R^{16} stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{15} und R^{16} stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{15} und R^{16} stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{15} und R^{16} stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.

R^{17} steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, C_1-C_2-Halogenalkyl oder C_1-C_2-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{17} steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Trifluormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy oder Trichlormethoxy.

R^{17} steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl oder Trifluormethoxy.

R^{17} steht insbesondere bevorzugt für Methyl.

R^{18} und R^{19} stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{18} und R^{19} stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{18} und R^{19} stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{18} und R^{19} stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.

R^{20} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{20} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder Trifluormethyl.

R^{20} steht ganz besonders bevorzugt für Methyl.

R^{21} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_2-Halogenalkyl, C_1-C_2-Halogenalkoxy oder C_1-C_2-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{21} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Difluormethyl, Trifluor-

methyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trichlormethoxy, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio oder Trichlormethylthio.

R^{21} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Difluormethyl, Trifluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{21} steht insbesondere bevorzugt für Iod, Methyl, Difluormethyl oder Trifluormethyl.

R^{22} steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C_1-C_4-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C_1-C_2-Halogenalkyl oder C_1-C_2-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{22} steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy oder Trichlormethoxy.

R^{22} steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{23} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, C_1-C_4-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, C_1-C_2-Halogenalkyl oder C_1-C_2-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, C_1-C_2-Alkylsulphinyl oder C_1-C_2-Alkylsulphonyl.

R^{23} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Trifluormethoxy, Difluormethoxy, Difluorchlormethoxy, Trichlormethoxy, Methylsulphinyl oder Methylsulphonyl.

R^{23} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Trichlormethyl, Methylsulphinyl oder Methylsulphonyl.

R^{23} steht insbesondere bevorzugt für Wasserstoff.

R^{24} steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{24} steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{25} steht bevorzugt für Methyl oder Ethyl.

R^{25} steht besonders bevorzugt für Methyl.

Q^1 steht bevorzugt für S (Schwefel), SO_2 oder CH_2.

Q^1 steht besonders bevorzugt für S (Schwefel) oder CH_2.

Q^1 steht ganz besonders bevorzugt für S (Schwefel).

p steht bevorzugt für 0 oder 1.

p steht besonders bevorzugt für 0.

R^{26} steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{26} steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{26} steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{27} steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{27} steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{27} steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{28} und R^{29} stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{28} und R^{29} stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{28} und R^{29} stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{28} und R^{29} stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.

R^{30} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{30} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{30} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{30} steht insbesondere bevorzugt für Methyl.

R^{31} und R^{32} stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Nitro, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{31} und R^{32} stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{31} und R^{32} stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{31} und R^{32} stehen insbesondere bevorzugt jeweils für Wasserstoff.

R^{33} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen,

R^{33} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{33} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{33} steht insbesondere bevorzugt für Methyl.

R^{34} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C_1-C_6-Alkylamino, Di(C_1-C_6-alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{34} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{34} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{34} steht insbesondere bevorzugt für Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl oder Trifluormethyl.

R^{35} steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{35} steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{35} steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{35} steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl oder Difluormethyl.

R^{36} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C_1-C_4-Alkylamino, Di(C_1-C_4-alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{36} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Cyano, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{36} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{36} steht insbesondere bevorzugt für Amino, Methylamino, Dimethylamino, Methyl oder Trifluormethyl.

R^{37} steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{37} steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{37} steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{37} steht insbesondere bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl oder Difluormethyl.

R^{38} steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{38} steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{38} steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{39} steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.

R^{39} steht besonders bevorzugt für Methyl.

R^{40} steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl,

R^{40} steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor oder Methyl.

R^{41} steht bevorzugt für Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{41} steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{41} steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{41} steht insbesondere bevorzugt für Methyl oder Trifluormethyl.

R^{42} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{42} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Trifluormethyl.

R^{43} steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, C_1-C_4-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C_1-C_2-Halogenalkyl oder C_1-C_2-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{43} steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, iso-Butyl, sec-Butyl, tert-Butyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{43} steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{44} steht bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C_1-C_2-Alkoxy-C_1-C_2-alkyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Methylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl.

R^{44} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Hydroxymethyl oder Hydroxyethyl.

R^{44} steht ganz besonders bevorzugt für Methyl oder Methoxymethyl.

R^{45} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R^{45} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl Trifluormethyl, Difluormethyl oder Trichlormethyl.

R^{45} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.

R^{46} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.

R^{46} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl.

R^{46} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Difluormethyl oder Trifluormethyl.

R^{47} steht bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen.

R^{47} steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl oder Trifluormethyl.

R^{47} steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff.

R^{48} steht bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl.

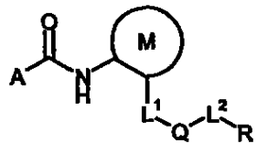
R^{48} steht besonders bevorzugt Methyl oder Ethyl.

Bevorzugt sind solche Verbindungen der Formel (I), in welcher alle Reste jeweils die oben genannten bevorzugten Bedeutungen haben.

Besonders bevorzugt sind solche Verbindungen der Formel (I), in welcher alle Reste jeweils die oben genannten besonders bevorzugten Bedeutungen haben.

Bevorzugt und jeweils als Teilmenge der oben genannten Verbindungen der Formel (I) zu verstehen sind folgende Gruppen von neuen Carboxamiden:

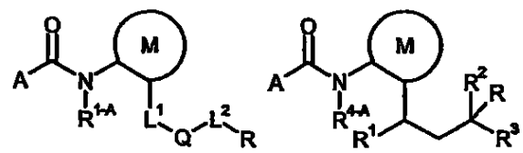
Gruppe 1: Carboxamide der Formel (I-a)



(I-a)

in welcher M, L^1, Q, L^2, R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Gruppe 2: Carboxamide der Formel (I-b)



(I-b)

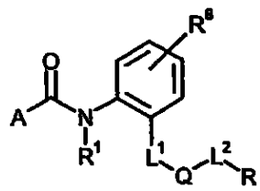
in welcher R^{1-A}, M, L^1, Q, L^2, R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

R^{1-A} steht bevorzugt für C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_4-Alkylsulfinyl, C_1-C_4-Alkylsulfonyl, C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl; C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkylthio, C_1-C_4-Halogenalkylsulfinyl, C_1-C_4-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C_1-C_3-alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_8-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkyl)carbonyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl; Halogen-(C_1-C_3-alkyl)carbonyl-C_1-C_3-alkyl, Halogen-(C_1-C_3-alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
(C_1-C_6-Alkyl)carbonyl, (C_1-C_4-Alkoxy)carbonyl, (C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl)carbonyl, (C_3-C_6-Cycloalkyl)carbonyl; (C_1-C_4-Halogenalkyl)carbonyl, (C_1-C_4-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C_1-C_3-alkoxy-C_1-C_3-alkyl)carbonyl, (C_3-C_6-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$.

R^{1-A} steht besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n- oder iso-Propyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butyl, Pentyl oder Hexyl, Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n- oder iso-Propylsulfinyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfinyl, Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n- oder iso-Propylsulfonyl, n-, iso-, sec- oder tert-Butylsulfonyl, Methoxymethyl, Methoxyethyl, Ethoxymethyl, Ethoxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Trifluorethyl, Difluormethylthio, Difluorchlormethylthio, Trifluormethylthio, Trifluormethylsulfinyl, Trifluormethylsulfonyl, Trifluormethoxymethyl; Formyl, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO-CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO-CF_3$, $-CH_2-CO-CCl_3$, $-CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CF_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CCl_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CF_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CCl_2CCl_3$;
Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propylcarbonyl, iso-Propylcarbonyl, tert-Butylcarbonyl, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl, Cyclopropylcarbonyl; Trifluormethylcarbonyl, Trifluormethoxycarbonyl, oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$.

R^{1-A} steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Methoxymethyl, Formyl, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-C(=O)CHO$, $-C(=O)C(=O)CH_3$, $-C(=O)C(=O)CH_2OCH_3$, $-C(=O)CO_2CH_3$, $-C(=O)CO_2CH_2CH_3$.

Gruppe 3: Carboxamide der Formel (I-c)



(I-c)

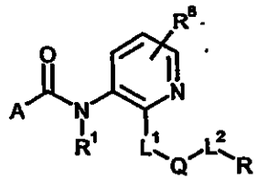
in welcher R^1, R^8, L^1, Q, L^2, R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-c), in welcher R^1 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-c), in welcher R^8 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-c), in welcher R^1 und R^8 jeweils für Wasserstoff stehen.

Gruppe 4: Carboxamide der Formel (I-d)



(I-d)

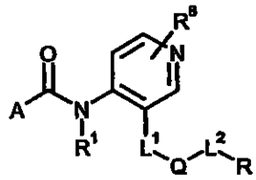
in welcher R^1, R^8, L^1, Q, L^2, R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-d), in welcher R^1 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-d), in welcher R^8 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-d), in welcher R^1 und R^8 jeweils für Wasserstoff stehen.

Gruppe 5: Carboxamide der Formel (I-e)



(I-e)

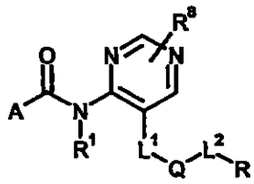
in welcher R^1, R^8, L^1, Q, L^2, R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-e), in welcher R^1 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-e), in welcher R^8 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-e), in welcher R^1 und R^8 jeweils für Wasserstoff stehen.

Gruppe 6: Carboxamide der Formel (I-f)



(I-f)

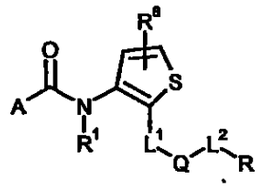
in welcher R^1, R^8, L^1, Q, L^2, R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-f), in welcher R^1 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-f), in welcher R^8 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-f), in welcher R^1 und R^8 jeweils für Wasserstoff stehen.

Gruppe 7: Carboxamide der Formel (I-g)



(I-g)

in welcher R^1, R^8, L^1, Q, L^2, R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-g), in welcher R^1 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-g), in welcher R^8 für Wasserstoff steht.

Bevorzugt sind Carboxamide der Formel (I-g), in welcher R^1 und R^8 jeweils für Wasserstoff stehen.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I) (und ebenso der Gruppen 1 bis 7), in welcher R^1 für Wasserstoff steht.

Hervorgehoben sind Verbindungen der Formel (I) (und ebenso der Gruppen 1 bis 7), in welcher R^1 für Formyl steht.

Hervorgehoben sind außerdem Verbindungen der Formel (I) (und ebenso der Gruppen 1 bis 7), in welcher R^1 für -C(=O)C(=O)R^2 steht, wobei R^2 die oben angegebenen Bedeutungen hat.

Gesättigte oder ungesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl oder Alkenyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein. Ebenfalls können doppelt gebundene Kohlenwasserstoffreste wie Alkylen (Alkandiyl) soweit möglich jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

Gegebenenfalls substituierte Reste können einfach oder mehrfach substituiert sein, wobei bei Mehrfachsubstitutionen die Substituenten gleich oder verschieden sein können. So schließt die Definition Dialkylamino auch eine unsymmetrisch durch Alkyl substituierte Aminogruppe wie z.B. Methyl-ethylamino ein.

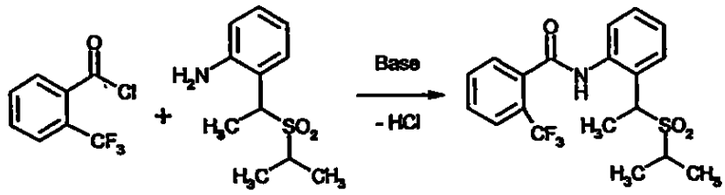
Durch Halogen substituierte Reste, wie z.B. Halogenalkyl, sind einfach oder mehrfach halogeniert. Bei mehrfacher Halogenierung können die Halogenatome gleich oder verschieden sein. Halogen steht dabei für Fluor, Chlor, Brom und Iod, insbesondere für Fluor, Chlor und Brom.

Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restedefinitionen bzw. Erläuterungen können zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend. Insbesondere können die in den Gruppen 1 bis 6 genannten Verbindungen sowohl mit den allgemeinen wie auch mit bevorzugten, besonders bevorzugten usw. Bedeutungen kombiniert werden, wobei auch hier jeweils alle Kombinationen zwischen den Vorzugsbereichen möglich sind.

Beschreibung der erfindungsgemäßen Verfahren zum Herstellen der Hexylcarboxanilide der Formel (I) sowie der Zwischenprodukte

Verfahren (a)

Verwendet man 2-Trifluormethylbenzoesäurechlorid und {2-[1-(Isopropylsulfonyl)ethyl]phenyl}-amin als Ausgangsstoffe, so kann das erfindungsgemäße Verfahren (a) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



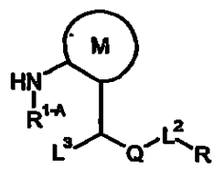
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe benötigten Carbonsäure-Derivate sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel (II) hat A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit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

Die Carbonsäure-Derivate der Formel (II) sind größtenteils bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen (vgl. WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 und EP-A 0 589 313).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Anilin-Derivate sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel (III) haben R^1, M, Q, L^2 und R bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden. L^3 steht bevorzugt für Wasserstoff oder C_1-C_5-Alkyl, besonders bevorzugt für Wasserstoff oder Methyl.

Die Anilin-Derivate der Formel (III) sind neu.

Anilin-Derivate der Formel (III-a)

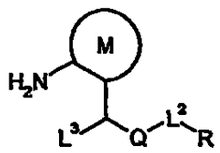


(III-a)

in welcher R^{1-A}, M, Q, L^2, R und L^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

werden erhalten, indem man

(d) Anilin-Derivate der Formel (III-b)



(III-b)

in welcher M, Q, L^2, R und L^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogeniden der Formel (VI)

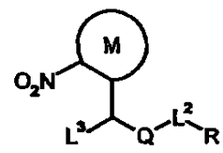
$$R^{1-A}—X^2 \qquad (VI)$$

in welcher R^{1-A} und X^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Anilin-Derivate der Formel (III-b) werden erhalten, indem man

(e) eine Nitro-Verbindung der Formel (VII)



(VII)

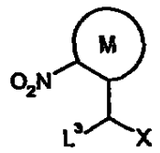
in welcher M, Q, L^2, R und L^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart eines Metalls und eines Reduktionsmittels sowie gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels umsetzt.

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

Nitro-Verbindungen der Formel (VII) werden erhalten, indem man

(f) eine Nitro-Verbindung der Formel (VIII)



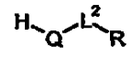
(VIII)

in welcher

M und L^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

X für Chlor, Brom oder Iod steht,

mit einer Verbindung der Formel (IX)



(IX)

in welcher Q, L^2 und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,

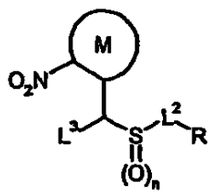
in Gegenwart einer Base und gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe benötigten Nitro-Verbindungen sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel (VIII) haben M und L^3 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) bzw. der Formel (III) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden. X steht bevorzugt für Chlor.

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

Verbindungen der Formel (IX) sind bekannt oder können nach bekannten Verfahren erhalten werden.

Nitro-Verbindungen der Formel (VII-a)



(VII-a)

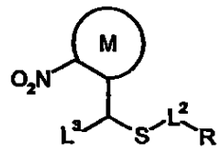
in welcher

M, L^2, R und L^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

n für 1 oder 2 steht,

werden erhalten, indem man

(g) eine Nitro-Verbindung der Formel (VII-b)

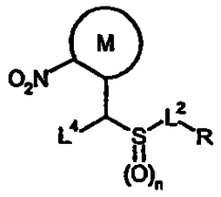


(VII-b)

in welcher M, L^2, R und L^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart eines Oxidationsmittels sowie gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines weiteren Reaktionshilfsmittels umsetzt.

Nitro-Verbindungen der Formel (VII-c)



(VII-c)

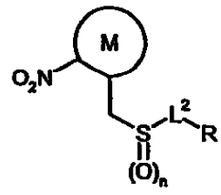
in welcher

M, L^2, R und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

L^4 für C_1-C_9-Alkyl, bevorzugt für C_1-C_5-Alkyl, besonders bevorzugt für Methyl steht,

werden erhalten, indem man

(h) eine Nitro-Verbindung der Formel (VII-d)



(VII-d)

in welcher M, L^2, R und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogeniden der Formel (X)

$$L^4—X^2 \qquad (X)$$

in welcher L^4 und X^2 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

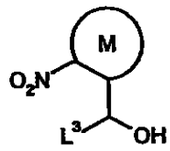
in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

Halogenide der Formel (X) sind bekannt.

Die Verbindungen der Formeln (VII-a), (VII-b), (VII-c) und (VII-d) sind Untergruppen der Nitro-Verbindungen der Formel (VII) und werden von der allgemeinen Beschreibung dieser Verbindungen umfasst. Die bevorzugten, besonders bevorzugten usw. Definitionen gelten hier entsprechend.

Nitro-Verbindungen der Formel (VIII) werden erhalten, indem man

(j) Hydroxy-Derivate der Formel (XI)



(XI)

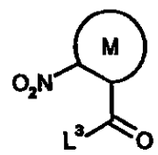
in welcher M und L^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säureakzeptors und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators halogeniert.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) als Ausgangsstoffe benötigten Hydroxy-Derivate sind durch die Formel (XI) allgemein definiert. In dieser Formel (XI) haben M und L^3 bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) bzw. der Formel (III) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diese Reste angegeben wurden.

Hydroxy-Derivate der Formel (XI) werden erhalten, indem man

(k) acylierte Aromaten der Formel (XII)



(XII)

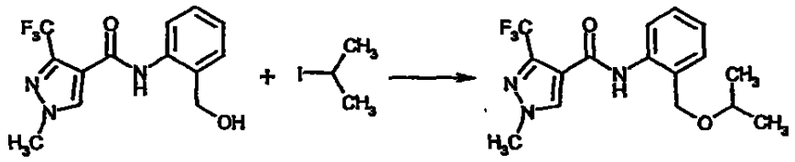
in welcher M und L^3 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart eines Reduktionsmittels sowie gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators umsetzt.

Anilin-Derivate der Formel (III) können auch in Analogie zu bekannten Verfahren erhalten werden (vgl. EP-A 0 737 682).

Verfahren (b)

Verwendet man N-[2-(Hydroxymethyl)phenyl]-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid und 2-Iodpropan als Ausgangsstoffe, so kann das erfindungsgemäße Verfahren (b) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:

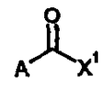


Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) als Ausgangsstoffe benötigten Carboxamide sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In dieser Formel (IV) haben M, L^1, Q und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für A angegeben wurden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) weiterhin als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel (V) haben L^2 und R bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für A angegeben wurden. Y steht bevorzugt für Chlor, Brom, Iod, Triflat (Trifluormethylsulfonyl), Mesylat (Methylsulfonyl) oder Tosylat (4-Methylphenylsulfonyl), besonders bevorzugt für Brom, Iod oder Triflat (Trifluormethylsulfonyl).

Verbindungen der Formel (V) sind bekannt oder können nach bekannten Verfahren erhalten werden.
Carboxamide der Formel (IV) sind neu. Sie werden erhalten, indem man

(m) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)

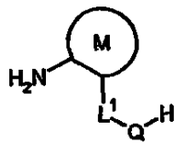
 (II)

in welcher

A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X^1 für Halogen oder Hydroxy steht,

mit Anilin-Derivaten der Formel (XIII)

 (XIII)

in welcher M, L^1 und Q die oben angegebenen Bedeutungen haben,

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

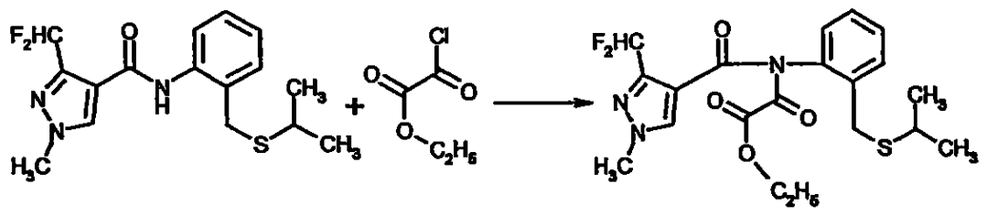
Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (m) als Ausgangsstoffe benötigten Carbonsäure-Derivate der Formel (II) sind bereits in Zusammenhang mit dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) beschrieben worden.

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (m) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Anilin-Derivate sind durch die Formel (XIII) allgemein definiert. In dieser Formel (XIII) haben M, L^1 und Q bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt angegeben wurden.

Anilin-Derivate der Formel (XIII) sind bekannt oder können nach bekannten Verfahren erhalten werden.

Verfahren (c)

Verwendet man 3-(Difluormethyl)-N-{2-[(isopropylthio)methyl]phenyl}-1-methyl-1H-pyrazol-4-carboxamid und Ethyl-chlor(oxo)acetat als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden:



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

Die Hexylcarboxanilide der Formel (I-a) sind ebenfalls erfindungsgemäße Verbindungen und Gegenstand dieser Anmeldung. Sie können nach dem erfindungsgemäßen Verfahren (a) erhalten werden (mit R^1 = Wasserstoff).

Die zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe weiterhin benötigten Halogenide sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel (VI) hat R^{1-A} bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt diejenigen Bedeutungen, die bereits im Zusammen-

hang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I-b) als bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diesen Rest angegeben wurden. X^2 steht bevorzugt für Chlor oder Brom.

Halogenide der Formel (VI) sind bekannt.

Reaktionsbedingungen

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

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

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (m) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Kondensationsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Amidierungsreaktionen verwendbaren Kondensationsmittel infrage. Beispielhaft genannt seien Säurehalogenidbildner wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid, Oxalylchlorid oder Thionylchlorid; Anhydridbildner wie Chlorameisensäureethylester, Chlorameisensäuremethylester, Chlorameisensäureisopropylester, Chlorameisensäureisobutylester oder Methansulfonylchlorid; Carbodiimide, wie N,N'-Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder andere übliche Kondensationsmittel, wie Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol,

2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EEDQ), Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff oder Brom-tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphat.

Die erfindungsgemäßen Verfahren (a) und (m) werden gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Beispielsweise genannt seien 4-Dimethylaminopyridin, 1-Hydroxy-benzotriazol oder Dimethylformamid.

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

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (a) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro mol des Carbonsäure-Derivates der Formel (II) im Allgemeinen 0,2 bis 5 mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 mol an Anilin-Derivat der Formel (III) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (m) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (IV) setzt man pro mol des Carbonsäure-Derivates der Formel (II) im Allgemeinen 0,2 bis 5 mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 mol an Anilin-Derivat der Formel (XIII) ein.

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

Die erfindungsgemäßen Verfahren (b), (c), (d) und (h) werden in Gegenwart einer Base durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie z.B. Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Caesiumcarbonat, sowie tertiäre Amine, wie Trime-

thylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung der erfindungsgemäßen Verfahren (b), (c), (d) und (h) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 150°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 110°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (b) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Carboxamids der Formel (IV) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an einer Verbindung der Formel (V) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (c) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (I) setzt man pro Mol des Hexylcarboxanilids der Formel (I-a) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Halogenid der Formel (VI) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (d) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (III-a) setzt man pro Mol des Anilin-Derivates der Formel (III-b) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Halogenid der Formel (VI) ein.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (h) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (VII-c) setzt man pro Mol einer Nitro-Verbindung der Formel (VII-d) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol an Halogenid der Formel (X) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan; Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n- oder iso-Propanol, n-, iso-, sec- oder tert-Butanol, Ethandiol, Propan-1,2-diol, Ethoxyethanol, Methoxyethanol, Diethylenglykolmonomethylether, Diethylenglykolmonoethylether, Triethylenglykol, deren Gemische mit Wasser oder reines Wasser.

Das erfindungsgemäße Verfahren (e) wird in Gegenwart eines Metalls durchgeführt. Als solche kom-

men vorzugsweise Übergangsmetalle, wie beispielsweise Palladium, Platin, Rhodium, Nickel (Raney-Nickel), Eisen, Cobalt, Ruthenium, Iridium, Zink, oder Osmium infrage. Die Metalle können gegebenenfalls an Trägermaterialien, wie z. B. Kohle, Harze, Zeolithe, Alkali- oder Erdalkalisulfate gebunden sein.

Das erfindungsgemäße Verfahren (e) wird in Gegenwart eines Reduktionsmittels durchgeführt. Als solche kommen vorzugsweise elementarer Wasserstoff, Formiatsalze, vorzugsweise Alkaliformiatsalze, wie z. B. Natriumformiat, aber auch Ammoniumformiat oder auch Metallhydride bzw. komplexe Metallhydride, wie z.B. Lithiumaluminiumhydrid, Natriumborhydrid infrage.

Das erfindungsgemäße Verfahren (e) kann in Gegenwart von Säuren durchgeführt werden. Als solche kommen vorzugsweise organische Säuren, wie z. B. Ameisensäure, Essigsäure, Ascorbinsäure, aber auch Mineralsäuren, wie z.B. Salzsäure oder Schwefelsäure infrage.

Das erfindungsgemäße Verfahren (e) kann in Gegenwart von Basen durchgeführt werden. Als solche kommen vorzugsweise organische Basen, wie z. B. Pyridin, aber auch wässrige Lösungen von Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxiden, wie z.B. Natriumhydroxid oder Bariumhydroxid infrage.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von –80°C bis 300°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 200°C.

Bei der Verwendung von elementarem Wasserstoff wird das erfindungsgemäße Verfahren (e) unter einem Wasserstoffdruck zwischen 0,5 and 200 bar, bevorzugt zwischen 1 und 100 bar durchgeführt.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (e) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (III-b) setzt man pro Mol einer Nitro-Verbindung der Formel (VII) im Allgemeinen 0,8 bis 1000 Mol, vorzugsweise 1 bis 500 Mol an Reduktionsmittel (Ammoniumformiat, Hydrid etc.) ein.

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

thylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid.

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

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahren (f) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 200°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 20°C bis 150°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (f) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (VII) setzt man pro Mol einer Nitro-Verbindung der Formel (VIII) im Allgemeinen 0,2 bis 5 Mol, vorzugsweise 0,5 bis 2 Mol einer Verbindung der Formel (IX) ein.

Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) kommen alle inerten organischen Lösungsmittel in Betracht. Hierzu gehören vorzugsweise aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie beispielsweise Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-tert-Amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid; Sulfone, wie Sulfolan.

Das erfindungsgemäße Verfahren (g) wird in Gegenwart eines Oxidationsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle organischen und anorganischen Oxidationsmittel infrage, vorzugsweise elementarer Sauerstoff, Ozon, Peroxide, wie z.B. Wasserstoffperoxid, m-Chlorperbenzoesäure, Benzoylperoxid, tert.-Butylperoxid; Chlorlauge (Natriumhypochlorid); Chromsalze wie z.B. Chrom(VI)-oxid,

Chromsäure, Natriumdichromat, Pyridiniumchlorochromat; Mangansalze, wie z.B. Kaliumpermanganat, Braunstein; Selendioxid; Iodate und Periodate; Kaliumperoxodisulfat.

Das erfindungsgemäße Verfahren (g) kann in Gegenwart von Säuren durchgeführt werden. Als solche kommen vorzugsweise organische Säuren, wie z. B. Ameisensäure, Essigsäure, Ascorbinsäure, aber auch Mineralsäuren, wie z.B. Salzsäure oder Schwefelsäure infrage.

Das erfindungsgemäße Verfahren (g) kann in Gegenwart von Basen durchgeführt werden. Als solche kommen vorzugsweise organische Basen, wie z. B. Pyridin, aber auch wässrige Lösungen von Alkali- oder Erdalkalimetallhydroxiden, wie z.B. Natriumhydroxid oder Bariumhydroxid infrage.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) in einem größeren Bereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von –80°C bis 300°C, vorzugsweise bei Temperaturen von –20°C bis 100°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (g) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (VII-a) setzt man pro Mol einer Nitro-Verbindung der Formel (VII-b) im Allgemeinen 0,6 bis 10 Mol, vorzugsweise 0,8 bis 5 Mol an Oxidationsmittel ein.

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

Das erfindungsgemäße Verfahren (j) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Säureakzeptors durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Basen infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, -hydroxide, -amide, -alkoholate, -acetate, -carbonate oder -hydrogencarbonate, wie z.B. Natriumhydrid, Natriumamid, Natrium-methylat, Natrium-ethylat, Kalium-tert.-butylat, Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Ammoniumacetat, Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat oder Ammoniumcarbonat, so-

wie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, N,N-Dimethyl-benzylamin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU).

Das erfindungsgemäße Verfahren (j) wird in Gegenwart eines geeigneten Halogenierungsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Halogenierungsreaktionen verwendbaren Halogenierungsmittel infrage. Beispielhaft genannt seien Halogenidbildner wie Phosgen, Phosphortribromid, Phosphortrichlorid, Phosphorpentachlorid, Phosphoroxychlorid, Oxalylchlorid oder Thionylchlorid; Anhydridbildner wie Chlorameisensäureethylester, Chlorameisensäuremethylester, Chlorameisensäureisopropylester, Chlorameisensäureisobutylester oder Methansulfonylchlorid; oder andere übliche Kondensationsmittel, wie Phosphorpentoxid, Polyphosphorsäure, N,N'-Carbonyldiimidazol, 2-Ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydrochinolin (EEDQ), Triphenylphosphin/Tetrachlorkohlenstoff oder Brom-tripyrrolidinophosphonium-hexafluorophosphat.

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

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 200°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 150°C.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (j) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (VIII) setzt man pro mol eines Hydroxy-Derivates der Formel (XI) im Allgemeinen 0,2 bis 10 mol, vorzugsweise 0,5 bis 5 mol an Halogenierungsmittel ein.

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

Das erfindungsgemäße Verfahren (k) wird in Gegenwart eines geeigneten Reduktionsmittels durchgeführt. Als solche kommen alle üblichen anorganischen oder organischen Reduktionsmittel infrage. Hierzu gehören vorzugsweise Erdalkalimetall- oder Alkalimetallhydride, wie z.B. Natriumhydrid, oder komplexe Hydride, wie z.B. Lithiumaluminiumhydrid, Natriumborhydrid, Natriumcyanoborhydrid, Diisobutylaluminiumhydrid, Boran, Diboran oder Borankomplexe, wie z.B. Boran-Pyridin, Silane, wie z.B. Triethylsilan, Metalle, wie z.B. Natrium, Lithium, Zink, Eisen, oder Wasserstoff.

Das erfindungsgemäße Verfahren (k) wird gegebenenfalls in Gegenwart einer geeigneten Säure oder Lewissäure durchgeführt. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Säure/Lewissäure vermittelten Reduktionen verwendbaren Säuren/Lewissäuren infrage. Beispielhaft genannt seien Salzsäure, Essigsäure, Trifluoressigsäure, Bortrifluorid oder komplexe Bortrifluoride, wie z.B. Bortrifluoridetherat, Aluminiumtrichlorid, Certrichlorid, anorganische oder organische Titanverbindungen, wie z.B. Titantetrachlorid, Titantetraisopropylat.

Das erfindungsgemäße Verfahren (k) wird gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators durchgeführt. Beispielsweise genannt seien Metalle oder Metallsalze, insbesondere Übergangsmetalle oder deren Salze, wie z.B. Platin, Palladium, Nickel (Raney-Nickel), Iridium, Rhodium, Osmium, Eisen, Ruthenium, Cobalt. Diese Metalle bzw. Metallsalze können gegebenenfalls auch an Harze oder Oberflächen bzw. Trägermaterialien (z. B. Kohle) gebunden oder aufgetragen sein.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen von 0°C bis 200°C, vorzugsweise bei Temperaturen von 0°C bis 150°C.

Bei der Verwendung von Wasserstoff als Reduktionsmittel kann das erfindungsgemäße Verfahren (k) in einem größeren Druckbereich variiert werden. Im Allgemeinen arbeitet man bei Drücken von 1 bar bis 300 bar, vorzugsweise bei 1 bar bis 100 bar.

Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (k) zur Herstellung der Verbindungen der Formel (XI) setzt man pro mol eines acylierten Aromaten der Formel (XII) im Allgemeinen 0,2 bis 10 mol, vorzugsweise 0,5 bis 5 mol an Reduktionsmittel ein.

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

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

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

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

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

Xanthomonas-Arten, wie beispielsweise Xanthomonas campestris pv. oryzae;

Pseudomonas-Arten, wie beispielsweise Pseudomonas syringae pv. lachrymans;

Erwinia-Arten, wie beispielsweise Erwinia amylovora;

Pythium-Arten, wie beispielsweise Pythium ultimum;

Phytophthora-Arten, wie beispielsweise Phytophthora infestans;

Pseudoperonospora-Arten, wie beispielsweise Pseudoperonospora humuli oder Pseudoperonospora cubensis;

Plasmopara-Arten, wie beispielsweise Plasmopara viticola;

Bremia-Arten, wie beispielsweise Bremia lactucae;

Peronospora-Arten, wie beispielsweise Peronospora pisi oder P. brassicae;

Erysiphe-Arten, wie beispielsweise Erysiphe graminis;

Sphaerotheca-Arten, wie beispielsweise Sphaerotheca fuliginea;

Podosphaera-Arten, wie beispielsweise Podosphaera leucotricha;

Venturia-Arten, wie beispielsweise Venturia inaequalis;

Pyrenophora-Arten, wie beispielsweise Pyrenophora teres oder P. graminea (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Cochliobolus-Arten, wie beispielsweise Cochliobolus sativus (Konidienform: Drechslera, Syn: Helminthosporium);

Uromyces-Arten, wie beispielsweise Uromyces appendiculatus;

Puccinia-Arten, wie beispielsweise Puccinia recondita;

Sclerotinia-Arten, wie beispielsweise Sclerotinia sclerotiorum;

Tilletia-Arten, wie beispielsweise Tilletia caries;

Ustilago-Arten, wie beispielsweise Ustilago nuda oder Ustilago avenae;

Pellicularia-Arten, wie beispielsweise Pellicularia sasakii;

Pyricularia-Arten, wie beispielsweise Pyricularia oryzae;
Fusarium-Arten, wie beispielsweise Fusarium culmorum;
Botrytis-Arten, wie beispielsweise Botrytis cinerea;
Septoria-Arten, wie beispielsweise Septoria nodorum;
Leptosphaeria-Arten, wie beispielsweise Leptosphaeria nodorum;
Cercospora-Arten, wie beispielsweise Cercospora canescens;
Alternaria-Arten, wie beispielsweise Alternaria brassicae;
Pseudocercosporella-Arten, wie beispielsweise Pseudocercosporella herpotrichoides,
Rhizoctonia-Arten, wie beispielsweise Rhizoctonia solani.

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

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

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

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

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

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Steigerung des Ernteertrages. Sie sind

außerdem mindertoxisch und weisen eine gute Pflanzenverträglichkeit auf.

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

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

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

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

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

mehrung von Mikroorganismen beeinträchtigt werden können. Im Rahmen der vorliegenden Erfindung seien als technische Materialien vorzugsweise Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Anstrichmittel, Kühlschmiermittel und Wärmeübertragungsflüssigkeiten genannt, besonders bevorzugt Holz.

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

Es seien beispielsweise Mikroorganismen der folgenden Gattungen genannt:
Alternaria, wie Alternaria tenuis,
Aspergillus, wie Aspergillus niger,
Chaetomium, wie Chaetomium globosum,
Coniophora, wie Coniophora puetana,
Lentinus, wie Lentinus tigrinus,
Penicillium, wie Penicillium glaucum,
Polyporus, wie Polyporus versicolor,
Aureobasidium, wie Aureobasidium pullulans,
Sclerophoma, wie Sclerophoma pityophila,
Trichoderma, wie Trichoderma viride,
Escherichia, wie Escherichia coli,
Pseudomonas, wie Pseudomonas aeruginosa,
Staphylococcus, wie Staphylococcus aureus.

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

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln, unter Druck stehenden verflüssigten Gasen und/ oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaumerzeugenden Mitteln. Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungs-

mittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im Wesentlichen infrage: Aromaten, wie Xylol, Toluol oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten oder chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, Alkohole, wie Butanol oder Glycol sowie deren Ether und Ester, Ketone, wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser. Mit verflüssigten gasförmigen Streckmitteln oder Trägerstoffen sind solche Flüssigkeiten gemeint, welche bei normaler Temperatur und unter Normaldruck gasförmig sind, z.B. Aerosol-Treibgase, wie Halogenkohlenwasserstoffe sowie Butan, Propan, Stickstoff und Kohlendioxid. Als feste Trägerstoffe kommen infrage: z.B. natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate. Als feste Trägerstoffe für Granulate kommen infrage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Bims, Marmor, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus organischem Material wie Sägemehl, Kokosnussschalen, Maiskolben und Tabakstängel. Als Emulgier und/oder schaumerzeugende Mittel kommen infrage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäureester, Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z.B. Alkylarylpolyglycolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Eiweißhydrolysate. Als Dispergiermittel kommen infrage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

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

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

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

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

Mischung ist größer als die Wirksamkeit der Einzelkomponenten.

Als Mischpartner kommen zum Beispiel folgende Verbindungen infrage:

Fungizide:

2-Phenylphenol; 8-Hydroxychinolinsulfat; Acibenzolar-S-methyl; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potassium; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin; Benalaxyl; Benalaxyl-M; Benodanil; Benomyl; Benthiavalicarb-isopropyl; Benzamacril; Benzamacril-isobutyl; Bilanafos; Binapacryl; Biphenyl; Bitertanol; Blasticidin-S; Bromuconazole; Bupirimate; Buthiobate; Butylamin; Calcium polysulfide; Capsimycin; Captafol; Captan; Carbendazim; Carboxin; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazone; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolinate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen; Diclocymet; Diclomezine; Dicloran; Diethofencarb; Difenoconazole; Diflumetorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; Diphenylamine; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon; Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole; Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodium; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Furmecyclox; Guazatine; Hexachlorobenzene; Hexaconazole; Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetate; Iminoctadine tris(albesilate)l; Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-methyl; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl; Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomycin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropyl; Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; Oxolinic acid; Oxpoconazole; Oxycarboxin; Oxyfenthiin; Paclobutrazol; Pefurazoate; Penconazole; Pencycuron; Phosdiphen; Phthalide; Picoxystrobin; Piperalin; Polyoxins; Polyoxorim; Probenazole; Prochloraz; Procymidone; Propamocarb; Propanosine-sodium; Propiconazole; Propineb; Proquinazid; Prothioconazole; Pyraclostrobin; Pyrazophos; Pyrifenox; Pyrimethanil; Pyroquilon; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxyfen; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-methyl; Thiram; Tioxymid; Tolclofos-methyl; Tolylfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil; Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-Chlorphenyl)-2-propinyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamid; 1-(1-Naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion; 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin; 2-Amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolcarboxamid; 2-

Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamide; 3,4,5-Trichlor-2,6-pyridindicarbonitril; Actinovate; cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol; Methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat; Monokaliumcarbonat; N-(6-Methoxy-3-pyridinyl)-cyclopropancarboxamid; N-Butyl-8-(1,1-dimethylethyl)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amin; Natriumtetrathiocarbonat; sowie Kupfersalze und -zubereitungen, wie Bordeaux mixture; Kupferhydroxid; Kupfernaphthenat; Kupferoxychlorid; Kupfersulfat; Cufraneb; Kupferoxid; Mancopper; Oxine-copper.

Bakterizide:

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

Insektizide / Akarizide / Nematizide:

1. Acetylcholinesterase (AChE) Inhibitoren

1.1 Carbamate (z.B. 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, Isoprocarb, Metam-sodium, Methiocarb, Methomyl, Metolcarb, Oxamyl, Pirimicarb, Promecarb, Propoxur, Thiodicarb, Thiofanox, Triazamate, Trimethacarb, XMC, Xylylcarb)

1.2 Organophosphate (z.B. 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, Triclorfon, Vamidothion)

2. Natrium-Kanal-Modulatoren / Spannungsabhängige Natrium-Kanal-Blocker

2.1 Pyrethroide (z.B. 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, Clocythrin, Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cypermethrin (alpha-, beta-, theta-, zeta-), Cyphenothrin, DDT, Deltamethrin, Empenthrin (1R-isomer), Esfenvalerate, Etofenprox, Fenfluthrin, Fenpropathrin, Fenpyrithrin, Fenvalerate, Flubrocythrinate, Flucythrinate, Flufenprox, Flumethrin, Fluvalinate, Fubfenprox, Gamma-Cyhalothrin, Imiprothrin, Kadethrin, Lambda-Cyhalothrin, Metofluthrin, Permethrin (cis-, trans-), Phenothrin (1R-trans isomer), Prallethrin, Profluthrin, Protrifenbute, Pyresmethrin, Resmethrin, RU 15525, Silafluofen, Tau-Fluvalinate, Tefluthrin, Terallethrin, Tetramethrin (1R-isomer), Tralomethrin, Transfluthrin, ZXI 8901, Pyrethrins (pyrethrum))

2.2 Oxadiazine (z.B. Indoxacarb)

3. Acetylcholin-Rezeptor-Agonisten/-Antagonisten

3.1 Chloronicotinyle/Neonicotinoide (z.B. Acetamiprid, Clothianidin, Dinotefuran, Imidacloprid, Nitenpyram, Nithiazine, Thiacloprid, Thiamethoxam)

3.2 Nicotine, Bensultap, Cartap

4. Acetylcholin-Rezeptor-Modulatoren

4.1 Spinosyne (z.B. Spinosad)

5. GABA-gesteuerte Chlorid-Kanal-Antagonisten

5.1 Cyclodiene Organochlorine (z.B. Camphechlor, Chlordane, Endosulfan, Gamma-HCH, HCH, Heptachlor, Lindane, Methoxychlor

5.2 Fiprole (z.B. Acetoprole, Ethiprole, Fipronil, Vaniliprole)

6. Chlorid-Kanal-Aktivatoren

6.1 Mectine (z.B. Abamectin, Avermectin, Emamectin, Emamectin-benzoate, Ivermectin, Milbemectin, Milbemycin)

7. Juvenilhormon-Mimetika

(z.B. Diofenolan, Epofenonane, Fenoxycarb, Hydroprene, Kinoprene, Methoprene, Pyriproxifen, Triprene)

8. Ecdysonagonisten/disruptoren

8.1 Diacylhydrazine (z.B. Chromafenozide, Halofenozide, Methoxyfenozide, Tebufenozide)

9. Inhibitoren der Chitinbiosynthese

9.1 Benzoylharnstoffe (z.B. Bistrifluron, Chlofluazuron, Diflubenzuron, Fluazuron, Flucycloxuron, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Lufenuron, Novaluron, Noviflumuron, Penfluron, Teflubenzuron, Triflumuron)

9.2 Buprofezin

9.3 Cyromazine

10. Inhibitoren der oxidativen Phosphorylierung, ATP-Disruptoren

10.1 Diafenthiuron

10.2 Organotine (z.B. Azocyclotin, Cyhexatin, Fenbutatin-oxide)

11. Entkoppler der oxidativen Phoshorylierung durch Unterbrechung des H-Protongradienten

11.1 Pyrrole (z.B. Chlorfenapyr)

11.2 Dinitrophenole (z.B. Binapacyrl, Dinobuton, Dinocap, DNOC)

12. Seite-I-Elektronentransportinhibitoren

12.1 METTs (z.B. Fenazaquin, Fenpyroximate, Pyrimidifen, Pyridaben, Tebufenpyrad, Tolfenpyrad)

12.2 Hydramethylnone

12.3 Dicofol

13. Seite-II-Elektronentransportinhibitoren

13.1 Rotenone

14. Seite-III-Elektronentransportinhibitoren

14.1 Acequinocyl, Fluacrypyrim

15. Mikrobielle Disruptoren der Insektendarmmembran

Bacillus thuringiensis-Stämme

16. Inhibitoren der Fettsynthese

16.1 Tetronsäuren (z.B. Spirodiclofen, Spiromesifen)

16.2 Tetramsäuren [z.B. 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)]

17. Carboxamide

(z.B. Flonicamid)

18. Oktopaminerge Agonisten

(z.B. Amitraz)

19. Inhibitoren der Magnesium-stimulierten ATPase

(z.B. Propargite)

20. Phthalamide

(z.B. N^2-[1,1-Dimethyl-2-(methylsulfonyl)ethyl]-3-iod-N^1-[2-methyl-4-[1,2,2,2-tetrafluor-1-(trifluor-methyl)ethyl]phenyl]-1,2-benzenedicarboxamide (CAS-Reg.-No.: 272451-65-7), Flubendiamide)

21. Nereistoxin-Analoge

(z.B. Thiocyclam hydrogen oxalate, Thiosultap-sodium)

22. Biologika, Hormone oder Pheromone

(z.B. Azadirachtin, Bacillus spec., Beauveria spec., Codlemone, Metarrhizium spec., Paecilomyces spec., Thuringiensin, Verticillium spec.)

23. Wirkstoffe mit unbekannten oder nicht spezifischen Wirkmechanismen

23.1 Begasungsmittel (z.B. Aluminium phosphide, Methyl bromide, Sulfuryl fluoride)

23.2 Selektive Fraßhemmer (z.B. Cryolite, Flonicamid, Pymetrozine)

23.3 Milbenwachstumsinhibitoren (z.B. Clofentezine, Etoxazole, Hexythiazox)
23.4 Amidoflumet, Benclothiaz, Benzoximate, Bifenazate, Bromopropylate, Buprofezin, Chinomethionat, Chlordimeform, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Clothiazoben, Cycloprene, Cyflumetofen, Dicyclanil, Fenoxacrim, Fentrifanil, Flubenzimine, Flufenerim, Flutenzin, Gossyplure, Hydramethylnone, Japonilure, Metoxadiazone, Petroleum, Piperonyl butoxide, Potassium oleate, Pyrafluprole, Pyridalyl, Pyriprole, Sulfluramid, Tetradifon, Tetrasul, Triarathene, Verbutin,

ferner die Verbindung 3-Methyl-phenyl-propylcarbamat (Tsumacide Z), die Verbindung 3-(5-Chlor-3-pyridinyl)-8-(2,2,2-trifluorethyl)-8-azabicyclo[3.2.1]octan-3-carbonitril (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) und das entsprechende 3-endo-Isomere (CAS-Reg.-Nr. 185984-60-5) (vgl. WO 96/37494, WO 98/25923), sowie Präparate, welche insektizid wirksame Pflanzenextrakte, Nematoden, Pilze oder Viren enthalten.

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren, Safener bzw. Semiochemicals ist möglich.
Darüber hinaus weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) auch sehr gute antimykotische Wirkungen auf. Sie besitzen ein sehr breites antimykotisches Wirkungsspektrum, insbesondere gegen Dermatophyten und Sprosspilze, Schimmel und diphasische Pilze (z.B. gegen Candida-Spezies wie Candida albicans, Candida glabrata) sowie Epidermophyton floccosum, Aspergillus-Spezies wie Aspergillus niger und Aspergillus fumigatus, Trichophyton-Spezies wie Trichophyton mentagrophytes, Microsporon-Spezies wie Microsporon canis und audouinii. Die Aufzählung dieser Pilze stellt keinesfalls eine Beschränkung des erfassbaren mykotischen Spektrums dar, sondern hat nur erläuternden Charakter.

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

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

Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,001 und 50 g pro Kilogramm Saatgut, vorzugsweise zwischen 0,01 und 10 g pro Kilogramm Saatgut. Bei der Behandlung des Bodens liegen die Aufwandmengen an Wirkstoff im allgemeinen zwischen 0,1 und 10.000 g/ha, vorzugsweise zwischen 1 und 5.000 g/ha.

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

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

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

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits") verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleuni-

gung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Erzeugnisse, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Tabak und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits") werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten, Spinnentiere, Nematoden und Schnecken durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus Bacillus Thuringiensis (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im Folgenden „Bt Pflanzen"). Als Eigenschaften („Traits") werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits") werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, z.B. Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. "PAT"-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits") verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für „Bt Pflanzen" seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucoton® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits").

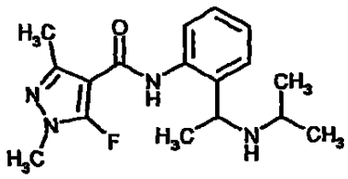
Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die

Behandlung dieser Pflanzen. Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

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

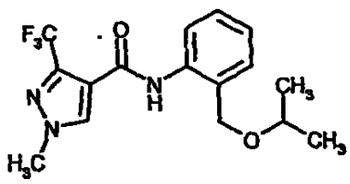
Herstellungsbeispiele

Herstellung von Verbindung Nr. 40



Zu einer Lösung bestehend aus 0,27 g (1,5 mmol) 2-[1-(Isopropylamino)ethyl]anilin (III-4) und 0,42 ml (3,0 mmol) Triethylamin in 5 ml Dichlormethan wird eine Lösung bestehend aus 0,27 g (1,5 mmol) 5-Fluor-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carbonsäurechlorid in 10 ml Dichlormethan zugetropft. Die Reaktionsmischung wird 2 Stunden bei 50°C und anschließend 16 h bei Raumtemperatur gerührt. Zur Aufarbeitung wird die Reaktionsmischung auf Wasser gegeben, die organische Phase über Magnesiumsulfat getrocknet und im Vakuum aufkonzentriert. Säulenchromatographie (Hexan/Aceton 4 : 1) liefert 0,27 g (56 % der Theorie) 5-Fluor-N-{2-[1-(isopropylamino)ethyl]phenyl}-1,3-dimethyl-1H-pyrazol-4-carboxamid [log P (pH 2,3) = 0,58].

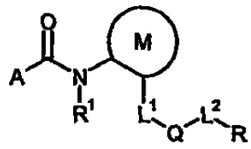
Herstellung von Verbindung Nr. 60



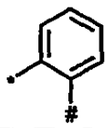
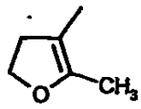
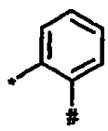
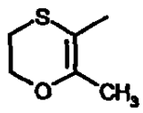
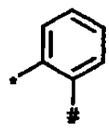
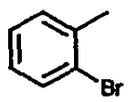
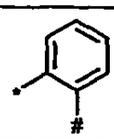
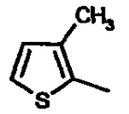
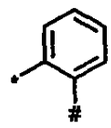
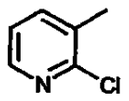
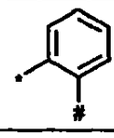
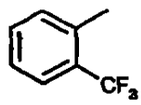
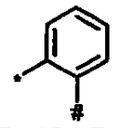
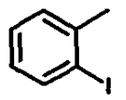
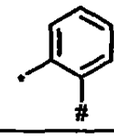
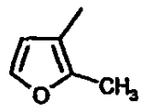
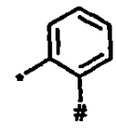
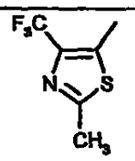
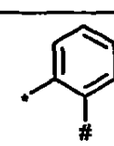
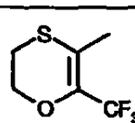
Bei Raumtemperatur werden 156,0 mg (3,9 mmol) 60%iges Natriumhyrid in Öl zu einer Lösung bestehend aus 897,8 mg (3,0 mmol) N-[2-(Hydroxymethyl)phenyl]-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid (IV-1) in 2 ml Dimethylformamid gegeben. Nach 30 Minuten werden 0,6 ml (6,0 mmol) 2-Iodpropan zugegeben. Die Reaktionsmischung wird 6 Stunden bei 100°C und 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird mit 1 ml Methanol versetzt, auf Wasser gegeben, mit Essigsäureethylester extrahiert, die organische Phase über Magnesiumsulfat getrocknet, vom Trockenmittel abfiltriert und im Vakuum aufkonzentriert. Säulenchromatographie (Cyclohexan/Essigsäureethylester 3 : 1) liefert 100,0 mg (9,7 % der Theorie) an N-[2-(Isopropoxymethyl)phenyl]-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid [logP (pH 2,3) = 2,85].

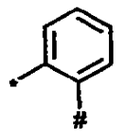
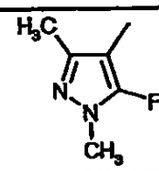
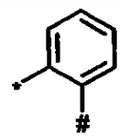
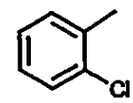
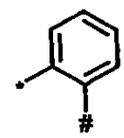
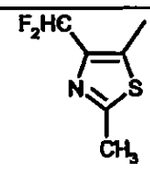
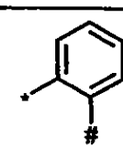
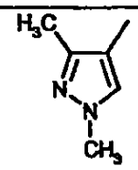
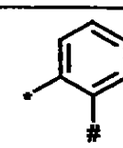
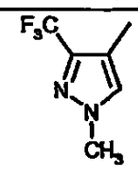
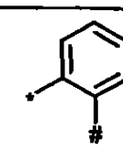
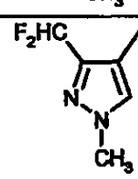
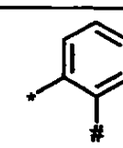
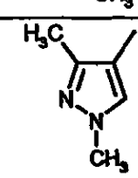
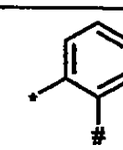
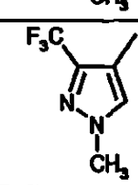
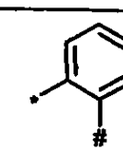
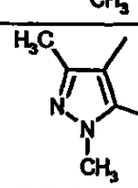
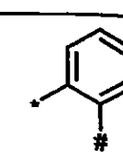
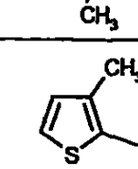
Analog Beispiel 1 und 2, sowie entsprechend den Angaben in der allgemeinen Beschreibung der erfindungsgemäßen Herstellverfahren (a) bis (m) wurden auch die in der nachstehenden Tabelle 1 genannten Verbindungen der Formel (I) erhalten:

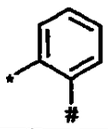
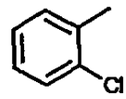
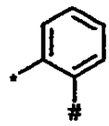
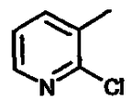
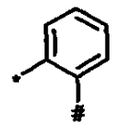
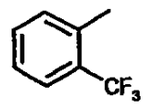
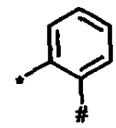
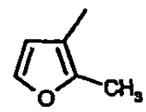
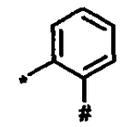
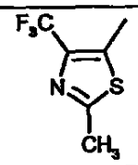
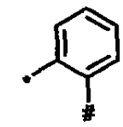
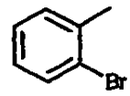
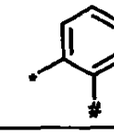
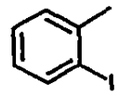
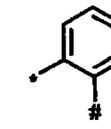
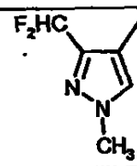
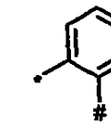
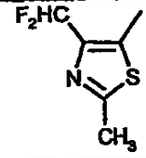
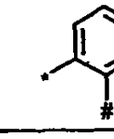
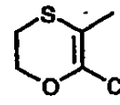
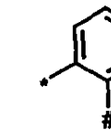
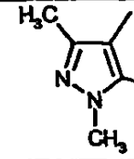
Tabelle 1

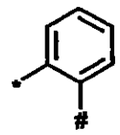
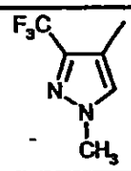
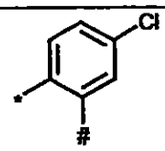
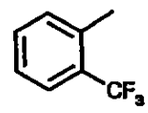
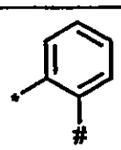
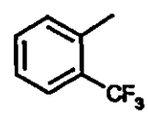
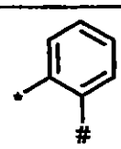
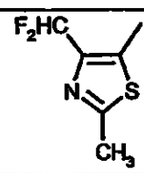
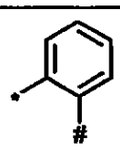
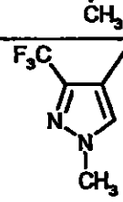
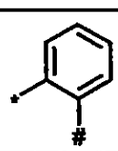
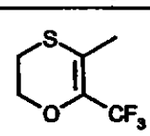
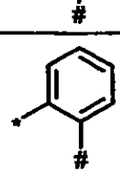
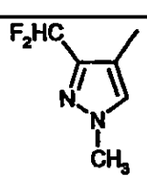
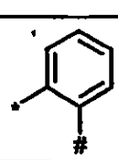
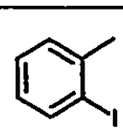
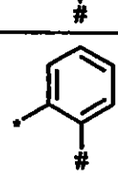
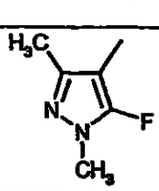
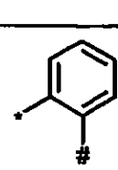
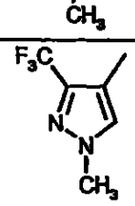


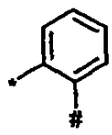
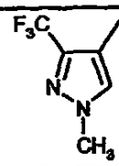
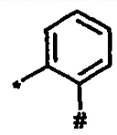
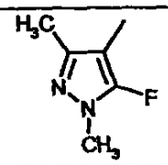
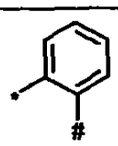
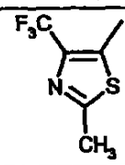
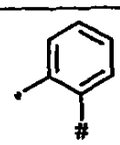
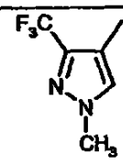
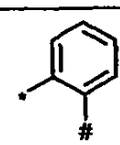
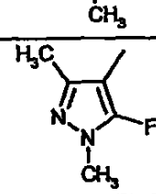
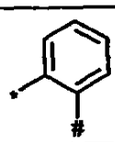
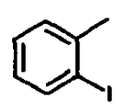
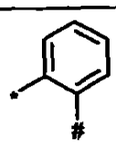
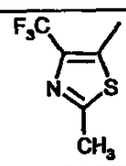
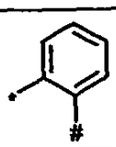
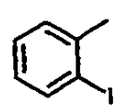
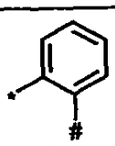
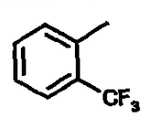
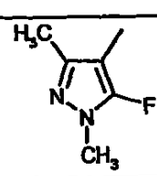
(I)

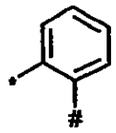
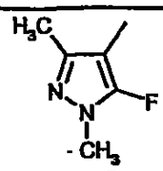
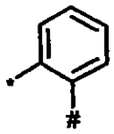
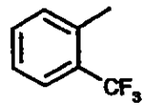
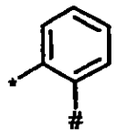
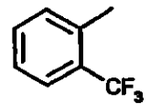
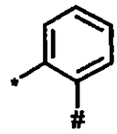
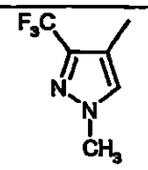
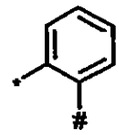
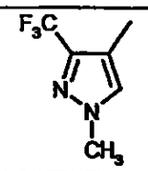
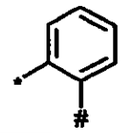
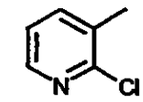
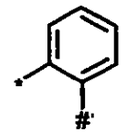
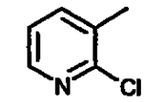
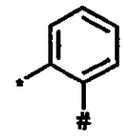
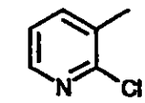
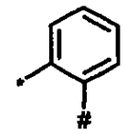
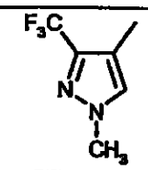
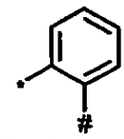
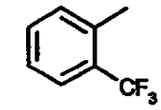
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
1	H		$-CH_2-O-CH_3$		2,18
2	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,07
3	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,30
4	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,38
5	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		1,68
6	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,53
7	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,43
8	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,21
9	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,35
10	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,39

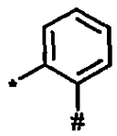
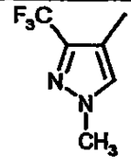
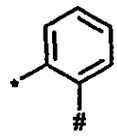
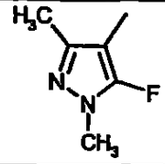
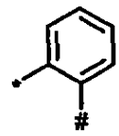
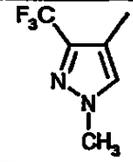
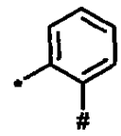
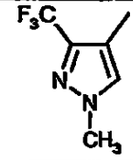
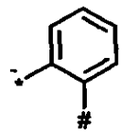
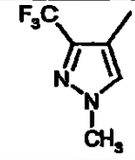
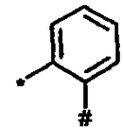
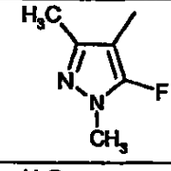
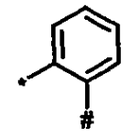
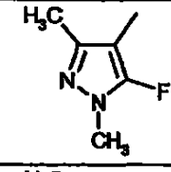
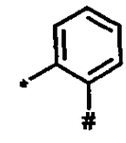
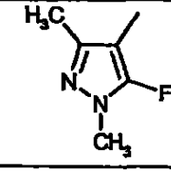
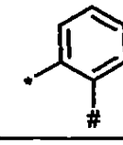
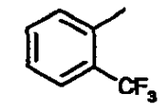
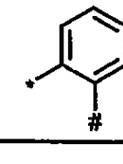
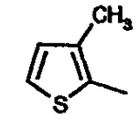
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
11	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		1,66
12	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,23
13	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,16
14	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		1,46
15	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,09
16	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		1,86
17	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		2,53
18	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,27
19	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		2,98
20	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		4,03

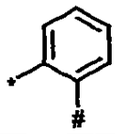
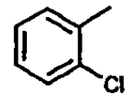
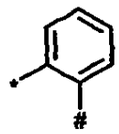
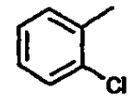
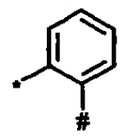
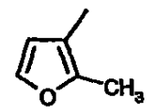
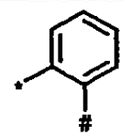
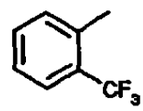
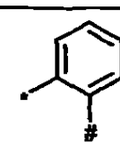
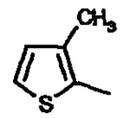
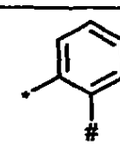
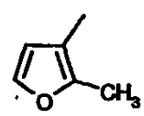
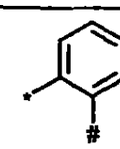
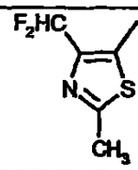
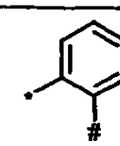
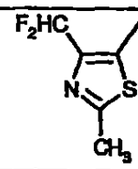
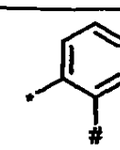
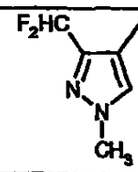
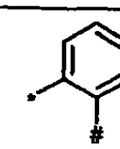
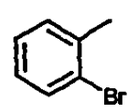
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
21	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,74
22	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		2,95
23	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,90
24	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,71
25	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,73
26	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,79
27	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,91
28	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,01
29	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,55
30	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,76
31	H		$-CH(CH_3)-O-CH_3$		2,17

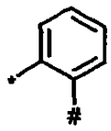
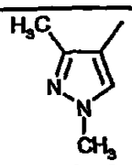
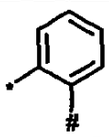
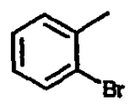
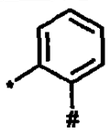
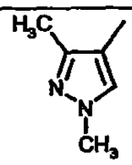
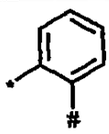
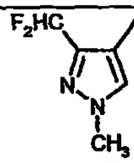
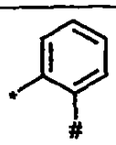
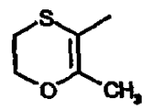
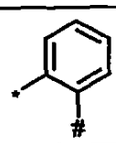
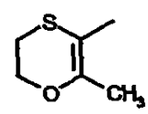
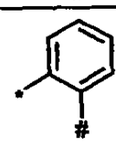
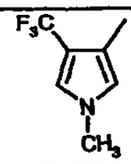
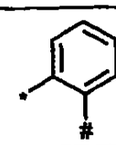
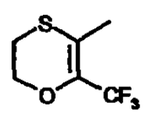
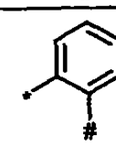
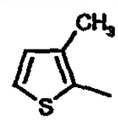
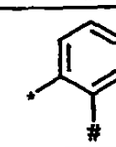
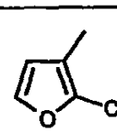
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
32	H		$-CH(CH_3)-O-CH_3$		2,46
33	H		$-CH(CH_3)-O-CH_3$		3,56
34	H		$-CH(CH_3)-O-CH_3$		2,99
35	H		$-CH_2-S-CH(CH_3)_2$		3,27
36	H		$-CH_2-S-CH(CH_3)_2$		3,05
37	H		$-CH_2-S-CH(CH_3)_2$		3,48
38	H		$-CH_2-S-CH(CH_3)_2$		2,76
39	H		$-CH_2-S-CH(CH_3)_2$		3,68
40	H		$-CH(CH_3)-NH-CH(CH_3)_2$		0,58
41	H		$-CH(CH_3)-NH-CH(CH_3)_2$		1,06

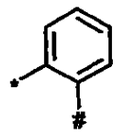
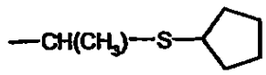
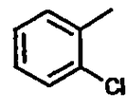
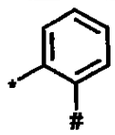
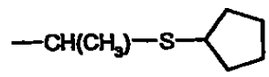
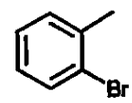
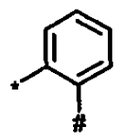
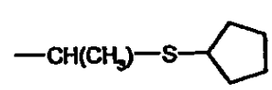
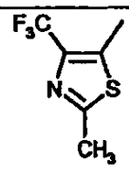
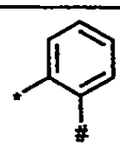
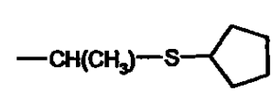
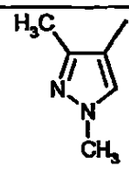
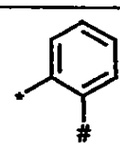
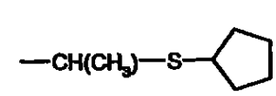
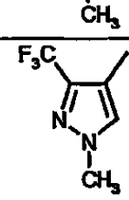
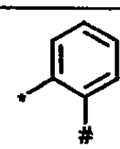
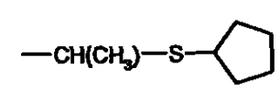
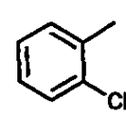
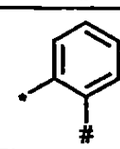
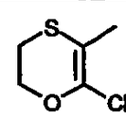
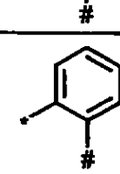
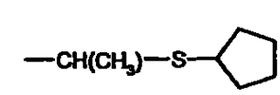
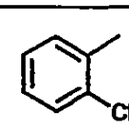
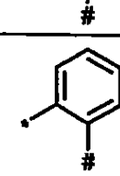
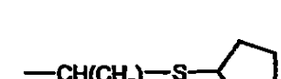
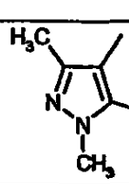
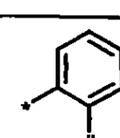
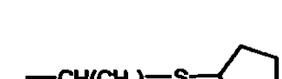
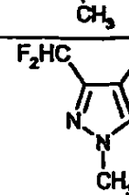
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
42	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,02
43	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		3,82
44	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,52
45	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		4,14
46	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		3,38
47	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,75
48	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		4,12
49	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		4,33
50	H		$-CH_2-O-C(O)-CHCl_2$		3,15
51	H		$-CH_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		2,39

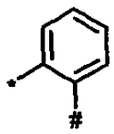
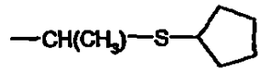
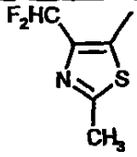
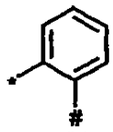
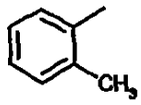
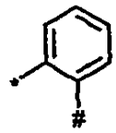
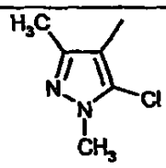
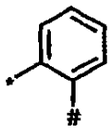
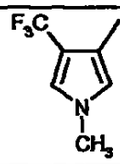
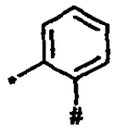
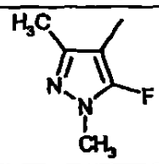
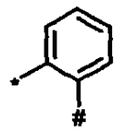
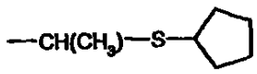
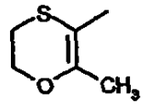
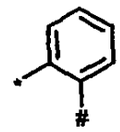
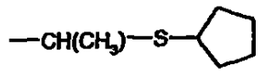
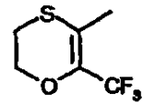
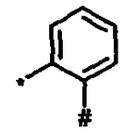
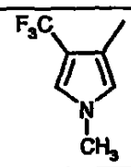
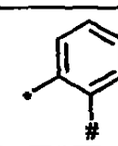
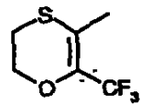
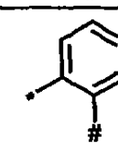
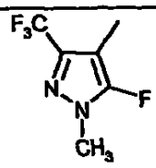
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
52	H		$-CH_2-O-C(O)-CHCl_2$		2,36
53	H		$-CH_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		3,24
54	H		$-CH_2-O-CH(CH_3)_2$		2,51
55	H		$-CH_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		2,74
56	H		$-CH_2-O-C(O)-CHCl_2$		2,69
57	H		$-CH_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		2,38
58	H		$-CH_2-O-C(O)-CHCl_2$		2,38
59	C(O)i-Pr		$-CH_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		3,49
60	H		$-CH_2-O-CH(CH_3)_2$		2,85
61	H		$-(CH_2)_2C(CH_3)_2-O-C(O)-CH_3$		3,30

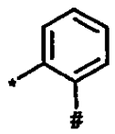
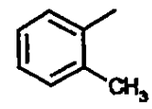
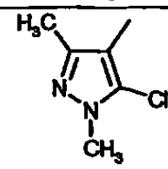
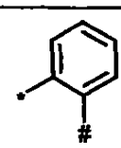
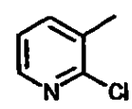
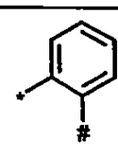
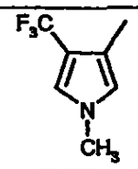
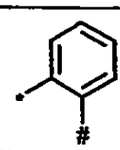
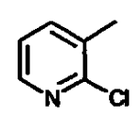
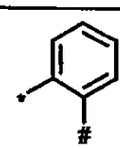
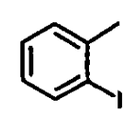
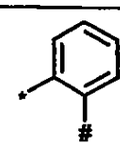
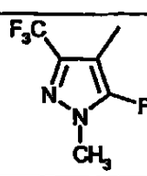
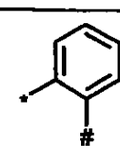
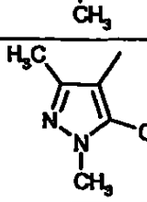
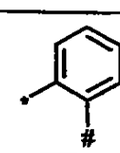
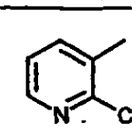
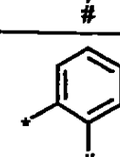
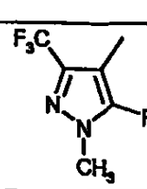
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
62	H		$-(CH_2)_2OH$		1,62
63	H		$-(CH_2)_2OH$		1,21
64	H		$-(CH_2)_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		2,79
65	H		$-(CH_2)_2-O-Si(CH_3)_2-C(CH_3)_3$		4,59
66	H		$-(CH_2)_2-O-C(O)-CHCl_2$		2,76
67	H		$-(CH_2)_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		2,40
68	H		$-(CH_2)_2-O-C(O)-CHCl_2$		2,43
69	H		$-(CH_2)_2-O-Si(CH_3)_2-C(CH_3)_3$		4,49
70	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,71
71	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,93

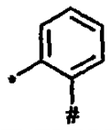
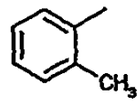
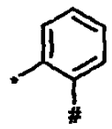
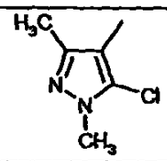
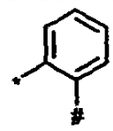
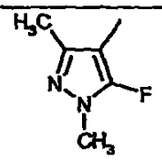
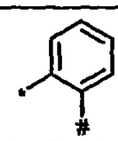
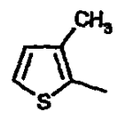
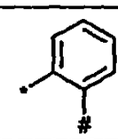
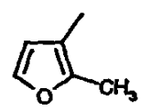
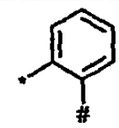
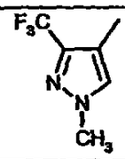
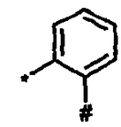
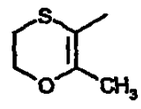
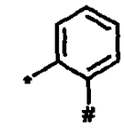
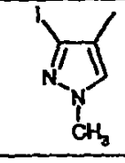
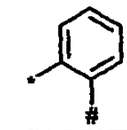
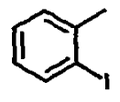
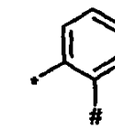
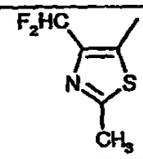
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
72	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,60
73	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		4,17
74	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		4,17
75	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		4,31
76	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		4,47
77	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,61
78	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		3,95
79	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,36
80	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		3,38
81	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,63

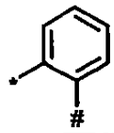
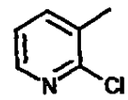
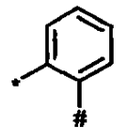
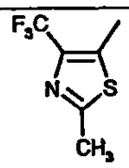
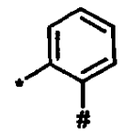
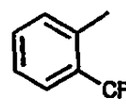
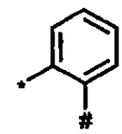
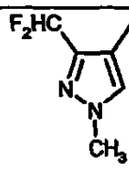
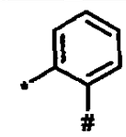
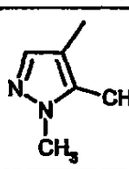
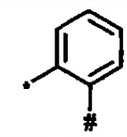
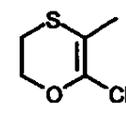
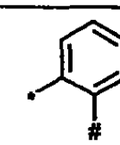
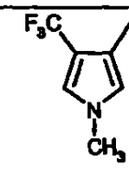
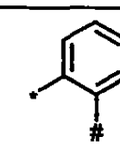
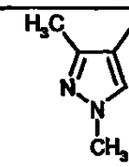
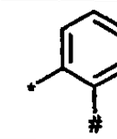
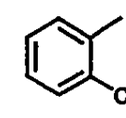
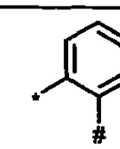
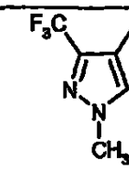
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
82	H		-CH(CH$_3$)-S-CH(CH$_3$)(CH$_2$)$_2$CH$_3$		3,27
83	H		-CH(CH$_3$)-S-CH(CH$_3$)CH$_2$CH$_3$		4,21
84	H		-CH(CH$_3$)-S-CH(CH$_3$)CH$_2$CH$_3$		2,90
85	H		-CH(CH$_3$)-S-CH(CH$_3$)(CH$_2$)$_2$CH$_3$		3,76
86	H		-CH(CH$_3$)-S-CH(CH$_3$)CH$_2$CH$_3$		4,07
87	H		-CH(CH$_3$)-S-CH(CH$_3$)(CH$_2$)$_2$CH$_3$		4,53
88	H		-CH(CH$_3$)-S-CH(CH$_3$)CH$_2$CH$_3$		3,92
89	H		-CH(CH$_3$)-S-CH(CH$_3$)CH$_2$CH$_3$		4,10
90	H		—CH(CH$_3$)—S— 		3,16
91	H		—CH(CH$_3$)—S— 		4,31

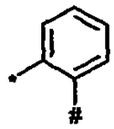
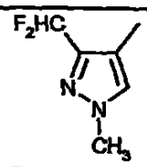
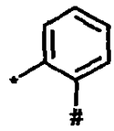
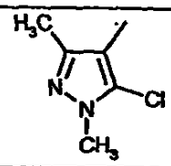
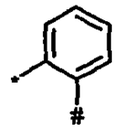
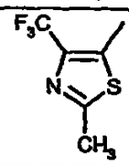
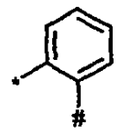
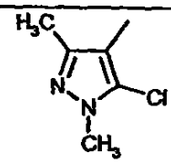
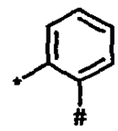
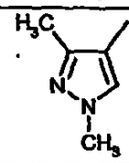
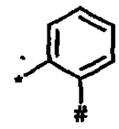
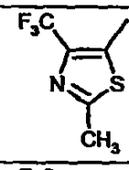
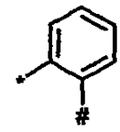
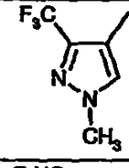
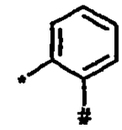
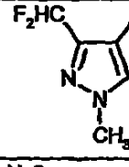
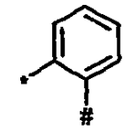
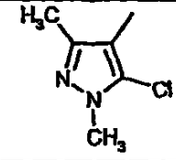
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
92	H				4,29
93	H				4,34
94	H				4,24
95	H				3,04
96	H				3,76
97	H				4,41
98	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,65
99	H				4,44
100	H				4,03
101	H				3,48

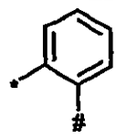
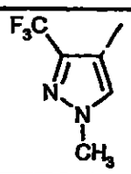
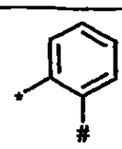
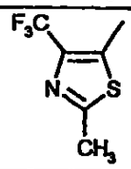
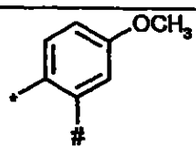
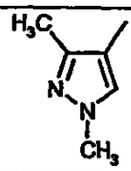
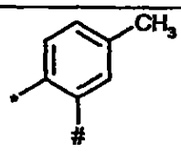
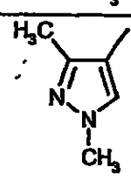
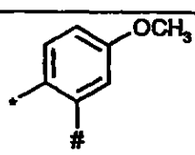
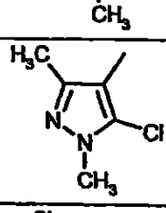
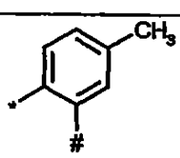
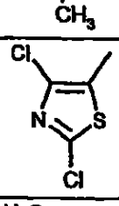
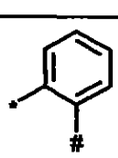
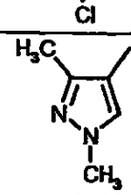
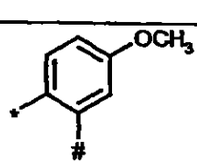
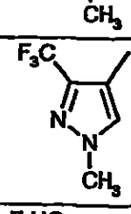
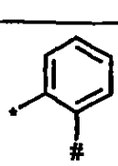
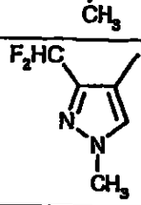
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
102	H				4,07
103	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,88
104	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,20
105	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,57
106	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)_2$		3,63
107	H				4,24
108	H				4,21
109	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,29
110	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,49
111	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,38

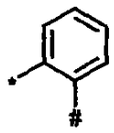
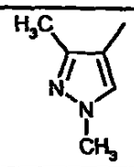
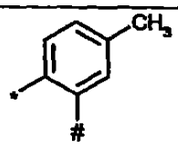
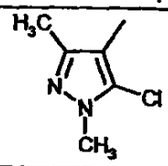
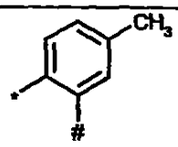
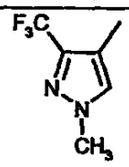
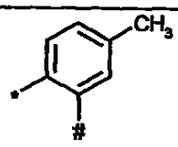
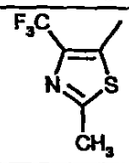
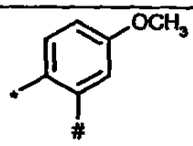
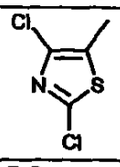
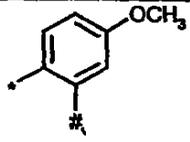
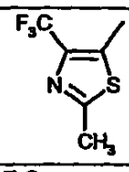
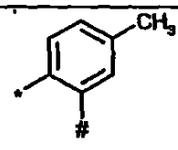
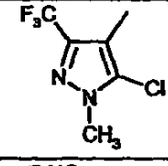
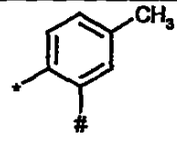
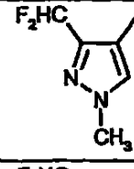
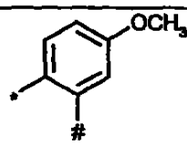
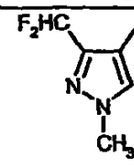
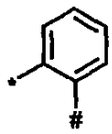
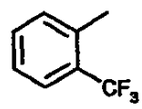
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
112	H		-CH(CH$_3$)-S-CH(CH$_3$)(CH$_2$)$_2$CH$_3$		4,76
113	H		-CH(CH$_3$)-S-CH(CH$_3$)(CH$_2$)$_2$CH$_3$		4,07
114	H		-CH(CH$_3$)-S-CH(CH$_3$)(CH$_2$)$_2$CH$_3$		3,79
115	H		—CH(CH$_3$)—S— 		4,02
116	H		—CH(CH$_3$)—S— 		3,46
117	H		—CH(CH$_3$)—S— 		4,45
118	H		—CH(CH$_3$)—S— 		4,12
119	H		—CH(CH$_3$)—S— 		3,76
120	H		-CH(CH$_3$)-S-CH(CH$_3$)CH$_2$CH$_3$		3,35
121	H		-CH(CH$_3$)-S-CH(CH$_3$)CH$_2$CH$_3$		3,99

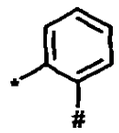
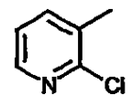
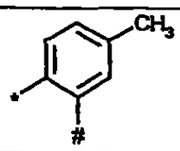
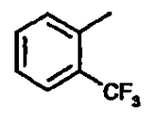
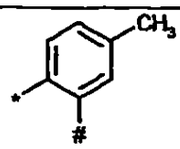
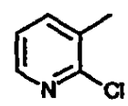
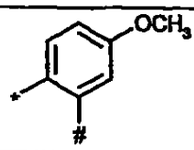
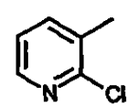
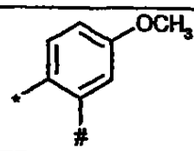
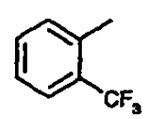
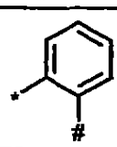
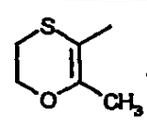
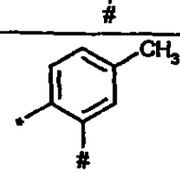
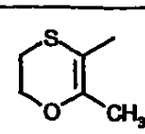
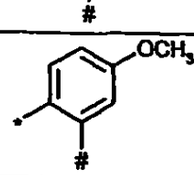
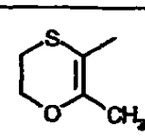
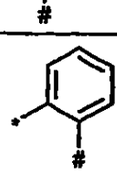
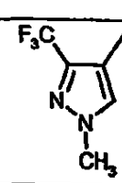
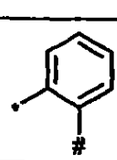
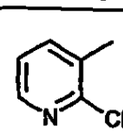
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
122	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		4,31
123	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		3,60
124	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		2,90
125	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		4,50
126	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		3,80
127	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		3,14
128	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		3,47
129	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		2,75
130	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		3,83
131	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		3,58

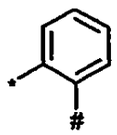
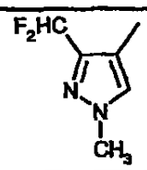
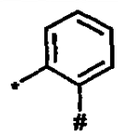
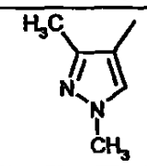
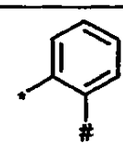
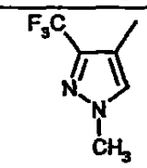
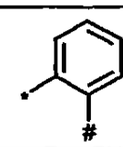
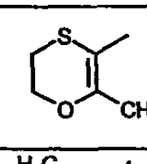
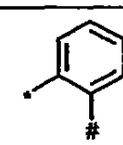
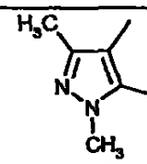
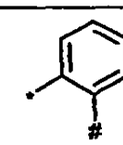
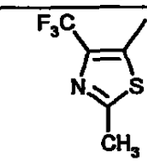
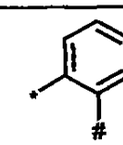
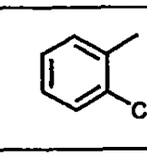
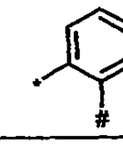
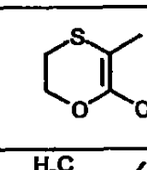
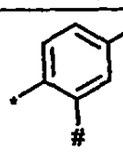
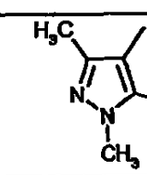
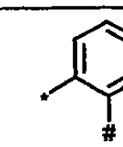
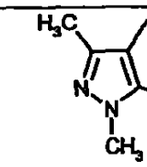
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
132	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		2,72
133	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		3,65
134	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		3,81
135	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		2,89
136	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		3,67
137	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		3,64
138	H		$-CH(CH_3)-O-CH(CH_3)_2$		5,60
139	H		$-CH_2-N(CH_3)_2$		98°C
140	H		$-CH_2-N(CH_3)_2$		
141	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		

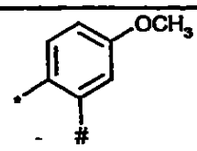
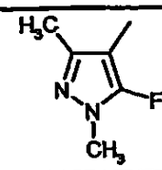
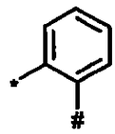
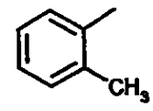
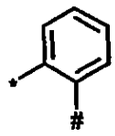
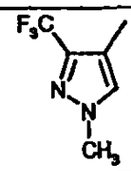
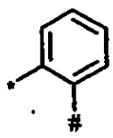
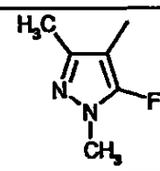
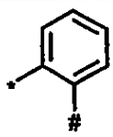
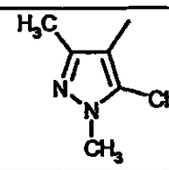
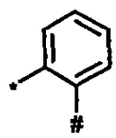
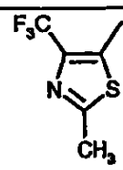
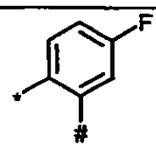
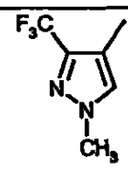
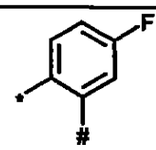
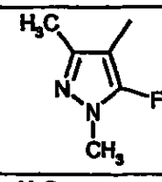
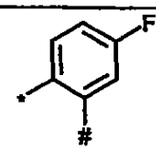
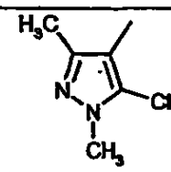
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
142	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		103°C
143	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		96°C
144	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		
145	H		$-CH_2-SO-CH_2CH_3$		
146	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		105°C
147	H		$-CH_2-SO-CH_2CH_3$		
148	H		$-CH_2-SO-CH_2CH_3$		
149	H		$-CH_2-SO-CH_2CH_3$		
150	H		$-CH_2-SO_2-CH_2CH_3$		148°C

Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
151	H		$-CH_2-SO_2-CH_2CH_3$		135°C
152	H		$-CH_2-SO_2-CH_2CH_3$		142°C
153	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		142°C
154	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		116°C
155	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		125°C
156	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		72°C
157	H		$-CH_2-SO_2-CH_2CH_3$		
158	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		135°C
159	H		$-CH_2-SO_2-CH_2CH_3$		143°C

Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
160	H		$-CH_2-SO-CH_2CH_3$		
161	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		127°C
162	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		
163	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		
164	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		116°C
165	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		98°C
166	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		132°C
167	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		86°C
168	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		110°C
169	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		79°C

Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
170	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		75°C
171	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		105°C
172	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		112°C
173	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		138°C
174	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		120°C
175	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		71°C
176	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		
177	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		68°C
178	H		$-CH_2-OH$		1,61
179	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		92°C

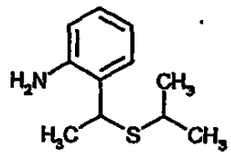
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
180	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		
181	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		86°C
182	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		82°C
183	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		45°C
184	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		
185	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		
186	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		94°C
187	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		77°C
188	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		96°C
189	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		

Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Fp. (°C)
190	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		147°C
191	H		$-CH_2-S-CH_3$		
192	H		$-CH(CH_3)-S-CH_2CH_3$		
193	H		$-CH(CH_3)-S-CH_2CH_3$		
194	H		$-CH(CH_3)-S-CH_2CH_3$		
195	H		$-CH(CH_3)-S-CH_2CH_3$		
196	H		$-CH(CH_3)-S-CH_2CH_3$		
197	H		$-CH(CH_3)-S-CH_2CH_3$		
198	H		$-CH(CH_3)-S-CH_2CH_3$		

) Die mit „“ markierte Bindung ist mit dem Amid verknüpft.

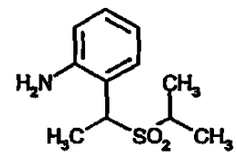
Herstellung der Ausgangsstoffe der Formel (III)

Beispiel (III-1)



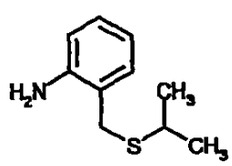
44 g (0,188 mol) 1-[1-(Isopropylthio)ethyl]-2-nitrobenzol (VII-1) werden in 250 ml Ethanol gelöst, mit 3 g Raney-Nickel versetzt und im Autoklav bei Raumtemperatur 6 Stunden mit 3 bar Wasserstoff hydriert. Nach 6 Stunden werden erneut 3 g Raney-Nickel hinzugegeben und weitere 16 Stunden bei Raumtemperatur mit 3 bar Wasserstoff hydriert. Zur Aufarbeitung wird vom Katalysator abfiltriert und das Lösungsmittel in Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch gereinigt (Kieselgel, Hexan/Methyl-tert-butylether 3:1). Man erhält 32 g (Gehalt 97,3 %, HPLC, 84,4 % der Theorie) an 2-[1-(Isopropylthio)ethyl]anilin in Form eines gelben Öls [logP (pH 2,3) = 2,45].

Beispiel (III-2)



In einem 500 ml Dreihalskolben mit Rührer und Thermometer werden 16,2 g (60,5 mmol) 1-[1-(Isopropylsulfonyl)ethyl]-2-nitrobenzol (VII-4) in 160 ml Methanol vorgelegt, unter Rühren mit 160 ml konzentrierter Salzsäure versetzt und bei 20-40°C portionsweise 31,5 g Zinnpulver (265,2 mmol) zugegeben. Die Mischung wird bei 40°C ca. 1 Stunde nachgerührt. Zur Aufarbeitung wird abgekühlt, filtriert und mit 1575 ml einer eisgekühlten 10%igen Natronlauge verrührt. Man extrahiert zweimal mit Dichlormethan, trocknet über Natriumsulfat und zieht das Lösungsmittel im Vakuum ab. Man erhält 13,3 g (Gehalt 95,8 %, HPLC, 92,6 % der Theorie) an 2-[1-(Isopropylsulfonyl)ethyl]anilin [logP (pH 2,3) = 1,28].

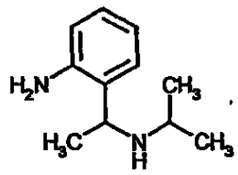
Beispiel (III-3)



In einem 500 ml Dreihalskolben mit Rührer und Thermometer werden 11,8 g (55,6 mmol) 1-[1-(Isopropylthio)methyl]-2-nitrobenzol (VII-2) in 150 ml Methanol vorgelegt, unter Rühren mit 150 ml konzentrierter Salzsäure versetzt und bei 20-40°C portionsweise 17,6 g Zinnpulver (148,5 mmol) zu-

gegeben. Die Mischung wird bei 40°C für ca. 1 Stunde nachgerührt. Zur Aufarbeitung wird abgekühlt, filtriert und mit 1300 ml einer eisgekühlten 10%igen Natronlauge verrührt. Man extrahiert zweimal mit Dichlormethan, trocknet über Natriumsulfat und verdampft das Lösungsmittel im Vakuum. Das Rohprodukt wird mit Hexan/Methyl-tert-butylether 3:1 an Kieselgel gereinigt. Man erhält 4,6 g (Gehalt 94,6 %, HPLC, 43,2 % der Theorie) an 2-[(Isopropylthio)methyl]anilin in Form eines gelben Öls [logP (pH 2,3) = 1,94].

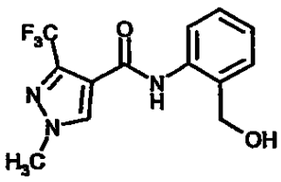
Beispiel (III-4)



In einem Autoklav wird eine Lösung von 5 g N-[1-(2-Nitrophenyl)ethyl]propan-2-amin (VII-5) (24 mmol) in 30 ml Methanol mit 0,5 g Raney-Nickel versetzt und 5 Stunden bei 50°C und 50 bar Wasserstoff hydriert. Zur Aufarbeitung wird abgekühlt, der Katalysator abfiltriert und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Man erhält 2,8 g (Gehalt 98,1 %, 64,2 % der Theorie) an 2-[1-(Isopropylamino)ethyl]anilin [logP (pH 2,3) = 0,05].

Herstellung der Ausgangsstoffe der Formel (IV)

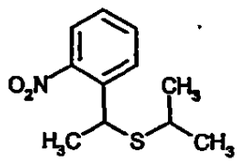
Beispiel (IV-1)



Bei Raumtemperatur wird eine Lösung bestehend aus 34,5 g (0,16 Mol) 1-Methyl-3-trifluoromethyl-1H-pyrazol-4-carbonsäurechlorid in 50 ml Tetrahydrofuran zu einer Lösung bestehend aus 20,0 g (0,16 Mol) (2-Amino-phenyl)-methanol und 36 ml (0,26 Mol) Triethylamin in 250 ml Tetrahydrofuran getropft. Nach Abklingen der exothermen Wärmetönung wird für 6 Stunden rückflussiert und weitere 48 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Die Reaktionsmischung wird auf ca. 250 ml Wasser gegeben, mit Essigsäureethylester extrahiert, mit 2 N Salzsäure gewaschen, über Magnesiumsulfat getrocknet und im Vakuum aufkonzentriert. Säulenchromatographie (Gradient Cyclohexan/Essigsäureethylester) liefert 33,8 g (69 % der Theorie) an N-[2-(Hydroxymethyl)phenyl]-1-methyl-3-(trifluormethyl)-1H-pyrazol-4-carboxamid [logP (pH 2,3) = 1,55].

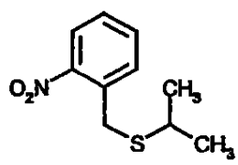
Herstellung der Ausgangsstoffe der Formel (VII)

Beispiel (VII-1)



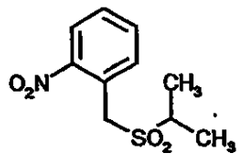
In einem 1 Liter-Dreihalskolben mit Rührer, Tropftrichter und Thermometer werden 34,8 g (0,354 mol) Natrium-2-propanthiolat in 450 ml Acetonitril vorgelegt und bei einer Temperatur von 30-40°C 63 g 1-(1-Chlorethyl)-2-nitrobenzol (VIII-1) (Gehalt 99,4 %, 0,337 mol) in 20 ml Acetonitril gelöst zugetropft. Die Suspension wird noch 16 Stunden bei 40°C nachgerührt, abgekühlt und das Lösungsmittel im Vakuum abgezogen. Der verbleibende Rückstand wird in Dichlormethan aufgenommen, gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch gereinigt (Kieselgel, Hexan/Aceton 29:1). Man erhält 48 g (Gehalt 98,8 %, HPLC, 62,4 % der Theorie) an 1-[1-(Isopropylthio)ethyl]-2-nitrobenzol in Form eines gelben Öls [logP (pH 2,3) = 3,89].

Beispiel (VII-2)



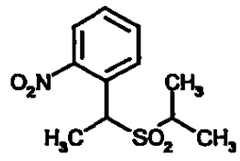
In einem 250 ml Dreihalskolben mit Rührer, Tropftrichter und Thermometer werden 10,3 g (0,105 mol) Natrium-2-propanthiolat in 75 ml Acetonitril vorgelegt und unter Kühlung bei 30-40°C eine Lösung von 17,2 g (0,1 mol) 2-Nitrobenzylchlorid in 20 ml Acetonitril zugetropft. Die Suspension wird 16 Stunden bei 40-50 °C nachgerührt. Zur Vervollständigung der Umsetzung werden noch 6 g Natrium-2-propanthiolat (0,061 mol) zugesetzt und weitere 24 Stunden bei 40-50°C gerührt. Zur Aufarbeitung wird abgekühlt und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Der Rückstand wird in Methyl-tert-butylether aufgenommen, gewaschen und über Natriumsulfat getrocknet. Das Natriumsulfat wird abfiltriert und die Lösung im Vakuum eingeengt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch gereinigt (Kieselgel, Cyclohexan/Essigsäureethylester 50:1). Man erhält 11,8 g (Gehalt 92 %, HPLC, 51,2 % der Theorie) an 1-[1-(Isopropylthio)methyl]-2-nitrobenzol in Form eines braunen Öls [logP (pH 2,3) = 3,28].

Beispiel (VII-3)



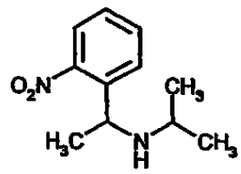
In einem 1 Liter-Dreihalskolben mit Rührer, Tropftrichter und Thermometer werden 32,8 g 1-[1-(Isopropylthio)methyl]-2-nitrobenzol (VII-2) (0,155 mol) in 465 ml Dichlormethan vorgelegt und unter Rühren nacheinander 14,3 g Ameisensäure (0,31 mol) und 1,6 g Ammoniummolybdat zugegeben. Unter schnellem Rühren werden bei Raumtemperatur 45,3 g (0,466 mol) 35%ige wässrige Wasserstoffperoxidlösung zugetropft. Die Mischung wird 16 Stunden nachgerührt. Zur Aufarbeitung wird die organische Phase abgetrennt, jeweils einmal mit verdünnter Natriumhydrogensulfit-Lösung und mit Wasser gewaschen und die organische Lösung über Natriumsulfat getrocknet. Das Lösungsmittel wird im Vakuum abdestilliert und der Rückstand mit Diethylether verrührt, das ausgefallene Produkt abgesaugt und getrocknet. Man erhält 30,5 g (Gehalt 99 %, HPLC, 80 % der Theorie) an 1-[(Isopropylsulfonyl)methyl]-2-nitrobenzol in Form eines gelben Feststoffes [logP (pH 2,3) = 1,63].

Beispiel (VII-4)



In einem 1 Liter-Dreihalskolben mit Rührer und Thermometer werden 18,9 g (77,7 mmol) 1-[(Isopropylsulfonyl)methyl]-2-nitrobenzol (VII-3) in 390 ml Acetonitril vorgelegt und nacheinander 90,1 g (652 mmol) Kaliumcarbonat, 0,26 g 18-Krone-6 und 12,1 g (85,5 mmol) Iodmethan zugegeben. Man rührt 4 Stunden unter Rückfluss, setzt dann noch 2,5 g Iodmethan (17,6 mmol) nach und rührt weitere 4 Stunden unter Rückfluss. Zur Aufarbeitung wird abgekühlt und im Vakuum eingeengt. Der Rückstand wird in Essigsäureethylester aufgenommen, mit Wasser gewaschen und über Natriumsulfat getrocknet. Nach dem Abziehen des Lösungsmittels wird das Rohprodukt säulenchromatographisch gereinigt (Kieselgel, Hexan/Aceton 7:3). Man erhält 16,2 g (Gehalt 96,1 %, HPLC, 77,9 % der Theorie) an 1-[1-(Isopropylsulfonyl)ethyl]-2-nitrobenzol [logP (pH 2,3) = 1,99].

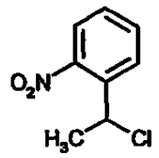
Beispiel (VII-5)



In einem Autoklav werden 13,8 g 1-(1-Chlorethyl)-2-nitrobenzol (VIII-1) (98,3%ig, 73,1 mmol) und 43,2 g Isopropylamin (731 mmol) 24 Stunden bei 60°C und Eigendruck gerührt. Nach dem Abkühlen des Reaktionsgemisches wird das überschüssige Isopropylamin im Vakuum entfernt und das Rohprodukt mit Cyclohexan/Essigsäureethylester 4:1 an Kieselgel gereinigt. Man erhält 5 g (Gehalt 94,4 %, 31 % der Theorie) an N-[1-(2-Nitrophenyl)ethyl]propan-2-amin in Form eines Öls [logP (pH 2,3) = 0,55].

Herstellung der Ausgangsstoffe der Formel (VIII)

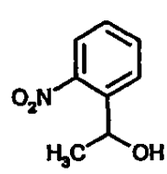
Beispiel (VIII-1)



In einem 6 Liter-Dreihalskolben mit Rührer, Tropftrichter und Thermometer werden 311 g 1-(2-Nitrophenyl)ethanol (XI-1) (Gehalt 95,8 %, 1,78 mol) in 3000 ml Dimethylformamid gelöst. Unter Rühren werden in einer Portion 921,4 g (7,13 mol) Diisopropylethylamin zugegeben, 5 Minuten gerührt und bei guter Kühlung in einem Temperaturbereich zwischen 20 und 35°C 612,5 g (5,35 mol) Methansulfonsäurechlorid zugetropft. Nach Abklingen der Reaktion wird noch 90 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, unter Vakuum das Lösungsmittel entfernt, in Essigsäureethylester aufgenommen, 3 mal mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Das Rohprodukt wird säulenchromatographisch gereinigt (Kieselgel, Hexan/Aceton 9:1). Man erhält 219 g (Gehalt 100 %, HPLC, 66,2 % der Theorie) an 1-(1-Chlorethyl)-2-nitrobenzol in Form eines bräunlichen Öls [logP (pH 2,3) = 2,87].

Herstellung der Ausgangsstoffe der Formel (XI)

Beispiel (XI-1)



In einem 6-Liter Dreihalskolben mit Rührer, Tropftrichter, Thermometer und Blasenzähler werden 320 g (1,938 mol) 2-Nitroacetophenon in 3200 ml Methanol vorgelegt und unter schwacher Kühlung bei 30-40°C eine Lösung von 73,3 g (1,938 mol) Natriumborhydrid in 288 ml Wasser zugetropft. Nach Abklingen der Reaktion wird noch 16 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt. Zur Aufarbeitung wird mit verdünnter Salzsäure neutralisiert und das Lösungsmittel am Rotationsverdampfer ab-

gezogen. Der verbliebene Rückstand wird mit Dichlormethan aufgenommen, mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet und das Lösungsmittel im Vakuum entfernt. Man erhält 311 g (Gehalt 95,1 %, HPLC, 91,3 % der Theorie) von 1-(2-Nitrophenyl)ethanol [logP (pH 2,3) = 1,49] in Form eines hellen Öls.

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

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

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

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

Anwendungsbeispiele

Beispiel A

Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

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

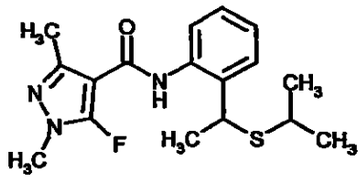
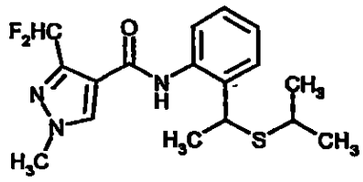
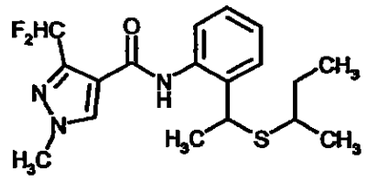
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Sporensuspension des Apfelmehltauerregers Podosphaera leucotricha inokuliert. Die Pflanzen werden dann im Gewächshaus bei ca. 23°C und einer relativen Luftfeuchtigkeit von ca. 70 % aufgestellt.

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

Tabelle A

Podosphaera-Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	100	91
	100	84
	100	94

Beispiel B

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

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

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

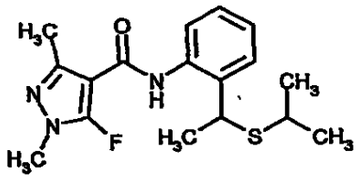
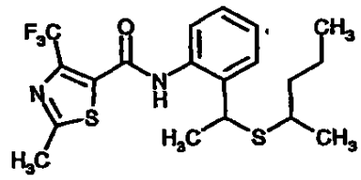
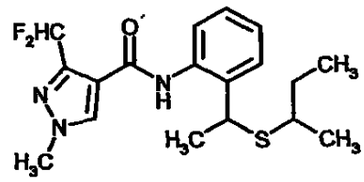
Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer wässrigen Konidiensuspension des Apfelschorferregers Venturia inaequalis inokuliert und verbleiben dann 1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

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

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

Tabelle B

Venturia - Test (Apfel) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	100	95
	100	89
	100	99

Beispiel C

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

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

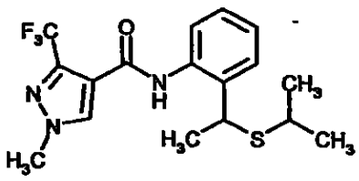
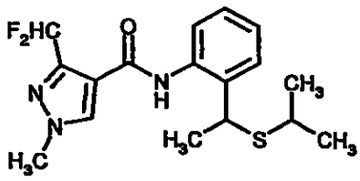
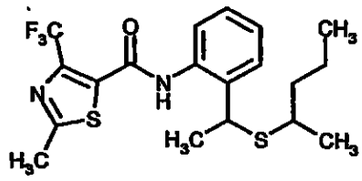
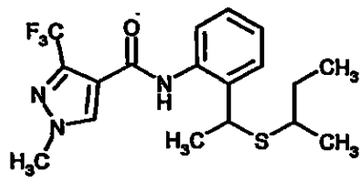
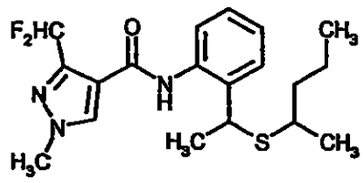
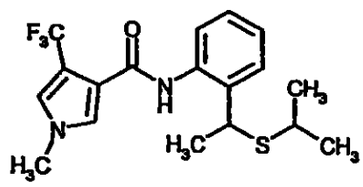
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

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

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

Tabelle C

Botrytis - Test (Bohne) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	84
	500	100
	500	99
	500	100
	500	97
	500	97

Beispiel D

Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

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

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

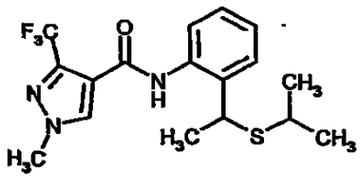
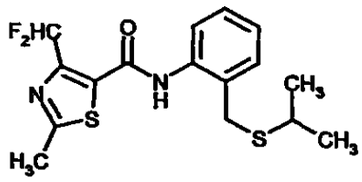
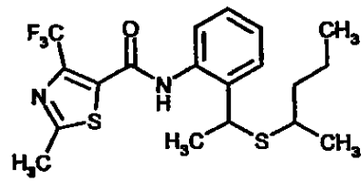
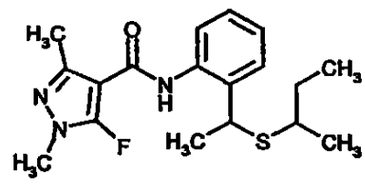
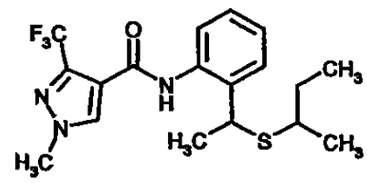
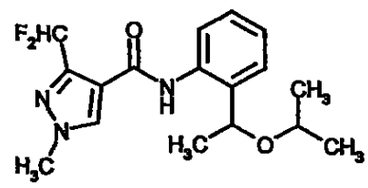
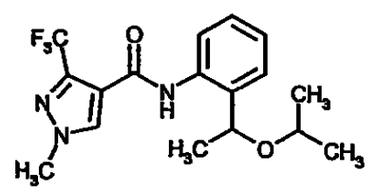
Zur Prüfung auf protektive Wirksamkeit werden junge Pflanzen mit der Wirkstoffzubereitung in der angegebenen Aufwandmenge besprüht. Nach Antrocknen des Spritzbelages werden die Pflanzen mit einer Konidiensuspension von Puccinia recondita besprüht. Die Pflanzen verbleiben 48 Stunden bei 20°C und 100 %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

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

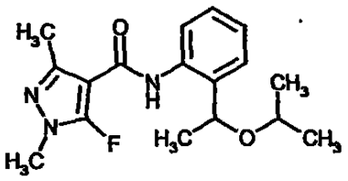
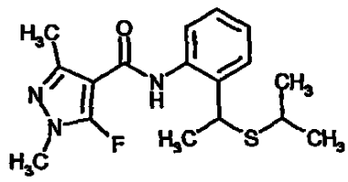
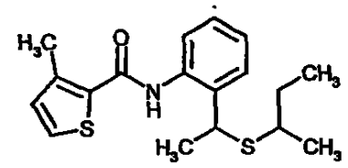
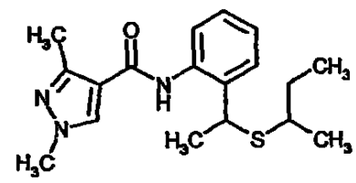
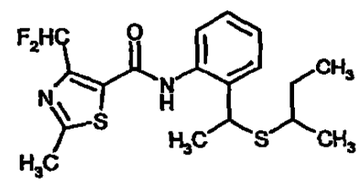
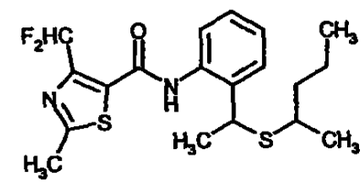
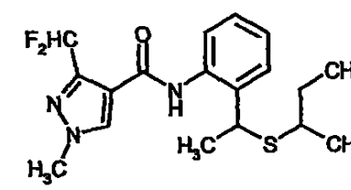
10 Tage nach der Inokulation erfolgt die Auswertung. Dabei bedeutet 0 % ein Wirkungsgrad, der demjenigen der Kontrolle entspricht, während ein Wirkungsgrad von 100 % bedeutet, dass kein Befall beobachtet wird.

Tabelle D

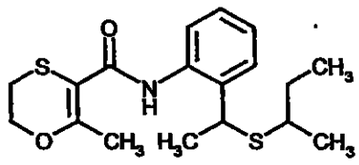
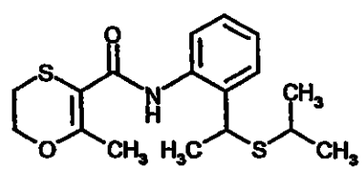
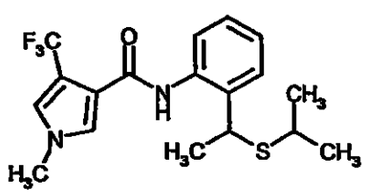
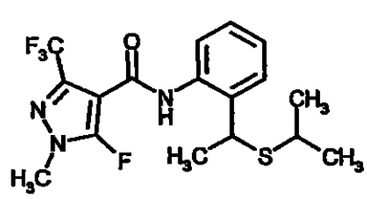
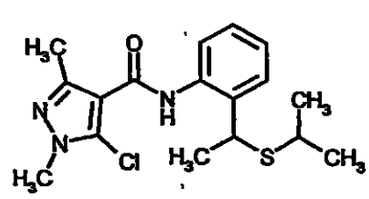
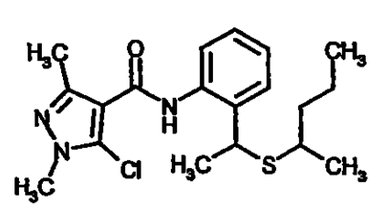
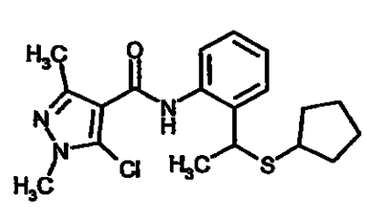
Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

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

Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

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

Puccinia-Test (Weizen) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	500	100
	500	100
	500	100
	500	96
	500	100
	500	100
	500	100

Beispiel E

Alternaria-Test (Tomate) / protektiv

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

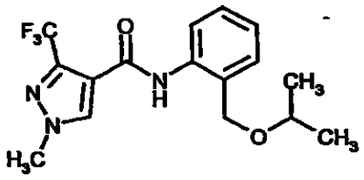
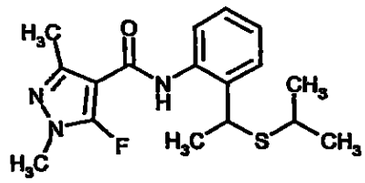
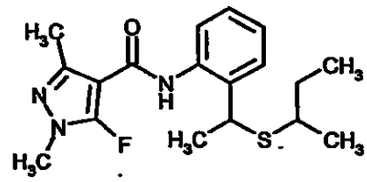
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

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

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

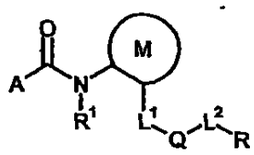
Tabelle E

Alternaria-Test (Tomate) / protektiv

Wirkstoff Erfindungsgemäß	Aufwandmenge an Wirkstoff in g/ha	Wirkungsgrad in %
	750	95
	750	90
	750	95

Patentansprüche

1. Carboxamide der Formel (I)



(I)

in welcher

R^1 für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkylsulfinyl, C_1-C_6-Alkylsulfonyl, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Cycloalkyl; C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkylthio, C_1-C_4-Halogenalkylsulfinyl, C_1-C_4-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkyl)carbonyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl; Halogen-(C_1-C_3-alkyl)carbonyl-C_1-C_3-alkyl, Halogen-(C_1-C_3-alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C_1-C_8-Alkyl)carbonyl, (C_1-C_6-Alkoxy)carbonyl, (C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl)carbonyl, (C_3-C_8-Cycloalkyl)carbonyl; (C_1-C_6-Halogenalkyl)carbonyl, (C_1-C_6-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl)carbonyl, (C_3-C_8-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$ steht,

R^2 für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Cycloalkyl; C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkoxy, Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R^3 und R^4 unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Cycloalkyl; C_1-C_8-Halogenalkyl, Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R^3 und R^4 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1-C_4-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann,

R^5 und R^6 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_3-C_8-Cycloalkyl; C_1-C_8-Halogenalkyl, C_3-C_8-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

R^5 und R^6 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1-C_4-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 bis 8 Ringatomen bilden,

wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann,

R^7 für Wasserstoff oder C_1-C_6-Alkyl steht,

M für einen jeweils einfach durch R^8 substituierten Phenyl-, Pyridin- oder Pyrimidin-, Pyridazin oder Pyrazin-Ring oder für einen durch R^{8-A} substituierten Thiazol-Ring steht,

R^8 für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

R^8 außerdem für Methoxy steht,

R^{8-A} für Wasserstoff, Methyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

L^1 für C_1-C_{10}-Alkylen (Alkandiyl) steht,

Q für O, S, SO, SO_2 oder NR^9 steht,

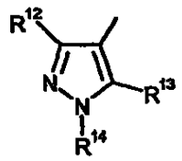
L^2 für eine direkte Bindung, $SiR^{10}R^{11}$ oder CO steht,

R für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_1-C_8-Alkoxy, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Alkylthio-C_1-C_4-alkyl, C_2-C_8-Alkenyl, C_2-C_8-Alkinyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_2-C_6-Halogenalkenyl, C_2-C_6-Halogenalkinyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl steht,

R^9 für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Alkylthio-C_1-C_4-alkyl, C_2-C_8-Alkenyl, C_2-C_8-Alkinyl, C_1-C_6-Halogenalkyl, C_2-C_6-Halogenalkenyl, C_2-C_6-Halogenalkinyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl steht,

R^{10} und R^{11} unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_1-C_8-Alkoxy, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Alkylthio-C_1-C_4-alkyl oder C_1-C_6-Halogenalkyl stehen,

A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht, in welcher

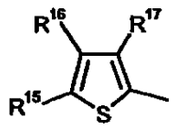
R^{12} für Wasserstoff, Cyano, Halogen, Nitro, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, C_3-C_6-Cycloalkyl, C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkoxy oder C_1-C_4-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, Aminocarbonyl oder Aminocarbonyl-C_1-C_4-alkyl steht,

R^{13} für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy oder C_1-C_4-Alkylthio steht,

R^{14} für Wasserstoff, C_1-C_4-Alkyl, Hydroxy-C_1-C_4-alkyl, C_2-C_6-Alkenyl, C_3-C_6-Cycloalkyl, C_1-C_4-Alkylthio-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkylthio-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Halogenalkoxy-C_1-C_4-alkyl mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, oder Phenyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A2)



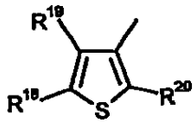
(A2) steht, in welcher

R^{15} und R^{16} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{17} für Halogen, Cyano oder C_1-C_4-Alkyl, oder C_1-C_4-Halogenalkyl oder C_1-C_4-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A3)



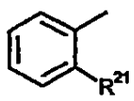
(A3) steht, in welcher

R^{18} und R^{19} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{20} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)

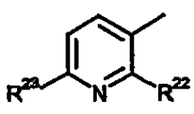


(A4) steht, in welcher

R^{21} für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Cyano, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkoxy oder C_1-C_4-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)



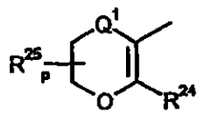
(A5) steht, in welcher

R^{22} für Halogen, Hydroxy, Cyano, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkylthio oder C_1-C_4-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{23} für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen, C_1-C_4-Alkylsulphinyl oder C_1-C_4-Alkylsulphonyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A6)



(A6) steht, in welcher

R^{24} für C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

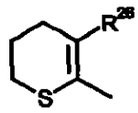
R^{25} für C_1-C_4-Alkyl steht,

Q^1 für S (Schwefel), SO, SO_2 oder CH_2 steht,

p für 0, 1 oder 2, wobei R^{25} für identische oder verschiedene Reste steht, wenn p für 2 steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)

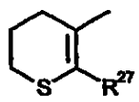


(A7) steht, in welcher

R^{26} für C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A8)

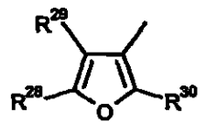


(A8) steht, in welcher

R^{27} für C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A9)



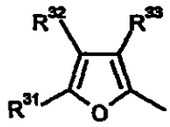
(A9) steht, in welcher

R^{28} und R^{29} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen stehen,

R^{30} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)



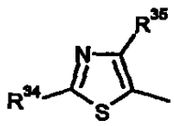
(A10) steht, in welcher

R^{31} und R^{32} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Amino, Nitro, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl having 1 bis 5 Halogenatomen stehen,

R^{33} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



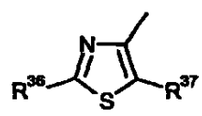
(A11) steht, in welcher

R^{34} für Wasserstoff, Halogen, Amino, C_1-C_4-Alkylamino, Di-(C_1-C_4-alkyl)amino, Cyano, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{35} für Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A12)



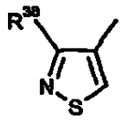
(A12) steht, in welcher

R^{36} für Wasserstoff, Halogen, Amino, C_1-C_4-Alkylamino, Di-(C_1-C_4-alkyl)amino, Cyano, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{37} für Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A13)

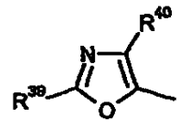


(A13) steht, in welcher

R^{38} für Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A14)



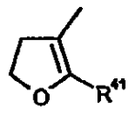
(A14) steht, in welcher

R^{39} für Wasserstoff oder C_1-C_4-Alkyl steht,

R^{40} für Halogen oder C_1-C_4-Alkyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A15)

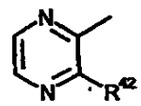


(A15) steht, in welcher

R^{41} für C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A16)

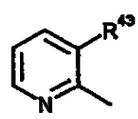


(A16) steht, in welcher

R^{42} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A17)

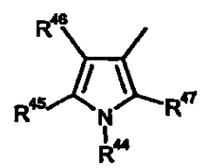


(A17) steht, in welcher

R^{43} für Halogen, Hydroxy, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_4-Alkylthio, C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkylthio oder C_1-C_4-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A18)



(A18) steht, in welcher

R^{44} für Wasserstoff, Cyano, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, Hydroxy-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Alkylsulfonyl, Di(C_1-C_4-alkyl)aminosulfonyl, C_1-C_6-Alkylcarbonyl oder jeweils gegebenenfalls substituiertes Phenylsulfonyl oder Benzoyl steht,

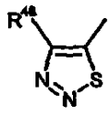
R^{45} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{46} für Wasserstoff, Halogen, Cyano, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

R^{47} für Wasserstoff, Halogen, C_1-C_4-Alkyl oder C_1-C_4-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Halogenatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A19)



(A19) steht, in welcher

R^{48} für C_1-C_4-Alkyl steht.

2. Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher R nicht für Alkoxy steht, wenn L^2 für eine direkte Bindung steht.

3. Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 oder 2, in welcher

R^1 für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkylsulfinyl, C_1-C_6-Alkylsulfonyl, C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl; C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_6-Halogenalkylthio, C_1-C_6-Halogenalkylsulfinyl, C_1-C_6-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C_1-C_3-alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_6-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkyl)carbonyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl; Halogen-(C_1-C_3-alkyl)carbonyl-C_1-C_3-alkyl, Halogen-(C_1-C_3-alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; (C_1-C_6-Alkyl)carbonyl, (C_1-C_4-Alkoxy)carbonyl, (C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl)carbonyl, (C_3-C_6-Cycloalkyl)carbonyl; (C_1-C_4-Halogenalkyl)carbonyl, (C_1-C_4-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C_1-C_3-alkoxy-C_1-C_3-alkyl)carbonyl, (C_3-C_6-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$ steht,

R^2 für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_4-Alkoxy, C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl; C_1-C_4-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkoxy, Halogen-C_1-C_3-alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_6-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R^3 und R^4 unabhängig voneinander jeweils für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl; C_1-C_6-Halogenalkyl, Halogen-C_1-C_3-alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_3-C_6-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

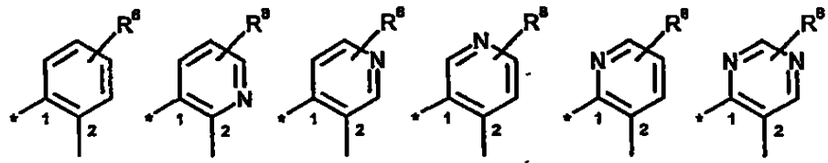
R^3 und R^4 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1-C_4-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann,

R^5 und R^6 unabhängig voneinander für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_3-C_6-Cycloalkyl; C_1-C_4-Halogenalkyl, C_3-C_6-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen stehen,

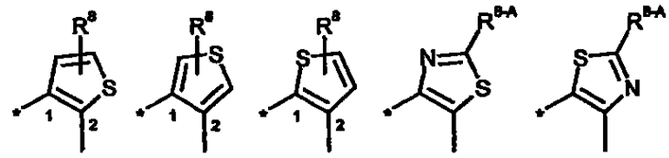
R^5 und R^6 außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, einen gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C_1-C_4-Alkyl substituierten gesättigten Heterocyclus mit 5 oder 6 Ringatomen bilden, wobei der Heterocyclus 1 oder 2 weitere, nicht benachbarte Heteroatome aus der Reihe Sauerstoff, Schwefel oder NR^7 enthalten kann,

R^7 für Wasserstoff oder C_1-C_4-Alkyl steht,

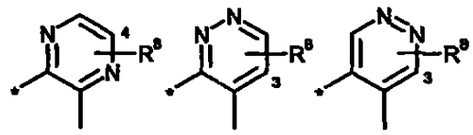
M für einen der folgenden Cyclen steht



M-1 M-2 M-3 M-4 M-5 M-6



M-7 M-8 M-9 M-10 M-11



M-12 M-13 M-14

wobei die mit „*“ markierte Bindung mit dem Amid verknüpft ist,

R^8 für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

R^8 außerdem für Methoxy steht,

R^{8-A} für Wasserstoff, Methyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

L^1 für C_1-C_{10}-Alkylen (Alkandiyl) steht,

Q für O, S, SO, SO_2 oder NR^9 steht,

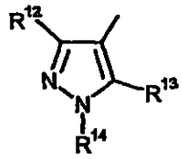
L^2 für eine direkte Bindung, $SiR^{10}R^{11}$ oder CO steht,

R für Wasserstoff, C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_1-C_3-Alkylthio-C_1-C_3-alkyl, C_1-C_4-Halogenalkyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl steht,

R^9 für Wasserstoff C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl, C_1-C_3-Alkylthio-C_1-C_3-alkyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl steht,

R^{10} und R^{11} unabhängig voneinander für C_1-C_6-Alkyl, C_1-C_6-Alkoxy, C_1-C_3-Alkoxy-C_1-C_3-alkyl oder C_1-C_3-Alkylthio-C_1-C_3-alkyl stehen,

A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht, in welcher

R^{12} für Wasserstoff, Cyano, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, iso-Propyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Cyclopropyl, C_1-C_2-Halogenalkyl, C_1-C_2-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Trifluormethylthio, Difluormethylthio, Aminocarbonyl, Aminocarbonylmethyl oder Aminocarbonylethyl steht,

R^{13} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio oder Ethylthio steht,

R^{14} für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Cyclopropyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl oder Phenyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A2)



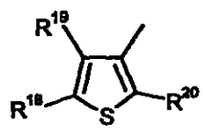
(A2) steht, in welcher

R^{15} und R^{16} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

R^{17} für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Methyl, Ethyl, C_1-C_2-Halogenalkyl oder C_1-C_2-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A3)



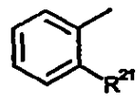
(A3) steht, in welcher

R^{18} und R^{19} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

R^{20} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A4)

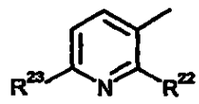


(A4) steht, in welcher

R^{21} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C_1-C_4-Alkyl, C_1-C_2-Halogenalkyl, C_1-C_2-Halogenalkoxy oder C_1-C_2-Halogenalkylthio mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A5)



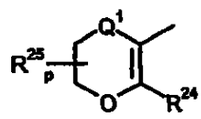
(A5) steht, in welcher

R^{22} für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, Cyano, C_1-C_4-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C_1-C_2-Halogenalkyl oder C_1-C_2-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomensteht,

R^{23} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, C_1-C_4-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, C_1-C_2-Halogenalkyl oder C_1-C_2-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen, C_1-C_2-Alkylsulphinyl oder C_1-C_2-Alkylsulphonyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A6)



(A6) steht, in welcher

R^{24} für Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

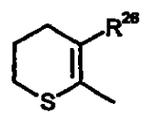
R^{25} für Methyl oder Ethyl steht,

Q^1 für S (Schwefel), SO_2 oder CH_2 steht,

p für 0 oder 1 steht,

oder

A für den Rest der Formel (A7)

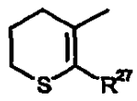


(A7) steht, in welcher

R^{26} für Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A8)

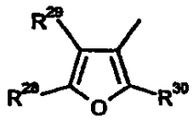


(A8) steht, in welcher

R^{27} für Methyl, Ethyl, Trifluormethyl, Difluormethyl, Difluorchlormethyl oder Trichlormethyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A9)



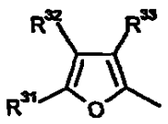
(A9) steht, in welcher

R^{28} und R^{29} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen stehen,

R^{30} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A10)



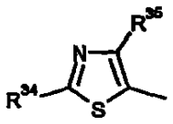
(A10) steht, in welcher

R^{31} und R^{32} unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, Nitro, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen stehen,

R^{33} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A11)



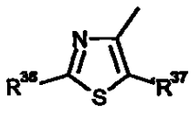
(A11) steht, in welcher

R^{34} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C_1-C_4-Alkylamino, Di(C_1-C_4-alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

R^{35} für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A12)



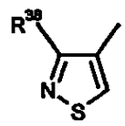
(A12) steht, in welcher

R^{36} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Amino, C_1-C_4-Alkylamino, Di(C_1-C_4-alkyl)amino, Cyano, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

R^{37} für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A13)

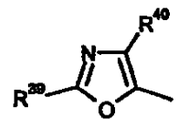


(A13) steht, in welcher

R^{38} für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A14)



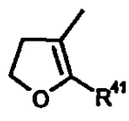
(A14) steht, in welcher

R^{39} für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht,

R^{40} für Fluor, Chlor, Brom, Methyl oder Ethyl steht,

oder

A für den Rest der Formel (A15)

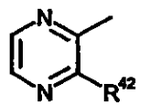


(A15) steht, in welcher

R^{41} für Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A16)

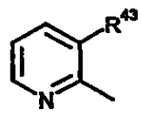


(A16) steht, in welcher

R^{42} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A17)

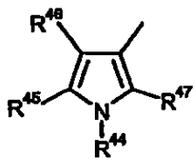


(A17) steht, in welcher

R^{43} für Fluor, Chlor, Brom, Iod, Hydroxy, C_1-C_4-Alkyl, Methoxy, Ethoxy, Methylthio, Ethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, C_1-C_2-Halogenalkyl oder C_1-C_2-Halogenalkoxy mit jeweils 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomensteht,

oder

A für den Rest der Formel (A18)



(A18) steht, in welcher

R^{44} für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C_1-C_2-Alkoxy-C_1-C_2-alkyl, Hydroxymethyl, Hydroxyethyl, Methylsulfonyl oder Dimethylaminosulfonyl steht,

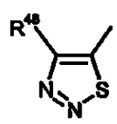
R^{45} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R^{46} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Iod, Cyano, Methyl, Ethyl, iso-Propyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,

R^{47} für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl oder C_1-C_2-Halogenalkyl mit 1 bis 5 Fluor, Chlor und/oder Bromatomen steht,

oder

A für den Rest der Formel (A19)

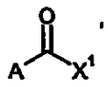


(A19) steht, in welcher

R^{48} für Methyl, Ethyl, n-Propyl oder iso-Propyl steht.

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

(a) Carbonsäure-Derivate der Formel (II)



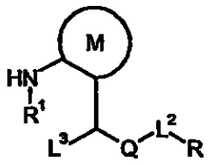
(II)

in welcher

A die oben angegebenen Bedeutungen hat und

X^1 für Halogen oder Hydroxy steht,

mit Anilin-Derivaten der Formel (III)



(III)

in welcher

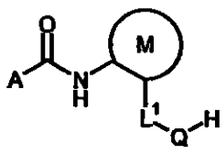
R^1, M, Q, L^2 und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,

L^3 für Wasserstoff oder C_1-C_9-Alkyl steht,

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

oder

(b) Carboxamide der Formel (IV)



(IV)

in welcher M, L^1, Q und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit einer Verbindung der Formel (V)



(V)

in welcher

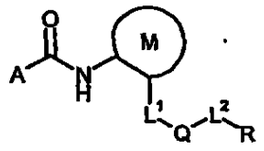
L^2 und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,

Y für Halogen, Triflat (Trifluormethylsulfonyl), Mesylat (Methylsulfonyl) oder Tosylat (4-Methylphenylsulfonyl) steht,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

(c) Carboxamide der Formel (I-a)



(I-a)

in welcher M, L^1, Q, L^2, R und A die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogeniden der Formel (VI)

$R^{1-A}—X^2$ (VI)

in welcher

X^2 für Chlor, Brom oder Iod steht,

R^{1-A} für C_1-C_8-Alkyl, C_1-C_6-Alkylsulfinyl, C_1-C_6-Alkylsulfonyl, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Cycloalkyl; C_1-C_6-Halogenalkyl, C_1-C_4-Halogenalkylthio, C_1-C_4-Halogenalkylsulfinyl, C_1-C_4-Halogenalkylsulfonyl, Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_3-C_8-Halogencycloalkyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; Formyl, Formyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkyl)-carbonyl-C_1-C_3-alkyl, (C_1-C_3-Alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl; Halogen-(C_1-C_3-alkyl)carbonyl-C_1-C_3-alkyl, Halogen-(C_1-C_3-alkoxy)carbonyl-C_1-C_3-alkyl mit jeweils 1 bis 13 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen;
(C_1-C_8-Alkyl)carbonyl, (C_1-C_8-Alkoxy)carbonyl, (C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl)carbonyl, (C_3-C_8-Cycloalkyl)carbonyl; (C_1-C_6-Halogenalkyl)carbonyl, (C_1-C_6-Halogenalkoxy)carbonyl, (Halogen-C_1-C_4-alkoxy-C_1-C_4-alkyl)carbonyl, (C_3-C_8-Halogencycloalkyl)carbonyl mit jeweils 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen; oder $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ oder $-CH_2NR^5R^6$ steht,

wobei R^2, R^3, R^4, R^5 und R^6 die oben angegebenen Bedeutungen haben,

in Gegenwart einer Base und in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt.

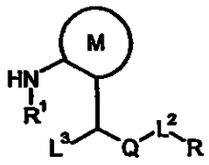
5. Mittel zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einem Carboxamid der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

6. Verwendung von Carboxamiden der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen.

7. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf die Mikroorganismen und/oder deren Lebensraum ausbringt.

8. Verfahren zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung unerwünschter Mikroorganismen, dadurch gekennzeichnet, dass man Carboxamide der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.

9. Anilin-Derivaten der Formel (III)



(III)

in welcher

R^1, M, Q, L^2 und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

L^3 für Wasserstoff oder C_1-C_9-Alkyl steht.

DERIVADOS DE N-(2-(HIDROXIMETIL)FENIL)-1H-PIRAZOL-4-CARBOXAMIDA Y COMPUESTOS EMPARENTADOS COMO PRODUCTOS ACTIVOS MICROBICIDAS PARA EL EMPLEO EN LA PROTECCION DE LAS PLANTAS Y DE LOS MATERIALES.

Campo de la invención

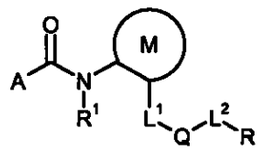
La presente invención se refiere a nuevas carboxamidas, a varios procedimientos para su obtención y a su empleo para la lucha contra los microorganismos indeseables.

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, EP-A 0 824 099, EP-A 0 737 682, EP-A 0 591 699, EP-A 0 589 301, EP-A 0 545 099, DE-A 24 09 011, DE-A 20 06 472, JP-A 2001-302605, JP-A 10-251240, JP-A 8-176112, JP-A 8- 92223 y JP-A 53-72823). De este modo se conoce ya un gran número de alquilcarboxamidas, que no están substituidas en la parte alquilo, tal como, por ejemplo, la N-alil-N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-1-metil-3-(triflúormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida por la publicación WO 02/059086, la N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-2,4-dimetil-1,3-tiazol-5-carboxamida por la publicación EP-A 0 824 099 y la 5-flúor-1,3-dimetil-N-[2-(1,3,3-trimetilbutil)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida por la publicación WO 03/010149. La actividad de estos productos es buena, sin embargo deja mucho que desear en algunos casos, con ocasión de cantidades pequeñas de aplicación.

Descripción detallada de la invención

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



(I)

en la que

R^1 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átom os de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átom os de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átom os de carbono; halógenoalquib con 1 a 6 átom os de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 á tomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógeno-alcox con 1 a 4 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, (alquilo con 1 a 3 áto mos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono; halógeno-(alquilo con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 áto mos de carbono, halógeno-(alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 át omos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo;

(alquilo con 1 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 8 átom os de carbono)carbonilo; (halógenoalquilo con 1 a 6 átom os de carbono)carbonilo, (halogenalcoxi con 1 a 6 átom os de carbono)carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 8 á tomos de carbono)carbonilo con, respectivamente, 1 hasta 9 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo; o

$-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ o $-CH_2NR^5R^6$,

R^2 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 8 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 á tomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átom os de carbono, halogenalcoxi con 1 a 6 á tomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenocicbalquilo con 3 a 8 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^3 y R^4 significan, independientemente entre sí respectivamente hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 áto mos de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átom os de carbono; halógenoalquilo con 1 a 8 átom os de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenocicloalquib con 3 a 8 átom os de carbono, con, respectivamente, 1 hasta 9 áto mos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^3 y R^4 forman, además, junto con el á tomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado, con 5 hasta 8 átom os en el anillo substituido, en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroát omos más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^7,

R^5 y R^6 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 á tomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 á tomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 8 á tomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 á tomos de carbono, con, respectivamente, 1 hasta 9 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

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

R^7 significa hidrógeno o alquilo con 1 a 6 átomos de carbono,

M significa un anillo de fenilo, de piridina o de pirimidina, de piridazina o de pirazina monosubstituidos, respectivamente, por R^8 o significa un anillo de tiazol substituido por R^{8-A},

R^8 significa hidrógeno, fluor, cloro, metilo, iso-propilo, metiltio o triflúormetilo,

R^8 significa, además, metoxi,

R^{8-A} significa hidrógeno, metilo, metiltio o triflúormetilo,

L^1 significa alquileno con 1 a 10 átomos de carbono (alcanodiilo),

Q significa O, S, SO, SO_2 o NR^9,

L^2 significa un enlace directo, $SiR^{10}R^{11}$ o CO,

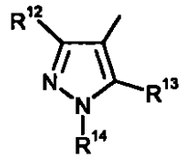
R significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo con 2 a 8 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquenlo con 2 a 6 átomos de carbono, halógenoalquinilo con 2 a 6 átomos de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono,

R^9 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4

átom os de carbono, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono-alquenilo con 2 a 8 átom os de carbono, alquinilo con 2 a 8 átom os de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átom os de carbono, halógenoalquenilo con 2 a 6 átom os de carbono, halógenoalquinilo con 2 a 6 átom os de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono,

R^{10} y R^{11} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 8 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alquiltio con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 6 átom os de carbono,

A significa el resto de la fórmula (A1)



(A1), en la que

R^{12} significa hidrógeno, ciano, halógeno nitro, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 át omos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átom os de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halogenalcoxi con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquiltio con 1 a 4 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de halógeno, aminocarbonilo o aminocarbonil-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono,

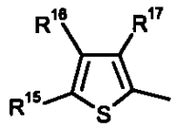
R^{13} significa hidrógeno, halógeno ciano, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono o alquiltio con 1 a 4 átom os de carbono,

R^{14} significa hidrógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, hidroxi-

alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono, alquenilo con 2 a 4 át omos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono, alquiltio con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halogenalcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de halógeno, o fenilo,

o

A significa el resto de la fórmula (A2)



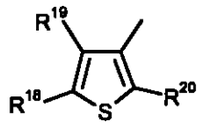
(A2), en la que

R^{15} y R^{16} significan, independientemente entre sí hidrógeno, halógenoalquilo con 1 a 4 át omos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{17} significa halógeno ciano o alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halogenalcoxi con 1 a 4 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A3)



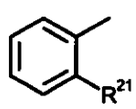
(A3), en la que

R^{18} y R^{19} significan, independientemente entre sí hidrógeno, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de halógeno,

R^{20} significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A4)

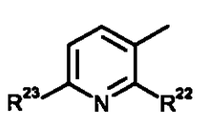


(A4), en la que

R^{21} significa hidrógeno, halógeno hidroxi, ciano, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halogenalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A5)



(A5), en la que

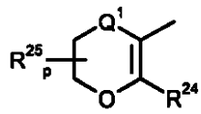
R^{22} significa halógenohidroxi, ciano, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono o halogenalcoxi con 1 a

4 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{23} significa hidrógeno, halógeno ciano, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono, alquiltio con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halogenalcoxi con 1 a 4 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de halógeno, alquilsulfinilo con 1 a 4 átom os de carbono o alquilsulfonilo con 1 a 4 átom os de carbono,

o

A significa el resto de la fórmula (A6)



(A6), en la que

R^{24} significa alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

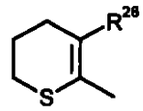
R^{25} significa alquilo con 1 a 4 átom os de carbono,

Q^1 significa S (azufre), SO, SO_2 o CH_2,

p significa 0, 1 o 2, significando R^{25} restos idénticos o diferentes, cuando p signifique 2,

o

A significa el resto de la fórmula (A7)

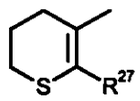


(A7), en la que

R^{26} significa alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A8)

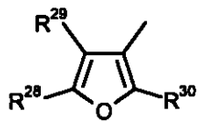


(A8), en la que

R^{27} significa alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A9)



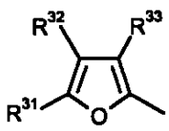
(A9), en la que

R^{28} y R^{29} significan, independientemente entre sí hidrógeno, halógeno, amino, alquilo con 1 a 4 áto mos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{30} significa hidrógeno, halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A10)



(A10), en la que

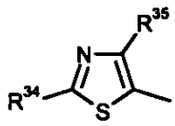
R^{31} y R^{32} significan, independientemente entre sí hidrógeno, halógeno, amino, nitro, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 áto mos de carbono, con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{33} significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 á tomos de

halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A11)



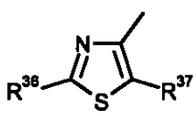
(A11), en la que

R^{34} significa hidrógeno, halógeno, amino, alquilamino con 1 a 4 átom os de carbono, di-(alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)amino, ciano, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{35} significa halógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A12)



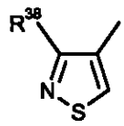
(A12), en la que

R^{36} significa hidrógeno, halógeno, amino, alquilamino con 1 a 4 átom os de carbono, di-(alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)amino, ciano, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{37} significa halógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A13)

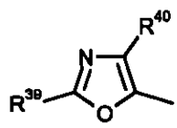


(A13), en la que

R^{38} significa halógeno, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A14)



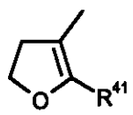
(A14), en la que

R^{39} significa hidrógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

R^{40} significa halógeno o alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

o

A significa el resto de la fórmula (A15)

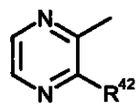


(A15), en la que

R^{41} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A16)



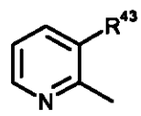
(A16), en la que

R^{42} significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de

halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A17)

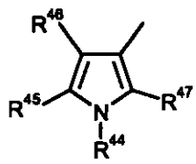


(A17), en la que

R^{43} significa halógeno hidroxi, alquilo con 1 a 4 áto mos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono, alquiltio con 1 a 4 át omos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átom os de carbono o halogenalcoxi con 1 a 4 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A18)



(A18), en la que

R^{44} significa hidrógeno, ciano, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, hidroxi-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átom os de carbono, di(alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)aminosulfonilo, alquilcarbonilo con 1 a 6 átom os de carbono o significa fenilsulfonilo o benzoilo substituidos, respectivamente, en caso dado,

R^{45} significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de

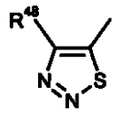
halógeno,

R^{46} significa hidrógeno, halógeno ciano, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{47} significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A19)



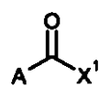
(A19), en la que

R^{48} significa alquilo con 1 a 4 átom os de carbono,

no significando R alcoxi cuando L^2 signifique un enlace directo.

Además, se ha encontrado que se obtienen las carboxamidas de la fórmula (I), si

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



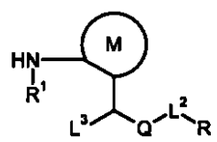
(II)

en la que

A tiene los significados anteriormente indicados y

X^1 significa halógeno o hidroxi,

con un derivado de anilina de la fórmula (III)



(III)

en la que

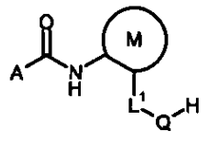
R^1, M, Q, L^2 y R tienen los significados anteriormente indicados,

L^3 significa hidrógeno o alquilo con 1 a 9 á tomos de carbono

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 aceptor de á cido y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

o

b) se hacen reaccionar carboxanilidas de la fórmula (I-a)



(I-a)

en la que M, L^1, Q y A tienen los significados anteriormente indicados,

con un compuesto de la fórmula (V)



(V)

en la que

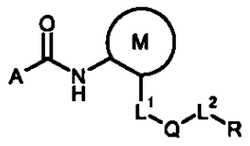
L^2 y R tienen los significados anteriormente indicados

Y significa halógeno, triflato (trifluormetilsulfonilo), mesilato (metilsulfonilo) o tosilato (4-metilfenilsulfonilo),

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

o

(c) se hacen reaccionar carboxamidas de la fórmula (I-a)



(I-a)

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

con halogenuros de la fórmula (VI)

$$R^{1-A}—X^2 \qquad \text{(VI)}$$

en la que

X^2 significa cloro, bromo o yodo,

R^{1-A} significa alquilo con 1 a 8 átom os de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átom os de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átom os de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átom os de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átom os de carbono con, respectivamente, 1 a 9 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, (alquilo con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 át omos de carbono; halógeno-(alquib con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, halógeno-(alcoxicon 1 a 3 átom os de

carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono con, respectivamente, 1 a 13 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo;

(alquilo con 1 a 8 átom os de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 8 átom os de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 8 átom os de carbono)carbonilo; (halógenoalqulo con 1 a 6 átom os de carbono)carbonilo, (halógenoalcoxi con 1 a 6 átom os de carbono)carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 8 átom os de carbono)carbonilo con, respectivamente, 1 a 9 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo; o $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ o $-CH_2NR^5R^6$.

teniendo R^2, R^3, R^5 y R^6 los significados anteriormente indicados,

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

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

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

tautómeras.

Las carboxamidas según la invenciónestán definidas, en general, por medio de la fórmula (I). Las definiciones de los restos preferentes de las fórmulas precedentes y citadas a continuación, han sido dadas mas adelante. Estas definiciones son válidas de manera equivalente para los productos finales de la fórmula (I) así como para todos los productos intermedios.

R^1 significa preferentemente hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átom os de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 4 átom os de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, halógenocicloalquib con 3 a 8 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con 1 a 3 át omos de carbono, (alquilo con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono; halógeno-(alquib con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, halógeno-(alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo;

(alquilo con 1 a 6 átom os de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 á tomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono)carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 6 átomos de

carbono)carbonilo; (halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono)carbonilo, (halogenalcoxi con 1 a 4 átom os de carbono)carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono)carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono)carbonilo con, respectivamente, 1 hasta 9 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo; o $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ o $-CH_2NR^5R^6$.

R^1 significa de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc.-butilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o iso-propilsulfinilo, n-, iso-, sec- o terc.-butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o iso-propilsulfonilo, n-, iso-, sec- o terc.-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, triflúormetilo, triclorometilo, triflúoretilo, diflúormetiltio, diflúorcloromethiltio, triflúormetiltio, triflúormetilsulfinilo, triflúormetilsulfonilo, triflúormetoximetilo; formilo, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO-CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO-CF_3$, $-CH_2-CO-CCl_3$, $-CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CF_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CCl_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CF_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CCl_2CCl_3$;

metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, iso-propilcarbonilo, terc.-butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, terc.-butoxicarbonilo, ciclopropilcarbonilo; triflúormetilcarbonilo, triflúormetoxicarbonilo, o $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ o $-CH_2NR^5R^6$.

R^1 significa de forma muy especialmente preferente hidrógeno, metilo, metoximetilo, formilo, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-C(=O)CHO$, $-C(=O)C(=O)CH_3$, $-C(=O)C(=O)CH_2OCH_3$, $-C(=O)CO_2CH_3$, $-C(=O)CO_2CH_2CH_3$.

R^2 significa preferentemente hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 át omos de carbono, alcoxi con 1 a 3 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 3 áto mos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 á tomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 á tomos de carbono, halogenalcoxi con 1 a 4 átom os de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^2 significa de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, terc.-butilo, metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, terc.-butoxi, metoximetilo, ciclopropilo; triflúormetilo, triflúormetoxi.

R^3 y R^4 significan, independientemente entre sí preferentemente hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 3 áto mos de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^3 y R^4 forman, además, junto con el á tomo de nitrógeno, con el que están enlazados, preferentemente un heterociclo saturado, con 5 o 6 á tomos en el anillo substituido, en caso dado, de ua hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono,

pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátomos más no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^7.

R^3 y R^4 significan, independientemente entre sí de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc.-butilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; trifluormetilo, triclorometilo, trifluoretilo, trifluormetoximetilo.

R^3 y R^4 forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que están enlazados, de forma especialmente preferente un heterociclo saturado, de la serie formada por morfolina, tiomorfolin o piperazina, substituido en caso dado, de una a cutro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo o por metilo, pudiendo estar substituida la piperazina sobre el segundo átomo de nitrógenopor R^7.

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

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

R^5 y R^6 significian, independientemente entre sí de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc.-butilo,

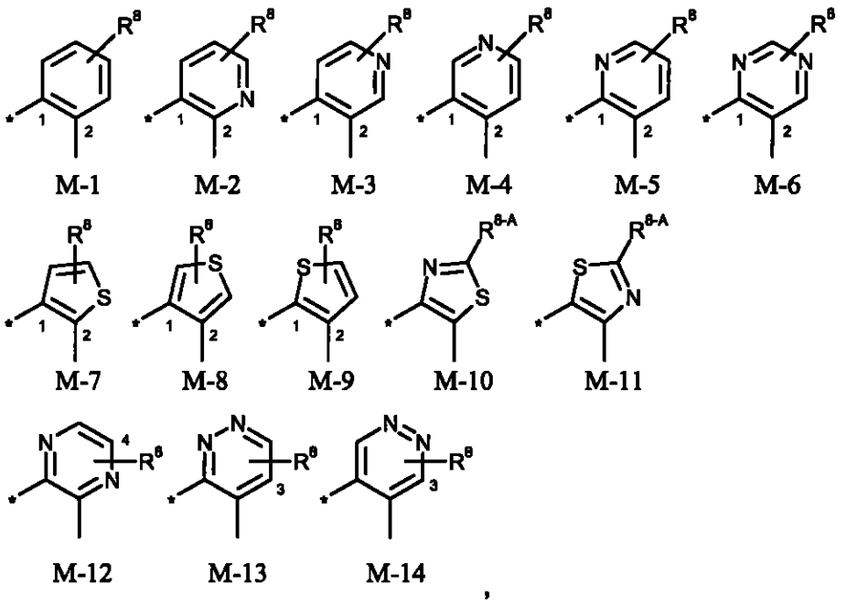
metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo; triflúormetilo, triclorometilo, triflúoretilo, triflúormetoximetilo.

R^5 y R^6 forman, además, junto con el átomo de nitrógeno, con el que está enlazados, de forma especialmente preferente un heterociclo saturado, substituido en caso dado de una a cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes por flúor, por cloro, por bromo o por metilo, de la serie fromada por morfolina, tiomorfolina o piperazina, pudiendo estar substituida la piperazina sobre el segundo átomo de nitrógeno por R^7.

R^7 significa preferentemente hidrógenoo alquilo con 1 a 4 átomos de carbono.

R^7 significa de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc.-butilo.

M significa preferentemente uno de los ciclos siguientes



M-1 M-2 M-3 M-4 M-5 M-6

M-7 M-8 M-9 M-10 M-11

M-12 M-13 M-14

estando enlazado el enlace marcado con „*“ con la amida.

M significa de forma especialmente preferente un ciclo elegido entre M-1, M-2, M-3,

M-6, M-7, M-10 o M-11.

M significa, además, de forma especialmente preferente un ciclo elegido entre M-1, M-2, M-3, M-4, M-5, M-6 o M-10 o M-11.

M significa de forma muy especialmente preferente el ciclo M-1.

M significa, además, de forma muy especialmente preferente el heterociclo M-2.

M significa, además, de forma muy especialmente preferente el heterociclo M-3.

M significa, además, de forma muy especialmente preferente el heterociclo M-6.

M significa, además, de forma muy especialmente preferente el heterociclo M-7

M significa, además, de forma muy especialmente preferente el heterociclo M-10.

M significa, además, de forma muy especialmente preferente el heterociclo M-11.

R^8 significa, preferentemente, hidrógeno.

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-1, además, preferentemente, flúor encontrándose el flúor, de forma especialmente preferente, en la posición4, 5 o 6, de forma muy especialmente preferente, en la posición4 o 6, en particular en la posición4.

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-1, además preferentemente cloro, encontrándose el cloro de forma especialmente preferente en la posición4, o 6.

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-1, además preferentemente metilo, encontrándose el metilo de forma especialmente preferente en la posición3 y, además, de forma especialmente preferente en la posición4.

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-1, además preferentemente metoxi, encontrándose el metoxi de forma especialmente preferente en la posición 4.

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-1, además preferentemente triflúormetilo, encontrándose el triflúormetilo de forma especialmente

preferente en la posición4, o 6.

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-2, M-3, M-4 o M-5, además preferentemente flúor, encontrándose el flúor de forma especialmente preferente en la posición6 (M-2, M-3) o en la posición3 (M-4, M-5).

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-2, M-3, M-4 o M-5, además, preferentemente cloro, encontrándose el cloro de forma especialmente preferente en la posición6 (M-2, M-3) o en la posición3 (M-4, M-5).

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-2, M-3, M-4 o M-5, además, preferentemente metilo, encontrándose el metilo de forma especialmente preferente en la posición4 (M-2) o en la posición3 (M-3, M-4, M-5).

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-6, además, preferentemente metilo, encontrándose el metilo de forma especialmente preferente en la posición 3.

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-6, además, preferentemente triflúormetilo, encontrándose el triflúormetilo de forma especialmente preferente en la posición3.

R^8 significa en el caso en que M signifique M-7, M-8 o M-9, además, preferentemente cloro, encontrándose el cloro de forma especialmente preferente en la posición5 (M-7, M-8) o en la posición3 (M-9).

R^8 significa en el caso en que M signifique M-7, M-8 o M-9, además, preferentemente metilo, encontrándose el metilo de forma especialmente preferente en la posición5 (M-7, M-8) o en la posición3 (M-9).

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-12 además, preferentemente metilo, encontrándose el metilo de forma especialmente preferente en la posición 4.

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-12, además, preferentemente triflúormetilo, encontrándose el triflúormetilo de forma especialmente preferente en la posición4.

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-13. además, preferentemente metilo, encontrándose el metilo de forma especialmente preferente en la posición 3.

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-13, además, preferentemente triflúormetilo, encontrándose el triflúormetilo de forma especialmente preferente en la posición3.

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-14, además, preferentemente metilo, encontrándose el metilo de forma especialmente preferente en la posición 3

R^8 significa, en el caso en que M signifique M-14, además, preferentemente triflúormetilo, encontrándose el triflúormetilo de forma especialmente preferente en la posición3.

R^{8-A} significa preferentemente hidrógeno.

R^{8-A} significa, además, preferentemente metilo.

R^{8-A} significa, además, preferentemente triflúormetilo.

L^1 significa preferentemente alquileno con 1 a 6 átom os de carbono (alcanodiilo).

L^1 significa de manera especialmente preferente $-CH_2-$, $-CH(CH_3)-$ o $-(CH_2)_2C(CH_3)_2-$.

L^1 significa, además, de manera especialmente preferente $-(CH_2)_2-$.

Q significa preferentemente O.

Q significa, además, preferentemente S.

Q significa, además, preferentemente SO.

Q significa, además, preferentemente SO_2.

Q significa, además, preferentemente NR^9, de manera especialmente preferente NH.

L^2 significa preferentemente un enlace directo.

L^2 significa, además, preferentemente $SiR^{10}R^{11}$.

L^2 significa, además, preferentemente CO.

R significa preferentemente hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 6 át omos de carbono, alcoxi con 1 a 3 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 áto mos de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 áto mos de carbono.

R significa, además, preferentemente halogenalquilo con 1 a 4 á tomos de carbono

R significa de manera especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, sec.-, iso- o terc.-butilo, metoxi, etoxi, n- o iso-propoxi, n-, sec.-, iso- o terc.-butoxi, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, metiltiometilo, etiltiometilo, metiltioetilo, etiltioetilo o ciclopropilo.

R significa, además, de manera especialmente preferente 1-metilbutilo, halogenalquilo con 1 a 2 átom os de carbono con 1 bis 5 átom os de flúor, de cloro o de bromo, ciclopentilo o ciclohexilo.

R significa de manera muy especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, iso- o terc.-butilo, metoxi, iso-propoxi, iso- o terc.-butoxi, metoximetilo o metiltiometilo.

R significa, además, de manera muy especialmente preferente sec.-butilo, 1-metilbutilo, diclorometilo, ciclopropilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

R significa de manera particularmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, iso- o terc.-butilo, metoxi, iso-propoxi, iso- o terc.-butoxi.

R significa, además, de manera particularmente preferente sec.-butilo o 1-metilbutilo.

R^9 significa preferentemente hidrógeno, alquilo con 1 a 6 átom os de carbono,

alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, alquiltio con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono.

R^9 significa de manera especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, sec.-, iso- o terc.-butilo, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, metiltiometilo, etiltiometilo, metiltioetilo, etiltioetilo o ciclopropilo

R^9 significa de manera muy especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, n- o iso-propilo, iso- o terc.-butilo, metoximetilo o metiltiometilo.

R^9 significa de manera particularmente preferente hidrógenoo metilo.

R^{10} y R^{11} significan, independientemente entre sí preferentemente alquilo con 1 a 6 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 6 á tomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono o alquiltio con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono.

R^{10} y R^{11} significan, independientemente entre sí, de manera especialmente preferente metilo, etilo, metoxi, etoxi, metoximetilo, etoximetilo, metoxietilo, etoxietilo, metiltiometilo, etiltiometilo, metiltioetilo o etiltioetilo.

R^{10} y R^{11} significan, independientemente entre sí, de manera muy especialmente preferente metilo, metoxi, metoximetilo o metiltiometilo.

R^{10} y R^{11} significan de manera particularmente preferente, respectivamente, metilo

A significa preferentemente uno de los restos A1, A2, A3, A4, A5, A6, A9, A10, A11, A12, A17 o A18.

A significa de forma especialmente preferente significa uno de los restos A1, A2, A4, A5, A6, A9, A11, A16, A17, A18.

A de forma muy especialmente preferente significa el resto A1.

A además, de forma muy especialmente preferente significa el resto A2.

A además, de forma muy especialmente preferente significa el resto A4.

A además, de forma muy especialmente preferente significa el resto A5.

A además, de forma muy especialmente preferente significa el resto A6.

A además, de forma muy especialmente preferente significa el resto A9.

A además, de forma muy especialmente preferente significa el resto A11

A además, de forma muy especialmente preferente significa el resto A16

A además, de forma muy especialmente preferente significa el resto A18

R^{12} significa preferentemente hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, iso-propilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, ciclopropilo, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, halogenalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo, triflúormetiltio, diflúormetiltio, aminocarbonilo, aminocarbonilmetilo o aminocarboniletilo.

R^{12} significa de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, iso-propilo, monoflúormetilo, monoflúoretilo, diflúormetilo, triflúormetilo, diflúorclorometilo, triclorometilo, diclorometilo, ciclopropilo, metoxi, etoxi, triflúormetoxi, triclorometoxi, metiltio, etiltio, triflúormetiltio o diflúormetiltio.

R^{12} significa de forma muy especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, iso-propilo, monoflúormetilo, monoflúoretilo, diflúormetilo, triflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{12} significa de forma particularmente preferente metilo, diflúormetilo, triflúormetilo o 1-flúoretilo.

R^{13} significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio o etiltio.

R^{13} significa de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo o metilo.

R^{13} significa de forma muy especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro o

metilo.

R^{14} significa preferentemente hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, halógenoalquilo con 1 a 2 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo, hidroximetilo, hidroxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo o fenilo.

R^{14} significa de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, iso-propilo, triflúormetilo, diflúormetilo, hidroximetilo, hidroxietilo o fenilo.

R^{14} significa de forma muy especialmente preferente hidrógeno, metilo, triflúormetilo o fenilo.

R^{14} significa de forma particularmente preferente metilo.

R^{15} y R^{16} significan, independientemente entre sí, preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{15} y R^{16} significan, independientemente entre sí, de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, diflúormetilo, triflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{15} y R^{16} significan, independientemente entre sí, de forma muy especialmente preferente significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, diflúormetilo, triflúormetilo o triclorometilo.

R^{15} y R^{16} significan de forma particularmente preferente respectivamente hidrógeno

R^{17} significa preferentemente flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, halógenoalquilo con 1 a 2 átom os de carbono o halogenalcoxi con 1 a 2 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{17} significa de forma especialmente preferente flúor, cloro, bromo, ciano, metilo,

triflúormetilo, triflúormetoxi, diflúormetoxi, diflúorclorometoxi o triclorometoxi.

R^{17} significa de forma muy especialmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, triflúormetilo o triflúormetoxi.

R^{17} significa de forma particularmente preferente metilo.

R^{18} y R^{19} significan independientemente entre sí preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{18} y R^{19} significan, independientemente entre sí de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, diflúormetilo, triflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{18} y R^{19} significan, independientemente entre sí de forma muy especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, diflúormetilo, triflúormetilo o triclorometilo.

R^{18} y R^{19} significan de forma particularmente preferente respectivamente hidrógeno.

R^{20} significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo

R^{20} significa de forma especialmente preferente significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo o triflúormetilo.

R^{20} significa de forma muy especialmente preferente metilo.

R^{21} significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxi, ciano, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono, halogenalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono o halógenoalquiltio con 1 a 2 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de flúor, de

cloro y/o de bromo.

R^{21} significa de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxi, ciano, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc.-butilo, diflúormetilo, triflúormetilo, diflúorclorometilo, triclorometilo, triflúormetoxi, diflúormetoxi, diflúorclorometoxi, triclorometoxi, triflúormetiltio, diflúormetiltio, diflúorclorometiltio o triclorometiltio.

R^{21} significa de forma muy especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, diflúormetilo, triflúormetilo o triclorometilo.

R^{21} significa de forma particularmente preferente yodo, metilo, diflúormetilo o triflúormetilo.

R^{22} significa preferentemente flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxi, ciano, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, diflúormetiltio, triflúormetiltio, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono o halogenalcoxi con 1 a 2 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{22} significa de forma especialmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxi, ciano, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc.-butilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo, triclorometilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, diflúormetiltio, triflúormetiltio, triflúormetoxi, diflúormetoxi, diflúorclorometoxi o triclorometoxi.

R^{22} significa de forma muy especialmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{23} significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, halógenoalquilo con 1 a 2 átom os de carbono o halogenalcoxi con 1 a 2 átom os de carbono

con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo, alquilsulfinilo con 1 a 2 átom os de carbono o alquilsulfonilo con 1 a 2 átom os de carbono

R^{23} significa de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butılo, sec-butilo, terc -butilo, triflúormetılo, dıflúormetilo, diflúorclorometılo, triclorometilo, metoxi, etoxi, metıltio, etiltio, triflúormetoxi, diflúormetoxi, diflúorclorometoxi, triclorometoxi, metılsulfinilo o metilsulfonilo.

R^{23} significa de forma muy especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc.-butilo, triflúormetilo, diflúormetılo, triclorometilo, metilsulfinilo o metilsulfonilo.

R^{23} significa de forma particularmente preferente hidrógeno.

R^{24} significa preferentemente metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 áto mos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{24} significa de forma especialmente preferente metilo, etilo, trıflúormetilo, diflúormetilo. diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{25} significa preferentemente metilo o etilo.

R^{25} significa de forma especialmente preferente metilo.

Q^1 significa preferentemente S (azufre), SO_2 o CH_2.

Q^1 significa de forma especialmente preferente S (azufre) o CH_2.

Q^1 significa de forma muy especialmente preferente S (azufre)

p significa preferentemente 0 o 1.

p significa de forma especialmente preferente 0.

R^{26} significa preferentemente metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 áto mos de

carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{26} significa de forma especialmente preferente etilo, etilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{26} significa de forma muy especialmente preferente metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{27} significa preferentemente metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 áto mos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{27} significa de forma especialmente preferente metilo, etilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo

R^{27} significa de forma muy especialmente preferente metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{28} y R^{29} significan, inbdependientemente entre sí, preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 áto mos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{28} y R^{29} significan, independientemente entre sí de forma especialmente preferente significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{28} y R^{29} significan, independientemente entre sí de forma muy especialmente preferente significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{28} y R^{29} significan de forma particularmente preferente respectivamente hidrógeno.

R^{30} significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átom os de carbono, con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{30} significa de forma especialmente preferente significa hidrógeno, flúor, cloro,

bromo, yodo, metilo, etilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{30} significa de forma muy especialmente preferente significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{30} significa de forma particularmente preferente metilo.

R^{31} y R^{32} stehen unabhängig voneinander preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, nitro, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átom os de carbono con 1 hasta 5 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{31} y R^{32} significan independientemente entre sí de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, nitro, metilo, etilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{31} y R^{32} significan independientemente entre sí de forma muy especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{31} y R^{32} significan de forma particularmente preferente respectivamente hidrógeno.

R^{33} significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^{33} significa de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{33} significa de forma muy especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{33} significa de forma particularmente preferente metilo.

R^{34} significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, alquilamino con 1 a 4 átom os de carbono, di(alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)amino,

ciano, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{34} significa de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metilo, etilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{34} significa de forma muy especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo

R^{34} significa de forma particularmente preferente amino, metilamino, dimetilamino, metilo o triflúormetilo.

R^{35} significa preferentemente flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 át omos de carbono con 1 hasta 5 áto mos de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{35} significa de forma especialmente preferente flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{35} significa de forma muy especialmente preferente flúor, cloro, bromo, metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{35} significa de forma particularmente preferente metilo, triflúormetilo o diflúormetilo.

R^{36} significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, alquilamino con 1 a 4 átom os de carbono, di(alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)amino, ciano, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{36} significa de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, ciano, metilo, etilo, triflúormetilo,

diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{36} significa de forma muy especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, metilamino, dimetilamino, metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{36} significa de forma particularmente preferente amino, metilamino, dimetilamino, metilo o triflúormetilo.

R^{37} significa preferentemente flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{37} significa de forma especialmente preferente flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{37} significa de forma muy especialmente preferente flúor, cloro, bromo, metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{37} significa de forma particularmente preferente metilo, triflúormetilo o diflúormetilo.

R^{38} significa preferentemente flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{38} significa de forma especialmente preferente flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{38} significa de forma muy especialmente preferente flúor, cloro, bromo, metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{39} significa preferentemente hidrógeno, metilo o etilo.

R^{39} significa de forma especialmente preferente metilo.

R^{40} significa preferentemente flúor, cloro, bromo, metilo o etilo,

R^{40} significa de forma especialmente preferente flúor, cloro o metilo.

R^{41} significa preferentemente metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{41} significa de forma especialmente preferente metilo, etilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{41} significa de forma muy especialmente preferente metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{41} significa de forma particularmente preferente metilo o triflúormetilo.

R^{42} significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{42} significa de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo o triflúormetilo.

R^{43} significa preferentemente flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxi, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, diflúormetiltio, triflúormetiltio, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono o halogenalcoxi con 1 a 2 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{43} significa de forma especialmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo, n-butilo, iso-butilo, sec-butilo, terc.-butilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{43} significa de forma muy especialmente preferente flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{44} significa preferentemente hidrógeno, metilo, etilo, halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

alcoxi con 1 a 2 átomos de carbono-alquilo con 1 a 2 átom os de carbono, hidroximetilo, hidroxietilo, metilsulfonilo o dimetilaminosulfonilo.

R^{44} significa de forma especialmente preferente hidrógeno, metilo, etilo, triflúormetilo, metoximetilo, etoximetilo, hidroximetilo o hidroxietilo.

R^{44} significa de forma muy especialmente preferente metilo o metoximetilo.

R^{45} significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{45} significa de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo, triflúormetilo, diflúormetilo o triclorometilo.

R^{45} significa de forma muy especialmente preferente hidrógenoo metilo.

R^{46} significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo o halógenoalquilo con 1 a 2 át omos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{46} significa de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo, triflúormetilo, diflúormetilo, diflúorclorometilo o triclorometilo.

R^{46} significa de forma muy especialmente preferente hidrógeno, metilo, diflúormetilo o triflúormetilo.

R^{47} significa preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo.

R^{47} significa de forma especialmente preferente hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo o triflúormetilo.

R^{47} significa de forma muy especialmente preferente hidrógeno.

R^{48} significa preferentemente metilo, etilo, n-propilo o iso-propilo.

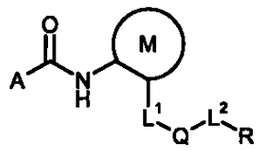
R^{48} significa de forma especialmente preferente metilo o etilo.

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

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

Preferentemente y, respectivamente, como cantidad parcial de los compuestos anteriormente citados de la fórmula (I) deben entenderse los grupos siguientes de las nuevas carboxamidas:

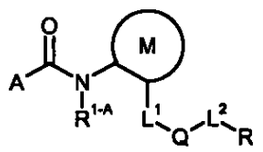
Grupo 1: Carboxamidas de la fórmula(I-a)



(I-a)

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

Grupo 2: carboxamidas de la fórmula(I-b)



(I-b)

en la que R^{1-A}, M, L^1, Q, L^2, R A tienen los significados anteriormente indicados.

R^{1-A} significa preferentemente alquilo con 1 a 6 áto mos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 4 átom os de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átom os de carbono,

alcoxi con 1 a 3 átomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono; halógenoalquib con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalqultio con 1 a 4 á tomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, halógenocicloalqilo con 3 a 8 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, (alquilo con 1 a 3 áto mos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono; halógeno-(alquilo con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 áto mos de carbono, halógeno-(alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 át omos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo;

(alquilo con 1 a 6 átom os de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono)carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono)carbonilo, (halógenoalquilo con 1 a 4 á tomos de carbono)carbonilo, (halogenalcoxi con 1 a 4 átom os de carbono)carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono)carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 6 át omos de carbono)carbonilo con, respectivamente, 1 hasta 9 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo; o $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ o $-CH_2NR^5R^6$.

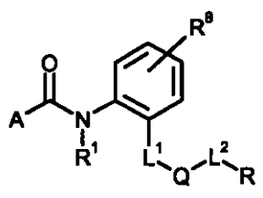
R^{1-A} significa <u>de forma especialmente preferente</u> metilo, etilo, n- o iso-propilo, n-, iso-, sec- o terc.-butilo, pentilo o hexilo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n- o iso-

propilsulfinilo, n-, iso-, sec- o terc.-butilsulfinilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n- o iso-propilsulfonilo, n-, iso-, sec- o terc.-butilsulfonilo, metoximetilo, metoxietilo, etoximetilo, etoxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo, triflúormetilo, triclorometilo, triflúoretilo, diflúormetiltio, diflúorclorometiltio, triflúormetiltio, triflúormetilsulfinilo, triflúormetilsulfonilo, triflúormetoximetilo; formilo, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO-CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CH_3$, $-CH_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CH_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH(CH_3)_2$, $-CH_2-CO-CF_3$, $-CH_2-CO-CCl_3$, $-CH_2-CO-CH_2CF_3$, $-CH_2-CO-CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO-CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CF_2CF_3$, $-CH_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-CH_2-CO_2CCl_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CF_2CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CH_2CCl_3$, $-(CH_2)_2-CO_2CCl_2CCl_3$;

metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, iso-propilcarbonilo, terc.-butilcarbonilo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, terc.-butoxicarbonilo, ciclopropilcarbonilo; triflúormetilcarbonilo, triflúormetoxicarbonilo, o $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ o $-CH_2NR^5R^6$.

R^{1-A} significa de forma muy especialmente preferente metilo, metoximetilo, formilo, $-CH_2-CHO$, $-(CH_2)_2-CHO$, $-CH_2-CO-CH_3$, $-CH_2-CO-CH_2CH_3$, $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$, $-C(=O)CHO$, $-C(=O)C(=O)CH_3$, $-C(=O)C(=O)CH_2OCH_3$, $-C(=O)CO_2CH_3$, $-C(=O)CO_2CH_2CH_3$.

Grupo 3: carboxamidas de la fórmula (I-c)



(I-c)

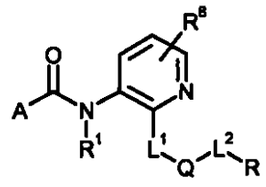
en la que R^1, R^8, L^1, Q, L^2, R y A tienen los significados anteriormente indicados

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-c), en la que R^1 significa hidrógeno.

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-c), en la que R^8 significa hidrógeno.

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-c), en la que R^1 y R^8 significan, respectivamente, hidrógeno.

Grupo 4: carboxamidas de la fórmula(I-d)



(I-d)

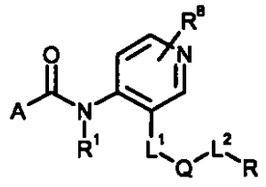
en la que R^1, R^8, L^1, Q, L^2, R y A tienen los significados anteriormente indicados.

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-d), en la que R^1 significa hidrógenosignifica.

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-d), en la que R^8 significa hidrógeno

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-d), en la que R^1 y R^8 significan, respectivamente, hidrógeno.

Grupo 5: carboxamidas de la fórmula(I-e)



(I-e)

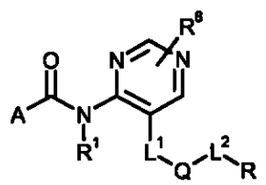
en la que R^1, R^8, L^1, Q, L^2, R y A tienen los significados anteriormente indicados.

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-e), en la que R^1 significa hidrógeno.

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-e), en la que R^8 significa hidrógeno.

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-e), en la que R^1 y R^8 significan, respectivamente, hidrógeno.

Grupo 6· carboxamidas de la fórmula (I-f)



(I-f)

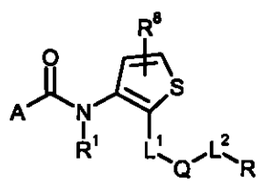
en la que R^1, R^8, L^1, Q, L^2, R y A tienen los significados anteriormente indicados.

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-f), en la que R^1 significa Hidrógeno.

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-f), en la que R^8 significa hidrógeno.

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-f), en la que R^1 y R^8 significan, respectivamente, hidrógeno.

Grupo 7· carboxamidas de la fórmula (I-g)



(I-g)

en la que R^1, R^8, L^1, Q, L^2, R y A tienen los significados anteriormente indicados.

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-g), en la que R^1 significa hidrógeno.

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-g), en la que R^8 significa hidrógeno.

Son preferentes las carboxamidas de la fórmula (I-g), en la que R^1 y R^8 significan, respectivamente, hidrógeno.

Debe reseñarselos compuestos de la fórmula (I) (e igualmente de los grupos 1 hasta 7), en la que R^1 significa hidrógeno.

Debe reseñarse los compuestos de la fórmula (I) (e igualmente de los grupos 1 hasta 7), en la que R^1 significa formilo

Debe reseñarse los compuestos de la fórmula (I) (e igualmente de los grupos 1 hasta 7), en la que R^1 significa $-C(=O)C(=O)R^2$, teniendo R^2 los significados anteriormente indicados.

Los restos hidrocarbonados saturados o insaturados tales como alquilo o alquenilo pueden ser, incluso en combinación con heteroátomos, tal como por ejemplo en alcoxi, respectivamente de cadena lineal o de cadena ramificada en tanto en cuanto sea posible. Del mismo modo, los restos hidrocarbonados doblemente enlazados, tales como alquileno (alcanodiilo) pueden ser de cadena lineal o de cadena ramificada, en tanto en cuanto sea posible.

Los restos substituidos, en caso dado, pueden estar mono o polisubstituidos, pudiendo ser iguales o diferentes los substituyentes en el caso de polisubstituciones. De este modo, la definición dialquilamino abarca, también, un grupo amino substituido de manera asimétrica por alquilo tal como por ejemplo metil-etilamino.

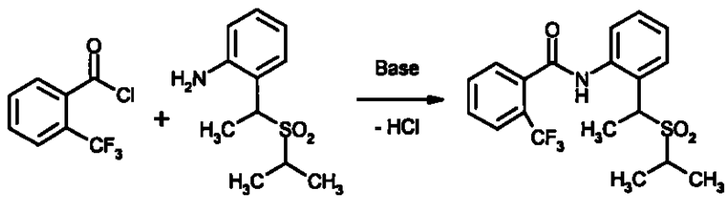
Los restos substituidos por halógeno, tal como por ejemplo halogenoalquilo, está n mono o polihalogenados. En el caso de varias halogenaciones, los á tomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes. En éste caso halógeno significa flúor, cloro, bromo y yodo, especialmente significa flúor, cloro y bromo.

Las definiciones de los restos o bien las explicaciones indicadas anteriormente de manera general o indicadas en los intervalos preferentes pueden combinarse arbitrariamente entre los intervalos correspondientes y los intervalos preferentes. Éstas son vá lidas para los productos finales así como, de manera correspondiente, para los productos de partida y para los productos intermedios. Especialmente los compuestos citados en los grupos 1 hasta 6 pueden combinarse tanto con los significados generales así como también con los significados preferentes, especialmente preferentes, etc., siendo posibles también en este caso respectivamente todas las combinaciones entre los intervalos preferentes

Descripción del procedimiento según la invención para la obtención de las hexilcarboxanilidas de la fórmula (I) así como de los productos intermedios

Procedimiento (a)

Si se utilizan el cloruro de 2-triflúormetilbenzoilo y la {2-[1-(isopropilsulfonil)etil]fenil}-amina como productos de partida, podrá representarse el procedimiento (a) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



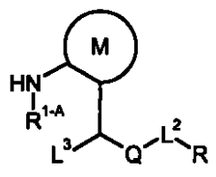
Los derivados de ácido carboxílico, necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento (a) según la invención están definidos, en general, por medio de la fórmula (II). En ésta fórmula (II), A tiene preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados para A como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula (I). Preferentemente X^1 significa cloro, bromo o hidroxi.

Los derivados de ácido carboxílico de la fórmula (II) son conocidos en su mayor parte y/o pueden prepararse según procedimientos en sí conocidos (véanse las publicaciones WO 93/11117, EP-A 0 545 099, EP-A 0 589 301 y EP-A 0 589 313).

Los derivados de anilina, necesarios además como productos de partida para la realización del procedimiento (a) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (III). En ésta fórmula (III), R^1, M, Q, L^2 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. Preferentemente, L^3 significa hidrógeno o alquilo con 1 a 3 átomos de carbono, de forma especialmente preferente significa hidrógeno o metilo.

Los derivados de anilina de la fórmula (III) son nuevos.

Los derivados de anilina de la fórmula (III-a)

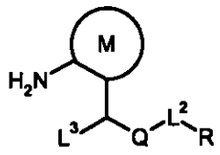


(III-a)

en la que R^{1-A}, M, Q, L^2, R y L^3 tienen los significados anteriormente indicados,

se obtienen, si

(d) se hacen reaccionar derivados de anilina de la fórmula (III-b)



(III-b)

en la que M, Q, L^2, R y L^3 tienen los significados anteriormente indicados,

con halogenuros de la fórmula (VI)

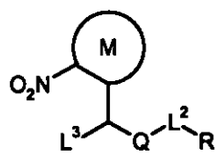
$$R^{1-A}—X^2 \qquad (VI)$$

en la que R^{1-A} y X^2 tienen los significados anteriormente indicados,

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

Los derivados de anilina de la fórmula (III-b) se obtienen, si

(e) se hacen reaccionar nitro-compuestos de la fórmula (VII)



(VII)

en la que M, Q, L^2, R y L^3 tienen los significados anteriormente indicados,

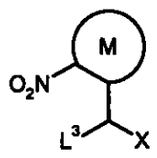
en presencia de un metal y de un agente reductor, así como, en caso dado, en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de otro agente auxiliar de la reacción.

Los nitro-compuestos, necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento (e) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (VII) En éste fórmula (VII), M, Q, L^2, R y L^3 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados de manera preferente, de manera especialmente

preferente o bien de manera muy especialmente preferente para estos restos en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula (I) o bien de la fórmula (III).

Los nitro-compuestos de la fórmula (VII) se obtienen, si

(f) se hace reaccionar un nitro-compuesto de la fórmula (VIII)

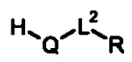


(VIII)

en la que M y L^3 tienen los significados anteriormente indicados,

X significa cloro, bromo o yodo,

con un compuesto de la fórmula (IX)



(IX)

en la que Q, L^2 y R tienen los significados anteriormente indicados,

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

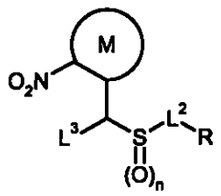
Los nitro-compuestos, necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento (f) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (VIII). En ésta fórmula (VIII), M y L^3 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula (I) o bien de la fórmula

(III). Preferentemente X significa cloro

Los compuestos necesarios, además, como productos de partida para la realización del procedimiento (f) según la invención están definidos en general, por medio de la fórmula (IX). En ésta fórmula (IX), Q, L^2 y R tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula (I) o bien de la fórmula (III).

Los compuestos de la fórmula (IX) son conocidos o pueden obtenerse según procedimientos conocidos.

Los nitro-compuestos de la fórmula (VII-a)



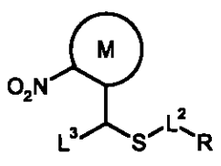
(VII-a)

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

n significa 1 o 2,

se obtienen, si

(g) se hacen reaccionar nitro-compuestos de la fórmula (VII-b)

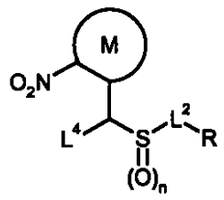


(VII-b)

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

en presencia de un agente oxidante así como, en caso dado, en presencia de un diluyente y, en caso dado, en presencia de otro agente auxiliar de la reacción.

Los nitro-compuestos de la fórmula (VII-c)



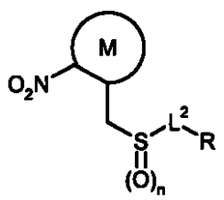
(VII-c)

en la que M, L^2, R y n tienen los significados anteriormente indicados,

L^4 significa alquilo con 1 a 9 á tomos de carbono, preferentemente significa alquilo con 1 a 5 át omos de carbono, de forma especialmente preferente significa metilo,

se obtienen si

(h) se hace reaccionar un nitro-compuesto de la fórmula(VII-d)



(VII-d)

en la que M, L^2, R y n tienen los significados anteriormente indicados,

con halogenuros de la fórmula (X)

$L^4—X^2$ (X)

en la que L^4 y X^2 tienen los significados anteriormente indicados,

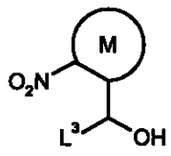
en presencia de una base y en presencia de un diluyente.

Los halogenuros de la fórmula (X) son conocidos.

Los compuestos de las fórmulas (VII-a), (VII-b), (VII-c) y (VII-d) son subgrupos de nitro-compuestos de la fórmula (VII) y quedan abarcados por la descripción general de éstos compuestos. Las definiciones preferentes, especialmente preferentes, etc son válidas, de manera correspondiente en éste caso.

Los nitro-compuestos de la fórmula (VIII) se obtienen, si

(j) se halogenan hidroxiderivados de la fórmula (XI)



(XI)

en la que M y L^3 tienen los significados anteriormente indicados,

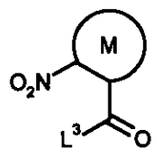
en caso dado en presencia de un diluyente, en caso dado en presencia de un aceptor de ácido y, en caso dado, en presencia de un catalizador.

Los hidroxiderivados, necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento (j) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (XI). En éste fórmula (XI), M y L^3 tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para estos restos en relación con la

descripción de los compuestos según la invención de la fórmula (I) o bien de la fórmula (III).

Los hidroxiderivados de la fórmula (XI) se obtienen, si

(k) se hacen reaccionar aromatos acilados de la fórmula (XII)



(XII)

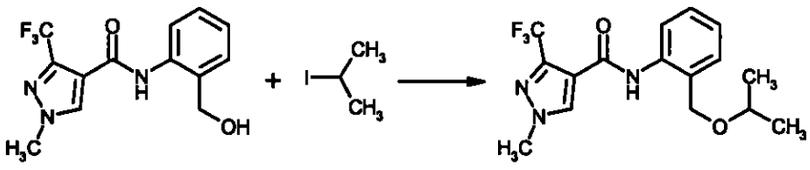
en la que M y L^3 tienen los significados anteriormente indicados,

en presencia de un agente reductor así como, en caso dado, en presencia de un diluyente, en caso dado en presencia de un ácid o y, en caso dado, en presencia de un catalizador.

Los derivados de anilina de la fórmula (III) pueden obtenerse también en analogía con los procedimientos conocidos (véase la publicación EP-A 0 737 682).

Procedimiento (b)

Si se emplean la N-[2-(hidroximetil)fenil]-1-metil-3-(triflúormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida y el 2-yodopropano como productos de partida, podrá representarse el procedimiento según la invención (b) por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Las carboxamidas, necesarias como productos de partida para la realización del

procedimiento (b) según la invención están definidas, en general, por medio de la fórmula (IV). En ésta fórmula (IV), M, L^1, Q y A tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados como preferentes, como especialmente preferente o bien como muy especialmente preferentes para A en relación con la descripción de los compuestos según la invenciónde la fórmula (I).

Los compuestos, necesarios además como productos de partida para la realización del procedimiento (b) según la invención están definidos, en general, por medio de la fórmula (V). En ésta fórmula (V), L^2 y R tienen preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados como preferentes, como especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes para A en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula (I). Preferentemente Y significa cloro, bromo, yodo, triflato (triflúormetilsulfonilo), mesilato (metilsulfonilo) o tosilato (4-metilfenilsulfonilo), de forma especialmente preferente significa bromo, yodo o triflato (triflúormetilsulfonilo).

Los compuestos de la fórmula (V) son conocidos o pueden obtenerse según procedimientos conocidos. Las carboxamidas de la fórmula (IV) son nuevas. Éstas se obtienen, si

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



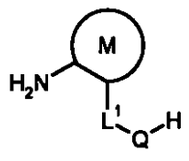
(II)

en la que

A tiene los significados anteriormente indicados y

X^1 significa halógeno o hidroxi,

con derivados de anilina de la fórmula (XIII)



(XIII)

en la que M, L^1 y Q 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 aceptor de ácid o y, en caso dado, en presencia de un diluyente.

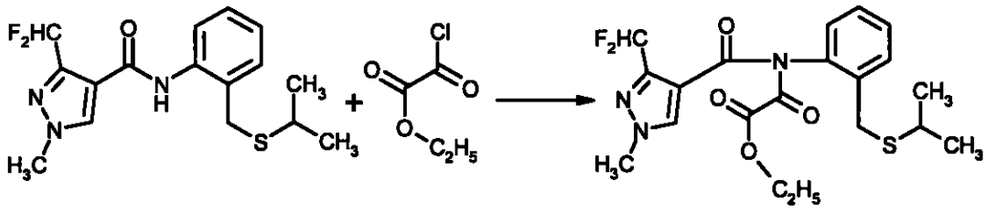
Los derivados de ácid os carboxílicos de la fórmula (II), necesarios como productos de partida para la realización del procedimiento (m) según la invención han sido descritos ya en relación con el procedimiento (a) según la invención.

Los derivados de anilina, necesarios además como productos de partida para la realización del procedimiento (m) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (XIII). En ésta fórmula (XIII), M, L^1 y Q 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 según la invención de la fórmula (I).

Los derivados de anilina de la fórmula (XIII) son conocidos o pueden obtenerse según procedimientos conocidos.

Procedimiento (c)

Si se emplean la 3-(diflúormetil)-N-{2-[(isopropiltio)metil]fenil}-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida y el cloro(oxo)acetato de etilo como productos de partida podrá representarse el desarrollo del procedimiento (c) según la invención por medio del esquema de fórmulas siguiente:



Las hexilcarboxanilidas, necesarias como productos de partida para la realización del procedimiento (c) según la invención, están definidas, en general, por medio de la fórmula (I-a). En ésta fórmula (I-a), M, L^1, Q, L^2, R 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 según la invención de la fórmula (I).

Las hexilcarboxanilidas de la fórmula (I-a) son igualmente compuestos según la invención y constituyen un objeto de ésta solicitud. Éstas pueden obtenerse según el procedimiento (a) según la invención(con R = hidrógeno).

Los halogenuros, necesarios además como productos de partida para la realización del procedimiento (c) según la invención, están definidos, en general, por medio de la fórmula (VI). En ésta fórmula (VI), R^{1-A} tiene preferentemente, de forma especialmente preferente o bien de forma muy especialmente preferente aquellos significados que ya han sido citados para éste resto como preferentes, como

especialmente preferentes o bien como muy especialmente preferentes en relación con la descripción de los compuestos según la invención de la fórmula (I-b). Preferentemente X^2 significa cloro o bromo

Los halogenuros de la fórmula (VI) son conocidos.

Condiciones de la reacción.

Como diluyentes para la realización de los procedimientos (a) y (m), según la invención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A éstos pertenecen, preferentemente los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como por ejemplo el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno o la decalina, los hidrocarburos halogenados, tales como por ejemplo el clorobenceno, el diclorobenceno, el diclorometano, el cloroformo, el tetraclorometano, el dicloroetano, o el tricloroetano; los éteres, tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-terc.-butiléter, el metil-terc.-amiléter, el dioxano, el tretrahidrofurano, 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 hexametilfósforotriamida.

Los procedimientos (a) y (m), según la invención, se llevan a cabo, en caso dado, en presencia de un aceptor de ácido adecuado. Como tales entran en consideración todas las bases inorgánicas u orgánicas usuales. A éstas pertenecen, preferentementdiazabie, los hidruros, los hidróxidos, las amidas, los alcoholatos, los acetatos, 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 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 diazabiciclooctano (DABCO), el diazabiciclononeno (DBN), o el diazabicicloundeceno (DBU).

Los procedimientos (a) y (m), según la invención, se llevan a cabo, en caso dado, en presencia de un agente de condensación adecuado. Como tales entran en consideración todos los agentes de condensación empleables usualmente para este tipo de reacciones de amidación. De manera ejemplificativa pueden citarse los formadores de halogenuro de acilo tales como el fosgeno, el tribromuro de fósforo, el tricloruro de fósforo, el pentacloruro de fósforo, el oxicloruro de fósforo, el cloruro de oxalilo 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'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes de condensación usuales, tales como el pentóxido de fósforo, el ácido polifosfórico, el N,N'-carbonildi imidazol, el 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), la trifenilfosfina/tetracloruro de carbono o el hexaflúorfosfato de bromo-tripirrolidinofosfonio.

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

Las temperaturas de la reacción en la realización de los procedimientos (a) y (m), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja

a temperaturas desde 0°C hasta 150°C, preferentemente a temperaturas desde 0°C hasta 80°C.

Para la realización del procedimiento (a) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), se emplean, por mol del derivado 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 (m) 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 (XIII).

Como diluyentes para la realización de los procedimientos (b), (c), (d) y (h), según la invención, entran en consideración todos los disolventes orgán icos inertes. A éstos pertenecen, preferentemente los hidrocarburos alifát icos, alicíclicos o aromáticos, tales como, por ejemplo, el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno o la decalina, los hidrocarburos halogenados, tales como por ejemplo el clorobenceno, el diclorobenceno, el diclorometano, el cloroformo, el tetraclorometano, el dicloroetano, o el tricloroetano; los éteres, tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-terc.-butiléter, el metil-terc.-amiléter, el dioxano, el tretrahidrofurano, 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 hexametilfósforotriamida.

Los procedimientos (b), (c), (d) y (h), según la invención, se llevan a cabo, en caso dado, en presencia de una base. 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, 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 potasio, el bicarbonato de potasio, el bicarbonato de sodio o el carbonato de cesio, así como las aminas terciarias, tales como la trimetilamina, la trietilamina, la trubutilamina, la N,N-dimetilanilina, la N,N-dimetil-bencilamina, la piridina, la N-metilpiperidina, la N-metilmorfolina, la N,N-dimetilaminopiridina, el diazabiciclooctano (DABCO), el diazabiciclononeno (DBN), o el diazabicicloundeceno (DBU).

Las temperaturas de la reacción en la realización de los procedimientos (b), (c), (d) y (h), 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 110°C.

Para la realización del procedimiento (b) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), se emplean, por mol de la carboxamida de la fórmula (IV), en general, desde 0,2 hasta 5 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 2 moles de halogenuro de la fórmula (V).

Para la realización del procedimiento (c) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (I), se emplean, por mol de la hexilcarboxanilida de la fórmula (I-a), en general, desde 0,2 hasta 5 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 2 moles de halogenuro de la fórmula (VI).

Para la realización del procedimiento (d) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (III-a), se emplean, por mol del derivado de anilina de la

fórmula (III-b), en general, desde 0,2 hasta 5 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 2 moles de halogenuro de la fórmula (VI).

Para la realización del procedimiento (h) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (VII-c), se emplean, por mol de un nitro-compuesto de la fórmula (VII-d), en general, desde 0,2 hasta 5 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 2 moles de halogenuro de la fórmula (X).

Como diluyentes para la realización del procedimiento (e) según la invención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen, preferentemente los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como, por ejemplo, el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno o la decalina; éteres, tales como dietiléter, diisopropiléter, metil-t-butiléter, el metil-terc.-amiléter, el dioxano, el tretrahidrofurano, el 1,2-dimetoxietano, el 1,2-dietoxietano o el anisol; las amidas, tales como la N,N-dimetilformamida, la N,N-dimetilacetamida, la N-metilformanilida, la N-metilpirrolidona o la hexametilfosforotriamida; los sulfóxidos, tal como el dimetilsulfóxido, las sulfonas tal como el sulfolano; los alcoholes, tales como el metanol, el etanol, el n- o iso-propanol, el n-, iso-, sec.- o terc.-butanol, el etanodiol, el propano-1,2-diol, el etoxietanol, el metoxietanol, el dietilenglicolmonometiléter, el dietilenglicolmonoetiléter, el trietilenglicol, sus mezclas con agua o el agua pura.

El procedimiento (e) según la invención se lleva a cabo en presencia de un metal. Como tales entran en consideración los metales de transición, tales como, por ejemplo, el paladio, el platino, el rodio, el níquel (níquel Raney), el hierro, el cobalto, el rutenio, el iridio el cinc o el osmio. Los metales pueden estar enlazados sobre materiales de soporte, tales como, por ejemplo, carbones, resinas, zeolitas, sulfatos alcalinos o alcalinotérreos.

El procedimiento (e) según la invención se lleva a cabo en presencia de un agente reductor. Como tales entran en consideración, preferentemente, el hidrógeno elemental, las sales de formiato, preferentemente sales de formiatos alcalinos, tal como, por ejemplo, el formiato de sodio, así como también el formiato de amonio o incluso los hidruros metálicos o bien los hidruros metálicos complejos, tales como, por ejemplo, el hidruro de litio y de aluminio, el borohidruro de sodio.

El procedimiento (e) según la invención puede llevarse a cabo en presencia de ácidos. Como tales entran en consideración, preferentemente, ácidos orgánicos, tales como, por ejemplo, el ácido fórmico, el ácido acético, el ácido ascórbico así como también los ácidos minerales, tal como, por ejemplo el ácido clorhídrico o el ácido sulfúrico.

El procedimiento (e) según la invención puede llevarse a cabo en presencia de bases. Como tales entran en consideración, preferentemente, las bases orgánicas, tal como, por ejemplo, la piridina, así como también las soluciones acuosas de los hidróxidos alcalinos o alcalinotérreos, tales como, por ejemplo, el hidróxido de sodio o el hidróxido de bario.

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento (e), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas desde -80°C hasta 300°C, preferentemente a temperaturas desde 0°C hasta 200°C.

Cuando se utilice hidrógeno elemental, el procedimiento (e) según la invención se llevará a cabo bajo una presión de hidrógeno comprendida entre 0,5 y 200 bares, preferentemente entre 1 y 100 bares.

Para la realización del procedimiento (e) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (III-b), se emplean, por mol del derivado de un nitro-

compuesto de la fórmula (VII), en general, desde 0,8 hasta 1.000 moles, preferentemente desde 1 hasta 500 moles del agente reductor (formiato de amonio, hidruro, etc).

Como diluyentes para la realización del procedimiento (f) según la invención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen, preferentemente los hidrocarburos alifá ticos, alicíclicos o aromát icos, tales como, por ejemplo, el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno o la decalina; los hidrocarburos halogenados, tales como, por ejemplo, el clorobenceno, el diclorobenceno, el diclorometano, el cloroformo, el tetraclorometano, el dicloroetano o el tricloroetano; los éteres, tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-terc.-butiléter, el metil-terc.-amiléter, el dioxano, el tretrahidrofurano, el 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol, amidas, tales como la N,N-dimetilformamida, la N,N-dimetilacetamida, la N-metilformanilida, la N-metilpirrolidona o la hexametilfosforotriamida.

El procedimiento (f), según la invención, se lleva a acabo en presencia de una base. 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, 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 potasio, el bicarbonato de potasio, el bicarbonato de sodio o el carbonato de cesio, así como las aminas terciarias, tales como la trimetilamina, la trietilamina, la trubutilamina, la N,N-dimetilanilina, la N,N-dimetil-bencilamina, la

piridina, la N-metilpiperidina, la N-metilmorfolina, la N,N-dimetilaminopiridina, el diazabiciclooctano (DABCO), el diazabiciclononeno (DBN), o el diazabicicloundeceno (DBU).

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento (f), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas desde 0°C hasta 200°C, preferentemente a temperaturas desde 20°C hasta 150°C.

Para la realización del procedimiento (f) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (VII), se emplean, por mol de un nitro-compuesto de la fórmula (VIII), en general, desde 0,2 hasta 5 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 2 moles de un compuesto de la fórmula (IX).

Como diluyentes para la realización del procedimiento (g) según la invención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen, preferentemente los hidrocarburos alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como, por ejemplo, el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno o la decalina; éteres, tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-t-butiléter, el metil-terc.-amiléter, el dioxano, el tretrahidrofurano, el 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; las amidas, tales como la N,N-dimetilformamida, la N,N-dimetilacetamida, la N-metilformanilida, la N-metilpirrolidona o la hexametilfosforotriamida; los sulfóxidos, tal como el dimetilsulfóxido; las sulfonas tal como el sulfolano.

El procedimiento (g), según la invención, se lleva a cabo en presencia de un agente oxidante. Como tales entran en consideración todos los agentes oxidantes orgánicos e inorgánicos, preferentemente el oxígeno elemental, el ozono, los peróxidos, tales como, por ejemplo, el peróxido de hidrógeno, el ácido m-

cloroperbenzoico, el peróxido de benzoilo, el peróxido de terc.-butilo; la lejía de cloro (hipoclorito de sodio); las sales de cromo tales como, por ejemplo, el óxido de cromo(VI), el ácido crómico, el dicromato de sodio, el clorocromato de piridinio; las sales de manganeso, tales como, por ejemplo, el permanganato de potasio, la pirolusita; el dióxido de selenio; los yodatos y los peryodatos; el peroxodisulfato de potasio.

El procedimiento (g), según la invención, puede llevarse a cabo en presencia de un ácido. Como tales entran en consideración, preferentemente, los ácidos orgánicos, tales como, por ejemplo, el ácido fórmico, el ácido acético, el ácido ascórbico, así como también los ácidos minerales tales como, por ejemplo, el ácido clorhídrico o el ácido sulfúrico.

El procedimiento (g), según la invención, puede llevarse a cabo en presencia de bases. Como tales entran en consideración, preferentemente las bases orgánicas tal como, por ejemplo, la piridina así como, también, las soluciones acuosas de hidróxidos de los metales alcalinos o de los metales alcalinotérreos tales como, por ejemplo, el hidróxido de sodio o el hidróxido de bario.

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento (g), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas desde -80°C hasta 300°C, preferentemente a temperaturas desde -20°C hasta 100°C.

Para la realización del procedimiento (g) según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (VII-a), se emplean, por mol de un nitro-compuesto de la fórmula (VII-b), en general, desde 0,6 hasta 10 moles, preferentemente desde 0,8 hasta 5 moles de agente oxidante.

Como diluyentes para la realización del procedimiento (j) según la invención

entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen, preferentemente los hidrocarburos alifá ticos, alicíclicos o aromát icos, tales como, por ejemplo, el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno o la decalina; los hidrocarburos halogenados, tales como, por ejemplo, el clorobenceno, el diclorobenceno, el diclorometano, el cloroformo, el tetraclorometano, el dicloroetano o el tricloroetano; los éteres, tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-terc.-butiléter, el metil-terc.-amiléter, el dioxano, el tretrahidrofurano, 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 hexametilfosforotriamida.

El procedimiento (j) según la invención se lleva a cabo en presencia de de un aceptor de ácido adecuado. Como tales entran en consideración todas las bases inorgán icas u orgán icas usuales. A éstas pertenecen, preferentemente, los hidruros, los hidróxidos, las amidas, los alcoholatos, los acetatos, 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 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 trubutilamina, la N,N-dimetilanilina, la N,N-dimetil-bencilamina, la piridina, la N-metilpiperidina, la N-metilmorfolina, la N,N-dimetilaminopiridina, el diazabiciclooctano (DABCO), el diazabiciclononeno (DBN), o el diazabicicloundeceno (DBU).

El procedimiento (j), según la invención, se lleva a cabo en presencia de un agente de halogenación adecuado. Como tales entran en consideración los agentes de halogenación empleables usualmente para este tipo de reacciones de halogenación. De manera ejemplificativa pueden citarse los formadores de halogenuro tales como el fosgeno, el tribromuro de fósforo, el tricloruro de fósforo, el pentacloruro de fósforo, el oxicloruro de fósforo, el cloruro de oxalilo 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, u otros agentes de condensación usuales, tales como el pentóxido de fósforo, el ácido polifosfórico, el N,N'-carboni ldiimidazol, la 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), la trifenilfosfina/tetracloruro de carbono o el hexaflúorfosfato de bromo-tripirrolidinofosfonio.

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

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento (j), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas comprendidas entre 0°C y 200°C, preferentemente a temperaturas desde 0°C hasta 150°C.

Para la realización del procedimiento (j), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (VIII), se emplean, por mol de un hidroxi-derivado de la fórmula (XI), en general, desde 0,2 hasta 10 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 5 moles de agente de halogenación.

Como diluyentes para la realización del procedimiento (k) según la invención, entran en consideración todos los disolventes orgánicos inertes. A estos pertenecen,

preferentemente los hidrocarburos alifát icos o alicíclicos, tales como, por ejemplo, el éter de petróleo, el hexano, el heptano, el ciclohexano, el metilciclohexano, el benceno, el tolueno, el xileno o la decalina; los hidrocarburos halogenados, tales como, por ejemplo, el clorobenceno, el diclorobenceno, el diclorometano, el cloroformo, el tetraclorometano, el dicloroetano o el tricloroetano; los éteres, tales como el dietiléter, el diisopropiléter, el metil-terc.-butiléter, el metil-terc.-amiléter, el dioxano, el tretrahidrofurano, 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 hexametilfosforotriamida; alcoholes, tales como metanol, etanol, iso-propanol

El procedimiento (k) según la invención se lleva a cabo en presencia de un agente reductor adecuado. Como tales entran en consideración agentes reductores inorgán icos u orgánic os. A estos pertenecen, preferentemente, los hidruros de los metales alcalinotérreos o de los metales alcalinos, tal como, por ejemplo, el hidruro de sodio, o los hidruros complejos, tales como, por ejemplo, el hidruro de litio y de aluminio, el borohidruro de sodio, el cianoborohidruro de sodio, el hidruro de diisobutil-aluminio, el borano, el diborano o los complejos de borano, tal como, por ejemplo, el borano-piridina, los silanos, tal como, por ejemplo, el trietilsilano, los metales, tales como, por ejemplo, el sodio, el litio, el cinc, el hierro o el hidrógeno.

El procedimiento (k) según la invención se lleva a cabo en presencia de un ácido adecuado o de un ácido de Lewis. Como tales entran en consideracióntodos los ácidos/ácido s de Lewis empleables usualmente para tales reducciones realizadas por medio de ácidos/ácidos de Lewis. De manera ejemplificativa pueden citarse el ácido clorhídrico, el ácido acético, el ácido trifluoracético, el trifluoruro de boro o los trifluoruros de boro complejos tal como, por ejemplo, el eterato de trifluoruro de boro,

el tricloruro de aluminio, el tricloruro de cerio, compuestos del titanio inorgánicos u orgánicos tal como, por ejemplo, el tetraisopropilato de titanio

El procedimiento (k) según la invención se lleva a cabo en presencia de un catalizador. De manera ejemplificativa pueden citarse metales o sales metálicas, especialmente los metales de transición o sus sales, tales como, por ejemplo, el platino, el paladio, el níquel (níquel Raney), el iridio, el rodio, el osmio, el hierro, el rutenio, el cobalto. Estos metales o bien las sales metálic as pueden estar enlazados o aplicados en caso dado, también, sobre resinas o sobre superficies o bien sobre materiales de soporte (por ejemplo carbones).

Las temperaturas de la reacción en la realización del procedimiento (k), según la invención, pueden variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a temperaturas desde 0°C hasta 200°C, preferentemente a temperaturas desde 0°C hasta 150°C.

Cuando se utilice hidrógeno como agente reductor, la presión en el procedimiento (k) puede variar dentro de amplios límites. En general se trabaja a se lleva a presiones comprendida entre 1 bar y 300 bares, preferentemente comprendida entre 1 bar y 100 bares.

Para la realización del procedimiento (k), según la invención, para la obtención de los compuestos de la fórmula (XI) se emplean, por mol de un aromato acilado de la fórmula (XII), en general, desde 0,2 hasta 10 moles, preferentemente desde 0,5 hasta 5 moles del agente reductor.

Cuando no se diga otra cosa, se llevará n 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 microbicida y pueden emplearse en la prá ctica 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, Oomycetes, Chytridiomycetes, Zygomycetes, Ascomyicetes, Basidiomycetes y Deuteromycetes.

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 cará cter limitativo, algunos patógenos de enfermedades fúngicas y bacterianas, que entran dentro de las definiciones generales anteriormente enumeradas:

tipos de Xanthomonas, tales como por ejemplo Xanthomonas campestris pv. oryzae;

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 ultimun;

tipos de Phytophtora, 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;

tipos de Peronospora, tales como por ejemplo Peronospora pisi o P. brassicae;

tipos de erisife, 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;

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;

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;

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;

tipos de Cercospora, tal como por ejemplo Cercospora canescens;

tipos de Alternaria, tal como por ejemplo Alternaria brassicae;

tipos de Pseudocercosporella, tal como por ejemplo Pseudocercosporella herpotrichoides,

tipos de Rhizoctonia, tal como por ejemplo Rhizoctonia solani

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

Se entenderá n en este contexto por productos reforzadores de las plantas (inductores de resistencia) aquellas substancias que sean capaces de estimular el sistema

inmunológico de las plantas de tal manera que, las plantas tratadas desarrollen una amplia resistencia contra los microorganismos cuando se produzca una inoculación ulterior con estos microorganismos indeseables.

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 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 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 Venturia o de Alternaria.

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

Los productos activos, según la invención, pueden emplearse, en caso dado, en determinadas concentraciones y cantidades de aplicación, también como herbicidas, para influenciar el crecimiento de las plantas, así como para la lucha contra las pestes 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.

De conformidad con 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 de cultivo y de optimación o por medio de métodos 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 subterrá neos de las plantas, tales como brotes, hojas, flores y raíces, pudiéndose indicar de manera ejemplificativa hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos de frutos, frutos y semillas así como raíces, tubérculos y 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, lubrificantes 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, lubrificantes en frío y líquidos caloportadores, de forma especialmente preferente la madera.

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

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

Alternaria, tal como Alternaria tenuis,

Aspergillus, tal como Aspergillus niger,

Chaetomium, tal como Chaetomium globosum,

Coniophora, tal como Coniophora puetana,

Lentinus, tal como Lentinus tigrinus,

Penicillium, tal como Penicillium glaucum,

Polyporus, tal como Polyporus versicolor,

Aureobasidium, tal como Aureobasidium pullulans,

Sclerophoma, tal como Sclerophoma pityophila,

Trichoderma, tal como Trichoderma viride,

Escherichia, tal como Escherichia coli,

Pseudomonas, tal como Pseudomonas aeruginosa,

Staphylococcus, tal como Staphylococcus aureus.

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 poliméros y en masas de recubrimiento para semillas, así como formulaciones de nebulizado en frío y en caliente en volumen ultra-bajo (ULV).

Estas formulaciones se preparan de forma conocida, por ejemplo por mezcla 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 entendedor, podrán 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 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 sus éteres y 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 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 aerosol, tales como los hidrocarburos halogenados tales 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 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, minerales quebrados y fracciones tal como la calcita, el mármol, la piedra pómez, la sepiolita, la dolomita, así como granulados sintéticos constituidos a partir de harinas inorgánicas y orgánicas así como 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 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 sulfonatos de arilo, así como los hidrolizados de albúmina. Como dispersantes entran en consideración, por ejemplo las lejías sulfíticas de lignina y la metilcelulosa.

En las formulaciones pueden emplearse adhesivos tales como la 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 aceites minerales y vegetales.

Pueden emplearse colorantes tales como los pigmentos inorgá nicos, por ejemplo el óxido de hierro, el óxido de titanio, el azul de ferrocianuro y los colorantes orgá nicos tales como los colorantes de alizarina, los colorantes azoicos y los colorantes de ftalocianina metá licos y 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 producto activo, preferentemente entre 0,5 y 90 %.

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

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

Fungicidas:

2-fenilfenol; sulfato de 8-hidroxiquinolina; Acibenzolar-S-metilo; Aldimorph; Amidoflumet; Ampropylfos; Ampropylfos-potasio; Andoprim; Anilazine; Azaconazole; Azoxystrobin, Benalaxyl; Benalaxyl-M; 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; Carpropamid; Carvone; Chinomethionat; Chlobenthiazone; Chlorfenazole; Chloroneb; Chlorothalonil; Chlozolinate; Clozylacon; Cyazofamid; Cyflufenamid; Cymoxanil; Cyproconazole; Cyprodinil; Cyprofuram; Dagger G; Debacarb; Dichlofluanid; Dichlone; Dichlorophen, Diclocymet; Diclomezine; Dicloran;

Diethofencarb; Difenoconazole; Diflumetorim; Dimethirimol; Dimethomorph; Dimoxystrobin; Diniconazole; Diniconazole-M; Dinocap; difenilamina; Dipyrithione; Ditalimfos; Dithianon; Dodine; Drazoxolon; Edifenphos; Epoxiconazole; Ethaboxam; Ethirimol; Etridiazole; Famoxadone; Fenamidone; Fenapanil; Fenarimol; Fenbuconazole, Fenfuram; Fenhexamid; Fenitropan; Fenoxanil; Fenpiclonil; Fenpropidin; Fenpropimorph; Ferbam; Fluazinam; Flubenzimine; Fludioxonil; Flumetover; Flumorph; Fluoromide; Fluoxastrobin; Fluquinconazole; Flurprimidol; Flusilazole; Flusulfamide; Flutolanil; Flutriafol; Folpet; Fosetyl-Al; Fosetyl-sodio; Fuberidazole; Furalaxyl; Furametpyr; Furcarbanil; Furmecyclox; Guazatine; hexaclorobenceno, Hexaconazole, Hymexazol; Imazalil; Imibenconazole; Iminoctadine triacetato; Iminoctadine tris(albesil; Iodocarb; Ipconazole; Iprobenfos; Iprodione; Iprovalicarb; Irumamycin; Isoprothiolane; Isovaledione; Kasugamycin; Kresoxim-metilo; Mancozeb; Maneb; Meferimzone; Mepanipyrim; Mepronil; Metalaxyl, Metalaxyl-M; Metconazole; Methasulfocarb; Methfuroxam; Metiram; Metominostrobin; Metsulfovax; Mildiomycin; Myclobutanil; Myclozolin; Natamycin; Nicobifen; Nitrothal-isopropilo; Noviflumuron; Nuarimol; Ofurace; Orysastrobin; Oxadixyl; ácido Oxolinico; 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; Pyroxyfur; Pyrrolnitrine; Quinconazole; Quinoxyfen; Quintozene; Simeconazole; Spiroxamine; Sulfur; Tebuconazole; Tecloftalam; Tecnazene; Tetcyclacis; Tetraconazole; Thiabendazole; Thicyofen; Thifluzamide; Thiophanate-metilo, Thiram; Tioxymid; Tolclofos-metilo; Tolylfluanid; Triadimefon; Triadimenol; Triazbutil;

Triazoxide; Tricyclamide; Tricyclazole; Tridemorph; Trifloxystrobin; Triflumizole; Triforine; Triticonazole; Uniconazole; Validamycin A; Vinclozolin; Zineb; Ziram; Zoxamide; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-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-tricloro-2,6-piridindicarbonitrilo; Actinovate; cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol; 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo; carbonato monopotásico; N-(6-metoxi-3-piridinil)-ciclopropanocarboxamida; N-butil-8-(1,1-dimetiletil)-1-oxaspiro[4.5]decan-3-amina; tetratiocarbonato de sodio; así como sales de cobre y preparaciones de cobre, tales como mezclas de Bordeaux; hidróxido de cobre; naftenato de cobre; oxicloruro de cobre; sulfato de cobre; Cufraneb; óxidode cobre; Mancopper; oxina de cobre.

Bactericidas:

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

Insecticidas / acaricidas / nematicidas:

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, Isoprocarb, Metam-sodio, Methiocarb, Methomyl, Metolcarb, Oxamyl, Pirimicarb, Promecarb, Propoxur, Thiodicarb,

Thiofanox, Triazamate, Trimethacarb, XMC, Xylylcarb)

1.2 Organofosfatos (por ejemplo Acephate, Azamethiphos, Azinphos (-metilo, -etilo), Bromophos-etilo, Bromfenvinfos (-metilo), Butathiofos, Cadusafos, Carbophenothion, Chlorethoxyfos, Chlorfenvinphos, Chlormephos, Chlorpyrifos (-metilo/-etilo), Coumaphos, Cyanofenphos, Cyanophos, Chlorfenvinphos, Demeton-S-metilo, Demeton-S-metilsulfona, 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-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, 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, 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, Flubrocythrinate, Flucythrinate, Flufenprox, Flumethrin, 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))

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

4. Moduladores del receptor de la acetilcolina

4.1 Spinosinas (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-benzoato, Ivermectin, Milbemectin, Milbemycin)

7. Miméticos de la hormona juvenil

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

8. Agonistas/disruptoes de Ecdyson

8 1 Diacilhidrazinas (por ejemplo Chromafenozide, Halofenozide, Methoxyfenozide,

Tebufenozide)

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

9.3 Cyromazine

10. Inhibidores de la fosforilaciónoxidante, disruptores de ATP

10.1 Diafenthiuron

10.2 Organotinas (por ejemplo Azocyclotin, Cyhexatin, Fenbutatin- oxido)

11. Desacopladores de la fosforilación oxidante mediante interrupción de gradiente protónico de H

11.1 Pirroles (por ejemplo Chlorfenapyr)

11.2 Dinitrofenoles (por ejemplo Binapacyrl, Dinobuton, Dinocap, DNOC)

12. Inhibidores del transporte electrónicoen el lado I

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

12.2 Hydramethylnone

12.3 Dicofol

13. Inhibidores del transporte electrónicoen el lado II

13.1 Rotenone

14. Inhibidores del transporte electrónicoen 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

16.1 Ácidos tetrónicos (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-3-en-4-yl ethyl ester (CAS-Reg.-No.: 203313-25-1)]

17. Carboxamidas

(por ejemplo Flonicamid)

18. Agonistas octopaminérgicos

(por ejemplo Amitraz)

19. Inhibidores de la ATPase estimulados por magnesio

(por ejemplo Propargite)

20. Ftalamidas

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

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

23.1 Agentes para la gasificación (por ejemplo fosfuro de aluminio, bromuro de

metilo, fluoruro de sulfurilo)

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, Chinomethionat, Chlordimeform, Chlorobenzilate, Chloropicrin, Clothiazoben, Cycloprene, Dicyclanil, Fenoxacrim, Fentrifanil, Flubenzimine, Flufenerim, Flutenzin, Gossyplure, Hydramethylnone, Japonilure, Metoxadiazone, Petroleum, Piperonyl butoxide, oleato de potasio, Pyridalyl, Sulfluramid, Tetradifon, Tetrasul, Triarathene, Verbutin,

además el compuesto 3-metil-fenil-propilcarbamato (Tsumacide Z), el compuesto 3-(5-cloro-3-piridinil)-8-(2,2,2-triflúoretil)-8-azabiciclo[3.2.1]octan-3-carbonitrilo (CAS-Reg.-Nr. 185982-80-3) y el correspondiente isómero 3-endo (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.

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 difásicos (por ejemplo contra especies de Candida, tal como Candida albicans, Candida glabrata) así como Epidermophyton floccosum, especies de Aspergillus, tales como Aspergillus niger y Aspergillus fumigas, especies de Trichophyton, tal como Trichophyton mentagrophytes, especies de microesporas, tal como Microsporon canis

y audouinii. La enumeración de estos hongos no representa en modo alguno una limitación del espectro micótico a ser considerado sino que tiene, únicamente, un carácter orientador.

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

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

Tal como ya se ha indicado anteriormente, pueden tratarse según la invención todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente se tratan plantas y variedades de plantas así como sus partes de origen silvestre o que se obtienen por métodos 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 -Genetically Modified Organisms-) 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.

De conformidad con 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, mejore 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 pestes animales y microbianas, tal como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus así como una mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas se citaran las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, 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 resistencia de las plantas frente a los insectos, arácnidos, nematodos y 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), (denominadas a continuación "plantas Bt"). Como propiedades ("car acterísticas") 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 además, especialmente, la mayor tolerancia de las plantas frente a determinados productos activos herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, Glyphosate o Phosphinotrricin (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" pueden cıtarse variedades de maíz, variedades de algodón, varıedades de soja y variedades de papa, que se comercıalizan 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, 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 varıedades comercializadas para la denominación Clearfield® (por ejemplo maíz). Evidentemente estas manifestaciones son vá lidas 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 ("car acterísticas").

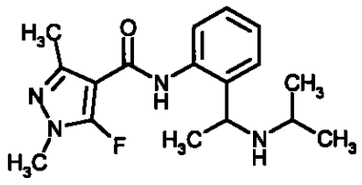
Las plantas indicadas pueden tratarse de forma especialmente ventajosa según la invención con los compuestos de la fórmula general (I) o bıen de las mezclas de los productos activos según la invención. Los sectores preferentes, anteriormente citados, en el caso de los productos activos o bien de las mezclas, son válidos también para el

tratamiento de estas plantas. Debe señalarse de manera especial el tratamiento de las plantas con los compuestos o bien con las mezclas indicadas especialmente en el presente texto

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

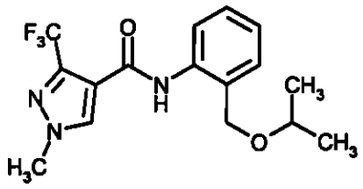
Ejemplos de obtención.

Obtención del compuesto Nr. 40



Se añade, gota a gota, a una solución constituida por 0,27 g (1,5 mmoles) de la 2-[1-(isopropilamino)etil]anilina (III-4) y 0,42 ml (3,0 mmoles) de trietilamina en 5 ml de diclorometano, una solución constituida por 0,27 g (1,5 mmoles) de cloruro de 5-flúor-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carbonilo en 10 ml de diclorometano. La mezcla de la reacción se agita durante 2 horas a 50°C y, a continuación, durante 16 horas a temperatura ambiente. Para la elaboración se vierte sobre agua la mezcla de la reacción, se seca la fase orgánica sobre sulfato de magnesio y se concentra en vacío. L cromatografía en columna (hexano/acetona 4:1) proporciona 0,27 g (56 % de la teoría) de la 5-flúor-N-{2-[1-(isopropilamino)etil]fenil}-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida [log P (pH 2,3) = 0,58].

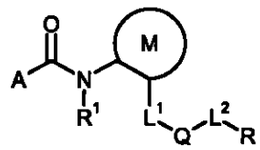
Obtención del compuesto Nr. 60



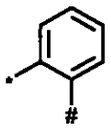
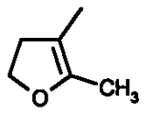
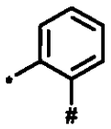
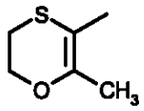
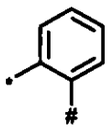
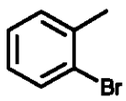
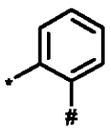
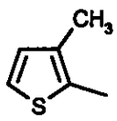
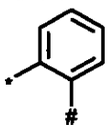
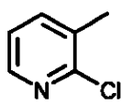
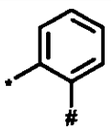
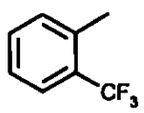
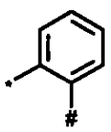
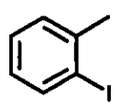
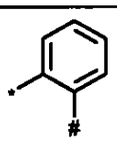
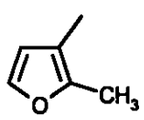
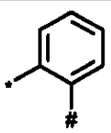
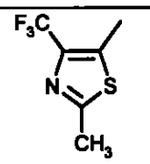
Se añaden, a temperatura ambiente, 156,0 mg (3,9 mmoles) de hidruro de sodio al 60 % en aceite, a una solución constituida por 897,8 mg (3,0 mmoles) de la N-[2-(hidroximetil)fenil]-1-metil-3-(triflúormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida (IV-1) en 2 ml de dimetilformamida. Al cabo de 30 minutos se añaden 0,6 ml (6,0 mmoles) de 2-yodopropano. La mezcla de la reacción se agita durante 6 horas a 100°C y durante 16 horas a temperatura ambiente. A continuación se combina con 1 ml de metanol, se vierte sobre agua, se extrae con acetato de etilo, la fase orgánica se seca sobre sulfato de magnesio, se separa por filtración del agente secante y se concentra en vacío. La cromatografía en columna (ciclohexano/acetato de etilo 3:1) proporciona 100,0 mg (9,7 % de la teoría) de la N-[2-(isopropoximetil)fenil]-1-metil-3-(triflúormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida [log P (pH 2,3) = 2,85].

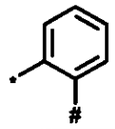
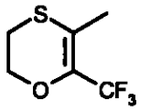
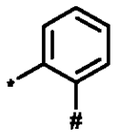
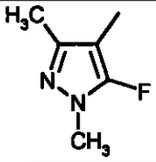
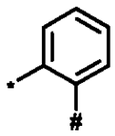
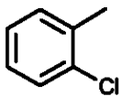
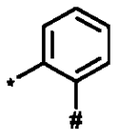
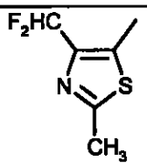
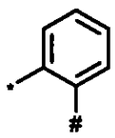
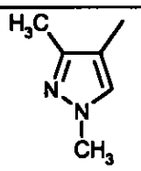
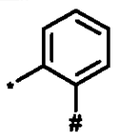
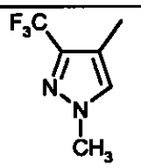
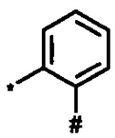
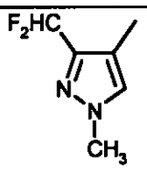
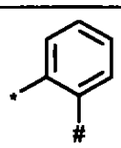
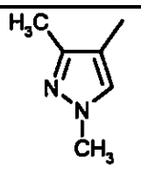
De manera análoga a la de los ejemplos 1 y 2, así como de acuerdo con las indicaciones dadas en la descripción general de los procedimientos de obtención según la invención (a) hasta (m), se obtuvieron también los compuestos de la fórmula (I) citados en la tabla 1 siguiente:

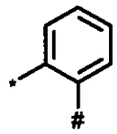
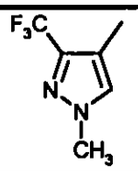
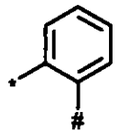
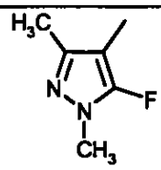
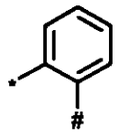
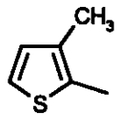
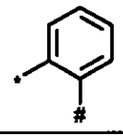
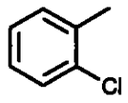
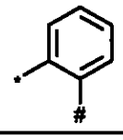
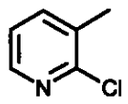
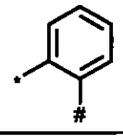
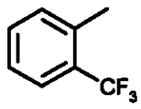
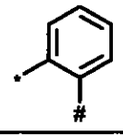
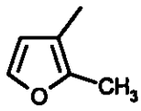
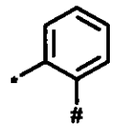
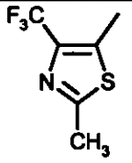
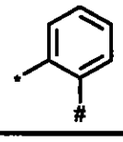
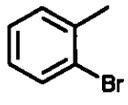
Tabla 1

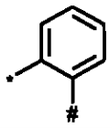
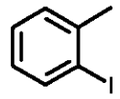
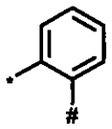
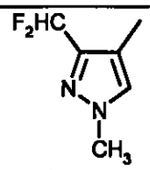
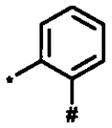
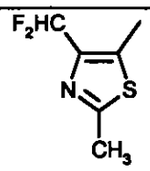
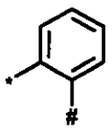
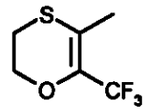
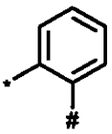
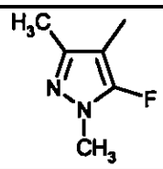
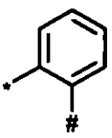
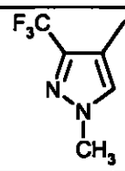
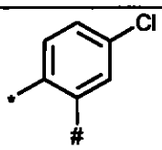
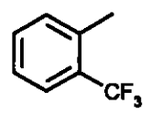
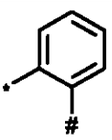
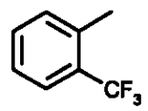


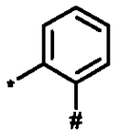
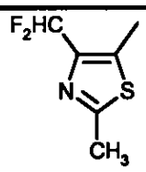
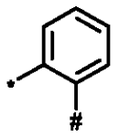
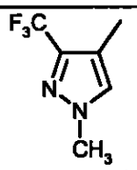
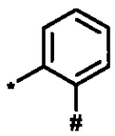
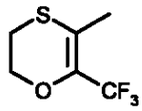
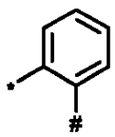
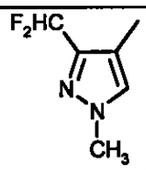
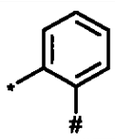
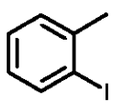
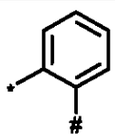
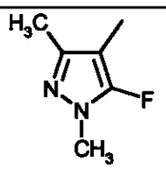
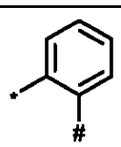
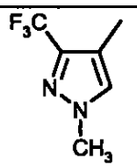
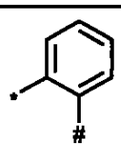
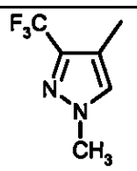
(I)

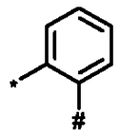
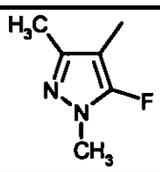
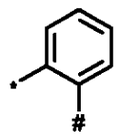
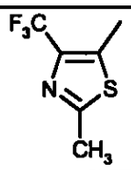
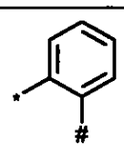
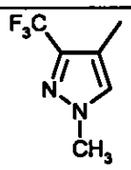
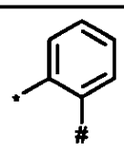
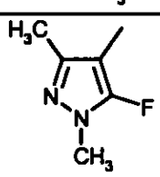
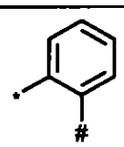
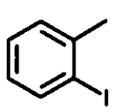
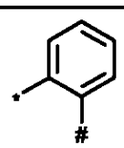
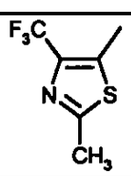
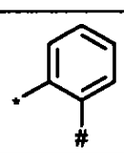
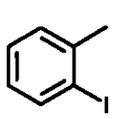
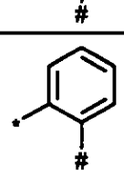
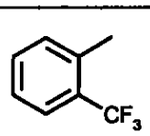
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
1	H		$-CH_2-O-CH_3$		2,18
2	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,07
3	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,30
4	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,38
5	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		1,68
6	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,53
7	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,43
8	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,21
9	H		$-CH(CH_3)-SO_2-CH(CH_3)_2$		2,35

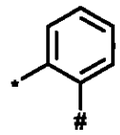
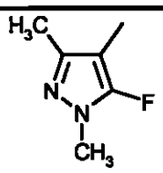
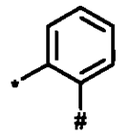
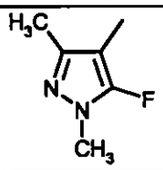
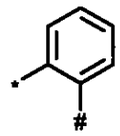
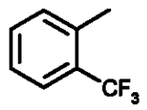
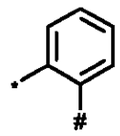
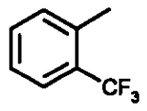
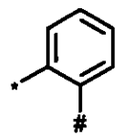
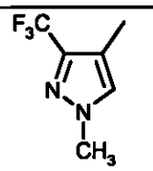
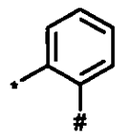
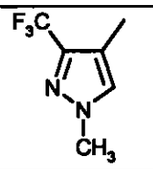
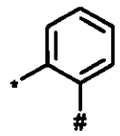
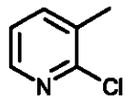
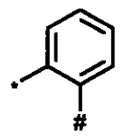
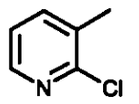
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
10	H		-CH(CH3)-SO2-CH(CH3)2		2,39
11	H		-CH(CH3)-SO2-CH(CH3)2		1,66
12	H		-CH(CH3)-SO2-CH(CH3)2		2,23
13	H		-CH(CH3)-SO2-CH(CH3)2		2,16
14	H		-CH(CH3)-SO2-CH(CH3)2		1,46
15	H		-CH(CH3)-SO2-CH(CH3)2		2,09
16	H		-CH(CH3)-SO2-CH(CH3)2		1,86
17	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		2,53

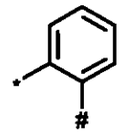
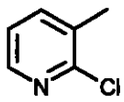
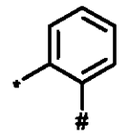
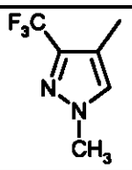
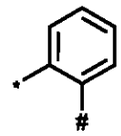
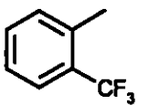
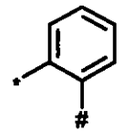
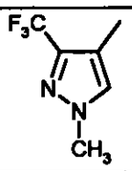
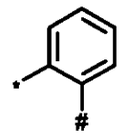
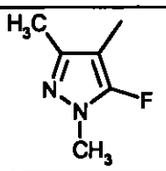
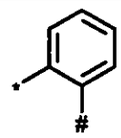
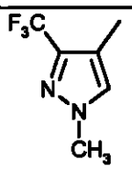
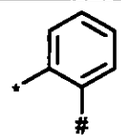
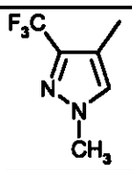
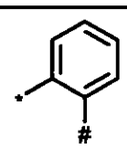
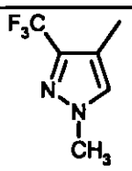
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
18	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,27
19	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		2,98
20	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		4,03
21	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,74
22	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		2,95
23	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,90
24	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,71
25	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,73
26	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,79

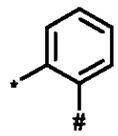
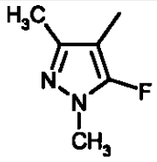
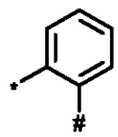
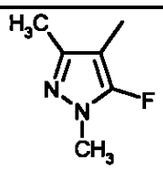
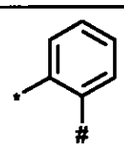
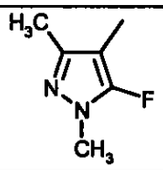
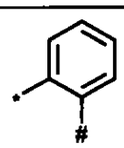
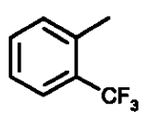
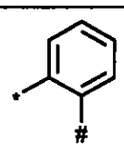
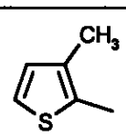
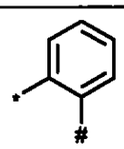
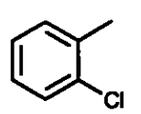
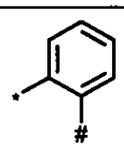
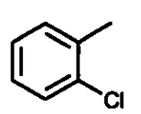
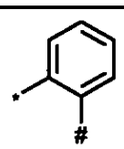
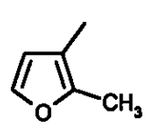
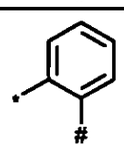
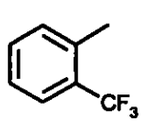
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
27	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,91
28	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,01
29	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,55
30	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,76
31	H		-CH(CH3)-O- CH3		2,17
32	H		-CH(CH3)-O-CH3		2,46
33	H		-CH(CH3)-O-CH3		3,56
34	H		-CH(CH3)-O-CH3		2,99

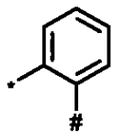
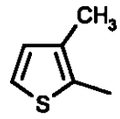
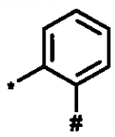
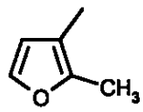
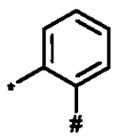
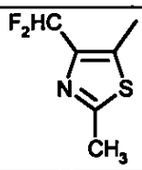
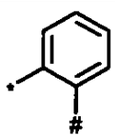
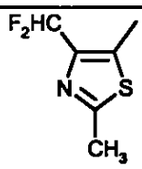
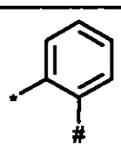
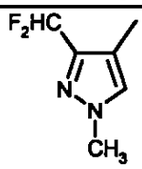
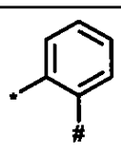
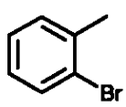
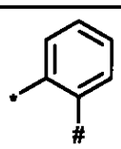
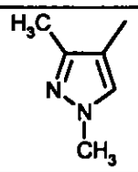
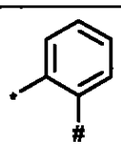
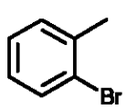
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
35	H		$-CH_2-S-CH(CH_3)_2$		3,27
36	H		$-CH_2-S-CH(CH_3)_2$		3,05
37	H		$-CH_2-S-CH(CH_3)_2$		3,48
38	H		$-CH_2-S-CH(CH_3)_2$		2,76
39	H		$-CH_2-S-CH(CH_3)_2$		3,68
40	H		$-CH(CH_3)-NH-CH(CH_3)_2$		0,58
41	H		$-CH(CH_3)-NH-CH(CH_3)_2$		1,06
42	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,02

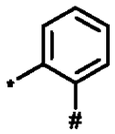
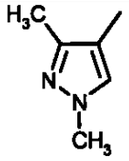
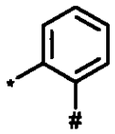
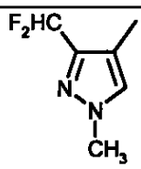
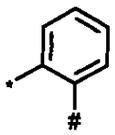
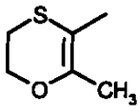
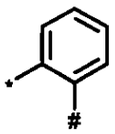
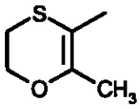
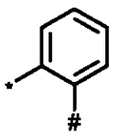
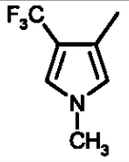
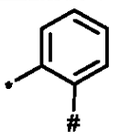
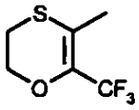
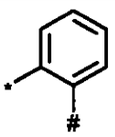
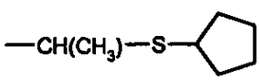
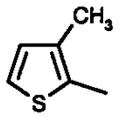
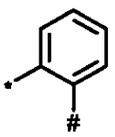
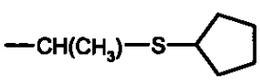
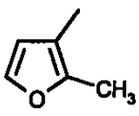
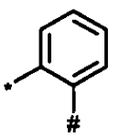
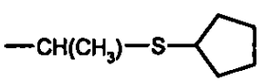
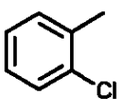
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
43	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		3,82
44	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		4,52
45	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		4,14
46	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		3,38
47	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		4,75
48	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		4,12
49	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		4,33
50	H		-CH₂-O-C(O)-CHCl₂		3,15

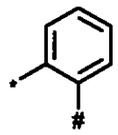
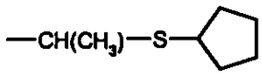
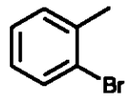
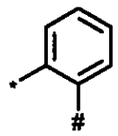
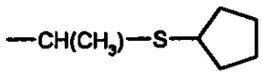
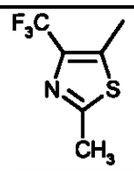
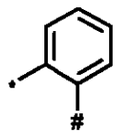
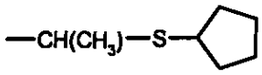
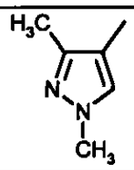
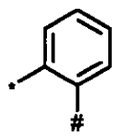
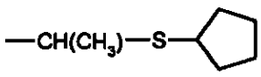
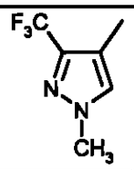
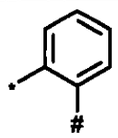
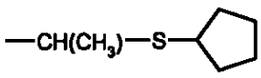
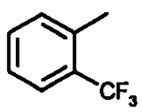
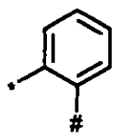
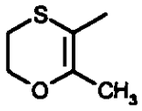
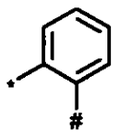
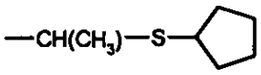
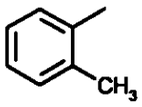
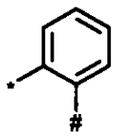
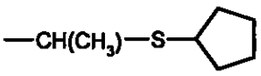
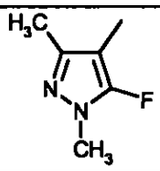
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
51	H		$-CH_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		2,39
52	H		$-CH_2-O-C(O)-CHCl_2$		2,36
53	H		$-CH_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		3,24
54	H		$-CH_2-O-CH(CH_3)_2$		2,51
55	H		$-CH_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		2,74
56	H		$-CH_2-O-C(O)-CHCl_2$		2,69
57	H		$-CH_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		2,38
58	H		$-CH_2-O-C(O)-CHCl_2$		2,38

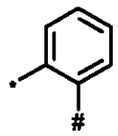
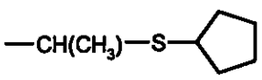
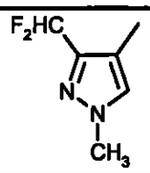
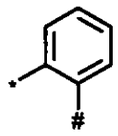
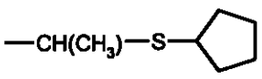
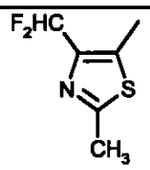
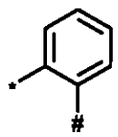
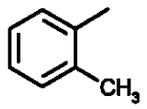
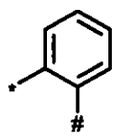
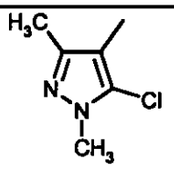
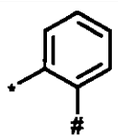
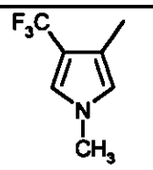
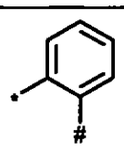
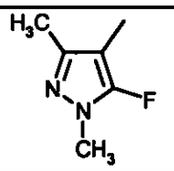
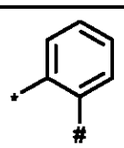
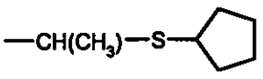
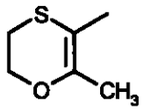
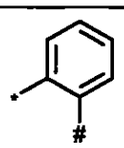
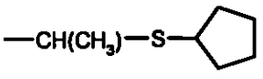
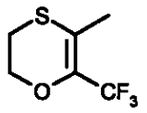
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
59	C(O)i-Pr		$-CH_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		3,49
60	H		$-CH_2-O-CH(CH_3)_2$		2,85
61	H		$-(CH_2)_2C(CH_3)_2-O-C(O)-CH_3$		3,30
62	H		$-(CH_2)_2OH$		1,62
63	H		$-(CH_2)_2OH$		1,21
64	H		$-(CH_2)_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		2,79
65	H		$-(CH_2)_2-O-Si(CH_3)_2-C(CH_3)_3$		4,59
66	H		$-(CH_2)_2-O-C(O)-CHCl_2$		2,76

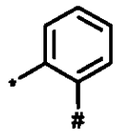
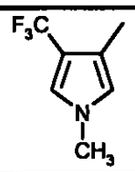
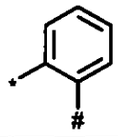
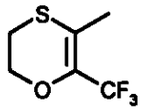
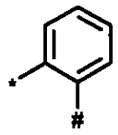
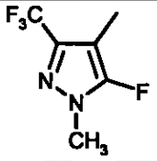
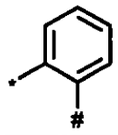
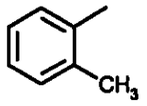
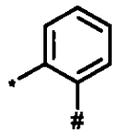
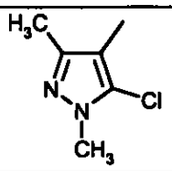
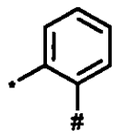
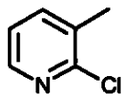
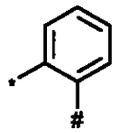
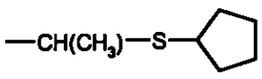
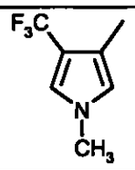
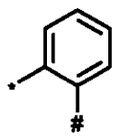
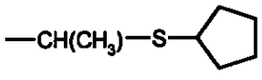
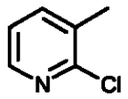
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
67	H		$-(CH_2)_2-O-C(O)-CH(CH_3)_2$		2,40
68	H		$-(CH_2)_2-O-C(O)-CHCl_2$		2,43
69	H		$-(CH_2)_2-O-Si(CH_3)_2-C(CH_3)_3$		4,49
70	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,71
71	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,93
72	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)(CH_2)_2CH_3$		4,60
73	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		4,17
74	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		4,17
75	H		$-CH(CH_3)-S-CH(CH_3)CH_2CH_3$		4,31

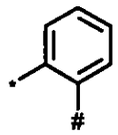
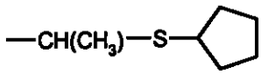
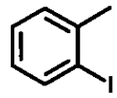
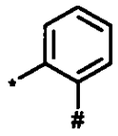
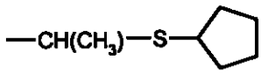
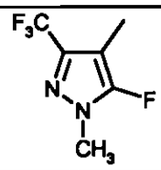
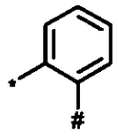
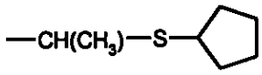
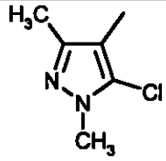
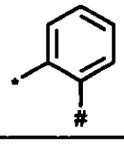
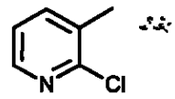
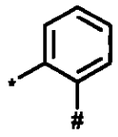
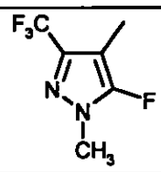
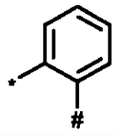
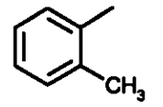
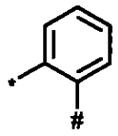
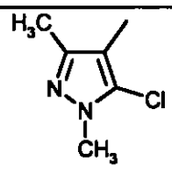
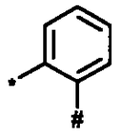
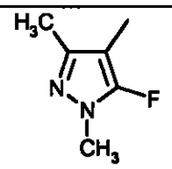
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
76	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		4,47
77	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		4,61
78	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		3,95
79	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		4,36
80	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		3,38
81	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		4,63
82	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		3,27
83	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		4,21

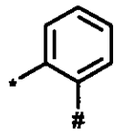
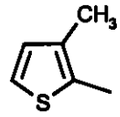
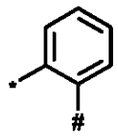
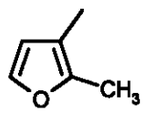
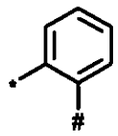
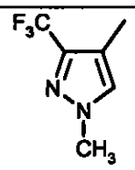
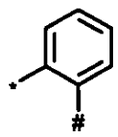
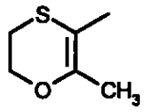
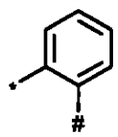
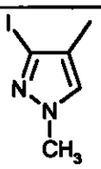
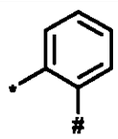
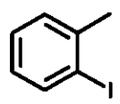
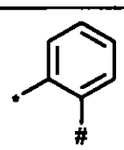
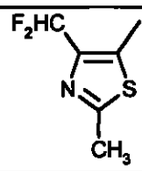
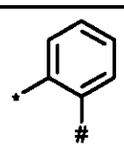
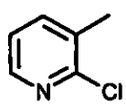
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
84	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		2,90
85	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		3,76
86	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		4,07
87	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		4,53
88	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		3,92
89	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		4,10
90	H				3,16
91	H				4,31
92	H				4,29

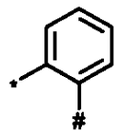
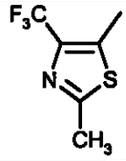
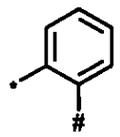
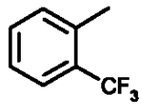
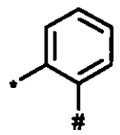
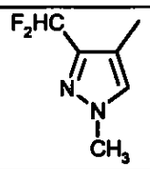
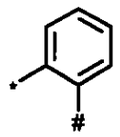
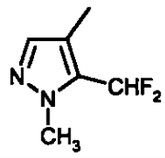
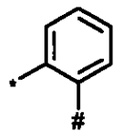
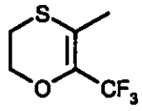
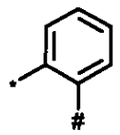
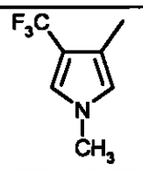
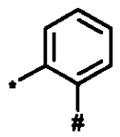
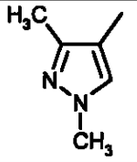
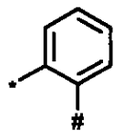
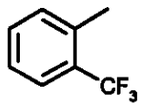
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
93	H				4,34
94	H				4,24
95	H				3,04
96	H				3,76
97	H				4,41
98	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,65
99	H				4,44
100	H				4,03

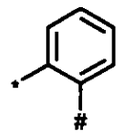
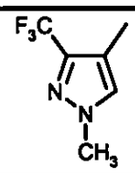
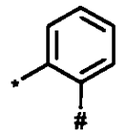
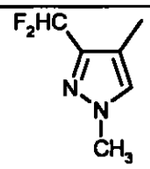
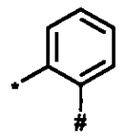
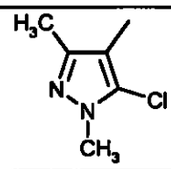
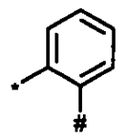
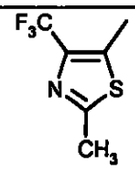
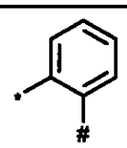
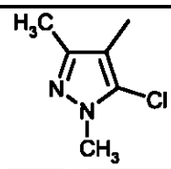
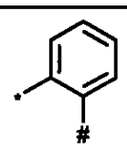
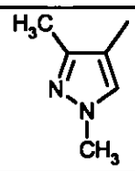
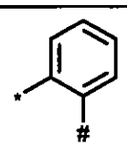
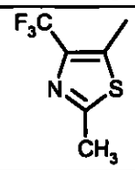
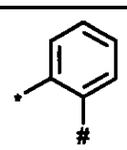
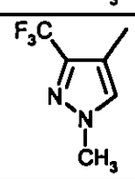
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
101	H				3,48
102	H				4,07
103	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,88
104	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,20
105	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,57
106	H		-CH(CH3)-S-CH(CH3)2		3,63
107	H				4,24
108	H				4,21

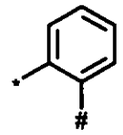
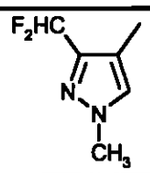
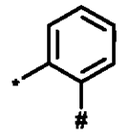
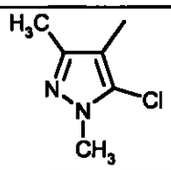
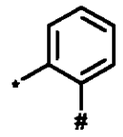
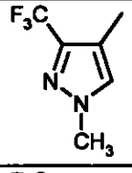
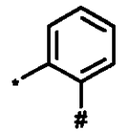
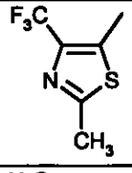
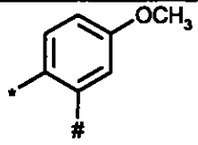
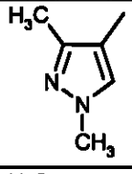
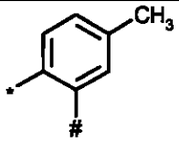
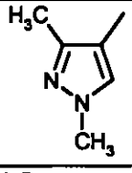
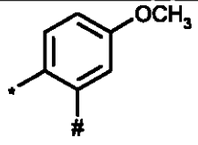
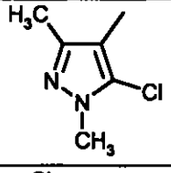
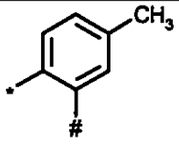
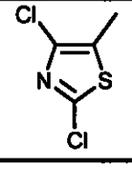
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
109	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		4,29
110	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		4,49
111	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		4,38
112	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		4,76
113	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		4,07
114	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)(CH₂)₂CH₃		3,79
115	H				4,02
116	H				3,46

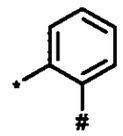
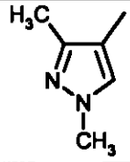
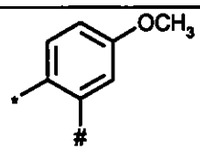
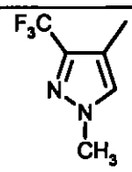
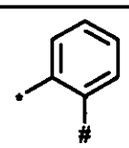
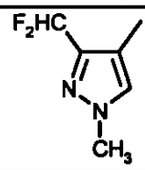
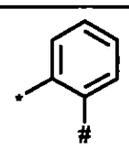
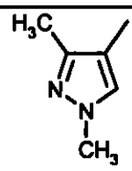
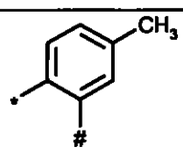
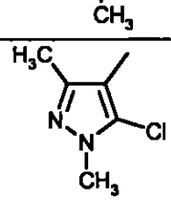
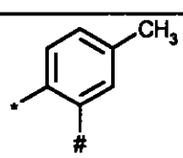
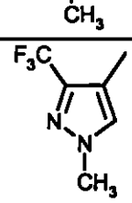
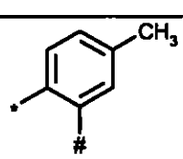
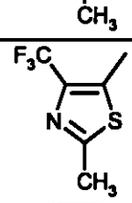
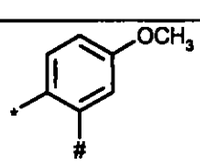
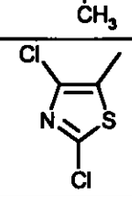
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
117	H				4,45
118	H				4,12
119	H				3,76
120	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		3,35
121	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		3,99
122	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		4,31
123	H		-CH(CH₃)-S-CH(CH₃)CH₂CH₃		3,60
124	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		2,90

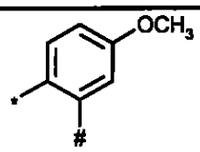
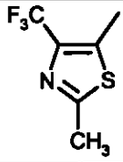
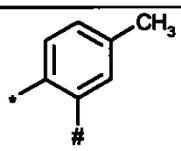
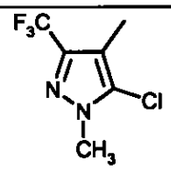
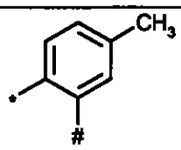
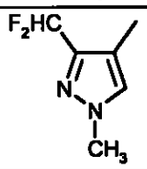
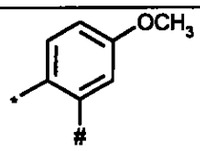
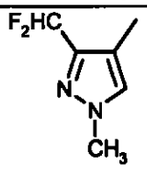
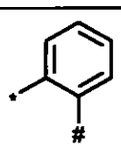
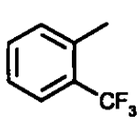
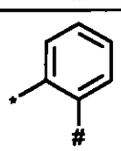
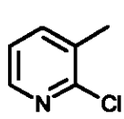
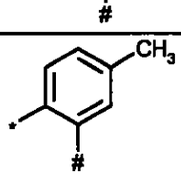
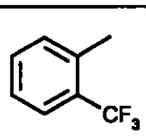
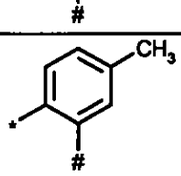
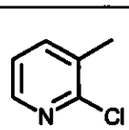
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
125	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		4,50
126	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		3,80
127	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		3,14
128	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		3,47
129	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		2,75
130	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		3,83
131	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		3,58
132	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		2,72

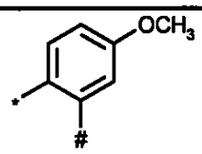
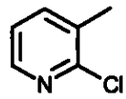
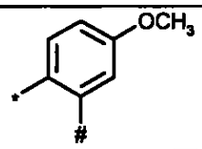
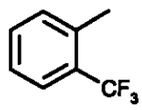
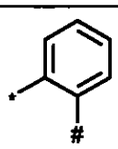
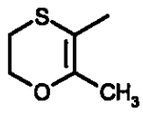
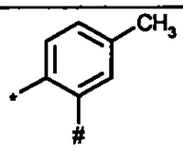
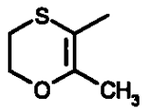
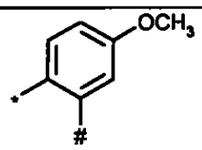
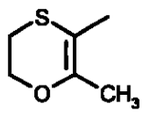
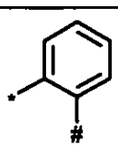
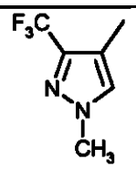
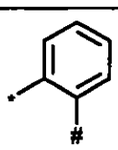
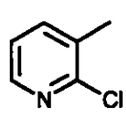
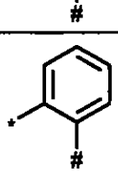
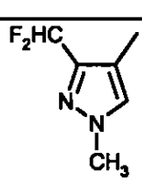
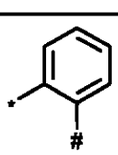
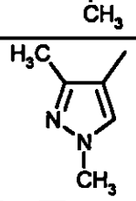
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
133	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		3,65
134	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		3,81
135	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		2,89
136	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		3,67
137	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		3,64
138	H		-CH(CH₃)-O-CH(CH₃)₂		5,60
139	H		-CH₂-N(CH₃)₂		98°C
140	H		-CH₂-N(CH₃)₂		

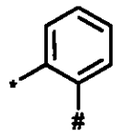
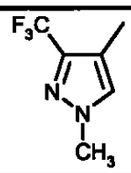
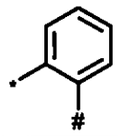
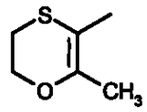
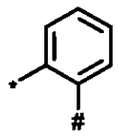
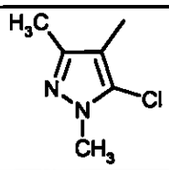
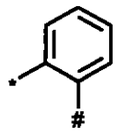
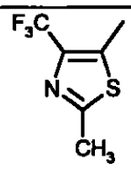
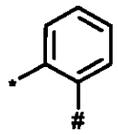
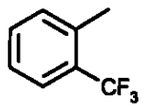
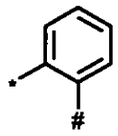
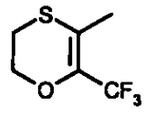
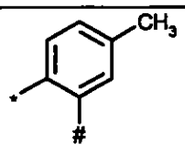
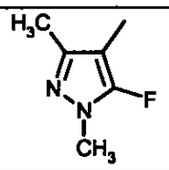
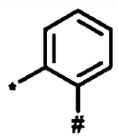
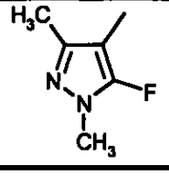
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
141	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		
142	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		103°C
143	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		96°C
144	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		
145	H		$-CH_2-SO-CH_2CH_3$		
146	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		105°C
147	H		$-CH_2-SO-CH_2CH_3$		
148	H		$-CH_2-SO-CH_2CH_3$		

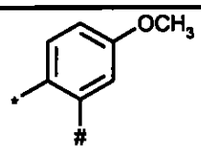
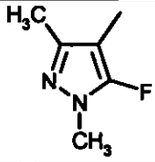
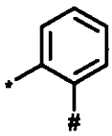
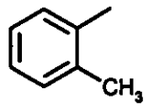
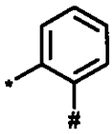
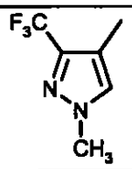
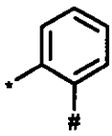
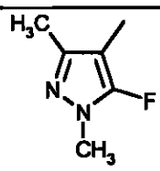
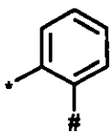
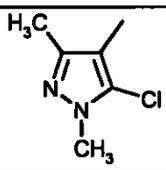
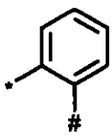
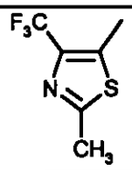
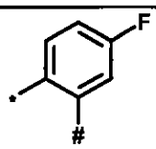
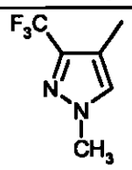
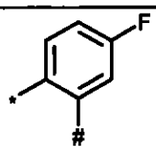
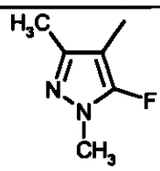
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
149	H		$-CH_2-SO-CH_2CH_3$		
150	H		$-CH_2-SO_2-CH_2CH_3$		148°C
151	H		$-CH_2-SO_2-CH_2CH_3$		135°C
152	H		$-CH_2-SO_2-CH_2CH_3$		142°C
153	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		142°C
154	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		116°C
155	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		125°C
156	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		72°C

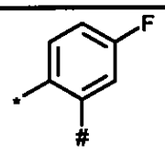
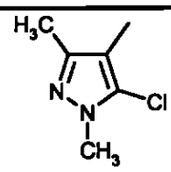
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
157	H		$-CH_2-SO_2-CH_2CH_3$		
158	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		135°C
159	H		$-CH_2-SO_2-CH_2CH_3$		143°C
160	H		$-CH_2-SO-CH_2CH_3$		
161	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		127°C
162	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		
163	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		
164	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		116°C

Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
165	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		98°C
166	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		132°C
167	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		86°C
168	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		110°C
169	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		79°C
170	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		75°C
171	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		105°C
172	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		112°C

Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
173	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		138°C
174	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		120°C
175	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		71°C
176	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		
177	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		68°C
178	H		$-CH_2-OH$		1,61
179	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		92°C
180	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		
181	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		86°C

Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
182	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		82°C
183	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		45°C
184	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		
185	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		
186	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		94°C
187	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		77°C
188	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		96°C
189	H		$-CH_2-S-CH_2CH(CH_3)_2$		

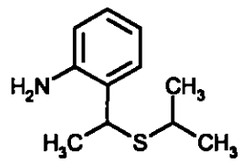
Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
190	H		$-CH_2-S-CH_2CH_3$		147°C
191	H		$-CH_2-S-CH_3$		
192	H		$-CH(CH_3)-S-CH_2CH_3$		
193	H		$-CH(CH_3)-S-CH_2CH_3$		
194	H		$-CH(CH_3)-S-CH_2CH_3$		
195	H		$-CH(CH_3)-S-CH_2CH_3$		
196	H		$-CH(CH_3)-S-CH_2CH_3$		
197	H		$-CH(CH_3)-S-CH_2CH_3$		

Nr.	R^1	M	$-L^1QL^2R$	A	logP (pH 2,3) Pf. (°C)
198	H		-CH(CH3)-S-CH2CH3		

[a]) El enlace, marcado con „*“, está enlazado con la amida.

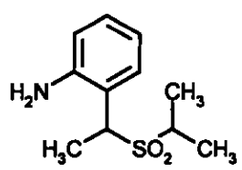
Obtención de los productos de partida de la fórmula (III)

Ejemplo (III-1)



Se disuelven 44 g (0,188 moles) de 1-[1-(isopropiltio)etil]-2-nitrobenceno (VII-1) en 250 ml de etanol, se combinan con 3 g de níquel Raney y se hidrogenan en el autoclave a temperatura ambiente durante 6 horas con 3 bares de hidrógeno. Al cabo de 6 horas se añade de nuevo 3 g de níquel Raney y se hidrogena durante otras 16 horas a temperatura ambiente con 3 bares de hidrógeno. Para la elaboración se separa el catalizador por filtración y el disolvente se elimina en vacio. El producto en bruto se purifica mediante cromatografía en columna (gel de sílice, hexano/metil-terc.-butiléter 3:1). Se obtienen 32 g (contenido 97,3 %, HPLC, 84,4 % de la teoría) de la 2-[1-(isopropiltio)etil]anilina en forma de un aceite amarillo [logP (pH 2,3) = 2,45].

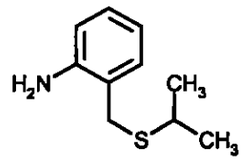
Ejemplo (III-2)



Se disponen en un matraz de tres cuellos, de 500 ml con agitador y termómetro, 16,2 g (60,5 mmoles) de 1-[1-(isopropilsulfonil)etil]-2-nitrobenceno (VII-4) en 160 ml de metanol, se combinan, bajo agitación, con 160 ml de ácido clorhídrico concentrado

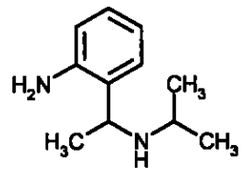
y se añaden, en porciones, a 20-40°C, 31,5 g de polvo de estaño (265,2 mmoles). La mezcla se continúa agitando a 40°C durante aproximadamente 1 hora. Para la elaboración se refrigera, se filtra y se agita con 1.575 ml de una lejía de hidróxido de sodio al 10 % refrigerada con hielo. Se extrae dos veces con diclorometano, se seca sobre sulfato de sodio y el disolvente se elimina en vacío. Se obtienen 13,3 g (contenido 95,8 %, HPLC, 92,6 % de la teoría) de la 2-[1-(isopropilsulfonil)etil]anilina [logP (pH 2,3) = 1,28].

Ejemplo (III-3)



Se disponen en un matraz de tres cuellos, de 500 ml, con agitador y termómetro, 11,8 g (55,6 mmoles) de 1-[1-(isopropiltio)metil]-2-nitrobenceno (VII-2) en 150 ml de metanol, se combinan, bajo agitación, con 150 ml de ácido clorhídrico concentrado y se añaden, en porciones, a 20-40°C, 17,6 g de polvo de estaño (148,5 mmoles) La mezcla se continúa agitando, a 40°C, durante aproximadamente 1 hora. Para la elaboración se refrigera, se filtra y se agita con 1.300 ml de una lejía de hidróxido de sodio al 10 %, refrigerada con hielo. Se extrae dos veces con diclorometano, se seca sobre sulfato de sodio y el disolvente se elimina por evaporación en vacío. El producto en bruto se purifica con hexano/metil-terc -butiléter 3:1 sobre gel de sílice. Se obtienen 4,6 g (contenido 94,6 %, HPLC, 43,2 % de la teoría) de la 2-[(isopropiltio)metil]anilina en forma de un aceite amarillo [logP (pH 2,3) = 1,94].

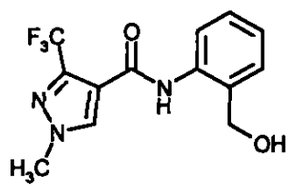
Ejemplo (III-4)



Se dispone en un autoclave una solución de 5 g de la N-[1-(2-nitrofenil)etil]propano-2-amina (VII-5) (24 mmoles) en 30 ml de metanol, con 0,5 g de níquel Raney y se hidrogenan durante 5 horas, a 50°C y a 50 bares de hidrógeno. Para la elaboración se refrigera, el catalizador se separa por filtración y el disolvente se elimina en vacío Se obtienen 2,8 g (contenido 98,1 %, HPLC, 64,2 % de la teoría) de la 2-[1-(isopropilamino)etil]anilina [logP (pH 2,3) = 0,05].

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

Ejemplo (IV-1)

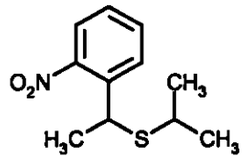


Se añade, gota a gota, a temperatura ambiente, una solución constituida por 34,5 g (0,16 moles) del cloruro de 1-metil-3-triflúormetil-1H-pirazol-4-carbonilo en 50 ml de tetrahidrofurano, a una solución constituida por 20,0 g (0,16 moles) de (2-amino-fenil)-metanol y 36 ml (0,26 moles) de trietilamina en 250 ml de tetrahidrofurano. Tras atenuación del calor de la reacción exotérmica se refluye durante 6 horas y se agita

durante otras 48 horas a temperatura ambiente. La mezcla de la reacciónse vierte sobre aproximadamente 250 ml de agua, se extrae con acetato de etilo, se lava con ácido clorhídrico 2N, se seca sobre sulfato de magnesio y se concentra en vacío. La cromatografía en columna (grandiente ciclohexano/acetato de etilo) proporciona 33,8 g (69 % de la teoría) de la N-[2-(hidroximetil)fenil]-1-metil-3-(trıflúormetil)-1H-pirazol-4-carboxamida [logP (pH 2,3) = 1,55].

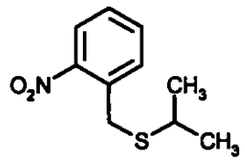
Obtenciónde los productos de partida de la fórmula (VII)

Ejemplo (VII-1)



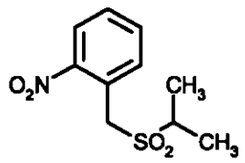
Se disponen en un matraz de tres cuellos, de 1 litro, con agitador, con embudo de goteo y con termómetro, 34,8 g (0,354 moles) de 2-propanotiolato de sodio en 450 ml de acetonitrilo y se añaden, gota a gota, a una temperatura de 30-40°C, 63 g de 1-(1-cloroetil)-2-nitrobenceno (VIII-1) (contenido 99,4 %, 0,337 moles) disueltos en 20 ml de acetonitrılo. La suspensión se continúa agitando durante otras 16 horas a 40°C, se refrigera y el disolvente se elimina en vacío. El residuo remanente se recoge con diclorometano, se lava, se seca sobre sulfato de sodio y el disolvente se elimina en vacío. El producto en bruto se purifica mediante cromatografía en columna (gel de sílice, hexano/acetona 29:1). Se obtienen 48 g (contenido 98,8 %, HPLC, 62,4 % de la teoría) del 1-[1-(isopropiltio)etil]-2-nitrobenceno en forma de un aceite amarillo [logP (pH 2,3) = 3,89].

Ejemplo (VII-2)



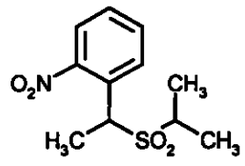
Se disponen en un matraz de tres cuellos, de 250 ml, con agitador, con embudo de goteo y con termómetro, 10,3 g (0,105 moles) de 2-propanotiolato de sodio en 75 ml de acetonitrilo y se añade, gota a gota, bajo refrigeración a 30-40°C, una solución de 17,2 g (0,1 mol) de cloruro de 2-nitrobencilo en 20 ml de acetonitrilo. La suspensión se continúa agitando durante 16 horas a 40-50°C. Para completar la conversión se añaden otros 6 g de 2-propanotiolato de sodio (0,061 moles) y se agita durante otras 24 horas a 40-50°C. Para la elaboración se refrigera y el disolvente se elimina en vacío. El residuo se recoge con metil-terc.-butiléter, se lava y se seca con sulfato de sodio. El sulfato de sodio se separa por filtración y la solución se concentra por evaporación en vacío. El producto en bruto se purifica mediante cromatografía en columna (gel de sílice, ciclohexano/acetato de etilo 50.1). Se obtienen 11,8 g (contenido 92 %, HPLC, 51,2 % de la teoría) de 1-[1-(isopropiltio)metil]-2-nitrobenceno en forma de un aceite pardo [logP (pH 2,3) = 3,28].

Ejemplo (VII-3)



Se disponen en un matraz de tres cuellos, de 1 litro, con agitador, con embudo de goteo y con termómetro, 32,8 g de 1-[1-(isopropiltio)metil]-2-nitrobenceno (VII-2) (0,155 moles) en 465 ml de diclorometano y se añaden, bajo agitación, sucesivamente 14,3 g de ácido fórmico (0,31 moles) y 1,6 g de molibdato de amonio. Bajo rápida agitación se añaden, gota a gota, a temperatura ambiente 45,3 g (0,466 moles) de solución acusa al 35 % de peróxido de hidrógeno. La mezcla se continúa agitando durante 16 horas. Para la elaboración se separa la fase orgánica, se lava respectivamente una vez con soluciónd iluida de hidrógenosulfito de sodio y con agua y la solución orgá nica se seca sobre sulfato de sodio. El disolvente se elimina por destilación en vacío y el residuo se agita con dietiléter, el producto precipitado se separa mediante filtración por succióny se seca. Se obtienen 30,5 g (contenido 99 %, HPLC, 80 % de la teoría) del 1-[(isopropilsulfonil)metil]-2-nitrobenceno en forma de un producto sólido amarillo [logP (pH 2,3) = 1,63].

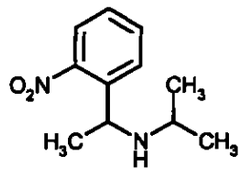
Ejemplo (VII-4)



Se disponen en un matraz de tres cuellos, de 1 litro, con agitador y con termómetro, 18,9 g (77, 7 mmoles) de 1-[(isopropilsulfonil)metil]-2-nitrobenceno (VII-3) en 390 ml de acetonitrilo y se añaden, sucesivamente, 90,1 g (652 mmoles) de carbonato de potasio, 0,26 g de 18-corona-6 y 12,1 g (85,5 mmoles) de yodometano. Se agita durante 4 horas bajo reflujo, se añaden entonces de nuevo 2,5 g de yodometano (17,6 mmoles) y se agita durante otras 4 horas a reflujo. Para la

elaboración se refrigera y se concentra por evaporación en vacío. El residuo se recoge en acetato de etilo, se lavac con agua y se seca sobre sulfato de sodio. Tras la eliminación del disolvente se purifica el producto en bruto mediante cromatografía en columna (gel de sílice, hexano/acetona 7.3). Se obtienen 16,2 g (contenido 96,1 %, HPLC, 77,9 % de la teoría) del 1-[1-(isopropilsulfonil)etil]-2-nitrobenceno [logP (pH 2,3) = 1,99].

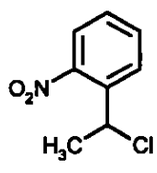
Ejemplo (VII-5)



Se agitan en un autoclave 13,8 g del 1-(1-cloroetil)-2-nitrobenceno (VIII-1) (98,3 %, 73,1 mmoles) y 43,2 g de isopropilamina (731 mmoles) durante 24 horas a 60°C y a presión autógena. Tras la refrigeración de la mezcla de la reacción se elimina la isopropilamina en exceso en vacío y el producto en bruto se purifica con ciclohexano/acetato de etilo 4:1 sobre gel de sílice. Se obtienen 5 g (contenido 94,4 %, 31 % de la teoría) de la N-[1-(2-nitrofenil)etil]propano-2-amina en forma de un aceite [logP (pH 2,3) = 0,55].

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

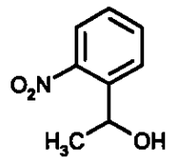
Ejemplo (VIII-1)



Se disuelven en un matraz de tres cuellos, de 6 litros, con agitador, con embudo de goteo y con termómetro, 311 g de 1-(2-nitrofenil)etanol (XI-1) (contenido 95,8 %, 1,78 moles) en 3000 ml de dimetilformamida. Bajo agitación se añaden, en una porción, 921,4 g (7,13 moles) de diisopropiletilamina, se agita durante 5 minutos y, bajo buena refrigeración se añaden, gota a gota, en un intervalo de temperaturas comprendido entre 20 y 35°C, 612,5 g (5,35 moles) de cloruro de metanosulfonilo. Tras la atenuación de la reacción se continúa agitando durante otras 90 horas a temperatura ambiente, el disolvente se elimina en vacío, se recoge en acetato de etil, se lava 3 veces con agua, se seca sobre sulfato de sodio y el disolvente se elimina en vacío. El producto en bruto se purifica mediante cromatografía en columna (gel de sílice, hexano/acetona 9:1). Se obtienen 219 g (contenido 100%, HPLC, 66,2 % de la teoría) del 1-(1-cloroetil)-2-nitrobenceno en forma de un aceite parduzco [logP (ph 2,3) = 2,87].

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

Ejemplo (XI-1)



Se disponen en un matraz de tres cuellos, de 6 litros, con agitador, embudo de goteo, termómetro y contador de burbujas, 320 g (1,938 moles) de 2-nitroacetofenona en 3.200 ml de metanol y añade gota a gota, bajo ligera refrigeración, a 30-40°C, una solución de 73,3 g (1,938 moles) de borohidruro de sodio en 288 ml de agua. Tras

atenuación de la reacción se continúa agitando durante otras 16 horas a temperatura ambiente. Para la elaboración se neutraliza con ácido clorhídrico diluido y el disolvente se elimina en el evaporador rotativo El residuo remanente se recoge con diclorometano, se lava con agua, se seca sobre sulfato de sodio y el disolvente se elimina en vacío. Se obtienen 311 g (contenido 95,1 %, HPLC, 91,3 % de la teoría) de 1-(2-nitrofenil)etanol [logP (ph 2,3) = 1,49] en forma de un aceite claro.

La determinación de los valores logP se llevó a cabo según la Directiva EEC 79/831 anexo V.A8 mediante HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) sobre una columna con inversiónde fases (C 18). Temperatura 43°C.

Eluyentes para la determinación en el intervalo ác ido (pH 2,3). á cido fosfórico acuoso al 0,1 %, acetonitrilo; gradiente lineal desde 10 % de acetonitrilo hasta 90 % de acetonitrilo.

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

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

Ejemplos de aplicación:

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.

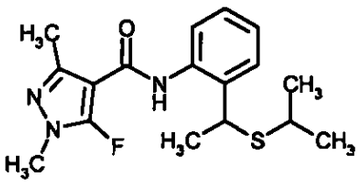
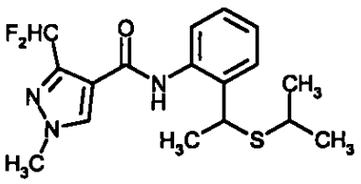
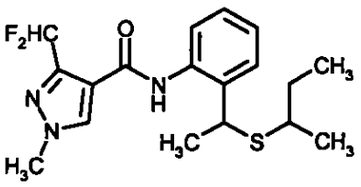
Para la obtención de una preparación de producto activo conveniente se mezcla 1 parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la 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 la antracnosis 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 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 según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
	100	91
	100	84
	100	94

Ejemplo B

Ensayo con Venturia (manzano) / protector

Disolvente: 24,5 Partes en peso de acetona.

24,5 Partes en peso de dimetilacetamida.

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

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.

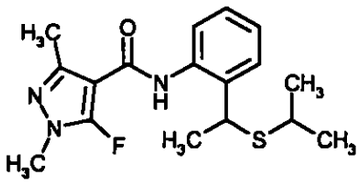
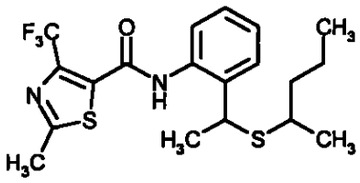
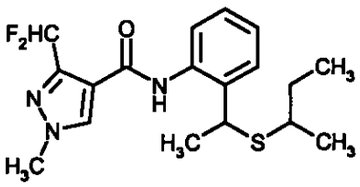
Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes de pepino con la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Tras el secado del recubrimiento aplicado por pulverización se inoculan las plantas con una suspensión acuosa de conidios de la antracnosis del manzano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

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

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 B

Ensayo con Venturia (manzano) / protector

Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
	100	95
	100	89
	100	99

Ejemplo C

Ensayo con Botrytis (frijoles) / 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.

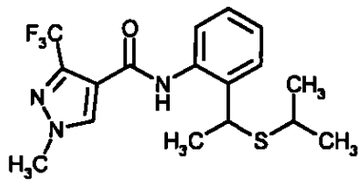
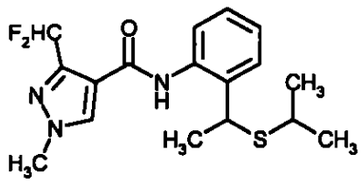
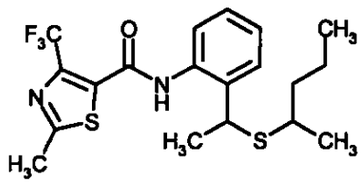
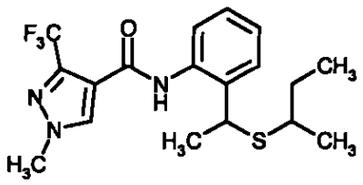
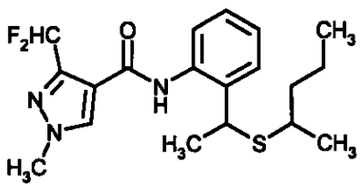
Para la obtención de una preparación de producto activo conveniente se mezcla 1 parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la 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 obscurecida aproximadamente a 20°C y con una humedad relativa del aire del 100 %.

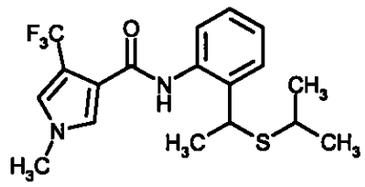
La evaluación se lleva a cabo a los 2 días desde la inoculación por medio de la magnitud de las manchas producidas por el ataque. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se ha observado ataque.

Tabla C

Ensayo con Botrytis (frijoles) / protector

Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
	500	84
	500	100
	500	99
	500	100
	500	97

Ensayo con Botrytis (frijoles) / protector

Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
	500	97

Ejemplo D

Ensayo con Puccinia (trigo) / protector

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

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

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

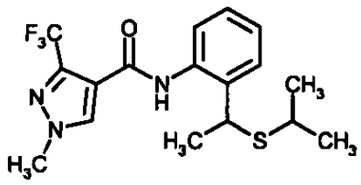
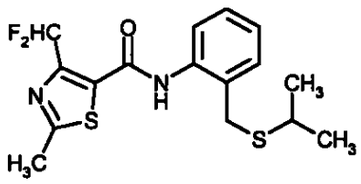
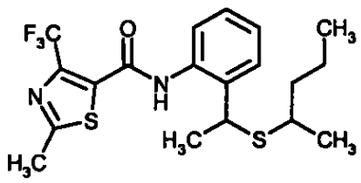
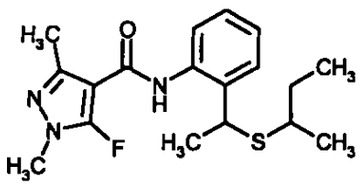
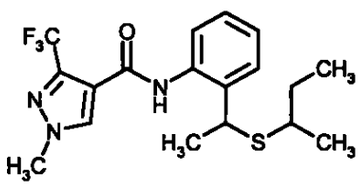
Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Tras el secado del recubrimiento, aplicado por pulverización, se inoculan las plantas con una suspensión de conidios de Puccinia recondita. Las plantas permanecen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

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

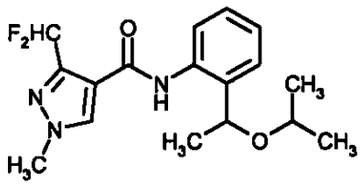
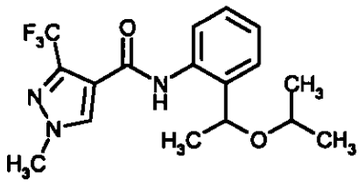
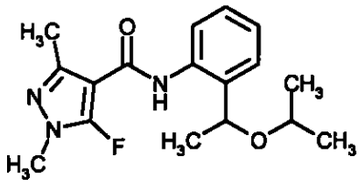
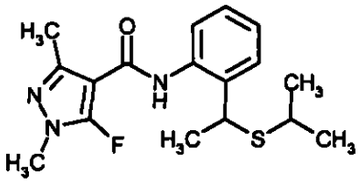
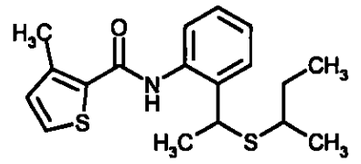
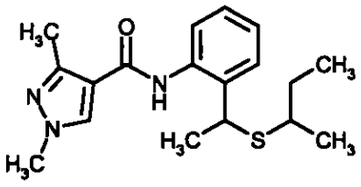
La evaluación se lleva a cabo a los 10 días desde la inoculación. En este caso 0 % significa un grado de actividad, que corresponde al de los controles, mientras que un grado de actividad del 100 % significa que no se ha observado ataque.

Tabla D

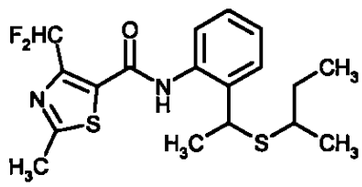
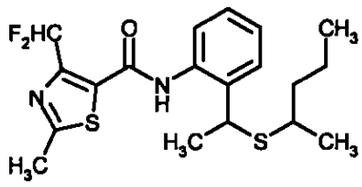
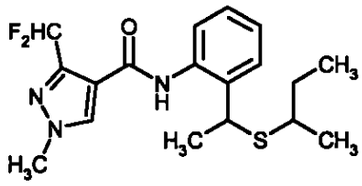
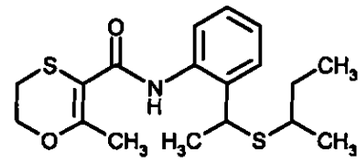
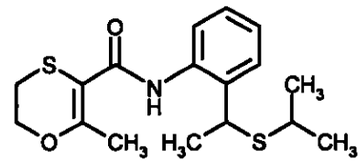
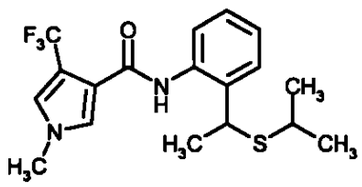
Ensayo con Pucinia (trigo) / protector

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

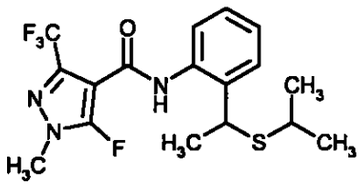
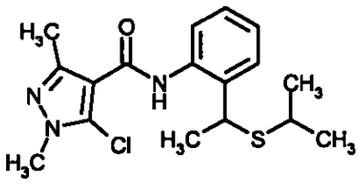
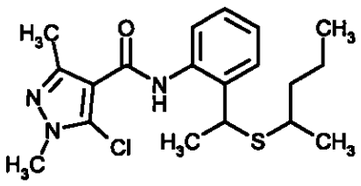
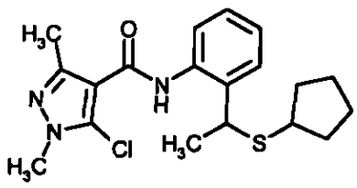
Ensayo con Pucinia (trigo) / protector

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

Ensayo con Pucinia (trigo) / protector

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

Ensayo con Pucinia (trigo) / protector

Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
	500	96
	500	100
	500	100
	500	100

Ejemplo E

Ensayo con Alternaria (tomate) / protector

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

Emulsionante: 1 Parte en peso de alquilarilpoliglicoléter.

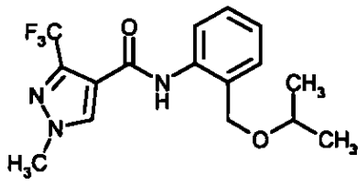
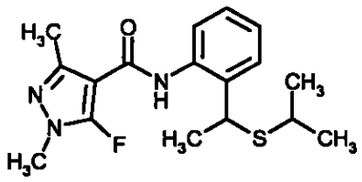
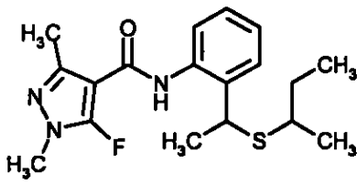
Para la obtención de una preparación de producto activo conveniente se mezcla 1 parte en peso del producto activo con las cantidades indicadas de disolvente y de emulsionante y se diluye el concentrado con agua hasta la concentración deseada.

Para ensayar la actividad protectora se pulverizan plantas jóvenes con la preparación del producto activo en la cantidad de aplicación indicada. Al cabo de 1 día, desde el tratamiento, se inoculan las plantas con una suspensión de esporas de Alternaria solani y se dejan reposar a continuación durante 24 horas con una humedad relativa del aire del 100 % y a 20°C. A continuación de dejan las plantas con una humedad relativa del aire del 96 % y a una temperatura de 20°C.

La evaluación se lleva a cabo a los 7 días desde la inoculación. En este caso 0 % 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.

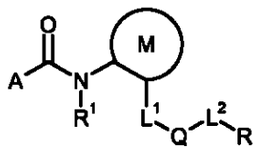
Tabla E

Ensayo con Alternaria (tomate) / protector

Producto activo según la invención	Cantidad aplicada de producto activo en g/ha	Grado de actividad en %
	750	95
	750	90
	750	95

REIVINDICACIONES

1.- Carboxamidas de la fórmula (I)



(I)

en la que

R^1 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átom os de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 6 átom os de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 6 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átom os de carbono; halógenoalquib con 1 a 6 átom os de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 á tomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, (alquilo con 1 a 3 áto mos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, (alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono; halógeno-(alquilo con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 áto mos de carbono, halógeno-(alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 át omos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo;

(alquilo con 1 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 8 átom os de

carbono)carbonilo; (halógenoalquilo con 1 a 6 átom os de carbono)carbonilo, (halogenalcoxi con 1 a 6 átom os de carbono)carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 8 á tomos de carbono)carbonilo con, respectivamente, 1 hasta 9 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo; o -C(=O)C(=O)R^2, -CONR^{3}R^4 o -CH$_2$NR^{5}R^6,

R^2 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 8 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 á tomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 6 átom os de carbono, halogenalcoxi con 1 a 6 á tomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenocicbalquilo con 3 a 8 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^3 y R^4 significan, independientemente entre sí respectivamente hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 áto mos de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, cicloalquilo con 3 a 8 átom os de carbono; halógenoalquilo con 1 a 8 átom os de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenocicloalquib con 3 a 8 átom os de carbono, con, respectivamente, 1 hasta 9 áto mos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^3 y R^4 forman, además, junto con el á tomo de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado, con 5 hasta 8 átom os en el anillo substituido, en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroát omos más, no contiguos, de la serie

formada or oxígeno, azufre o NR^7,

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

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

R^7 significa hidrógeno o alquilo con 1 a 6 átomos de carbono,

M significa un anillo de fenilo, de piridina o de pirimidina, de piridazina o de pirazina monosubstituidos, respectivamente, por R^8 o significa un anillo de tiazol substituido por R^{8-A},

R^8 significa hidrógeno, fluor, cloro, metilo, iso-propilo, metiltio o triflúormetilo,

R^8 significa, además, metoxi,

R^{8-A} significa hidrógeno, metilo, metiltio o triflúormetilo,

L^1 significa alquileno con 1 a 10 átomos de carbono (alcanodiilo),

Q significa O, S, SO, SO_2 o NR^9,

L^2 significa un enlace directo, $SiR^{10}R^{11}$ o CO,

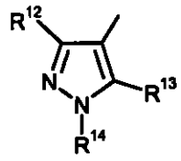
R significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono-alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alquenilo con 2 a 8 átomos de carbono, alquinilo con 2 a

8 átom os de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átom os de carbono, halógenoalquenlo con 2 a 6 átom os de carbono, halógenoalquinilo con 2 a 6 átom os de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono,

R^9 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 á tomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alquiltio con 1 a 4 átom os de carbono, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono-alquenilo con 2 a 8 átom os de carbono, alquinilo con 2 a 8 átom os de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átom os de carbono, halógenoalquenilo con 2 a 6 átom os de carbono, halógenoalquinilo con 2 a 6 átom os de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono,

R^{10} y R^{11} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 8 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 8 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alquiltio con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 6 átom os de carbono,

A significa el resto de la fórmula (A1)



(A1), en la que

R^{12} significa hidrógeno, ciano, halógeno nitro, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 át omos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átom os de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halogenalcoxi con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquiltio con 1 a 4 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de halógeno, aminocarbonilo o

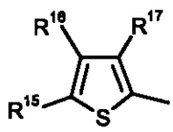
aminocarbonil-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono,

R^{13} significa hidrógeno, halógeno ciano, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono o alquiltio con 1 a 4 átom os de carbono,

R^{14} significa hidrógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, hidroxi-alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono, alquenilo con 2 a 4 át omos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono, alquiltio con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halogenalcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de halógeno, o fenilo,

o

A significa el resto de la fórmula (A2)



(A2), en la que

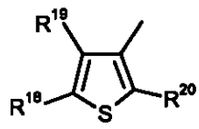
R^{15} y R^{16} significan, independientemente entre sí hidrógeno, halógenoalquilo con 1 a 4 át omos de carbono o halógenoalqulo con 1 a 4 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{17} significa halógem ciano o alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halogenalcoxi con 1 a 4 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de

halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A3)



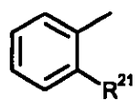
(A3), en la que

R^{18} y R^{19} significan, independientemente entre sí hidrógeno, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de halógeno,

R^{20} significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A4)

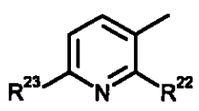


(A4), en la que

R^{21} significa hidrógeno, halógeno hidroxi, ciano, alquilo con 1 a 6 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halogenalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A5)



(A5), en la que

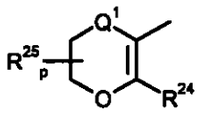
R^{22} significa halógeno hidroxi, ciano, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átomos de carbono o halogenalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de halógeno,

R^{23} significa hidrógeno, halógeno ciano, alquilo con 1 a 4 átomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono, alquiltio con 1 a 4 átomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono, halogenalcoxi con 1 a 4 átomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átomos de halógeno, alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono o alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono,

o

A significa el resto de la fórmula (A6)



(A6), en la que

R^{24} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de halógeno,

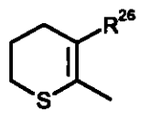
R^{25} significa alquilo con 1 a 4 átomos de carbono,

Q^1 significa S (azufre), SO, SO_2 o CH_2,

p significa 0, 1 o 2, significando R^{25} restos idénticos o diferentes, cuando p signifique 2,

o

A significa el resto de la fórmula (A7)

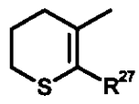


(A7), en la que

R^{26} significa alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A8)

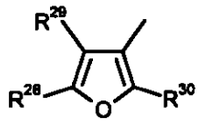


(A8), en la que

R^{27} significa alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A9)



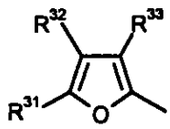
(A9), en la que

R^{28} y R^{29} significan, independientemente entre sí hidrógeno, halógeno, amino, alquilo con 1 a 4 áto mos de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{30} significa hidrógeno, halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A10)



(A10), en la que

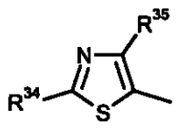
R^{31} y R^{32} signidfican, independientemente entre sí hidrógeno, halógeno, amino, nitro, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 áto mos de

carbono, con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{33} significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 á tomos de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A11)



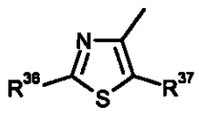
(A11), en la que

R^{34} significa hidrógeno, halógeno, amino, alquilamino con 1 a 4 átom os de carbono, di-(alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)amino, ciano, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{35} significa halógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A12)



(A12), en la que

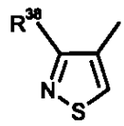
R^{36} significa hidrógeno, halógeno, amino, alquilamino con 1 a 4 átom os de carbono, di-(alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)amino, ciano, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{37} significa halógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o

halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A13)

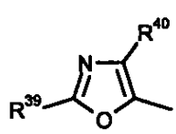


(A13), en la que

R^{38} significa halógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A14)



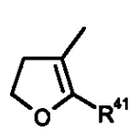
(A14), en la que

R^{39} significa hidrógenoo alquilo con 1 a 4 átom os de carbono,

R^{40} significa halógenoo alquilo con 1 a 4 átom os de carbono,

o

A significa el resto de la fórmula (A15)

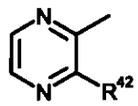


(A15), en la que

R^{41} significa alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A16)

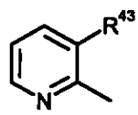


(A16), en la que

R^{42} significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A17)

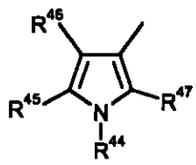


(A17), en la que

R^{43} significa halógeno hidroxi, alquilo con 1 a 4 áto mos de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono, alquiltio con 1 a 4 át omos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 átom os de carbono o halogenalcoxi con 1 a 4 átom os de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A18)



(A18), en la que

R^{44} significa hidrógeno, ciano, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, hidroxi-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 átom os de carbono, di(alquilo con 1 a 4 átom os de carbono)aminosulfonilo, alquilcarbonilo con 1 a 6 átom os

de carbono o significa fenilsulfonilo o Benzoilo substituidos respectivamente en caso dado,

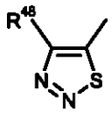
R^{45} significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{46} significa hidrógeno, halógeno ciano, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

R^{47} significa hidrógeno, halógeno, alquilo con 1 a 4 átom os de carbono o halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono con 1 hasta 5 átom os de halógeno,

o

A significa el resto de la fórmula (A19)



(A19), en la que

R^{48} significa alquilo con 1 a 4 átom os de carbono.

2.- Carboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que R no significa alcoxi, cuando L^2 signifique un enlace directo.

3.- Carboxamidas de la fórmula (I) según las reivindicaciones 1 o 2, en la que

R^1 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 á tomos de carbono, alquilsulfinilo con 1 a 4 á tomos de carbono, alquilsulfonilo con 1 a 4 á tomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 á tomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 á tomos de carbono, halógenoalquiltio con 1 a 4 á tomos de carbono, halógenoalquilsulfinilo con 1 a 4 á tomos de carbono,

halógenoalquilsulfonilo con 1 a 4 á tomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 8 á tomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo; formilo, formil-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono, (alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono, (alcoxi con 1 a 3 á tomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono; halógeno-(alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono, halógeno-(alcoxi con 1 a 3 á tomos de carbono)carbonil-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 13 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo, (alquilo con 1 a 6 á tomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 4 á tomos de carbono)carbonilo, (alcoxi con 1 a 3 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono)carbonilo, (cicloalquilo con 3 a 6 á tomos de carbono)carbonilo; (halógenoalquilo con 1 a 4 á tomos de carbono)carbonilo, (halógenoalcoxi con 1 a 4 á tomos de carbono)carbonilo, (halógeno-alcoxi con 1 a 3 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono)carbonilo, (halógenocicloalquilo con 3 a 6 á tomos de carbono)carbonilo con, respectivamente, 1 hasta 9 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo; o $-C(=O)C(=O)R^2$, $-CONR^3R^4$ o $-CH_2NR^5R^6$,

R^2 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 á tomos de carbono, alcoxi con 1 a 4 á tomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 á tomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 á tomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 4

á tomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 á tomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^3 y R^4 significan respectivamente, de menra independiente entre sí hidrógeno, alquilo con 1 a 6 á tomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 á tomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 á tomos de carbono, halógeno-alcoxi con 1 a 3 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 3 á tomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 á tomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^3 y R^4 forman, además, junto con el átom o de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo saturado, con 5 o 6 átom os en el anillo substituido, en caso dado, de una hasta cuatro veces, de forma igual o de formas diferentes, por halógeno o por alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátom os más, no contiguos de la serie fromada por oxígeno, azufre o NR^7,

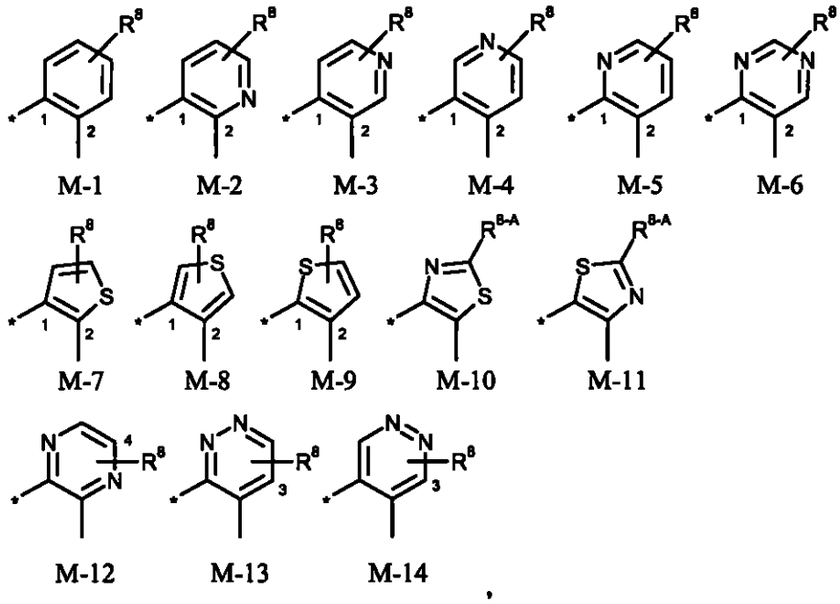
R^5 y R^6 significan, independientemente entre sí, hidrógeno, alquilo con 1 a 6 á tomos de carbono, cicloalquilo con 3 a 6 á tomos de carbono; halógenoalquilo con 1 a 4 á tomos de carbono, halógenocicloalquilo con 3 a 6 á tomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 9 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^5 y R^6 forman, además, junto con el átom o de nitrógeno, con el que están enlazados, un heterociclo con 5 o 6 átom os en el anillo, saturado, substituido en caso dado una o varias veces, de forma igual o de formas

diferentes por halógeno o por alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono, pudiendo contener el heterociclo 1 o 2 heteroátom os más, no contiguos, de la serie formada por oxígeno, azufre o NR^7,

R^7 significa hidrógenoo alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono,

M significa uno de los ciclos siguientes



M-1 M-2 M-3 M-4 M-5 M-6

M-7 M-8 M-9 M-10 M-11

M-12 M-13 M-14

estando unido el enlace, marcado con „ *“ con la amida,

R^8 significa hidrógeno, flúor, cloro, metilo, ıso-propilo, metiltio o triflúormetilo,

R^8 significa, además, metoxi

R^{8-A} significa hidrógeno,metilo, metiltio o triflúormetilo,

L^1 significa alquileno con 1 a 10 átom os de carbono (alcanodiilo),

Q significa O, S, SO, SO^2 o NR^9,

L^2 significa un enlace directo, $SiR^{10}R^{11}$ o CO,

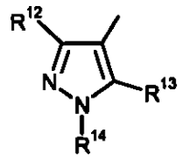
R significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 á tomos de carbono, alcoxi con 1 a

6 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 3 át omos de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, alquiltio con 1 a 3 áto mos de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, halógenoalquilo con 1 a 4 átom os de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono,

R^9 significa hidrógeno, alquilo con 1 a 6 á tomos de carbono, alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono, alquiltio con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átom os de carbono,

R^{10} y R^{11} significan, independientemente entre sí, alquilo con 1 a 6 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 6 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3 átom os de carbono o alquiltio con 1 a 3 átom os de carbono-alquilo con 1 a 3át omos de carbono,

A significa el resto de la fórmula (A1)



(A1), en la que

R^{12} significa hidrógeno, ciano, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, iso-propilo, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, ciclopropilo, halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 2 á tomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo, triflúormetiltio, difluormetiltio, aminocarbonilo, aminocarbonilmetilo o aminocarboniletilo,

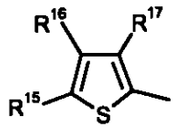
R^{13} significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo, metoxi, etoxi, metiltio o etiltio,

R^{14} significa hidrógeno, metilo, etilo, n-propilo, iso-propilo,

halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo, hidroximetilo, hidroxietilo, ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo o fenilo,

o

A significa el resto de la fórmula (A2)



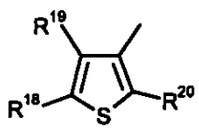
(A2), en la que

R^{15} y R^{16} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^{17} significa flúor, cloro, bromo, ciano, metilo, etilo, halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono o halógenoalcoxi con 1 a 2 á tomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A3)



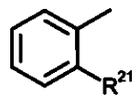
(A3), en la que

R^{18} y R^{19} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^{20} significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A4)

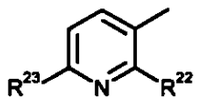


(A4), en la que

R^{21} significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxi, ciano, alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono, halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono, halógenoalcoxi con 1 a 2 á tomos de carbono o halógenoalquiltio con 1 a 2 á tomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A5)



(A5), en la que

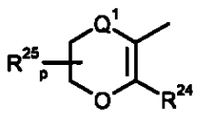
R^{22} significa flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxi, ciano, alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, difluormetiltio, triflúormetiltio, halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono o halógenoalcoxi con 1 a 2 á tomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^{23} significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono o halógenoalcoxi con 1 a 2 á tomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo, alquilsulfinilo con 1 a 2 á tomos

de carbono o alquilsulfonilo con 1 a 2 á tomos de carbono,

o

A significa el resto de la fórmula (A6)



(A6), en la que

R^{24} significa metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

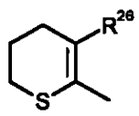
R^{25} significa metilo o etilo,

Q^1 significa S (azufre), SO_2 o CH_2,

p significa 0 o 1,

o

A significa el resto de la fórmula (A7)

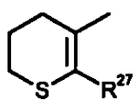


(A7), en la que

R^{26} significa metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A8)

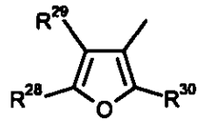


(A8), en la que

R^{27} significa metilo, etilo, triflúormetilo, diflúormetilo, difluorclorometilo o triclorometilo,

o

A significa el resto de la fórmula (A9)



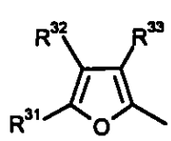
(A9), en la que

R^{28} y R^{29} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^{30} significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A10)



(A10), en la que

R^{31} y R^{32} significan, independientemente entre sí, hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, nitro, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^{33} significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A11)



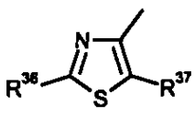
(A11), en la que

R^{34} significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, alquilamino con 1 a 4 á tomos de carbono, di(alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono)amino, ciano, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^{35} significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A12)



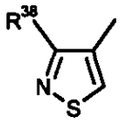
(A12), en la que

R^{36} significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, amino, alquilamino con 1 a 4 á tomos de carbono, di(alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono)amino, ciano, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^{37} significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A13)

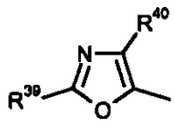


(A13), en la que

R^{38} significa flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 á tomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A14)



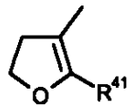
(A14), en la que

R^{39} significa hidrógeno, metilo o etilo,

R^{40} significa flúor, cloro, bromo, metilo o etilo,

o

A significa el resto de la fórmula (A15)

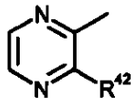


(A15), en la que

R^{41} significa metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A16)

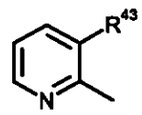


(A16), en la que

R^{42} significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A17)

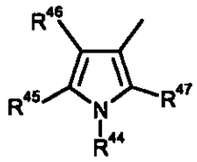


(A17), en la que

R^{43} significa flúor, cloro, bromo, yodo, hidroxi, alquilo con 1 a 4 á tomos de carbono, metoxi, etoxi, metiltio, etiltio, diflúormetiltio, triflúormetiltio, halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono o halógenoalcoxi con 1 a 2 á tomos de carbono con, respectivamente, 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A18)



(A18), en la que

R^{44} significa hidrógeno, metilo, etilo, halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo, alcoxi con 1 a 2 á tomos de carbono-alquilo con 1 a 2 á tomos de carbono, hidroximetilo, hidroxietilo, metilsulfonilo o dimetilaminosulfonilo,

R^{45} significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

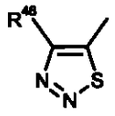
R^{46} significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, yodo, ciano, metilo, etilo, iso-propilo o halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

R^{47} significa hidrógeno, flúor, cloro, bromo, metilo, etilo o

halógenoalquilo con 1 a 2 á tomos de carbono con 1 hasta 5 átom os de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A19)

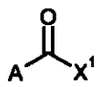


(A19), en la que

R^{48} significa metilo, etilo, n-propilo o iso-propilo.

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

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



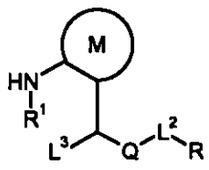
(II)

en la que

A tiene los significados anteriormente indicados y

X^1 significa halógeno o hidroxi,

con derivados de anilina de la fórmula (III)



(III)

en la que

R^1, M, Q, L^2 y R tienen los significados anteriormente indicados,

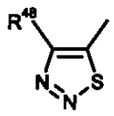
L^3 significa hidrógeno o alquilo con 1 a 9 átom os de carbono,

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 á cido y, en caso dado, en presencia de un diluyente,

halógenoalquilo con 1 a 2 átomos de carbono con 1 hasta 5 átomos de flúor, de cloro y/o de bromo,

o

A significa el resto de la fórmula (A19)

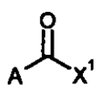


(A19), en la que

R^{48} significa metilo, etilo, n-propilo o iso-propilo

4 - Procedimiento para la obtención de carboxamidas de la fórmula (I) según la reivindicación 1, caracterizado porque

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



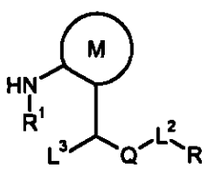
(II)

en la que

A tiene los significados anteriormente indicados y

X^1 significa halógeno o hidroxi,

con derivados de anilina de la fórmula (III)



(III)

en la que

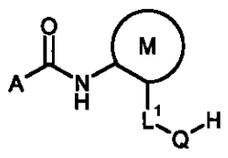
R^1, M, Q, L^2 y R tienen los significados anteriormente indicados,

L^3 significa hidrógeno o alquilo con 1 a 9 átomos de carbono,

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

o

(b) se hace reaccionar carboxanilidas de la fórmula (IV)



(IV)

en la que

M, L^1, Q y A tienen los significados anteriormente indicados

con un compuesto de la fórmula (V)



(V)

en la que

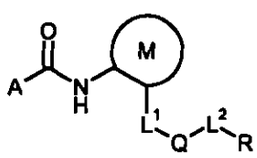
L^2 y R tienen los significados anteriormente indicados,

Y significa halógeno, triflato (trifluórmetilsulfonilo), mesilato (metilsulfonilo) o tosilato (4-metilfenilsulfonilo),

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

o

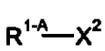
(c) se hace reaccionar carboxamidas de la fórmula (I-a)



(I-a)

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

con halogenuros de la fórmula (VI)



(VI)

en la que

X^2 significa cloro,bromo o yodo,

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

flúor, de cloro y/o de bromo, o -C(=O)C(=O)R^2, -CONR^{3}R^4 o -CH$_2$NR^{5}R^6,

teniendo R^2, R^3, R^4, R^5 y R^6 los significados anteriormente indicados,

en presencia de una base y en presencia de un diluyente

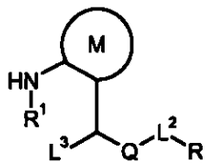
5 - Agentes para la lucha contra los microorganismos indeseables, caracterizados porque tienen un contenido en al menos una carboxamida de la fórmula (I), según la reivindicación 1, junto a agentes extendedores y/o productos tensioactivos

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

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

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

9 - Derivados de anilina de la fórmula (III),



(III)

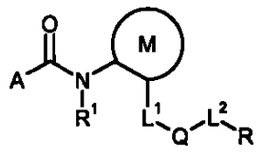
en la que

R^1, M, Q, L^2 y R tienen los significados indicados en la reivindicación 1,

L^3 significa hidrógeno o alquilo con 1 a 9 átomos de carbono

RESUMEN

Nuevas carboxamidas de la fórmula (I)



(I)

en la que

M significa un anillo de fenilo, de piridina o de pirimidina, de piridazina o de pirazina monosubstituidos, respectivamente, por R^8 o significa un anillo de tiazol substituido por R^{8-A},

R^8 significa hidrógeno, fluor, cloro, metilo, iso-propilo, metiltio o trifluórmetilo,

R^8 significa, además, metoxi,

R^{8-A} significa hidrógeno, metilo, metiltio o trifluórmetilo,

L^1 significa alquileno con 1 a 10 átom os de carbono (alcanodiilo),

Q significa O, S, SO, SO_2 o NR^9,

L^2 significa un enlace directo, $SiR^{10}R^{11}$ o CO,

R significa hidrógeno, alquilo con 1 a 8 á tomos de carbono, alcoxi con 1 a 8 átom os de carbono, alcoxi con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alquiltio con 1 a 4 átom os de carbono-alquilo con 1 a 4 átom os de carbono, alquenilo con 2 a 8 átom os de carbono, alquinilo con 2 a 8 átom os de carbono, halógenoalquilo con 1 a 6 átom os de carbono, halógenoalquenlo con 2 a 6 átom os de carbono, halógenoalquinilo con 2 a 6 átom os de carbono o cicloalquilo con 3 a 6 átomos de carbono,

A significa el resto de la fórmula (A 1)

Los otros substituyentes han sido definidos en la reivindicación 1

Los productos, según la invención, presentan una potente acción microbicida y pueden emplearse para la lucha contra los microorganismos indeseables, tales como los hongos y las bacterias, en la protección de las plantas y en la protección de las materiales

5

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internes Aktenzeichen
PCT/EP2005/000633

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES
IPK 7 A01N43/56 C07D231/16 C07D231/14

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

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)
IPK 7 A01N C07D

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

Während der Internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl verwendete Suchbegriffe)
EPO-Internal, WPI Data, PAJ, BEILSTEIN Data, 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 A (BAYER) 6. Februar 2003 (2003-02-06) in der Anmeldung erwähnt Seite 1, Absatz 1 Seiten 63-66, Zwischenprodukte Anspruch 1	1-9
X	DIXON ET AL: "Kinetics and mechanism of the addition of water and ring-opening of 2-methyl- and 2-aryl-4H-3,1-benzoxazines to 2-aminobenzyl esters in the acidic pH range; change in rate-limiting step with buffer concentration and evidence for a tetrahedral carbonyl addition intermediate" J. CHEM. SOC. PERKIN TRANS. 2, Bd. 8, 1997, Seiten 1503-1509, XP002323920 (2-hydroxymethyl-anilide) benzoic acid	1-8

-/-

[X] Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

[X] 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
"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der Internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
19. April 2005	02/05/2005

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde	Bevollmächtigter Bediensteter
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	Cortés, J

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

INTERNATIONAL RECHERCHENBERICHT

Internes Aktenzeichen
PCT/EP2005/000633

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	RAIFORD ET AL: "BEHAVIOR OF MIXED O-ACYL-N-ACYL DERIVATIVES IN WHICH THE REACTING GROUPS ARE NOT ON ADJACENT CARBON ATOMS" J. AM. CHEM. SOC , Bd. 48, 1926, Seiten 483-489, XP002323921 Seite 487;-Verbindungen	1-8
X	DATABASE BEILSTEIN 29. Juni 1989 (1989-06-29), XP002323927 Database accession no. BRN: 1216128 CAS Registry Number: 51489-16-8 Chemical Name: 2-Benzoylamido-6-chlor-benzylalkohol Zusammenfassung & ASAKAWA ET AL: CHEM. PHARM. BULL., Bd. 27, 1979, Seiten 522-527, & weitere Verbindungen, z.B.: 2-(2'-Thienylamino)-5-chlor-benzylalkohol	1-8
X	DATABASE BEILSTEIN 5. Februar 1990 (1990-02-05), XP002323928 Database accession no. BRN: 3325417 CAS Registry Number: 75541-90-1 Chemical Name: benzoic acid-(2-methoxymethyl-anilide) Zusammenfassung & CLOVER ET AL: J. CHEM. SOC. PERKIN TRANS 2, Bd 7, 1996, Seiten 1367-1376, & weitere Verbindungen, z.B.:	1-8
X	DATABASE BEILSTEIN 25. Juli 2003 (2003-07-25), XP002323929 Database accession no. BRN: 9326393 Chemical Name: furan-2-carboxylic acid (2-hydroxymethyl-phenyl)-amide Zusammenfassung & MISHIO ET AL: HETEROCYCLES, Bd. 58, 2002, Seiten 203-212,	1-8
X	BELEKON ET AL: "Synthesis of -Amino Acids via Asymmetric Phase Transfer-Catalyzed Alkylation of Achiral Nickel(II) Complexes of Glycine-Derived Schiff Bases" J. AM. CHEM. SOC., Bd. 125, Nr. 42, 2003, Seiten 12860-12871, XP002323922 pyridine-2-carboxylic acid(2-hydroxymethylphenyl)amide	1-8

-/--

~~230~~
236

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internes Aktenzeichen
PCT/EP2005/000633

C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
X	CHAN SIK CHO ET AL: "Ruthenium-catalyzed oxidative coupling and cyclization between 2-aminobenzyl alcohol and secondary alcohols leading to quinolines" TETRAHEDRON, Bd. 59, Nr. 40, 2003, Seiten 7997-8002, XP002323923 Verbindung 1	9
X	ROUSSEL ET AL: "Inhibition of the tissue factor/factor VIIa complex ? Lead optimisation using combinatorial chemistry" TETRAHEDRON, Bd. 55, Nr. 19, 1999, Seiten 6219-6230, XP002323924 2-amino-5-methyl-benzyl alcohol 2-amino-3-methyl-benzyl alcohol	9
X	TSOUNGAS ET AL "A convenient access to benzo-substituted phthalazines as potential precursors to DNA intercalators" TETRAHEDRON LETTERS, Bd. 42, Nr 37, 2001, Seiten 6589-6592, XP002323925 Verbindung 2	9
X	MULZER ET AL: "Chiral Acetals as Stereoinductors: Diastereoface Selective Alkylation of Dihydrobenzoxazine-Derived Amide Enolates" J. ORG. CHEM., Bd 65, Nr. 20, 2000, Seiten 6540-6546, XP002323926 tert-butyl(2-aminobenzyloxy)dimethylsilane	9
P,X	JP 2004 189738 A (NIPPON NOHYAKU) 8. Juli 2004 (2004-07-08) das ganze Dokument	1-9

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/000633

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO 03010149 A	06-02-2003	DE 10136065 A1	13-02-2003
		BR 0211482 A	17-08-2004
		CN 1533380 A	29-09-2004
		WO 03010149 A1	06-02-2003
		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
JP 2004189738 A	08-07-2004	KEINE	

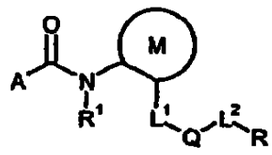
INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP2005/000633

Feld Nr. IV Wortlaut der Zusammenfassung (Fortsetzung von Punkt 5 auf Blatt 1)

Anlage zum Schreiben des Europäischen Patentamtes vom 02.05.2005

Neue Carboxamide der Formel (I)



(I)

in welcher

M für einen jeweils einfach durch R^8 substituierten Phenyl-, Pyridin- oder Pyrimidin-, Pyridazin oder Pyrazin-Ring oder für einen durch R^{8-A} substituierten Thiazol-Ring steht,

R^8 für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Methyl, iso-Propyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

R^8 außerdem für Methoxy steht,

R^{8-A} für Wasserstoff, Methyl, Methylthio oder Trifluormethyl steht,

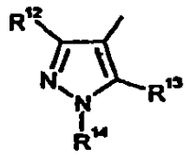
L^1 für C_1-C_{10}-Alkylen (Alkandiyl) steht,

Q für O, S, SO, SO_2 oder NR^9 steht,

L^2 für eine direkte Bindung, $SiR^{10}R^{11}$ oder CO steht,

R für Wasserstoff, C_1-C_8-Alkyl, C_1-C_8-Alkoxy, C_1-C_4-Alkoxy-C_1-C_4-alkyl, C_1-C_4-Alkylthio-C_1-C_4-alkyl, C_2-C_8-Alkenyl, C_2-C_8-Alkinyl, C_1-C_5-Halogenalkyl, C_2-C_6-Halogenalkenyl, C_2-C_6-Halogenalkinyl oder C_3-C_6-Cycloalkyl steht,

z.B.
A für den Rest der Formel (A1)



(A1) steht;

Die anderen Substituenten sind in Anspruch 1 definiert;

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

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES
EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN
SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCIÓN PCTd3

(21) N° de solicitud

22) Fecha de solicitud

(30) Prioridad (31) ***No Prioridad*** (32) ***Fecha*** (33) ***País***
102004005787 7 **06/02/2004** **DE**

(51) Int Cl **A01N 43/56**

(71)Solicitante(s) **BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT**

(72) **Inventor(es)** **RALF DUNKEL Y OTROS**

(74) Apoderado **EMILIO FERRERO**

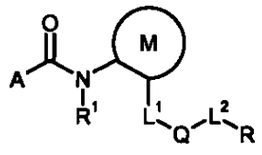
(85) Fecha límite inicio fase nacional
(86) Datos relativos a la presentacion de la solicitud PCT
Fecha de presentacion de la solicitud *22/01/2005*
No de solicitud *PCT/EP2005/000633*

(87) Publicacion internacional
Fecha *18/08/2005*
N° publicacion ***WO 2005/074686 A1***

(54) Título DERIVADOS DE N-(2-(HIDROXIMETIL)FENIL)-1H-PIRAZOL-4-CARBOXAMIDA Y COMPUESTOS EMPARENTADOS COMO PRODUCTOS ACTIVOS MICROBICIDAS PARA EL EMPLEO EN LA PROTECCIÓN DE LAS PLANTAS Y DE LOS MATERIALES

REIVINDICACIONES

1 - Carboxamidas de la fórmula (I)



(I)

en la que

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

Industria y Comercio

FORMATO DE DIGITALIZACION
RELACION DE ANEXOS

Royal Technologies S.A

239

Item		Expediente No 06077161	No de Folio
		No de unidades	√
1	CD		
2	DVD		
3	REVISTA		
4	LIBRO		
5	PERIODICO		
6	DISQUETES		
7	SOBRE DE MANILA		
8	SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA X	1	
9	SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO		
10	OTROS		

Observaciones Sobre con Arte final

240

240

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-077161- -00000-0000
Fec 2006-08-04 15:03:42 Dep 2020 NUECREACIONES
Tra 11 PATENTEIYII
Eve 378 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folios 240

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 06 - 51,927
FECHA : JULIO 10 DE 2006

***** C O N S I G N A C I O N *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
CAVELIER ABOGADOS	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	54929896	10/07/2006	42,127,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	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 : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No._____

Folio 13549-841-072-3

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
Rad: 06-077161- -00000-0000
Fec 2006-08-04 16:03:42 Dep 2020 NUECREACIONES
Tra 11 PATENTEIYII
Fre. 378 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folios 240

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

241

REQUISITOS MINIMOS PARA ADMISION A TRAMITE
PCT

PATENTE DE INVENCION [X] MODELO DE UTILIDAD [ ]

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

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 fotografica del Diseno 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 Agosto 4/06

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
Bogota, D C , Colombia

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

242

Bogotá,
2020

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

REFERENCIA	Radicación No.	6 77161
	Solicitud internacional	EP2005/000633
	Fecha inicio fase nacional	06/09/2006
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	11209

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 06 OCT. 2006
adpa11