



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Organización CSA Ltda

Delegatura de Propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

SOLICITUD

PCT

PATENTE DE INVENCION

08-10094

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO "NUEVOS DERIVADOS DE LA
BENZOHETEROCICLILETILCARBOXAMIDA"

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE BAUER CRESCENCE S.A.

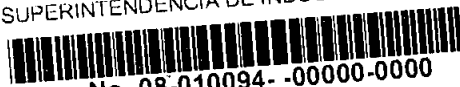
DOMICILIO LYON, FRANCIA

74. APODERADO ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ
T.P. 20.281

22. BOGOTÁ, D. C., FEBRERO 1, 2008.

PETITORIO

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-010094-00000-0000

Fecha: 2008-02-01 16:57:28 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONAL
Act. 411 PRESENTACION Folios: 192

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL

12 Feb 2008

1

SOLICITUD DE :

☒

Patente de Invención

☒

Capítulo I.

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☐

Capítulo II.

2

SOLICITANTE
(71)

Nombre: BAYER CROPSCIENCE S.A.

Dirección: 16 rue Jean-Marie Leclair, F-69009 Lyon, Cedex 09, Francia

Nacionalidad o Domicilio: Lyon, Francia

Lugar de Constitución: Francia

Teléfono:

Fax:

E-Mail

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

3

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

Dirección: Avenida 82 No.10-62 Piso 6

Teléfono: 634 1500

Fax: 376 2211

E-Mail: office.bogota@bakernet.com

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número 79.143.366 de

Usaquén

TP 20.281

4

INVENTOR (ES)

Nombre: MANSFIELD, Darren; COQUERON, Pierre-Yves; RIECK, Heiko; DESBORDES, Philippe; VILLIER, Alain; GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire y GENIX, Pierre.

Dirección: Graf-Adolf Strasse 7, 51429 Bergisch Gladbach, Alemania; 56 Cours De La Liberté, F-69003 Lyon, Francia; 29 Allée Buffon, F-69110 Sainte Foy-les-Lyon, Francia; 30 Rue Bancel, F-69007 Lyon, Francia; Les Terres de Tourvèon, Bat. A, 2 Chemin Du Champ, F-69660 Collonges Au Mont D'or, Francia; Le Trève Collonge, Route D'albigny, F-69250 Curis Au Mont D'or, Francia y 14 Rue Duviard, F-69004 Lyon, Francia, respectivamente.

Nacionalidad o Domicilio: Francesa

(72)

5

PCT (85)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2006/063992

Fecha 06-JUL-06

Publicación Internacional No. WO/2007/006739

Fecha 18-ENE-07

6

Título (54)

NUEVOS DERIVADOS DE LA BENZOHETEROCICLILETILCARBOXAMIDA

7

Clasificación Internacional (51)

C07D 333/38, A01N 43/12, A01N 43/32, A01N 43/36, A01N 43/38, A01N 43/40, A01N 43/56, A01N 43/78, C07D 401/12, C07D 403/12, C07D 405/12, C07D 409/12, C07D 411/12, C07D 417/12

8

Prioridad

(33) País de Origen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

SI

☒

NO

☐

EP

12-JUL-05

05356117.1

9

Comprobante de pago No.

Fecha

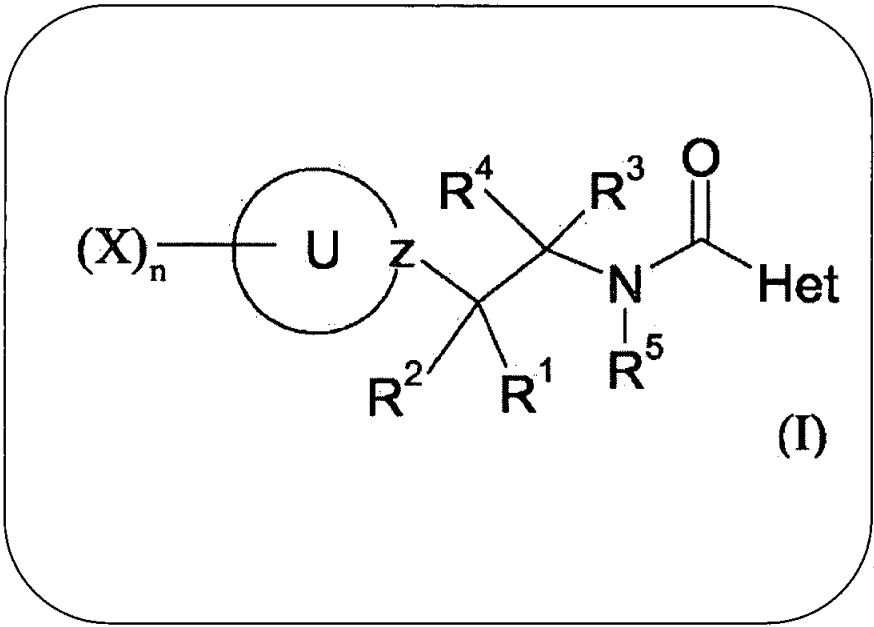
Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página

10

ANEXOS

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud
- ☒ 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 internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen preliminar (IPEA)
- ☐ Traducción del examen preliminar internacional 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 12 x 12
- ☐ 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
- ☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional.
- ☒ Otros: Extratos, Reporte Preliminar Internacional sobre patentabilidad capítulo I y notificación de presentación de documento de prioridad

11 FIGURA CARATERISTICA



12 Solicito la concesión de la patente.

NOMBRE: ALVARO CORREA ORDONEZ

FIRMA: [Signature]

C.C. 79.143.366 de Usaquén T.R. 20.281

Instrucciones para la presentación de los anexos, ver reverso de esta página

POD-02638

Traducción oficial del francés por Marlén Neira Castro, resolución 2413 del Ministerio de Justicia

APOSTILLA EN PODER DE BAYER CROPSCIENCE SA

Poder bilingüe otorgado por Bayer CropScience SA, firmado en Lyon el 11 de febrero de 2005 por Alexander Nowak.

Sello de Legalización notarial en francés: El suscrito, P. Garel Galais, Notario de Chasselay (Ródano) certifica la firma de Alexander Nowak puesta en el documento como auténtica. Chasselay fechado el 15- 02- 05. Sello oficial de Patrice Garel Galais. Notario de Chasselay- Ródano (firma).

Al reverso:

APOSTILLA

(Convención de la Haya del 5 de octubre de 1961)- Colombia

1. País: República Francesa. Este documento Público
13. ha sido firmado por el Notario Garel Galaz Patrice.
3. Quien ejerce funciones de Notario
4. Lleva el sello de la Notaría de Chasselay- 69

CERTIFICADO

5. en Lyon
6. El 16 - 04- 05
7. Por el Procurador General ante el tribunal de apelación de Lyon
8. Bajo el No. 773
9. Sello del Tribunal de Apelación de Lyon Procurador General
10. Firma ilegible.

CERTIFICACIÓN NOTARIAL

Bilingüe inglés- español sobre cargo de Alexander Nowak como representante autorizado de Bayer CropScience S.A.

6- La certificaciones 3.4 y 5 se basan en: Página de la Gaceta "anuncios judiciales y legales" del periódico "Le Tout Lyon- Moniteur Judiciaire Reunis", fechado el 21 al 27 de junio de 2003.

- Poder de representación de Bayer CropScience SA (del Presidente de la Junta Directiva) fechado el 15 de octubre de 2004.

Sello oficial de Ceril Borel Girau. Notario de Chasselay- Ródano (firma). Al reverso

APOSTILLA

(Convención de la Haya del 5 de octubre de 1961)- Colombia

1. País: República Francesa. Este documento Público
14. ha sido firmado por el Notario Borel Giraud Cédric
3. Quien ejerce funciones de Notario
4. Lleva el sello de la Notaría de Chasselay- Ródano

CERTIFICADO

5. Lyon
6. El 10 de marzo de- 2005
7. Por el Procurador General ante el tribunal de apelación de Lyon
8. Bajo el No. 1752 (ilegible)
9. Sello: Tribunal de Apelación de Lyon Procurador General.
10. Firma ilegible.

Es traducción conforme con copia para confrontar- Bogota, Marzo 29-



BAKER & MCKENZIE

Ralsbeck, Lara, Rodríguez & Rueda
Av. 82 No. 10 - 62 Piso 6
Bogotá, Colombia

NIT: 860.068.840-3
Tel: +57 1 634 1500
Fax: +57 1 376 2211
www.bakernet.com

POWER OF ATTORNEY

The undersigned.

BAYER CROPSCIENCE SA

domiciled in

16, rue Jean-Marie Leclair
69009 LYON, France

declares that it hereby grants to

**ALVARO CORREA-ORDOÑEZ and/or OLGA
GEORGETTE OTERO and/or RICARDO METKE and/or
JUAN PABLO CONCHA.**

with domicile at Av. 82 No. 10 - 62, 6th floor, of Bogotá D. C., Colombia, a full and sufficient power of attorney to 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, 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, industrial designs, integrated circuits, layout-designs and vegetal varieties; the registration of trademarks, denominations of origin, commercial names, trade emblems, slogans and domain names; its renewal, assignments, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Processes of protection to the consumer, unfair competition, oppositions, cancellations, nullity, precautionary injunctions, infringement, granting of licenses, writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, an administrative processes relating to those rights. 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.

I hereby ratify all actions previously taken on behalf of this company by the aforementioned attorneys with respect to the mentioned matters.

Done and subscribed in
Lyon

On the February 11th, 2005 day of

Alexander NOWAK



Je soussigné M^{re} GAREL-GALAIS
Notaire à Chasselay (Rhône)
Certifie sincère la signature de
MR Alexander NOWAK
qui a été apposée
Chasselay, le 15/02/2005

PODER

La abajo firmada,

BAYER CROPSCIENCE SA

domiciliada en

16, rue Jean-Marie Leclair
69009 LYON, France

declara por el presente que otorga a

**ALVARO CORREA-ORDOÑEZ and/or OLGA GEORGETTE
OTERO and/or RICARDO METKE and/or JUAN PABLO
CONCHA.**

con domicilio en la Av. 82 No. 10 - 62 Piso 6 en Bogotá D. C., Colombia, poder especial amplio y suficiente, 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 autoridades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, diseños industriales, esquemas de trazado de circuitos integrados y variedades vegetales; el registro de marcas, denominaciones de origen, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales y nombres de dominio; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Los procesos para la protección del consumidor, competencia desleal, oposiciones, cancelaciones, nulidades, medidas cautelares, infracciones, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general procesos civiles, penales, administrativos relacionados con estos derechos. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del caso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

Igualmente, ratifico todo lo actuado hasta el momento en los mismos asuntos, por cualquiera de los mencionados apoderados en representación de ésta sociedad.

Dado y firmado en Lyon



5

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

Claude

1. — République française

Le présent acte public

2. — a été signé

GAZEL GAU'S Patrice

3. — en sa

qualité de

Notaire

est revêtu du sceau de

par étude

de CHASSELAIN (69)

Attesté

4. — à

l'ap

5. — le 16/02/05

6. — Par le Procureur général près la cour d'appel

sous n°

773



10. — Signature

[Signature]

COMO NOTARIA ONCE (E) DE ESTE
CIRCULO HAGO CONSTAR QUE ESTA
FOTOCOPIA COINCIDE CON EL
ORIGINAL QUE HE TENIDO A LA VISTA
31 ENE 2008
BOGOTA, D.C. COLOMBIA
MONICA ZULMA BAUTISTA NAVARRO
NOTARIA ONCE (11) E.

NOTARIAL CERTIFICATION

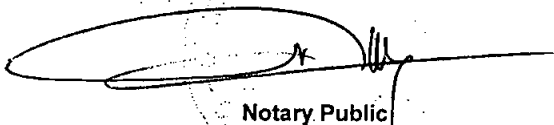
On this 10 day of March
2005, the undersigned Notary

CERTIFIES

Alexander NOWAK

1. That Alexander NOWAK
of legal age and domiciled in Neuenhaus Weg 10,
51467 Bergisch Gladbach, Germany
set his hand on the foregoing document.
2. That the grantor is to me personally known and that he/she has legal capacity to execute the instrument.
3. That the grantor has executed the foregoing document as
Authorized Representative
of the judicial person Bayer CropScience S.A.
4. That the judicial person Bayer Crop Science S.A.
having its home office in 16, rue Jean-Marie Leclair
69009 LYON, France
is duly organized, has present legal existence and that the purposes for which the power of attorney is granted are within the scope of its corporate purposes.
5. That the grantor has in fact the referred to authority and that his/her representation is legal.

6. That I have based certifications 3, 4 and 5 above on the following authentic documents for such purpose exhibited to me and which I mention specifically, giving their dates and their origin or source:
-Page "annonces judiciaires et légales" from the newspaper "Le Tout Lyon-Moniteur Judiciaire Reunis" dated 21 to 27 June 2003
-Power of Attorney from Bayer Cropscience SA (from the Chairman of the Management Board) dated 15 October 2004


Notary Public

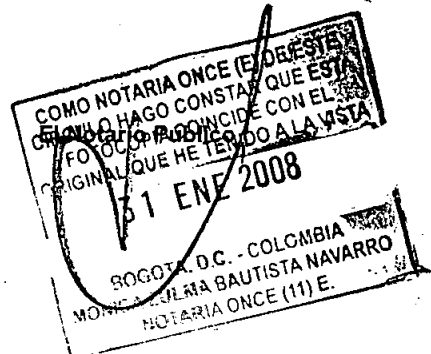
CERTIFICACION NOTARIAL

A los 10 días del mes de Marzo
de 2005, el suscrito Notario

DA FE

Alexander NOWAK

1. Que Alexander NOWAK
mayor y domiciliado en Neuenhaus Weg 10,
51467 Bergisch Gladbach, Alemania
suscribió de su puño y letra el documento que antecede.
2. Que conozco al otorgante y que éste tiene capacidad legal para el otorgamiento.
3. Que el otorgante ha suscrito el referido documento en su carácter de Representante Autorizado
de la persona jurídica Bayer CropScience S.A.
4. Que la persona jurídica Bayer CropScience S.A.
con sede en 16, rue Jean-Marie Leclair
69009 Lyon, Francia
está legalmente constituida, que tiene existencia legal actual y que el acto para el cual se otorga el poder está comprendido entre los que constituyen su objeto social.
5. Que el otorgante tiene efectivamente la representación que ostenta y que ésta es legítima.
6. Que he basado las certificaciones 3, 4 y 5 anteriores en los siguientes documentos auténticos que al efecto se me exhibieron y que menciono específicamente con expresión de sus fechas y de su origen o procedencia:

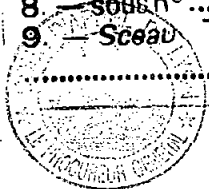


APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

- Colombie.....
1. — République française
Le présent acte public
2. — a été signé par BORTEL Gilberta Rénée
3. — agissant en qualité de Notaire
4. — est revêtu du sceau de son étude à
Chapelain (Mouze)

Attesté

5. — à Mon 6. — le 4 Mars 2008
7. — Par le Procureur général près la Cour d'Appel
8. — sous n° HSL
9. — Sceau 10. — Signature



[Handwritten signature]



(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
18 January 2007 (18.01.2007)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2007/006739 A1

(51) International Patent Classification:

C07D 333/38 (2006.01) A01N 43/12 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01) A01N 43/78 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01) A01N 43/32 (2006.01)
C07D 411/12 (2006.01) A01N 43/56 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01) A01N 43/36 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01) A01N 43/40 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01) A01N 43/38 (2006.01)

Collonge, Route d'Albigny, F-69250 Curis Au Mont D'or (FR). GENIX, Pierre [FR/FR]; 14 Rue Duviard, F-69004 Lyon (FR).

(74) Agent: GUITTON, Carole; BAYER CROPSCIENCE SA, Patents & Licensing Department, 14/20 Rue Pierre Baizet, F-69009 Lyon (FR).

(21) International Application Number:

PCT/EP2006/063992

(22) International Filing Date: 6 July 2006 (06.07.2006)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:

05356117.1 12 July 2005 (12.07.2005) EP

(71) Applicant (for all designated States except US): BAYER CROPSCIENCE SA [FR/FR]; 16 Rue Jean-Marie Leclair, F-69009 Lyon (FR).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): MANSFIELD, Darren [GB/DE]; Graf-Adolf Strasse 7, 51429 Bergisch Gladbach (DE). COQUERON, Pierre-Yves [FR/FR]; 56 Cours De La Liberté, F-69003 Lyon (FR). RIECK, Heiko [DE/FR]; 29 Allée Buffon, F-69110 Sainte Foy-les-Lyon (FR). DESBORDES, Philippe [FR/FR]; 30 Rue Bancel, F-69007 Lyon (FR). VILLIER, Alain [FR/FR]; Les Terres de Tourvéon, Bat. A, 2 Chemin Du Champ, F-69660 Collonges Au Mont D'or (FR). GROS-JEAN-COURNOYER, Marie-Claire [FR/FR]; Le Trève

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of national protection available): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

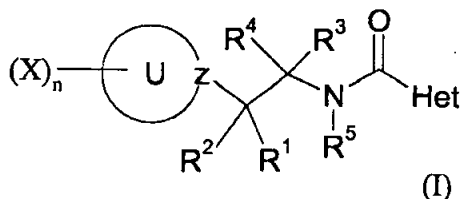
(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT,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

Published:

— with international search report

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

(54) Title: BENZOHETEROCYCLYLETHYLCARBOXAMIDE DERIVATIVES



(57) Abstract: The present invention relates to novel benzoheterocyclylethylcarboxamide derivatives of formula (I) in which the substituents are in the description, their process of preparation, their use as fungicides, particularly in the form of fungicidal compositions, methods for the control of phytopathogenic fungi of plants using these compounds or their compositions.

WO 2007/006739 A1

Benzoheterocyclylethylcarboxamide derivatives

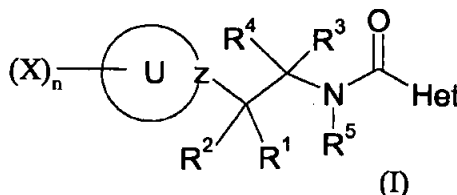
The present invention relates to novel benzoheterocyclylethylcarboxamide derivatives, their process of preparation, their use as fungicides, particularly in the form of fungicidal compositions, and methods for the control of phytopathogenic fungi of plants using these compounds or their compositions.

Patent application WO 03/042184 describes a broad family of benzimidazol- or indol-aminoacetonitrile derivatives for parasite control. However, their activity as fungicides was not tested and the document does not disclosed the compounds according to the invention.

It is always of high-interest in the field of agrochemicals to use novel pesticidal compounds in order to avoid or to fight the development of resistant strains to the active ingredients used by the farmer.

We have now found a new family of compounds which possess the above mentioned characteristics.

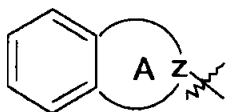
Accordingly, the present invention relates to a benzo-heterocyclylethylcarboxamide derivative of general formula (I)



in which :

- n is 0, 1, 2, 3, 4, 5 or 6;

- U is :



wherein A represents a 5- or 6-membered heterocycle with one, two or three heteroatoms which may be the same or different; fused with a phenyl ring.

- Z is a carbon atom or a heteroatom which can not be substituted by X;

- X is the same or different and is a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro- λ^6 -sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carboxy group, a

carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a C₁-C₈-alkyl, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₁-C₈-alkylamino, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a di-C₁-C₈-alkylamino, a C₁-C₈-alkoxy, a C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulfanyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyloxy, a C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₈-alkynyloxy, a C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₈-cycloalkyl, a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyloxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyl-C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonylamino, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a di-C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a C₁-C₈-alkyloxycarbonyloxy, a C₁-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphinyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkoxyimino, a (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkenyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkynyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a benzyloxy, a benzylsulfanyl, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl a phenyl or a phenylamino;

- R¹ and R² are the same or different and are a hydrogen atom, a cyano group, a formyl group, a carboxy group, a carbamoyl group, a (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a C₁-C₈-alkyl, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₃-C₈-cycloalkyl, a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl or a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms;

- R³ and R⁴ are the same or different and are a hydrogen atom, a formyl group, a (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a C₁-C₈-alkyl, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₃-C₈-cycloalkyl, a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

- R⁵ is a hydrogen atom, a C₁-C₆-alkyl, or a C₃-C₇-cycloalkyl;
- Het represents a 5- or 6-membered non-fused heterocycle with one, two or three heteroatoms which may be the same or different; Het being linked by a carbon atom and being at least substituted in ortho position;
- 5 as well as its salts, N-oxides, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active isomers.

In the context of the present invention :

- halogen means fluorine, bromine, chlorine or iodine.
- 10 -carboxy means -C(=O)OH ; carbonyl means -C(=O)- ; carbamoyl means -C(=O)NH₂ ; N-hydroxycarbamoyl means -C(=O)NHOH ;
- an alkyl group, an alkenyl group, and an alkynyl group as well as moieties containing these terms, can be linear or branched; and
- heteroatom means sulphur, nitrogen or oxygen.

- 15 In the context of the present invention, it has also to be understood that in the case of di-substituted amino and of di-substituted carbamoyl radicals, the two substituents may form together with the nitrogen atom bearing them a saturated heterocyclic ring containing 3 to 7 atoms.

- Any of the compounds of the present invention can exist in one or more
20 optical or chiral isomer forms depending on the number of asymmetric centres in the compound. The invention thus relates equally to all the optical isomers and to their racemic or scalemic mixtures (the term "scalemic" denotes a mixture of enantiomers in different proportions), and to the mixtures of all the possible stereoisomers, in all proportions. The diastereoisomers and/or the optical isomers can be separated
25 according to the methods which are known *per se* by the man ordinary skilled in the art.

- Any of the compounds of the present invention can also exist in one or more geometric isomer forms depending on the number of double bonds in the compound. The invention thus relates equally to all geometric isomers and to all possible
30 mixtures, in all proportions. The geometric isomers can be separated according to general methods, which are known *per se* by the man ordinary skilled in the art.

- Any of the compounds of general formula (I) wherein X represents a hydroxy, a sulfanyl group or an amino group may be found in its tautomeric form resulting from the shift of the proton of said hydroxy, sulfanyl or amino group. Such
35 tautomeric forms of such compounds are also part of the present invention. More generally speaking, all tautomeric forms of compounds of general formula (I)

wherein X represents a hydroxy, a sulfanyl group or an amino group, as well as the tautomeric forms of the compounds which can optionally be used as intermediates in the preparation processes, and which will be defined in the description of these processes, are also part of the present invention.

5

According to the present invention, the "U" group may be substituted in any position by (X)_n, in which X and n are as defined above. Preferably, the present invention relates to a benzoheterocyclylethylcarboxamide derivative of general formula (I) in which the different characteristics may be chosen alone or in combination as being :

10

- as regards n, n is 0, 1 or 2; and
- as regards X, X is chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

15

According to the present invention, the carbon atoms of the carboxamide moiety of the compound of formula (I) are substituted by R¹, R², R³ and R⁴; R¹, R², R³ and R⁴ being as defined above. Preferably, the present invention also relates to benzoheterocyclylethylcarboxamide derivative of general formula (I) in which the different characteristics may be chosen alone or in combination as being :

20

- as regards R¹ and R², R¹ and R² are chosen, independently of each other, as being a hydrogen atom, a C₁-C₈-alkyl, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₃-C₈-cycloalkyl, a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and
- 25 - as regards R³ and R⁴, R³ and R⁴ are chosen, independently of each other, as being a hydrogen atom, a C₁-C₈-alkyl, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₃-C₈-cycloalkyl, a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

30

According to the present invention, the nitrogen atom of the carboxamide moiety of the compound of formula (I) is substituted by R⁵, R⁵ being a hydrogen atom, a C₁-C₆-alkyl or a C₃-C₇-cycloalkyl. Preferably, the C₃-C₇-cycloalkyl is cyclopropyl.

35

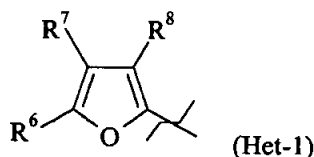
According to the present invention, "Het" of the compound of general formula (I) is a 5- or 6-membered non-fused heterocycle with one, two or three

heteroatoms which may be the same or different, Het being linked by a carbon atom and being substituted at least in ortho-position. Preferably, the present invention also relates to benzoheterocyclylethylcarboxamide derivative of general formula (I) in which Het is chosen as being 2-furan, 3-furan, 4,5-dihydro-3-furan, 2-thiophene, 3-thiophene, 2-pyrrole, 3-pyrrole, 5-oxazole, 4-oxazole, 5-thiazole, 4-thiazole, 5-pyrazole, 4-pyrazole, 3-pyrazole, 3-isoxazole, 4-isoxazole, 5-isoxazole, 3-isothiazole, 4-1,2,3-triazole, 4-thiadiazole, 5-thiadiazole, 2-pyridine, 3-pyridine, 4-pyridine, 2-oxathiine, 4,5dihydro-3-pyran, 4,5dihydro-2-thiopyran, 4,5dihydro-3-thiopyran or 2-pyrazine.

10

According to the present invention, "Het" of the compound of general formula (I) may be a five membered ring heterocycle. Specific examples of compounds of the present invention where Het is a five membered heterocycle include :

15 * Het represents a heterocycle of the general formula (Het-1)



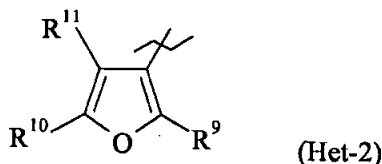
20

in which :

- R⁶ and R⁷ may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

25 - R⁸ may be a halogen atom, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-2)



30

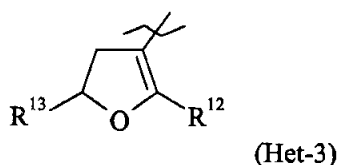
in which :

- R⁹ may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R¹⁰ and R¹¹ may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, an amino group, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

provided that the R⁹ and R¹¹ are not both a hydrogen atom.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-3)

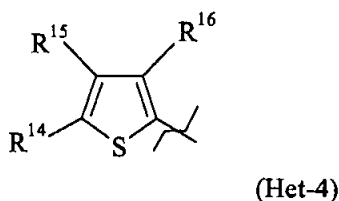


in which :

- R¹² may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R¹³ may be a hydrogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-4)

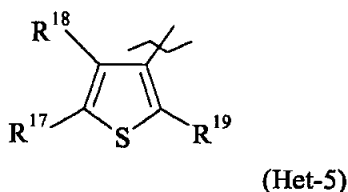


in which :

- R¹⁴ and R¹⁵ may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl, a phenyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl or a pyridyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl; and

- R¹⁶ may be a halogen atom, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₄-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-5)



15

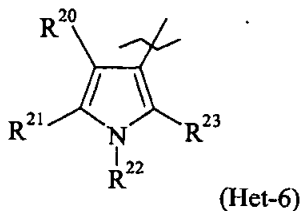
in which :

- R^{17} and R^{18} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkyloxy or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R^{19} may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

provided that the R^{18} and R^{19} are not both a hydrogen atom.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-6)



in which :

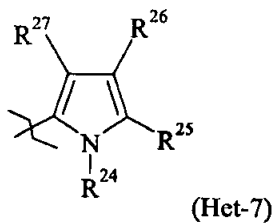
- R^{20} may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

- R^{21} and R^{23} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R^{22} may be a hydrogen atom, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, a hydroxy- C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl, a di(C_1 - C_4 -alkyl)aminosulphonyl, a C_1 - C_6 -alkylcarbonyl, a phenylsulphonyl optionally substituted by a halogen atom or a C_1 - C_4 -alkyl, or a benzoyl optionally substituted by a halogen atom or a C_1 - C_4 -alkyl;

provided that the R^{20} and R^{23} are not both a hydrogen atom.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-7)



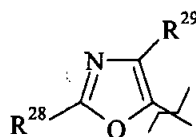
in which :

- R²⁴ may be a hydrogen atom, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, a hydroxy-C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkylsulphonyl, a di(C₁-C₄-alkyl)aminosulphonyl, a C₁-C₆-alkylcarbonyl, a phenylsulphonyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl, or a benzoyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl; and

- R²⁵, R²⁶ and R²⁷ may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₄-alkylcarbonyl;

provided that R²⁴ and R²⁷ are not both a hydrogen atom.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-8)



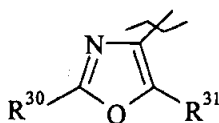
(Het-8)

in which :

- R²⁸ may be a hydrogen atom or a C₁-C₄-alkyl; and

- R²⁹ may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-9)



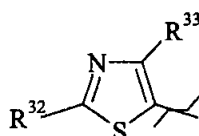
(Het-9)

in which :

- R³⁰ may be a hydrogen atom or a C₁-C₄-alkyl; and

- R³¹ may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a phenyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-10)

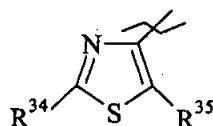


(Het-10)

in which :

- R³² may be a hydrogen atom, a halogen atom, an amino group, a cyano group, a C₁-C₄-alkylamino, a di-(C₁-C₄-alkyl)amino, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a phenyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl; and
- R³³ may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

- 10 * Het represents a heterocycle of the general formula (Het-11)

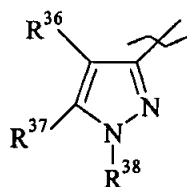


(Het-11)

- 15 in which :

- R³⁴ may be a hydrogen atom, a halogen atom, an amino group, a cyano group, a C₁-C₄-alkylamino, a di-(C₁-C₄-alkyl)amino, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and
- R³⁵ may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

- 20 * Het represents a heterocycle of the general formula (Het-12)



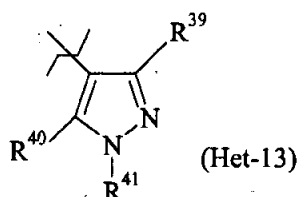
(Het-12)

in which :

- R³⁶ may be a halogen atom, a cyano group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₆-cycloalkyl, a C₁-C₄-alkoxy, a C₁-C₄-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms, an aminocarbonyl group or an aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl;
- R³⁷ may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy or a C₁-C₄-alkylthio; and

- R^{38} may be a hydrogen atom, a phenyl, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a hydroxy- C_1 - C_4 -alkyl, a C_2 - C_6 -alkenyl, a C_3 - C_6 -cycloalkyl, a C_1 - C_4 -alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkylthio- C_1 - C_4 -alkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkoxy- C_1 - C_4 -alkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-13)



in which :

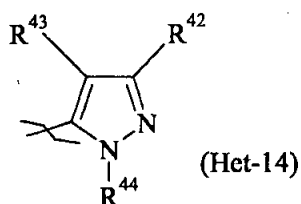
- R^{39} may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_3 - C_6 -cycloalkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy, a C_1 - C_4 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms, an aminocarbonyl or an aminocarbonyl- C_1 - C_4 -alkyl;

- R^{40} may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms or a C_1 - C_4 -alkylthio; and

- R^{41} may be a hydrogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a hydroxy- C_1 - C_4 -alkyl, a C_2 - C_6 -alkenyl, a C_3 - C_6 -cycloalkyl, a C_1 - C_4 -alkylthio- C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkylthio- C_1 - C_4 -alkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkoxy- C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkoxy- C_1 - C_4 -alkyl having 1 to 5 halogen atoms or a phenyl optionally substituted by a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkoxyalkyl or a nitro group;

provided that the R^{39} and R^{40} are not both a hydrogen atom.

- * Het represents a heterocycle of the general formula (Het-14)



in which :

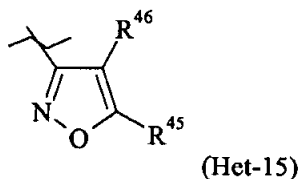
-R⁴² may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₆-cycloalkyl, a C₁-C₄-alkoxy, a C₁-C₄-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms, an aminocarbonyl, or an aminocarbonyl-C₁-C₄-alkyl;

- R⁴³ may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy, a C₁-C₄-alkylthio or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

- R⁴⁴ may be a hydrogen atom, a phenyl, a benzyl, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a hydroxy-C₁-C₄-alkyl, a C₂-C₆-alkenyl, a C₃-C₆-cycloalkyl, a C₁-C₄-alkylthio-C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkylthio-C₁-C₄-alkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkoxy-C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkoxy-C₁-C₄-alkyl having 1 to 5 halogen atoms;

provided that R⁴³ and R⁴⁴ are not both a hydrogen atom.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-15)

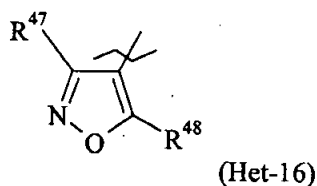


in which :

- R⁴⁵ may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R⁴⁶ may be a halogen atom, a C-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-16)

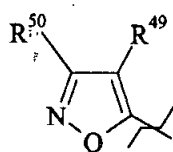


in which R⁴⁷ and R⁴⁸ may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a

phenyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl, or a heterocyclyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl;
provided that R⁴⁷ and R⁴⁸ are not both a hydrogen atom.

5

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-17)



10

(Het-17)

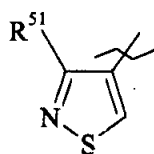
in which

- R⁴⁹ may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms. and

- R⁵⁰ may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

15

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-18)

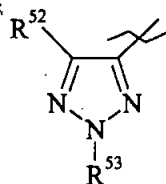


20

(Het-18)

in which R⁵¹ may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-19)



30

(Het-19)

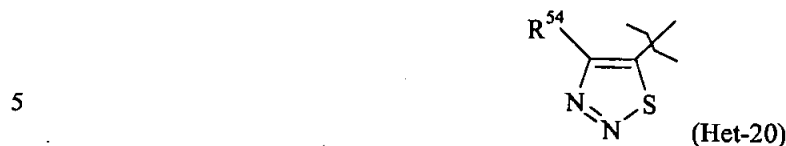
in which :

- R⁵² may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R⁵³ may be a hydrogen atom, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, or a phenyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl.

35

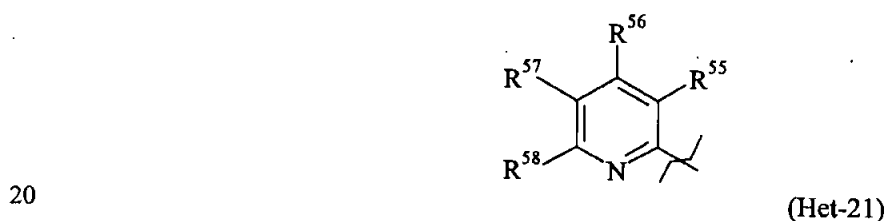
* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-20)



in which R^{54} may be a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

10 According to the present invention, "Het" of the compound of general formula (I) may be a six membered ring heterocycle. Specific examples of compounds of the present invention where Het is a six membered heterocycle include :

15 * Het represents a heterocycle of the general formula (Het-21)



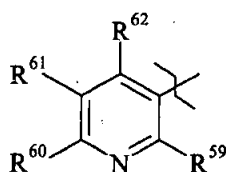
in which :

- R^{55} may be a halogen atom, a hydroxy group, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkoxy, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms or a C_1 - C_4 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms;

- R^{56} , R^{57} and R^{58} , which may be the same or different, may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkoxy, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl or a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl.

22

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-22)



(Het-22)

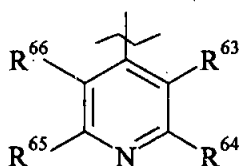
in which :

- R⁵⁹ may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxy group, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkoxy, a C₁-C₅-alkylthio, a C₂-C₅-alkenylthio, a C₁-C₄-halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a phenyloxy optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl, or a phenylthio optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl;

- R⁶⁰, R⁶¹ and R⁶², which may be the same or different, may be a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkoxy, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkylsulphinyl, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a N-morpholine optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl, or a thienyl optionally substituted by a halogen atom or a C₁-C₄-alkyl;

provided that the R⁵⁹ and R⁶² are not both a hydrogen atom.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-23)

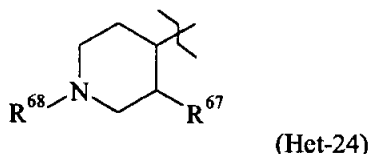


(Het-23)

in which R⁶³, R⁶⁴, R⁶⁵ and R⁶⁶, which may be the same or different, may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxy group, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkoxy, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkylsulphinyl or a C₁-C₄-alkylsulphonyl;

provided that the R⁶³ and R⁶⁶ are not both a hydrogen atom.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-24)

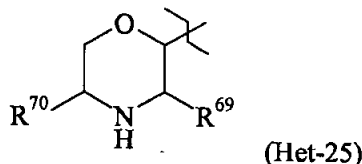


in which :

- R⁶⁷ may be a halogen atom, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

10 - R⁶⁸ may be a hydrogen atom, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkoxycarbonyl, a benzyl optionally substituted by 1 to 3 halogen atoms, a benzyloxycarbonyl optionally substituted by 1 to 3 halogen atoms or a heterocyclyl.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-25)

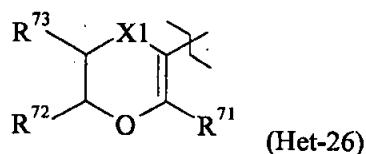


in which :

20 - R⁶⁹ may be a halogen atom, a hydroxy group, a cyano group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₄-alkoxy, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-halogenoalkylthio having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₄-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms;

25 - R⁷⁰ may be a hydrogen atom, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a benzyl.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-26)



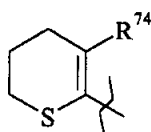
in which :

- X¹ may be a sulphur atom, -SO-, -SO₂- or -CH₂-;

35 - R⁷¹ may be a halogen, a C₁-C₄-alkyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and

- R^{72} and R^{73} may be the same or different and may be a hydrogen atom or a C_1 - C_4 -alkyl.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-27)

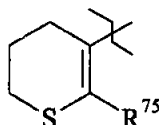


(Het-27)

in which :

- R^{74} may be a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-28)

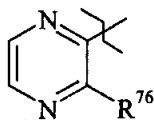


(Het-28)

in which :

- R^{75} may be a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* Het represents a heterocycle of the general formula (Het-29)



(Het-29)

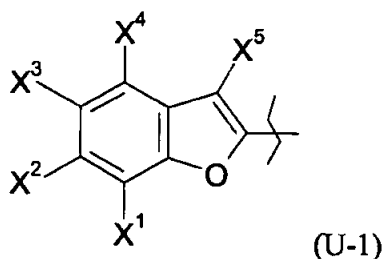
in which R^{76} may be a halogen atom, a C_1 - C_4 -alkyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

According to the present invention, the "U" group of the compound of general formula (I) is a benzoheterocycle where the heterocycle fused to the phenyl ring is a five or six membered ring with one, two or three heteroatoms which may be the same or different. Preferably, the present invention also relates to a benzoheterocyclylethylcarboxamide derivative of general formula (I) in which the different characteristics may be chosen alone or in combination as being :

- U is chosen as being a 2-benzothiophene, a 3-benzothiophene, a 1-indole, a 2-indole, a 3-indole, a 2-benzofuran, a 3-benzofuran, a 2-benzoxazole, a 2-benzothiazole, a 1-benzimidazole, a 2-benzimidazole, a 3-benz-1,2-isoxazole, a 3-benz-2,1-isoxazole, a 3-benz-1,2-isothiazole, a 3-benz-2,1-isothiazole, a 1-benzopyrazole, a 2-benzopyrazole, a 3-benzopyrazole, a 2-quinoline, a 3-quinoline, a 4-quinoline, a 1-isoquinoline, a 3-isoquinoline, a 4-isoquinoline.
- U is non substituted or substituted by 1, 2, 3, 4, 5, or 6 groups which are chosen, independently of each other, as being a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

Specific examples of "U" group include :

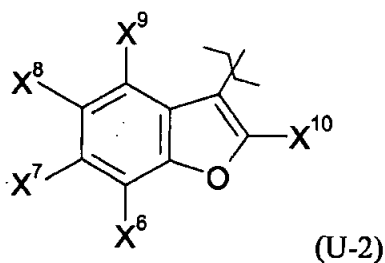
- * U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-1)



in which :

- X¹, X², X³, X⁴ and X⁵ may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms

- * U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-2)



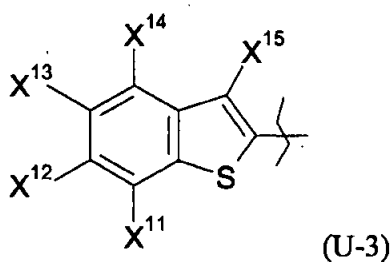
in which :

26

- X^6 , X^7 , X^8 , X^9 and X^{10} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy group, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

5

* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-3)



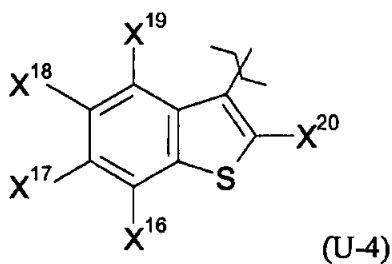
10

in which :

- X^{11} , X^{12} , X^{13} , X^{14} and X^{15} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy group, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms

15

* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-4)



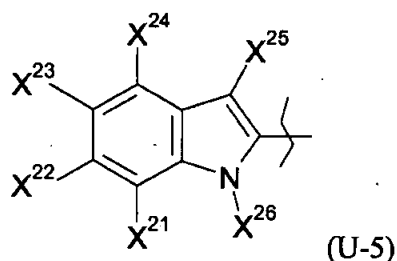
20

in which :

- X^{16} , X^{17} , X^{18} , X^{19} and X^{20} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy group, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

25

* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-5)

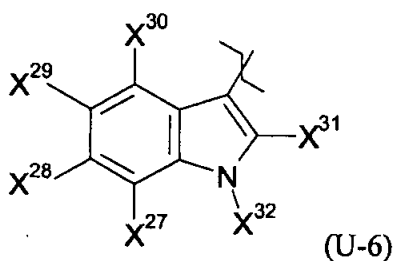


5 in which :

- X^{21} , X^{22} , X^{23} , X^{24} , X^{25} and X^{26} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms

10

* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-6)

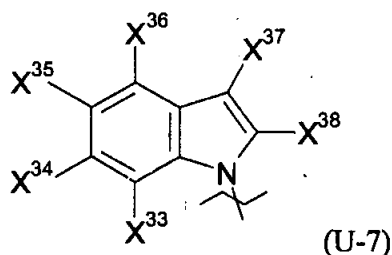


15 in which :

- X^{27} , X^{28} , X^{29} , X^{30} , X^{31} and X^{32} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

20

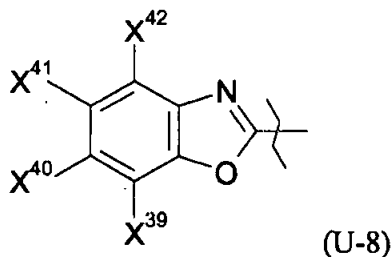
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-7)



in which :

- 5 - X^{33} , X^{34} , X^{35} , X^{36} , X^{37} and X^{38} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy group, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

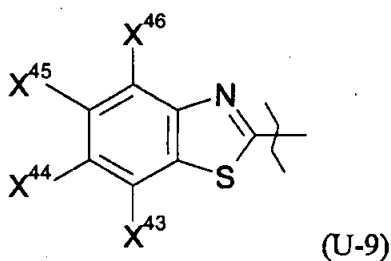
- 10 * U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-8)



in which :

- 15 - X^{39} , X^{40} , X^{41} and X^{42} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy group, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

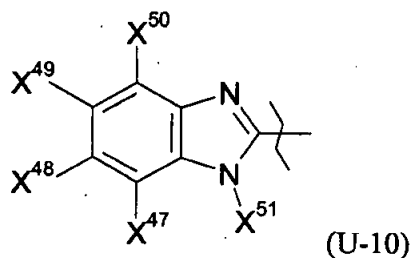
- 20 * U represents a benzothiazole of the general formula (U-9)



in which :

- X^{43} , X^{44} , X^{45} and X^{46} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy group, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

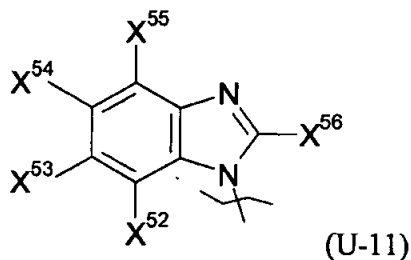
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-10)



in which :

- X^{47} , X^{48} , X^{49} , X^{50} and X^{51} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy group, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

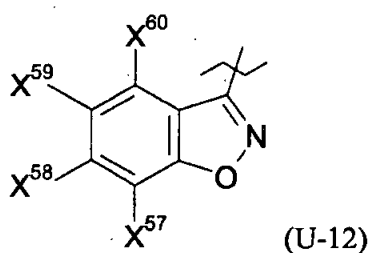
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-11)



in which :

- X^{52} , X^{53} , X^{54} , X^{55} and X^{56} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy group, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-12)

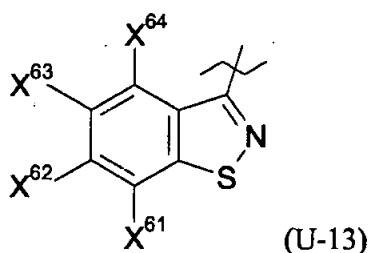


5 in which :

- X⁵⁷, X⁵⁸, X⁵⁹ and X⁶⁰ may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

10

* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-13)

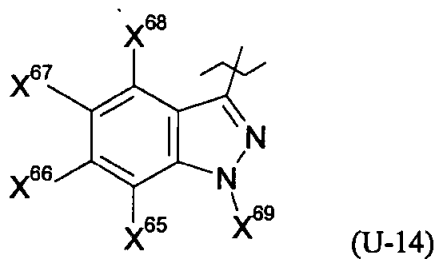


15 in which :

- X⁶¹, X⁶², X⁶³ and X⁶⁴ may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

20

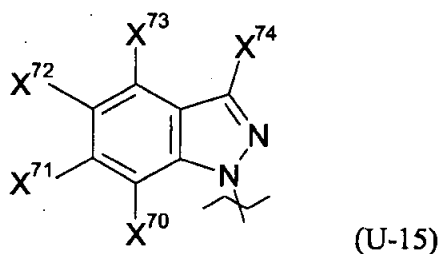
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-14)



in which :

- X^{65} , X^{66} , X^{67} , X^{68} and X^{69} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

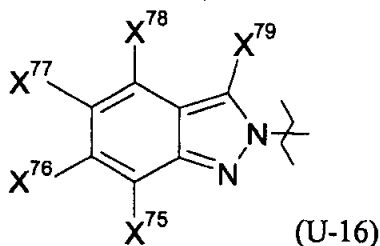
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-15)



in which :

- X^{70} , X^{71} , X^{72} , X^{73} and X^{74} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-16)

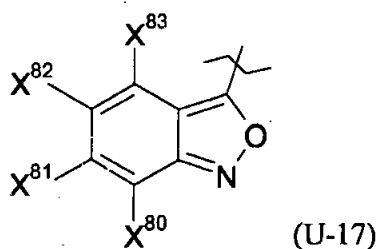


in which :

- X^{75} , X^{76} , X^{77} , X^{78} and X^{79} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

32

* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-17)

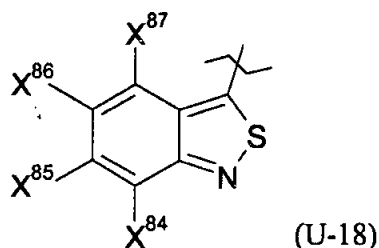


5 in which :

- X^{80} , X^{81} , X^{82} and X^{83} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy group, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

10

* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-18)

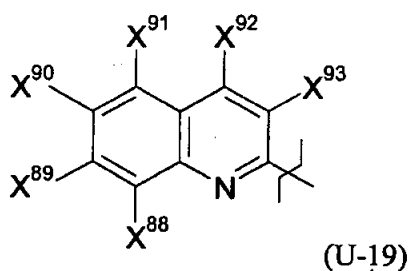


15 in which :

- X^{84} , X^{85} , X^{86} and X^{87} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy group, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

20

* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-19)



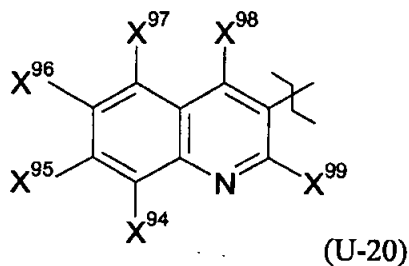
(U-19)

in which :

- 5 - X⁸⁸, X⁸⁹, X⁹⁰, X⁹¹, X⁹² and X⁹³ may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-20)

10



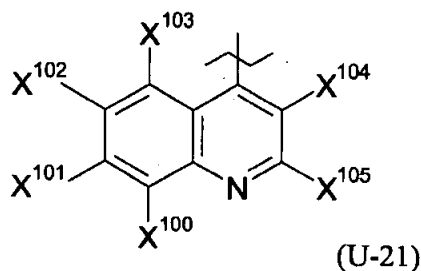
(U-20)

in which :

- 15 - X⁹⁴, X⁹⁵, X⁹⁶, X⁹⁷, X⁹⁸ and X⁹⁹ may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-21)

20

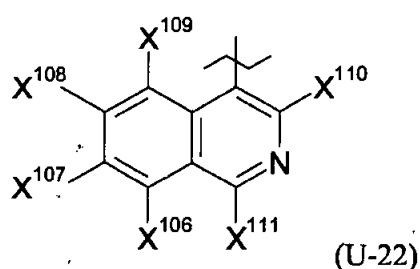


(U-21)

in which :

- X^{100} , X^{101} , X^{102} , X^{103} , X^{104} and X^{105} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

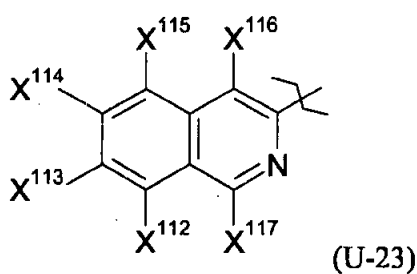
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-22)



in which :

- X^{106} , X^{107} , X^{108} , X^{109} , X^{110} and X^{111} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

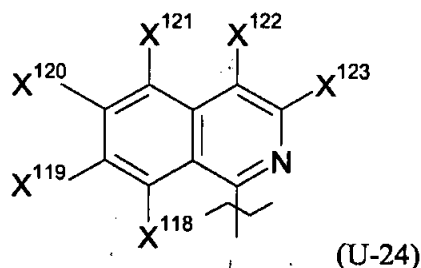
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-23)



in which :

- X^{112} , X^{113} , X^{114} , X^{115} , X^{116} and X^{117} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-24)

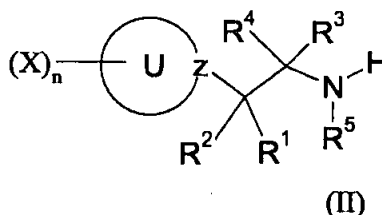


5 in which :

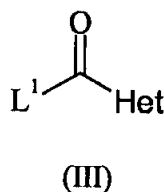
- X^{118} , X^{119} , X^{120} , X^{121} , X^{122} and X^{123} may be the same or different and may be a hydrogen atom, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C_1 - C_4 -alkyl, a C_1 - C_4 -alkoxy group, a C_1 - C_4 -alkylthio, a C_1 - C_4 -alkylsulphonyl or a C_1 - C_4 -halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

10

The present invention also relates to a process for the preparation of the compound of general formula (I). Thus, according to a further aspect of the present invention there is provided a process for the preparation of a compound of general formula (I) as defined above, which comprises reacting a
15 benzoheterocyclylethylamine derivative of general formula (II) or one of its salt :



20 in which U, X, n, Z, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 and R^5 are as defined above;
with a carboxylic acid derivative of the general formula (III)

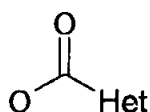


25

in which :

-Het is defined as above

- L¹ is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, -OR⁶, -OCOR⁶, R⁶ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl, pentafluorophenyl or a group of formula

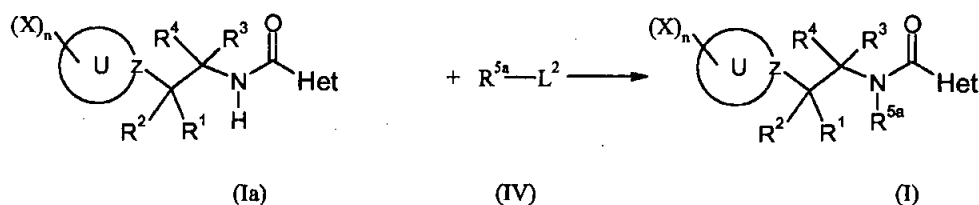


in the presence of a catalyst and, if L¹ is a hydroxyl group, in the presence of a condensing agent.

The process according to the present invention is conducted in the presence of a catalyst. Suitable catalyst may be chosen as being 4-dimethyl-aminopyridine, 1-hydroxy-benzotriazole or dimethylformamide.

In case L¹ is a hydroxy group, the process according to the present invention is conducted in the presence of a condensing agent. Suitable condensing agent may be chosen as being acid halide former, such as phosgene, phosphorous tribromide, phosphorous trichloride, phosphorous pentachloride, phosphorous trichloride oxide or thionyl chloride; anhydride former, such as ethyl chloroformate, methyl chloroformate, isopropyl chloroformate, isobutyl chloroformate or methanesulfonyl-chloride; carbodiimides, such as N,N'-dicyclohexylcarbodiimide (DCC), PS-DCC or other customary condensing agents, such as phosphorous pentoxide, polyphosphoric acid, N,N'-carbonyl-diimidazole, 2-ethoxy-N-ethoxycarbonyl-1,2-dihydroquinoline (EEDQ), triphenylphosphine/tetrachloromethane, 4-(4,6-dimethoxy[1.3.5]triazin-2-yl)-4-methylmorpholinium chloride hydrate or bromo-tripyrrolidino-phosphonium-hexafluorophosphate, 1-Hydroxybenzotriazole (HOBT).

When R⁵ is a hydrogen atom, the above mentioned process for the preparation of compound of general formula (I) may optionally be completed by a further step according to the following reaction scheme :



in which :
 - U, X, n, Z, R¹, R², R³, R⁴ and Het are as defined above;
 - R^{5a} is a C₁-C₆-alkyl, or a C₃-C₇-cycloalkyl;

- L^2 is a leaving group chosen as being a halogen atom, a 4-methyl phenylsulfonyloxy or a methylsulfonyloxy;
 comprising the reaction of a compound of general formula (Ia) with a compound of general formula (IV) to provide a compound of general formula (I).

5

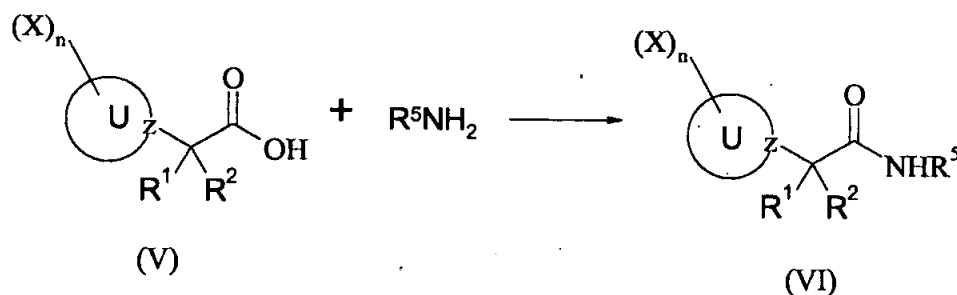
Depending on the definition of R^1 , R^2 , R^3 , R^4 or R^5 , amine derivatives of general formula (II) may be prepared by different processes. One example (A) of such a process may be when :

- 10 - U, X, n, Z and R^5 are as defined above;
 - R^1 is a hydrogen atom or a C_1 - C_6 alkyl ;
 - R^2 is a hydrogen atom or a C_1 - C_6 alkyl; and
 - R^3 and R^4 are hydrogen atoms;

then, the amine derivative of general formula (II) may be prepared according to a process which comprises :

- 15 - a first step according to reaction scheme A-1 :

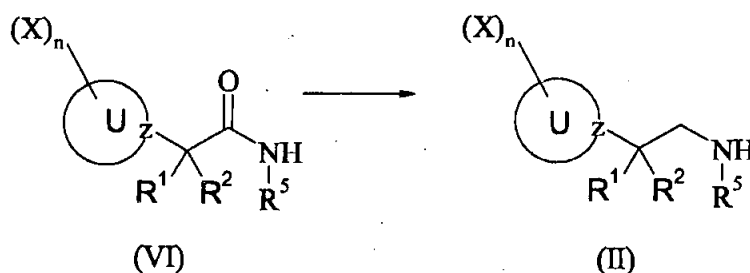
Scheme A-1



in which :

- 20 - U, X, n, Z and R^5 are as defined above;
 - R^1 is a hydrogen atom or a C_1 - C_6 alkyl ; and
 - R^2 is a hydrogen atom or a C_1 - C_6 alkyl.
- 25 comprising the transformation of an benzoheterocyclic carboxylic acid of general formula (V) to provide an benzoheterocyclyl-amide derivative of general formula (VI), in the presence of an amine derivative and a condensing agent, at a temperature of from 0°C to 200°C ;
- 30 - a second step according to reaction scheme A-2 :

Scheme A-2



in which :

- U, X, n, Z and R⁵ are as defined above;
- R¹ is a hydrogen atom or a C₁-C₆ alkyl ; and
- R² is a hydrogen atom or a C₁-C₆ alkyl.

comprising a reduction of a compound of general formula (VI) to provide, a benzoheterocyclylethylamine derivative of general formula (II), in the presence of a hydride donor, at a temperature of from 0°C to 200°C;

The first step (step A-1) is conducted in the presence of a condensing agent. Suitable condensing agent may be chosen as being acid halide former, such as phosgene, phosphorous tribromide, phosphorous trichloride, phosphorous pentachloride, phosphorous trichloride oxide or thionyl chloride; sulfuryl chloride; anhydride former, such as ethyl chloroformate, methyl chloroformate, isopropyl chloroformate, isobutyl chloroformate or methanesulfonyl- chloride.

The first step (step A-1) according to the present invention is conducted at a temperature of from 0°C to 200°C. Preferably, first step (step A-1) is conducted at a temperature of from 0°C to 120°C.

The first step (step A-1) according to the present invention may be conducted in the presence of a solvent or not. When a solvent is used, the solvent is chosen preferably as being water, an organic solvent or a mixture of both. Suitable organic solvents may for example be aliphatic, alicyclic or aromatic solvent.

The second step (step A-2) according to the present invention is conducted in the presence of a hydride donor. Preferably, the hydride donor is chosen as being metal or metalloid hydrides such as LiAlH₄, NaBH₄, KBH₄, B₂H₆.

The second step (step A-2) according to the present invention may be conducted in the presence of a catalyst. Preferably, the catalyst is chosen as being a Lewis acid such as TiCl_4 , AlCl_3 , $\text{BF}_3 \cdot \text{Et}_2\text{O}$, CeCl_3 .

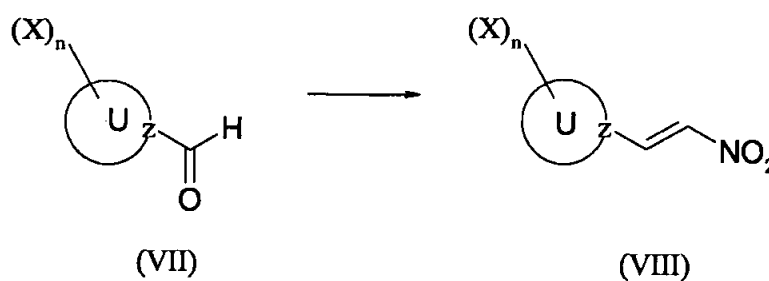
The second step (step A-2) according to the present invention is conducted at a temperature of from 0°C to 200°C . Preferably the temperature is of from 10°C to 120°C . More preferably, the temperature is of from 10°C to 80°C .

The second step (step A-2) according to the present invention may be conducted in the presence of an organic solvent, of water or of a mixture thereof. Preferably, the solvent is chosen as being ether, alcohol, carboxylic acid, or a mixture thereof with water or pure water.

When R5 is a hydrogen atom, the amine derivative of general formula (II) may also be prepared according to a process which comprises :

- a first step according to reaction scheme B-1 :

Scheme B-1

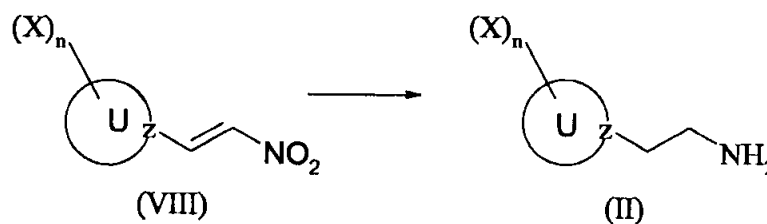


in which : - X, U, Z and n are as defined above;

comprising the transformation of an benzoheterocyclic aldehyde of general formula (VII) to provide an benzoheterocyclyl-nitroalkene derivative of general formula (VIII), at a temperature of from 0°C to 200°C .

- a second step according to reaction scheme B-2 :

Scheme B-2



in which : -X, U, Z and n are as defined above;

comprising a reduction of a compound of general formula (VIII) to provide, a
benzoheterocyclylethylamine derivative of general formula (II), in the presence of a
5 hydride donor, at a temperature of from 0°C to 200°C;

The first step (step B-1) according to the present invention is conducted at a
temperature of from 0°C to 200°C. Preferably, first step (step A-1) is conducted at a
temperature of from 0°C to 150°C, more preferably at a temperature of from 50°C to
10 150°C.

The first step (step B-1) according to the present invention may be conducted
in the presence of an organic solvent, of water or of a mixture thereof. Preferably, the
solvent is chosen as being ether, alcohol, carboxylic acid, or a mixture thereof with
water or pure water.

15 The first step (step B-1) according to the present invention may be conducted
in the presence of a buffer. Preferably the buffer is AcONH₄.

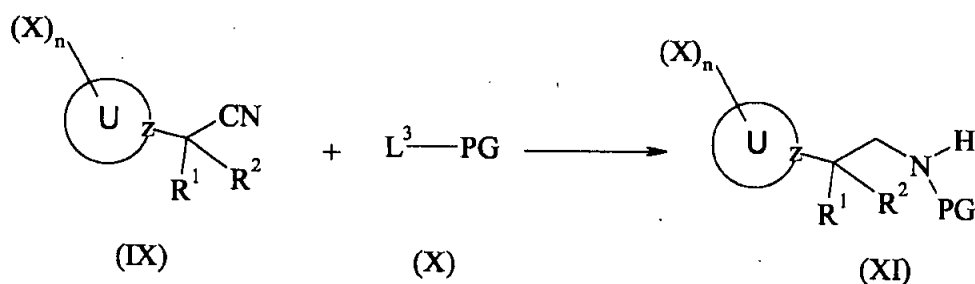
The second step (step B-2) according to the present invention is conducted in
20 the presence of a hydride donor. Preferably, the hydride donor is chosen as being
metal or metalloid hydrides such as LiAlH₄, NaBH₄, KBH₄, B₂H₆.

The second step (step B-2) according to the present invention is conducted at
a temperature of from 0°C to 200°C. Preferably the temperature is of from 10°C to
120°C. More preferably, the temperature is of from 10°C to 80°C.

25 The second step (step B-2) according to the present invention may be
conducted in the presence of an organic solvent, of water or of a mixture thereof.
Preferably, the solvent is chosen as being ether, alcohol, carboxylic acid, or a mixture
thereof with water or pure water.

30 When R₅ is a hydrogen atom, the amine derivative of general formula (II) may also
be prepared according to a process which comprises :

- a first step according to reaction scheme C-1 :

Scheme C-1

in which : - U, X, Z, n are as defined above;

- R¹ is a hydrogen atom or a C₁-C₆ alkyl;

- R² is a hydrogen atom or a C₁-C₆ alkyl;

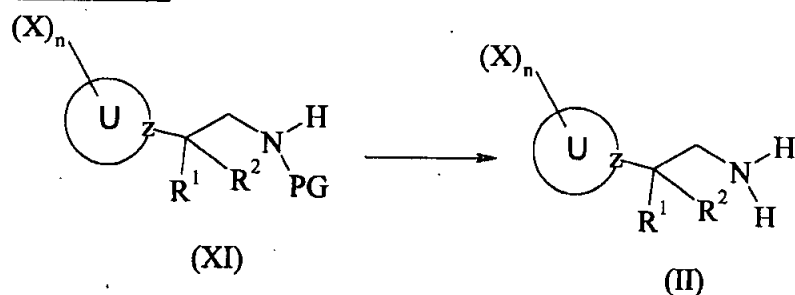
5 - L³ is a leaving group chosen as being a -OR⁷ group or a -OCOR⁷ group, R⁷ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

10 - PG represents a protecting group which may be a -COOR⁷ group or -COR⁷ group, R⁷ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising the reduction, by hydrogenation or by an hydride donor, of a compound of general formula (IX), in the presence of a catalyst and in the presence of a compound of general formula (X) to produce a compound of general formula (XI), at a temperature of from 0°C to 150°C and under a pressure of from 1 bar and 100 bar;

15

- a second step according to reaction scheme C-2 :

Scheme C-2

in which : - U, X, Z, n are as defined above;

20 - R¹ is a hydrogen atom or a C₁-C₆ alkyl;

- R² is a hydrogen atom or a C₁-C₆ alkyl

- PG represents a protecting group which may be a -COOR⁷ group or -COR⁷ group, R⁷ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

spraying or dusting device, but also concentrated commercial compositions which must be diluted before application to the crop.

The compounds of the invention can also be mixed with one or more insecticides, fungicides, bactericides, attractant acaricides or pheromones or other compounds with biological activity. The mixtures thus obtained have a broadened spectrum of activity. The mixtures with other fungicides are particularly advantageous. Examples of suitable fungicide mixing partners may be selected in the following lists :

B1) a compound capable to inhibit the nucleic acid synthesis like benalaxyl, benalaxyl-M, bupirimate, chiralaxyl, clozylacon, dimethirimol, ethirimol, furalaxyl, hymexazol, metalaxyl-M, ofurace, oxadixyl, oxolinic acid ;

B2) a compound capable to inhibit the mitosis and cell division like benomyl, carbendazim, diethofencarb, fuberidazole, pencycuron, thiabendazole thiophanate-methyl, zoxamide;

B3) a compound capable to inhibit the respiration for example as CI-respiration inhibitor like diflumerimol;

as CII-respiration inhibitor like boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, furametpyr, mepronil, oxycarboxine, penthiopyrad, thiifluzamide;

as CIII-respiration inhibitor like azoxystrobin, cyazofamid, dimoxystrobin, enestrobin, famoxadone, fenamidone, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, orysastrobin, pyraclostrobin, picoxystrobin, trifloxystrobin;

B4) a compound capable of to act as an uncoupler like dinocap, fluazinam;

B5) a compound capable to inhibit ATP production like fentin acetate, fentin chloride, fentin hydroxide, silthiofam;

B6) a compound capable to inhibit AA and protein biosynthesis like andoprim, blasticidin-S, cyprodinil, kasugamycin, kasugamycin hydrochloride hydrate, mepanipyrim, pyrimethanil;

B7) a compound capable to inhibit the signal transduction like fenpiclonil, fludioxonil, quinoxyfen;

B8) a compound capable to inhibit lipid and membrane synthesis like chlozolate, iprodione, procymidone, vinclozolin, pyrazophos, edifenphos, iprobenfos (IBP), isoprothiolane, tolclofos-methyl, biphenyl, iodocarb, propamocarb, propamocarb-hydrochloride;

B9) a compound capable to inhibit ergosterol biosynthesis like fenhexamid, azaconazole, bitertanol, bromuconazole, cyproconazole, diclobutrazole, difenoconazole, diniconazole, diniconazole-M, epoxiconazole, etaconazole,

fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, furconazole, furconazole-cis, hexaconazole, imibenconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, paclobutrazol, penconazole, propiconazole, prothioconazole, simeconazole, tebuconazole, tetraconazole, triadimefon, triadimenol, triticonazole, uniconazole, voriconazole, imazalil, imazalil sulfate, oxpoconazole, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pyrifenox, triforine, pefurazoate, prochloraz, triflumizole, viniconazole, aldimorph, dodemorph, dodemorph acetate, fenpropimorph, tridemorph, fenpropidin, spiroxamine, naftifine, pyributicarb, terbinafine;

B10) a compound capable to inhibit cell wall synthesis like benthiavalicarb, bialaphos, dimethomorph, flumorph, iprovalicarb, polyoxins, polyoxorim, validamycin A;

B11) a compound capable to inhibit melanine biosynthesis like carpropamid, diclocymet, fenoxanil, phtalide, pyroquilon, tricyclazole;

B12) a compound capable to induce a host defence like acibenzolar-S-methyl, probenazole, tiadinil;

B13) a compound capable to have a multisite action like captafol, captan, chlorothalonil, copper preparations such as copper hydroxide, copper naphthenate, copper oxychloride, copper sulphate, copper oxide, oxine-copper and Bordeaux mixture, dichlofluanid, dithianon, dodine, dodine free base, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatine, guazatine acetate, iminoctadine, iminoctadine albesilate, iminoctadine triacetate, mancopper, mancozeb, maneb, metiram, metiram zinc, propineb, sulphur and sulphur preparations including calcium polysulphide, thiram, tolylfluanid, zineb, ziram;

B14) a compound selected in the following list: amibromdole, benthiazole, bethoxazin, capsimycin, carvone, chinomethionat, chloropicrin, cufraneb, cyflufenamid, cymoxanil, dazomet, debacarb, diclomezine, dichlorophen, dicloran, difenzoquat, difenzoquat methylsulphate, diphenylamine, ethaboxam, ferimzone, flumetover, flusulfamide, fosetyl-aluminium, fosetyl-calcium, fosetyl-sodium, fluopicolide, fluoroimide, hexachlorobenzene, 8-hydroxyquinoline sulfate, irumamycin, methasulphocarb, metrafenone, methyl isothiocyanate, mildiomyacin, natamycin, nickel dimethyldithiocarbamate, nitrothal-isopropyl, octhilinone, oxamocarb, oxyfenthiin, pentachlorophenol and salts, 2-phenylphenol and salts, phosphorous acid and its salts, piperalin, propanosine-sodium, proquinazid, pyrrolnitrine, quintozone, tecloftalam, tecnazene, triazoxide, trichlamide, zarilamid and 2,3,5,6-tetrachloro-4-(methylsulfonyl)-pyridine, N-(4-Chloro-2-nitrophenyl)-N-ethyl-4-methyl-benzenesulfonamide, 2-amino-4-methyl-N-phenyl-5-

thiazolecarboxamide, 2-chloro-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridinecarboxamide, 3-[5-(4-chlorophenyl)-2,3-dimethylisoxazolidin-3-yl]pyridine, cis-1-(4-chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazole-1-yl)-cycloheptanol, methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazole-5-carboxylate, 3,4,5-trichloro-2,6-pyridinedicarbonitrile, Methyl 2-[[[cyclopropyl[(4-methoxyphenyl)imino]methyl]thio]methyl]-.alpha.-(methoxymethylene)-benzeneacetate, 4-Chloro-alpha-propynyloxy-N-[2-[3-methoxy-4-(2-propynyloxy)phenyl]ethyl]-benzeneacetamide, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propynyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamide, 5-chloro-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine, 5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-N-[(1R)-1,2,2-trimethylpropyl][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine, 5-chloro-N-[(1R)-1,2-dimethylpropyl]-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine, N-[1-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)ethyl]-2,4-dichloronicotinamide, N-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)methyl-2,4-dichloronicotinamide, 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyranon-4-one, N-[(Z)-[(cyclopropylmethoxy)imino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methyl]-2-phenylacetamide, N-(3-ethyl-3,5,5-trimethyl-cyclohexyl)-3-formylamino-2-hydroxy-benzamide, 2-[[[1-[3(1Fluoro-2-phenylethyl)oxy]phenyl]ethylidene]amino]oxy]methyl]-alpha-(methoxyimino)-N-methyl-alphaE-benzeneacetamide, N-{2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl]ethyl}-2-(trifluoromethyl)benzamide, N-(3',4'-dichloro-5-fluorobiphenyl-2-yl)-3-(difluoromethyl)-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, 2-(2-{[6-(3-chloro-2-methylphenoxy)-5-fluoropyrimidin-4-yl]oxy}phenyl)-2-(methoxyimino)-N-methylacetamide, 1-[(4-methoxyphenoxy)methyl]-2,2-dimethylpropyl-1H-imidazole-1-carboxylic acid, O-[1-[(4-methoxyphenoxy)methyl]-2,2-dimethylpropyl]-1H-imidazole-1-carbothioic acid.

The composition according to the invention comprising a mixture of a compound of formula (I) with a bactericide compound may also be particularly advantageous. Examples of suitable bactericide mixing partners may be selected in the following list : bronopol, dichlorophen, nitrapyrin, nickel dimethyldithiocarbamate, kasugamycin, octhilinone, furancarboxylic acid, oxytetracycline, probenazole, streptomycin, tecloftalam, copper sulphate and other copper preparations.

47

The fungicidal compositions of the present invention can be used to curatively or preventively control the phytopathogenic fungi of crops. Thus, according to a further aspect of the present invention, there is provided a method for curatively or preventively controlling the phytopathogenic fungi of crops characterised in that a fungicidal composition as hereinbefore defined is applied to the seed, the plant and/or to the fruit of the plant or to the soil in which the plant is growing or in which it is desired to grow.

The composition as used against phytopathogenic fungi of crops comprises an effective and non-phytotoxic amount of an active material of general formula (I).

The expression "effective and non-phytotoxic amount" means an amount of composition according to the invention which is sufficient to control or destroy the fungi present or liable to appear on the crops, and which does not entail any appreciable symptom of phytotoxicity for the said crops. Such an amount can vary within a wide range depending on the fungus to be controlled, the type of crop, the climatic conditions and the compounds included in the fungicidal composition according to the invention.

This amount can be determined by systematic field trials, which are within the capabilities of a person skilled in the art.

The method of treatment according to the present invention is useful to treat propagation material such as tubers or rhizomes, but also seeds, seedlings or seedlings pricking out and plants or plants pricking out. This method of treatment can also be useful to treat roots. The method of treatment according to the present invention can also be useful to treat the overground parts of the plant such as trunks, stems or stalks, leaves, flowers and fruits of the concerned plant.

Among the plants that can be protected by the method according to the present invention, mention may be made of cotton; flax; vine; fruit or vegetable crops such as *Rosaceae* sp. (for instance pip fruit such as apples and pears, but also stone fruit such as apricots, almonds and peaches), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (for instance banana trees and plantains), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (for instance lemons, oranges and grapefruit); *Solanaceae* sp. (for instance tomatoes), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (for instance lettuces), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (for instance peas), *Rosaceae* sp. (for instance strawberries); major crops such as *Graminae* sp. (for instance maize, lawn or cereals such as wheat, rice, barley and triticales), *Asteraceae* sp. (for instance sunflower), *Cruciferae* sp. (for instance colza), *Fabaceae* sp. (for

instance peanuts), *Papilionaceae sp.* (for instance soybean), *Solanaceae sp.* (for instance potatoes), *Chenopodiaceae sp.* (for instance beetroots); horticultural and forest crops; as well as genetically modified homologues of these crops.

Among the diseases of plants or crops that can be controlled by the method
5 according to the present invention, mention may be made of :

Powdery mildew diseases such as :

- Blumeria diseases, caused for example by *Blumeria graminis*;
- Podosphaera diseases, caused for example by *Podosphaera leucotricha*;
- Sphaerotheca diseases, caused for example by *Sphaerotheca fuliginea*;
- 10 Uncinula diseases, caused for example by *Uncinula necator*;

Rust diseases such as :

- Gymnosporangium diseases, caused for example by *Gymnosporangium sabinae*;
- Hemileia diseases, caused for example by *Hemileia vastatrix*;
- 15 Phakopsora diseases, caused for example by *Phakopsora pachyrhizi* or *Phakopsora meibomiae*;
- Puccinia diseases, caused for example by *Puccinia recondita*;
- Uromyces diseases, caused for example by *Uromyces appendiculatus*;

Oomycete diseases such as :

- 20 Bremia diseases, caused for example by *Bremia lactucae*;
- Peronospora diseases, caused for example by *Peronospora pisi* or *P. brassicae*;
- Phytophthora diseases, caused for example by *Phytophthora infestans*;
- Plasmopara diseases, caused for example by *Plasmopara viticola*;
- Pseudoperonospora diseases, caused for example by *Pseudoperonospora*
25 *humuli* or *Pseudoperonospora cubensis*;
- Pythium diseases, caused for example by *Pythium ultimum*;

Leafspot, leaf blotch and leaf blight diseases such as :

- Alternaria diseases, caused for example by *Alternaria solani*;
- Cercospora diseases, caused for example by *Cercospora beticola*;
- 30 Cladosporium diseases, caused for example by *Cladosporium cucumerinum*;
- Cochliobolus diseases, caused for example by *Cochliobolus sativus*;
- Colletotrichum diseases, caused for example by *Colletotrichum lindemuthianum*;
- Cycloconium diseases, caused for example by *Cycloconium oleaginum*;
- 35 Diaporthe diseases, caused for example by *Diaporthe citri*;
- Elsinoe diseases, caused for example by *Elsinoe fawcettii*;

- Gloeosporium diseases, caused for example by *Gloeosporium laeticolor*;
 Glomerella diseases, caused for example by *Glomerella cingulata*;
 Guignardia diseases, caused for example by *Guignardia bidwelli*;
 Leptosphaeria diseases, caused for example by *Leptosphaeria maculans*;
 5 *Leptosphaeria nodorum*;
 Magnaporthe diseases, caused for example by *Magnaporthe grisea*;
 Mycosphaerella diseases, caused for example by *Mycosphaerella graminicola*;
Mycosphaerella arachidicola; *Mycosphaerella fijiensis*;
 Phaeosphaeria diseases, caused for example by *Phaeosphaeria nodorum*;
 10 Pyrenophora diseases, caused for example by *Pyrenophora teres*;
 Ramularia diseases, caused for example by *Ramularia collo-cygni*;
 Rhynchosporium diseases, caused for example by *Rhynchosporium secalis*;
 Septoria diseases, caused for example by *Septoria apii* or *Septoria lycopersici*;
 Typhula diseases, caused for example by *Typhula incarnata*;
 15 Venturia diseases, caused for example by *Venturia inaequalis*;
- Root and stem diseases such as :
- Corticium diseases, caused for example by *Corticium graminearum*;
 Fusarium diseases, caused for example by *Fusarium oxysporum*;
 Gaeumannomyces diseases, caused for example by *Gaeumannomyces*
 20 *graminis*;
 Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani*;
 Tapesia diseases, caused for example by *Tapesia acuformis*;
 Thielaviopsis diseases, caused for example by *Thielaviopsis basicola*;
- Ear and panicle diseases such as :
- 25 Alternaria diseases, caused for example by *Alternaria spp.*;
 Aspergillus diseases, caused for example by *Aspergillus flavus*;
 Cladosporium diseases, caused for example by *Cladosporium spp.*;
 Claviceps diseases, caused for example by *Claviceps purpurea*;
 Fusarium diseases, caused for example by *Fusarium culmorum*;
 30 Gibberella diseases, caused for example by *Gibberella zeae*;
 Monographella diseases, caused for example by *Monographella nivalis*;
- Smut and bunt diseases such as :
- Sphacelotheca diseases, caused for example by *Sphacelotheca reiliana*;
 Tilletia diseases, caused for example by *Tilletia caries*;
 35 Urocystis diseases, caused for example by *Urocystis occulta*;
 Ustilago diseases, caused for example by *Ustilago nuda*;

Fruit rot and mould diseases such as :

Aspergillus diseases, caused for example by *Aspergillus flavus*;

Botrytis diseases, caused for example by *Botrytis cinerea*;

Penicillium diseases, caused for example by *Penicillium expansum*;

5 Sclerotinia diseases, caused for example by *Sclerotinia sclerotiorum*;

Verticillium diseases, caused for example by *Verticillium albo-atrum*;

Seed and soilborne decay, mould, wilt, rot and damping-off diseases :

Fusarium diseases, caused for example by *Fusarium culmorum*;

Phytophthora diseases, caused for example by *Phytophthora cactorum*;

10 Pythium diseases, caused for example by *Pythium ultimum*;

Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani*;

Sclerotium diseases, caused for example by *Sclerotium rolfsii*;

Microdochium diseases, caused for example by *Microdochium nivale*;

Canker, broom and dieback diseases such as :

15 Nectria diseases, caused for example by *Nectria galligena*;

Blight diseases such as :

Monilinia diseases, caused for example by *Monilinia laxa*;

Leaf blister or leaf curl diseases such as :

Taphrina diseases, caused for example by *Taphrina deformans*;

20 Decline diseases of wooden plants such as :

Esca diseases, caused for example by *Phaemoniella clamydospora*;

Diseases of flowers and Seeds such as :

Botrytis diseases, caused for example by *Botrytis cinerea*;

Diseases of tubers such as :

25 Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani*.

The fungicide composition according to the present invention may also be used against fungal diseases liable to grow on or inside timber. The term "timber" means all types of species of wood, and all types of working of this wood intended for construction, for example solid wood, high-density wood, laminated wood, and plywood. The method for treating timber according to the invention mainly consists in contacting one or more compounds of the present invention, or a composition according to the invention; this includes for example direct application, spraying, dipping, injection or any other suitable means.

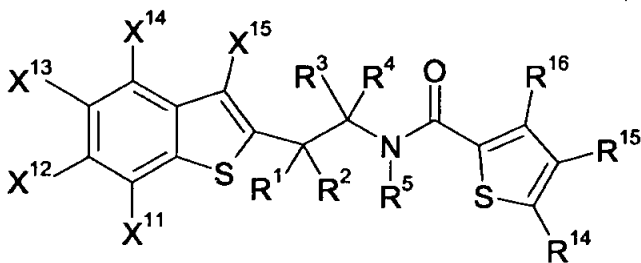
5 The dose of active material usually applied in the treatment according to the present invention is generally and advantageously between 10 and 800 g/ha, preferably between 50 and 300 g/ha for applications in foliar treatment. The dose of active substance applied is generally and advantageously between 2 and 200 g per 100 kg of seed, preferably between 3 and 150 g per 100 kg of seed in the case of seed treatment. It is clearly understood that the doses indicated above are given as illustrative examples of the invention. A person skilled in the art will know how to adapt the application doses according to the nature of the crop to be treated.

10 The fungicidal composition according to the present invention may also be used in the treatment of genetically modified organisms with the compounds according to the invention or the agrochemical compositions according to the invention. Genetically modified plants are plants into whose genome a heterologous gene encoding a protein of interest has been stably integrated. The expression
15 "heterologous gene encoding a protein of interest" essentially means genes which give the transformed plant new agronomic properties, or genes for improving the agronomic quality of the transformed plant.

20 The compositions according to the present invention may also be used for the preparation of composition useful to curatively or preventively treat human and animal fungal diseases such as, for example, mycoses, dermatoses, trichophyton diseases and candidiases or diseases caused by *Aspergillus spp.*, for example *Aspergillus fumigatus*.

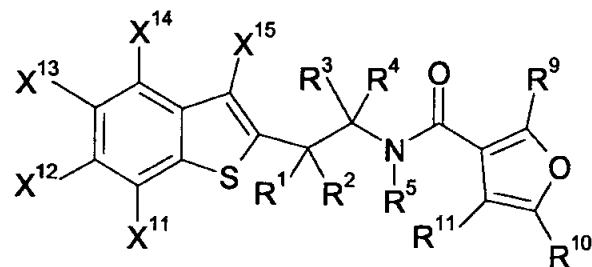
25 The aspects of the present invention will now be illustrated with reference to the following tables of compounds and examples. The following Table illustrates in a non-limiting manner examples of fungicidal compounds according to the present invention. In the following Examples, M+1 (or M-1) means the molecular ion peak, plus or minus 1 a.m.u. (atomic mass units) respectively, as observed in mass
30 spectroscopy and M (ApCI+) means the molecular ion peak as it was found via positive atmospheric pressure chemical ionisation in mass spectroscopy.

Table A



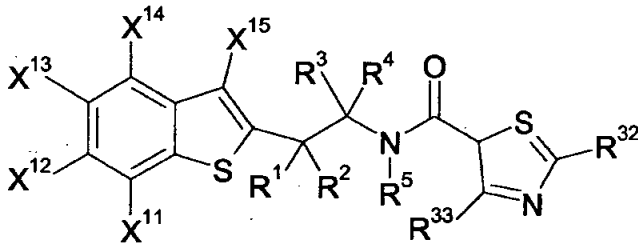
Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
A-1	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	Cl	H	CH ₃	414
A-2	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	Cl	H	CH ₃	462
A-3	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	316
A-4	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	CH ₃	380
A-5	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	CH ₃	428

Table B

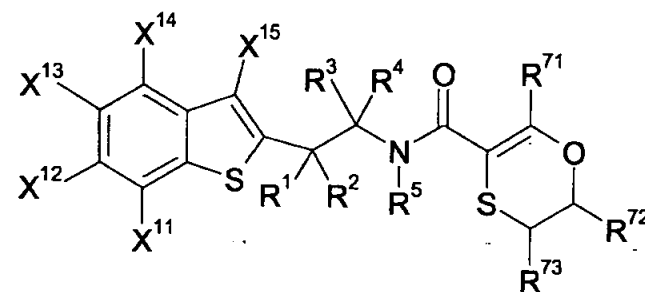


Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
B-1	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	Cl	H	CH ₃	348
B-2	H	H	H	H	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	Cl	H	CH ₃	402
B-3	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	446
B-4	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	300
B-5	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	314
B-6	H	H	H	H	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	368
B-7	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	CH ₃	412

Table C

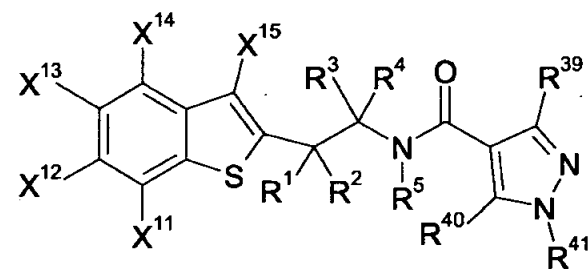


Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³²	R ³³	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
C-1	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	Cl	H	CH ₃	419
C-2	H	H	H	H	H	CH ₃	CHF ₂	H	H	Cl	H	CH ₃	401
C-3	H	H	H	H	H	CH ₃	CHF ₂	H	H	H	H	CH ₃	367

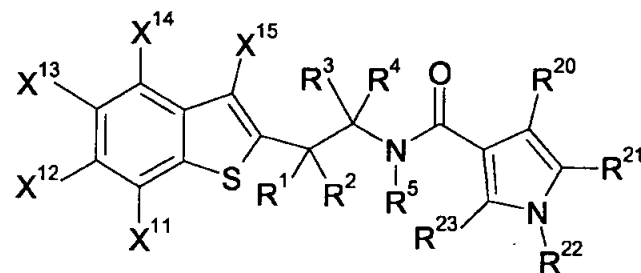
Table D

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁷¹	R ⁷²	R ⁷³	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
D-1	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	368
D-2	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	422
D-3	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	334
D-4	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	368

Table E

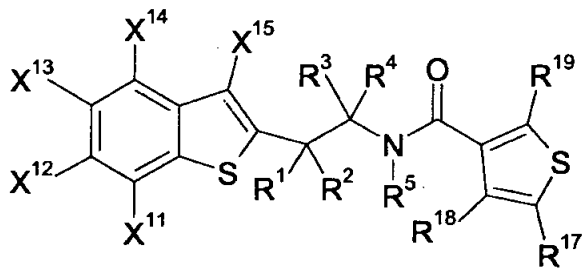


Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³⁹	R ⁴⁰	R ⁴¹	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
E-1	H	H	H	H	H	CH ₃	F	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	332
E-2	H	H	H	H	H	CH ₃	F	CH ₃	H	H	Cl	H	CH ₃	366
E-3	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	Cl	H	CH ₃	402
E-4	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	Cl	H	CH ₃	384
E-5	H	H	H	H	H	CH ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	368
E-6	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	350

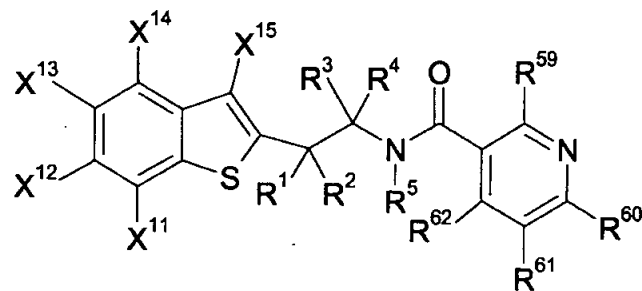
Table F

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ²⁰	R ²¹	R ²²	R ²³	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
F-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	Cl	H	CH ₃	401
F-2	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	367

Table G

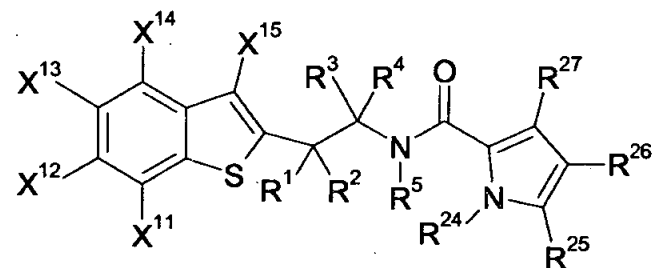


Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
G-1	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	Cl	H	CH ₃	462
G-2	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	CH ₃	428

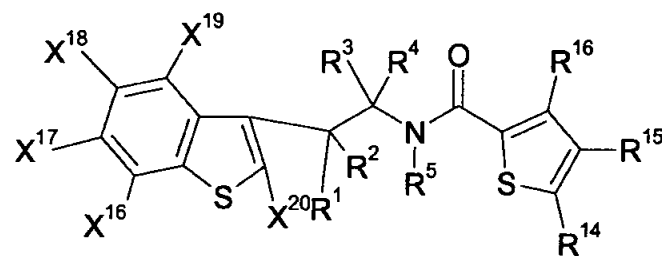
Table H

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁵⁹	R ⁶⁰	R ⁶¹	R ⁶²	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
H-1	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	331
H-2	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	365

Table I

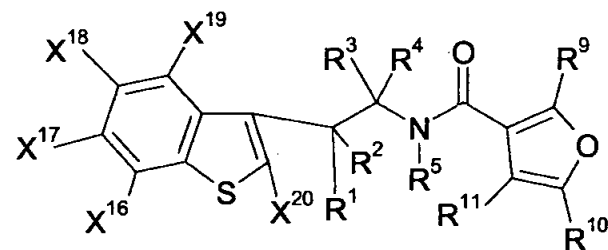


Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ²⁴	R ²⁵	R ²⁶	R ²⁷	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
I-1	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	I	H	H	H	H	CH ₃	425

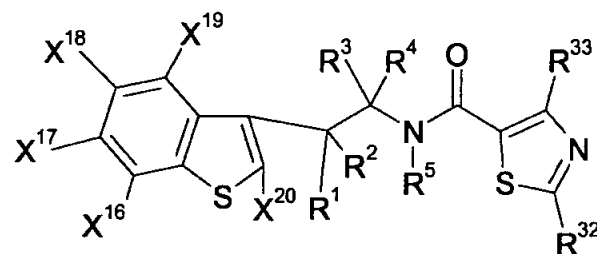
Table J

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶	X ¹⁶	X ¹⁷	X ¹⁸	X ¹⁹	X ²⁰	M+1
J-1	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	Cl	H	H	448
J-2	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	414

Table K

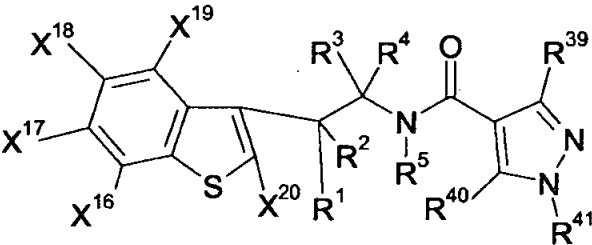


Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁰	R ¹⁰	R ¹¹	X ¹⁶	X ¹⁷	X ¹⁸	X ¹⁹	X ²⁰	M+1
K-1	H	H	H	H	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	Cl	H	H	388

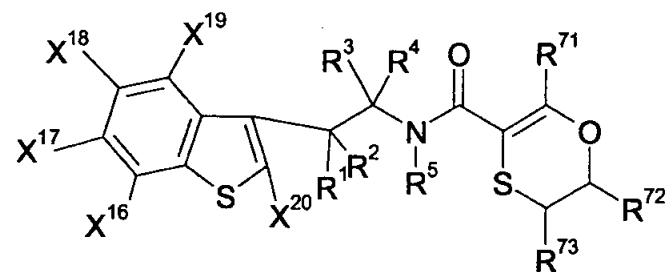
Table L

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³²	R ³³	X ¹⁶	X ¹⁷	X ¹⁸	X ¹⁹	X ²⁰	M+1
L-1	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	Cl	H	H	405
L-2	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	H	H	H	371

Table M

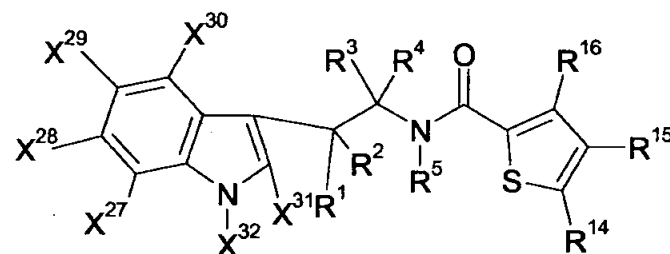


Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³⁹	R ⁴⁰	R ⁴¹	X ¹⁶	X ¹⁷	X ¹⁸	X ¹⁹	X ²⁰	M+1
M-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	Cl	H	H	388
M-2	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	Cl	H	H	370

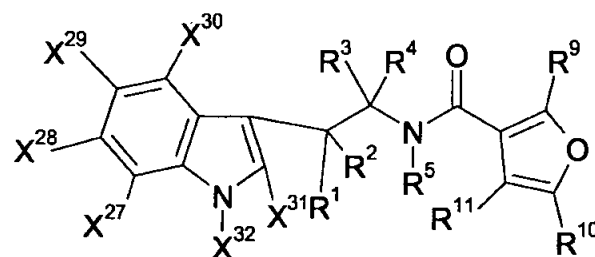
Table N

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁷¹	R ⁷²	R ⁷³	X ¹⁶	X ¹⁷	X ¹⁸	X ¹⁹	X ²⁰	M+1
N-1	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	Cl	H	H	354

Table O

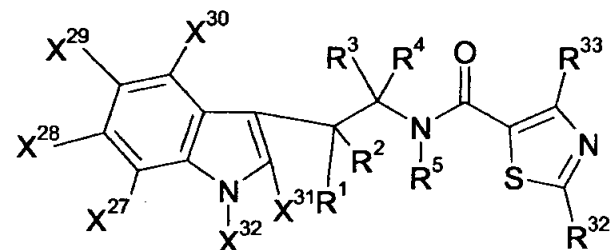


Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³ 0	X ³¹	X ³²	M+1
O-1	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	CH ₃	H	363
O-2	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	CH ₃	H	411
O-3	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	H	299
O-4	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	OH	H	H	H	301
O-5	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	OMe	H	H	H	379
O-6	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	Br	H	H	H	427
O-7	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	CH ₃	411
O-8	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	OMe	H	H	CH ₃	441

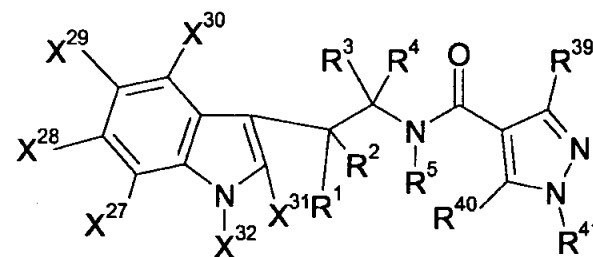
Table P

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
P-1	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	283
P-2	H	H	H	H	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	H	351
P-3	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	H	297
P-4	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	395
P-5	H	H	H	H	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	Br	H	H	H	415
P-6	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	Br	H	H	H	361
P-7	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	Br	H	H	H	459
P-8	H	H	H	H	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	351

Table Q

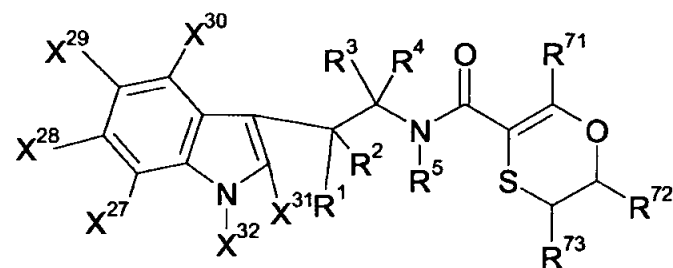


Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³²	R ³³	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
Q-1	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	H	H	CH ₃	H	368
Q-2	H	H	H	H	H	CH ₃	CHF ₂	H	H	H	H	CH ₃	H	350
Q-3	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	OMe	H	H	H	384
Q-4	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	Br	H	H	H	432
Q-5	H	H	H	H	H	CH ₃	CHF ₂	H	H	Br	H	H	H	414
Q-6	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	368
Q-7	H	H	H	H	H	CH ₃	CHF ₂	H	H	H	H	H	CH ₃	350

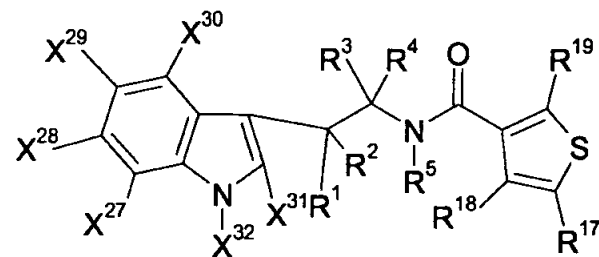
Table R

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³⁹	R ⁴⁰	R ⁴¹	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
R-1	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	OH	H	H	H	335
R-2	H	H	H	H	H	CH ₃	F	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	H	315
R-3	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	H	351
R-4	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	H	333
R-5	H	H	H	H	H	CH ₃	F	CH ₃	H	H	Br	H	H	H	379
R-6	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	Br	H	H	H	415
R-7	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	Br	H	H	H	397
R-8	H	H	H	H	H	CH ₃	F	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	315
R-9	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	351
R-10	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	333
R-11	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	OMe	H	H	CH ₃	381

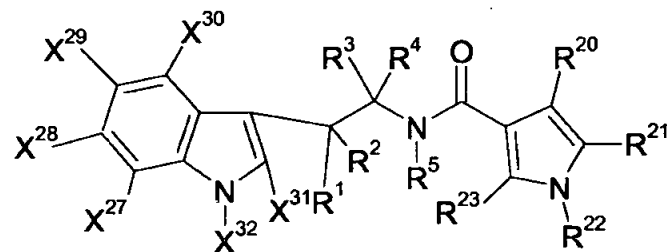
Table S



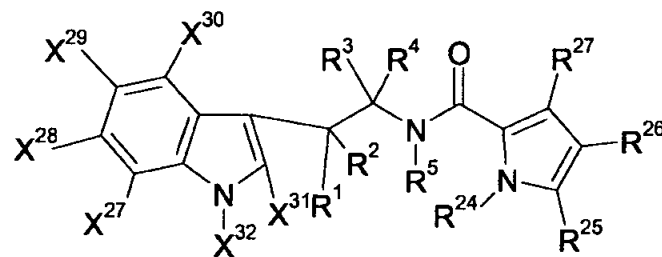
Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁷¹	R ⁷²	R ⁷³	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
S-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	371
S-2	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	317
S-3	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	OH	H	H	H	373
S-4	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	OMe	H	H	H	387
S-5	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	Br	H	H	H	381
S-6	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	Br	H	H	H	435
S-7	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	317
S-8	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	371

Table T

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
T-1	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	CH ₃	H	411
T-2	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	Br	H	H	H	475

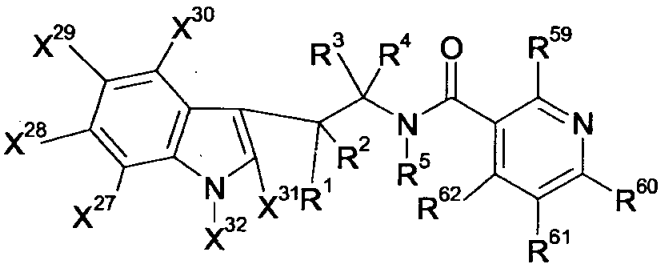
Table U

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ²⁰	R ²¹	R ²²	R ²³	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
U-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	H	350
U-2	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	Br	H	H	H	414
U-3	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	350

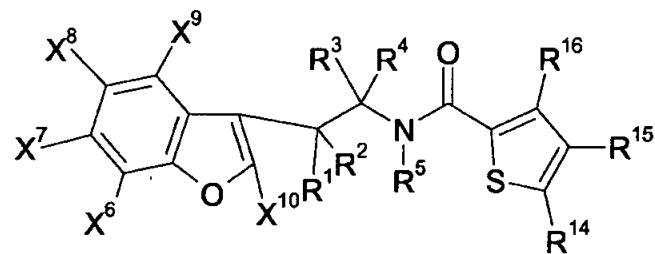
Table V

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ²⁴	R ²⁵	R ²⁶	R ²⁷	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
V-1	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	I	H	H	H	H	CH ₃	H	408

Table W

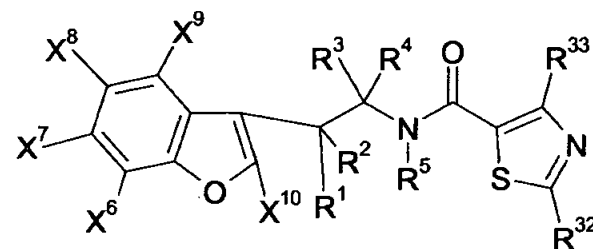


Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁵⁹	R ⁶⁰	R ⁶¹	R ⁶²	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
W-1	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	MeO	H	H	H	330
W-2	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	316
W-3	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	378
W-4	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	H	H	H	H	Br	H	H	H	392

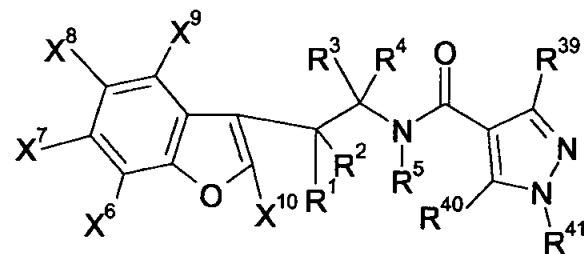
Table X

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶	R ³	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹	X ¹⁰	M+1
X-1	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	398

Table Y

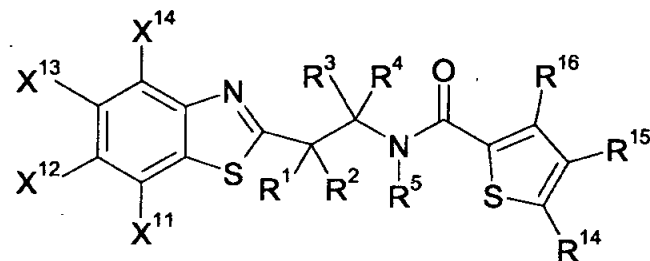


Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³²	R ³³	R ³	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹	X ¹⁰	M+1
Y-1	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	H	H	H	H	355

Table Z

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³⁹	R ⁴⁰	R ⁴¹	R ³	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹	X ¹⁰	M+1
Z-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	338

Table AA

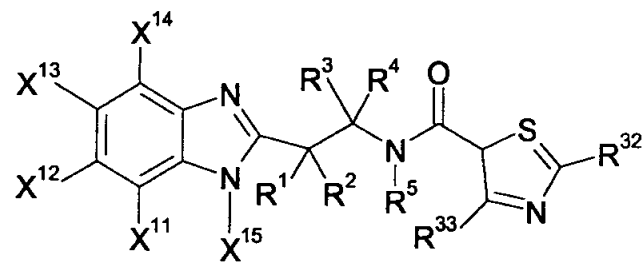


Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	M+1
AA-1	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	415

WO 2007/006739

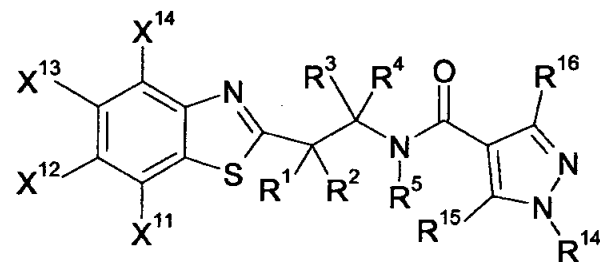
PCT/EP2006/063992

70

Table AB

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³²	R ³³	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
AB-1	Me	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	H	H	CH ₃	383

Table AC



Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	M+1
AC-1	H	H	H	H	H	Me	H	CF ₃	H	H	H	H	355

WO 2007/006739

PCT/EP2006/063992

30

Examples of process for the preparation of the compound of general formula (I)

5 Synthesis of *N*-[2-(1-benzothien-3-yl)ethyl]-3-iodothiophene-2-carboxamide (Compound J-2)

Preparation of *tert*-butyl [2-(1-benzothien-3-yl)ethyl]carbamate

To a stirred solution of (1-benzothien-3-yl)acetonitrile (3.00 g, 17.3 mmol), Nickel
10 (II) chloride hexahydrate (4.11 g, 17.3 mmol), and di-*tert*-butyl dicarbonate (7.55 g, 34.6 mmol) in methanol (150 mL) under a inert atmosphere of nitrogen was added sodium borohydride (3.20 g, 84.2 mmol) in portions over a period of 10 min, maintaining the temperature below 45 °C. The reaction mixture was stirred for 16 h and diluted with ethyl acetate (300 mL) and water (500 mL) was carefully added.
15 The mixture was filtered through *kieselghur* and ethylacetate was added (200 mL). The organic layer was dried (MgSO₄), filtered and concentrated *in vacuo* to afford an oil. Purification by flash chromatography using a 4:1 mixture of Heptane:Ethyl acetate afforded 2.07 g (43%) of *tert*-butyl [2-(1-benzothien-3-yl)ethyl]carbamate.

20

¹HNMR (250MHz, CDCl₃): δ 7.73 - 7.63 (1H, m), 7.61 - 7.55 (1H, m); 7.29 - 7.14 (2H, m); 7.0 (1H, s); 4.5 - 4.34 (N-H, b); 3.4 - 3.24 (2H, m); 2.94 - 2.80 (2H, m); 1.24 (9H, s).

25 *N*-[2-(1-benzothien-3-yl)ethyl]-3-iodothiophene-2-carboxamide (Compound J-2)

A stirred solution of *tert*-butyl [2-(5-chloro-1-benzothien-3-yl)ethyl]carbamate (0.16 g, 0.56 mmol) in dichloromethane (5 mL) was treated with trifluoroacetic acid (0.63 g, 5.60 mmol) and the reaction mixture was stirred at RT for 24 h. A saturated
30 aqueous solution of sodium bicarbonate was carefully added until effervescence stopped. The organic layer was dried (MgSO₄), filtered and concentrated *in vacuo* to afford 0.1 g of 2-(1-benzothien-3-yl) ethanamine.

82

A mixture of 2-(1-benzothien-3-yl)ethanamine (100 mg, 0.56 mmol) and triethylamine (57.0 mg, 0.56 mmol) in THF (5 mL) was treated with 3-iodothiophene-2-carbonyl chloride (154 mg, 0.56 mmol) and the mixture was heated at reflux for 3 h. After cooling to RT, the mixture was poured into water (15 mL) and taken up in ethyl acetate (15 mL). The organic layer was dried (MgSO₄), filtered and concentrated *in vacuo*. Purification of the residue by flash chromatography using a 4:1 mixture of Heptane:Ethyl acetate afforded 120 mg (49%) of *N*-[2-(1-benzothien-3-yl)ethyl]-3-iodothiophene-2-carboxamide (Compound J-2).

10

Mass Spectrum : [M+1] = 414 .

Examples of biological activity of the compound of general formula (I)

Example A : *in vivo* test on *Alternaria brassicae* (Leaf spot of crucifers)

5 The active ingredient tested is prepared by potter homogenisation in a concentrated suspension type formulation at 100 g/l. This suspension is then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

10 Radish plants (Pernot variety) in starter cups, sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate and grown at 18-20°C, are treated at the cotyledon stage by spraying with the aqueous suspension described above.

Plants, used as controls, are treated with an aqueous solution not containing the active material.

15 After 24 hours, the plants are contaminated by spraying them with an aqueous suspension of *Alternaria brassicae* spores (40,000 spores per cm³). The spores are collected from a 12 to 13 days-old culture.

The contaminated radish plants are incubated for 6-7 days at about 18°C, under a humid atmosphere.

20 Grading is carried out 6 to 7 days after the contamination, in comparison with the control plants.

Under these conditions, good (at least 50%) or total protection is observed at a dose of 500 ppm with the following compounds E1, E2, K1, M2, P7, Q5, R6, S5, S6, T2, AA 1 and AC1 and at a dose of 250 ppm with the following compounds: A5, B1, B2, B7, C1 and H2.

Example B : *in vivo* test on *Botrytis cinerea* (cucumber Grey mould)

30 The active ingredient tested is prepared by potter homogenisation in a concentrated suspension type formulation at 100 g/l. This suspension is then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

Cucumber plants (Marketer variety) in starter cups, sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate and grown at 18- 20°C, are treated at the cotyledon Z11 stage by spraying with the aqueous suspension described above. Plants, used as controls, are treated with an aqueous solution not containing the active material.

35 After 24 hours, the plants are contaminated by depositing drops of an aqueous suspension of *Botrytis cinerea* spores (150,000 spores per ml) on upper surface of the

leaves. The spores are collected from a 15-day-old culture and are suspended in a nutrient solution composed of :

- 20 g/L of gelatin
- 50 g/L of cane sugar
- 5 - 2 g/L of NH_4NO_3
- 1 g/L of KH_2PO_4

The contaminated cucumber plants are settled for 5/7 days in a climatic room at 15-11°C (day/night) and at 80% relative humidity.

- 10 Grading is carried out 5/7 days after the contamination, in comparison with the control plants. Under these conditions, good (at least 50%) or total protection is observed at a dose of 500 ppm with the following compounds: E1, E2, E3, E4, C2, F1, G2, H1, and S3.

15 **Example C : *in vivo* test on *Pyrenophora teres* (Barley Net blotch)**

The active ingredient tested is prepared by potter homogenisation in a concentrated suspension type formulation at 100 g/l. This suspension is then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

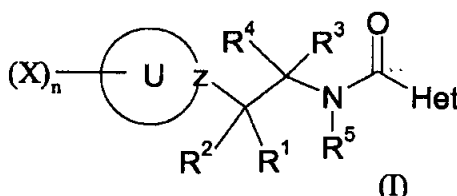
- 20 Barley plants (Express variety) in starter cups, sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate and grown at 12°C, are treated at the 1-leaf stage (10 cm tall) by spraying with the aqueous suspension described above. Plants, used as controls, are treated with an aqueous solution not containing the active material.

- 25 After 24 hours, the plants are contaminated by spraying them with an aqueous suspension of *Pyrenophora teres* spores (12,000 spores per ml). The spores are collected from a 12-day-old culture. The contaminated barley plants are incubated for 24 hours at about 20°C and at 100% relative humidity, and then for 12 days at 80% relative humidity.

- 30 Grading is carried out 12 days after the contamination, in comparison with the control plants. Under these conditions, good (at least 50%) or total protection is observed at a dose of 500 ppm with the following compounds: A1, A2, B3, C2, D1, D2, E1, E2, E3, E4, F1, G1, G2, H1, K1, M2, P5, X1, Y1, Z1 and AB1; at a dose of 330 ppm with the following compounds: P4, R1 and U1, and at a dose of 250 ppm with the following compounds: A5, B1, B2, B7, C1 and H2.

CLAIMS

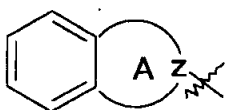
1. A compound of general formula (I)



in which :

- n is 0, 1, 2, 3, 4, 5 or 6;

- U is :



wherein A represents a 5- or 6-membered heterocycle with one, two or three heteroatoms which may be the same or different; fused with a phenyl ring.

- Z is a carbon atom or a heteroatom which can not be substituted by X;

- X is the same or different and is a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro- λ^6 -sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carboxy group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a C₁-C₈-alkyl, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₁-C₈-alkylamino, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a di-C₁-C₈-alkylamino, a C₁-C₈-alkoxy, a C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulfanyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulfanyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyloxy, a C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₈-alkynyloxy, a C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₈-cycloalkyl, a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyloxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyl-C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonylamino, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a di-C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy,

a C₁-C₈-alkyloxycarbonyloxy, a C₁-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphinyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkoxyimino, a
 5 (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkenyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkynyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a benzyloxy, a benzylsulfanyl, a benzylamino, a phenoxy, a phenylsulfanyl a phenyl or a phenylamino;

- R¹ and R² are the same or different and are a hydrogen atom, a cyano group,
 10 a formyl group, a carboxy group, a carbamoyl group, a (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a C₁-C₈-alkyl, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₃-C₈-cycloalkyl, a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl or a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl
 15 having 1 to 5 halogen atoms;

- R³ and R⁴ are the same or different and are a hydrogen atom, a hydrogen atom, a formyl group, a (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a C₁-C₈-alkyl, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₃-C₈-cycloalkyl, a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1
 20 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

- R⁵ is a hydrogen atom, a C₁-C₆-alkyl, or a C₃-C₇-cycloalkyl;

- Het represents 5- or 6-membered non-fused heterocycle with one, two or three heteroatoms which may be the same or different; Het being linked by a carbon
 25 atom and being at least substituted in ortho position;

as well as its salts, N-oxydes, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active isomers.

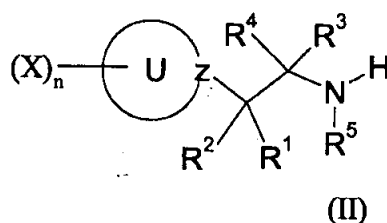
2. A compound according to claim 1, characterized in that n is 0, 1 or 2.
 30

3. A compound according to claim 1 or 2, characterized in that X is chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkyl, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl or a C₁-C₄-halogenoalkyl
 35 having 1 to 5 halogen atoms.

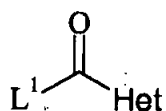
4. A compound according to any of the claims 1 to 3, characterized in that R¹ and R²

are chosen, independently of each other, as being a hydrogen atom, a C₁-C₈-alkyl, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₃-C₈-cycloalkyl, a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

- 5 5. A compound according to any of the claims 1 to 4, characterized in that R³ and R⁴ are chosen, independently of each other, as being a hydrogen atom, a C₁-C₈-alkyl, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₃-C₈-cycloalkyl, a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.
- 10 6. A compound according to any of the claims 1 to 5, characterized in that Het is chosen as being 2-furan, 3-furan, 4,5-dihydro-3-furan, 2-thiophene, 3-thiophene, 2-pyrrole, 3-pyrrole, 5-oxazole, 4-oxazole, 5-thiazole, 4-thiazole, 5-pyrazole, 4-pyrazole, 3-pyrazole, 3-isoxazole, 4-isoxazole, 5-isoxazole, 3-isothiazole, 4-1,2,3-triazole, 4-thiadiazole, 5-thiadiazole, 2-pyridine, 3-pyridine, 4-pyridine, 2-oxathiine, 15 4,5dihydro-3-pyran, 4,5dihydro-2-thiopyran, 4,5dihydro-3-thiopyran or 2-pyrazine.
7. A compound according to any of the claims 1 to 6, characterized in that U is chosen as being a 2-benzothiophene, a 3-benzothiophene, a 1-indole, a 2-indole, a 3-indole, a 2-benzofuran, a 3-benzofuran, a 2-benzoxazole, a 2-benzothiazole, a 1-benzimidazole, a 2-benzimidazole, a 3-benz-1,2-isoxazole, a 3-benz-2,1-isoxazole, a 3-benz-1,2-isothiazole, a 3-benz-2,1-isothiazole, a 1-benzopyrazole, a 2-benzopyrazole, a 3-benzopyrazole, a 2-quinoline, a 3-quinoline, a 4-quinoline, a 1-isoquinoline, a 3-isoquinoline, a 4-isoquinoline.
- 20 8. A process for the preparation of a compound of general formula (I) as defined in any of the claims 1 to 7, which comprises reacting a benzoheterocyclylethylamine derivative of general formula (II) or one of its salt :



- 30 in which U, X, n, Z, R¹, R², R³, R⁴ and R⁵ are as defined in any of the claims 1 to 7;
with a carboxylic acid derivative of the general formula (III)



(III)

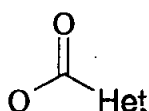
5

in which :

-Het is as defined in claim 1 or claim 6;

- L¹ is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, -OR⁶, -OCOR⁶, R⁶ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl, pentafluorophenyl or a group of formula

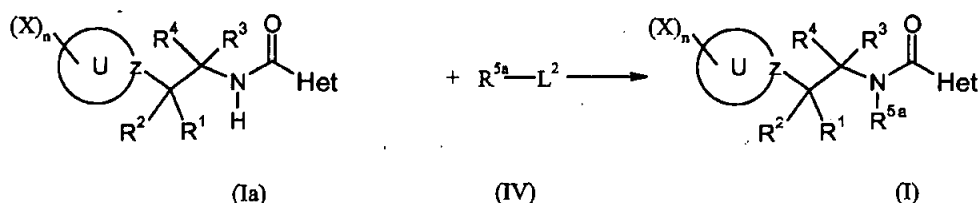
10



in the presence of a catalyst and, if L¹ is a hydroxyl group, in the presence of a condensing agent.

15

9. A process according to claim 8, characterized in that R⁵ is a hydrogen atom, and that the process is completed by a further step according to the following reaction scheme :



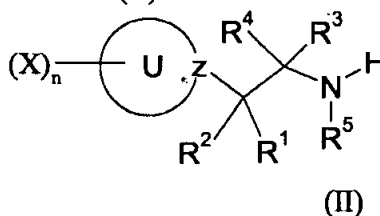
20

in which :
 - U, X, n, Z, R¹, R², R³, R⁴ and Het are as defined in claim 8;
 - R^{5a} is a C₁-C₆-alkyl, or a C₃-C₇-cycloalkyl;
 - L² is a leaving group chosen as being a halogen atom, a 4-methyl phenylsulfonyloxy or a methylsulfonyloxy;

25

comprising the reaction of a compound of general formula (Ia) with a compound of general formula (IV) to provide a compound of general formula (I).

10. A compound of general formula (II)



in which U, X, n, Z, R¹, R², R³, R⁴ and R⁵ are as defined in any of the claims 1, 2, 3, 4, 5 or 7.

5

11. Fungicide composition comprising an effective amount of a compound according to any of the claims 1 to 7 and an agricultural acceptable support.

10 12. Method for preventively or curatively combating the phytopathogenic fungi of crops, characterized in that an effective and non-phytotoxic amount of a composition according to claim 11 is applied to the plant seeds or to the plant leaves and/or to the fruits of the plants or to the soil in which the plants are growing or in which it is desired to grow them.

(12) SOLICITUD INTERNACIONAL PUBLICADA BAJO EL TRATADO DE COOPERACIÓN EN
MATERIA DE PATENTES (PCT)

(19) Organización Mundial de la Propiedad
Intelectual
Oficina Internacional



(43) Fecha de publicación internacional
18 Enero 2007 (18.01.2007)

(10) Número de publicación
internacional
WO 2007/006739 A1

- (51) Clasificación Internacional de Patentes⁷:
- | | |
|-----------------------|----------------------|
| C07D 333/38 (2006.01) | A01N 43/12 (2006.01) |
| C07D 409/12 (2006.01) | A01N 43/78 (2006.01) |
| C07D 417/12 (2006.01) | A01N 43/32 (2006.01) |
| C07D 411/12 (2006.01) | A01N 43/56 (2006.01) |
| C07D 405/12 (2006.01) | A01N 43/36 (2006.01) |
| C07D 403/12 (2006.01) | A01N 43/40 (2006.01) |
| C07D 401/12 (2006.01) | A01N 43/38 (2006.01) |

(21) Número de solicitud internacional:
PCT/EP2006/063992

(22) Fecha de presentación internacional:
6 Julio 2006 (06.07.2006)

(25) Idioma de la presentación:
Inglés

(26) Idioma de la publicación:
Inglés

(30) Datos de prioridad:
05356116.3 12 Julio 2005 (12.07.2005) EP

(71) Solicitante (para todos los Estados designados excepto EE.UU.): BAYER CROPSCIENCE SA [FR/FR]; 16 Rue Jean-Marie Leclair, F-69009 Lyon (FR).

(72) Inventores; e

(75) Inventores/Solicitantes (solamente para EE.UU.): MANSFIELD, Darren [GB/DE]; Graf-Adolf Strasse 7, 51429 Bergisch Gladbach (DE). COQUERON, Pierre-Yves [FR/FR]; 56 Cours De La Liberté, F-69003 Lyon (FR). RIECK, Heiko [DE/FR]; 29 Allée Buffon, F-69110 Sainte Foy-les-Lyon (FR). DESBORDES, Philippe [FR/FR]; 30 Rue Bancel, F-69007 Lyon (FR). VILLIER, Alain [FR/FR]; Les Terres de Tourvéon, Bat. A, 2 Chemin Du Champ, F-69660 Collonges Au Mont D'or (FR). GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire [FR/FR]; Le Trève

Collonge, Route D'albigny, F-69250 Curis Au Mont D'or (FR). GENIX, Pierre [FR/FR]; 14 Rue Duviard, F-69004 Lyon (FR).

(74) Agente: GUITTON, Carole; BAYER CROPSCIENCE SA, Patents & Licensing Department, 14/20 Rue Pierre Baizet, F-69009 Lyon (FR).

(81) Estados designados (a menos que se indique otra cosa, para todo tipo de protección nacional disponible): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW

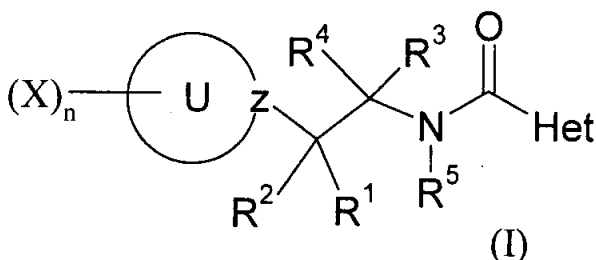
(84) Estados designados (a menos que se indique otra cosa, para todo tipo de protección regional disponible): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Euroasiática (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), Europea (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, 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).

Publicada:

--- Con informe de búsqueda internacional.

Para códigos de dos letras y otras abreviaturas, se hace referencia a "Notas de Guía sobre Códigos y Abreviaturas" que aparecen al comienzo de cada índice regular del Boletín PCT.

(54) Título: NUEVOS DERIVADOS DE LA BENZOHETEROCICLILETILCARBOXAMIDA



(57) Resumen: La presente invención se refiere a nuevos derivados de la benzoheterocicliletilcarboxamida de fórmula (I), en la que los sustituyentes son según la memoria descriptiva, su procedimiento de preparación, su uso como fungicidas, particularmente en forma de composiciones fungicidas, métodos para luchar contra hongos fitopatógenos de plantas usando estos compuestos o sus composiciones.

Nuevos derivados de la Benzoheterocicliletilcarboxamida

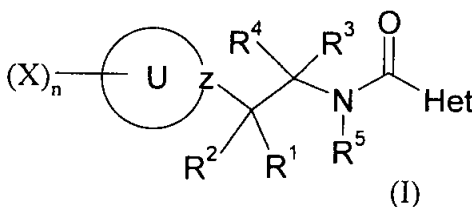
La presente invención se refiere a nuevos derivados de la benzoheterocicliletilcarboxamida, su procedimiento de preparación, su utilización como fungicidas, particularmente en forma de composiciones fungicidas y a métodos para el control de hongos fitopatógenos de plantas utilizando estos compuestos o sus composiciones.

En la solicitud de patente internacional WO 03/042184 se describe una extensa familia de derivados de benzimidazol- o indol-aminoacetonitrilo para luchar contra los parásitos. Sin embargo, no se ensayó su actividad como fungicidas y el documento no describe los compuestos de acuerdo con la invención.

Siempre es de gran interés en el campo de la agricultura usar nuevos compuestos plaguicidas para evitar o para combatir el desarrollo de cepas resistentes a los ingredientes activos usados por el agricultor.

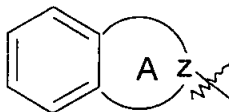
Se ha encontrado ahora una nueva familia de compuestos que poseen las características mencionadas anteriormente.

De acuerdo con esto, la presente invención se refiere a un derivado de la benzoheterocicliletilcarboxamida de fórmula general (I):



en la que:

- n es 0, 1, 2, 3, 4, 5 ó 6;
- U es:



en la que A representa un heterociclo de 5 ó 6 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser el mismo o diferentes, condensado con un anillo de fenilo.

- Z es un átomo de carbono o un heteroátomo que no puede estar sustituido por X;

- X es el mismo o diferente y es: un átomo de halógeno, un grupo nitro, un

grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxycarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-[alquilo C₁-C₆], un alquilo C₁-C₈, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un [alquil C₁-C₈]amino, un halogeno[alquilo C₁-C₈] con 1 a 5 átomos de halógeno, un di-[alquil C₁-C₈]amino, un alcoxi C₁-C₈, un halogenoalcoxi C₁-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfanilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfanilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil C₂-C₈]oxi, un halogeno[alquenil C₂-C₈]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquinil C₃-C₈]oxi, un halogeno[alquinil C₃-C₈]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbamoilo, un di-[alquil C₁-C₈]carbamoilo, un N-[alquil C₁-C₈]oxicarbamoilo, un [alcoxi C₁-C₈]carbamoilo, un N-[alquil C₁-C₈]-[alcoxi C₁-C₈]carbamoilo, un [alcoxi C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alcoxi C₁-C₈]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carboniloxi, un halogeno[alquil C₁-C₈]carboniloxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilamino, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilamino con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]aminocarboniloxi, un di-[alquil C₁-C₈]aminocarboniloxi, un [alquil C₁-C₈]oxicarboniloxi, un [alquil C₁-C₈]sulfenilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfenilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfinilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfinilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alcoxi C₁-C₆]imino, un [(alcoxi C₁-C₆)imino]-[alquilo C₁-C₆], un [(alquenil C₁-C₆)oxiimino]-[alquilo C₁-C₆], un [(alquinil C₁-C₆)oxiimino]-[alquilo C₁-C₆], un (benciloxiimino)-[alquilo C₁-C₆], un benciloxi, un bencilsulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo un fenilo o un fenilamino;

- R¹ y R² son el mismo o diferentes y son: un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo (hidroxiimino)-alquilo C₁-C₆, un alquilo C₁-C₈, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C₁-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbamoilo, un di-[alquil C₁-C₈]carbamoilo, un [alcoxi C₁-C₈]carbamoilo, un [alcoxi C₁-C₈]carbonilo o un halogeno[alcoxi C₁-C₈]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno;

- R³ y R⁴ son el mismo o diferentes y son: un átomo de hidrógeno, un grupo formilo, un grupo (hidroxiimino)-alquilo C₁-C₈, un alquilo C₁-C₈, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalquilo C₁-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno;

- R⁵ es: un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₈ o un cicloalquilo C₃-C₇;

Het representa un heterociclo no condensado de 5 ó 6 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser el mismo o diferentes, estando Het unido por un átomo de carbono y estando al menos sustituido en posición orto;

así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloides e isómeros ópticamente activos.

En el contexto de la presente invención:

- halógeno significa: flúor, bromo, cloro o iodo.

- carboxi significa -C(=O)OH ; carbonilo significa -C(=O)-; carbamoilo significa -C(=O)NH₂ ; N-hidroxycarbamoilo significa -C(=O)NHOH;

- un grupo alquilo, un grupo alquenilo y un grupo alquinilo, así como los restos que contienen estos términos, pueden ser lineales o ramificados y

- heteroátomo significa: azufre, nitrógeno u oxígeno.

En el contexto de la presente invención, debe también entenderse que en el caso de radicales amino di-sustituidos y de carbamoilo di-sustituidos, los dos sustituyentes pueden formar junto con el átomo de nitrógeno al que se unen, un anillo heterocíclico saturado que contiene de 3 a 7 átomos.

Cualquiera de los compuestos de la presente invención puede existir en una o más formas de isómeros ópticos o quirales, dependiendo del número de centros asimétricos en el compuesto. Así, la invención se refiere igualmente a todos los isómeros ópticos y a sus mezclas racémicas o escalémicas (la terminología "escalémico" indica una mezcla de enantiómeros en diferentes proporciones) y a las mezclas de todos los posibles estereoisómeros, en todas las proporciones. Los diaestereoisómeros y/o los isómeros ópticos pueden separarse de acuerdo con los métodos que son conocidos por sí mismos por cualquier experto en la materia.

Cualquiera de los compuestos de la presente invención puede existir también en una o más formas de isómeros geométricos, dependiendo del número de dobles enlaces en el compuesto. Así, la invención se refiere igualmente a todos los isómeros geométricos y a todas las posibles mezclas, en todas las proporciones. Los isómeros

geométricos pueden separarse de acuerdo con métodos generales, que son conocidos por sí mismos por cualquier experto en la materia.

Cualquiera de los compuestos de fórmula general (I), en la que X representa: un hidroxilo, un grupo sulfanilo o un grupo amino, puede encontrarse en su forma tautómera resultante del cambio de posición del protón de dicho grupo hidroxilo, sulfanilo o amino. Tales formas tautoméricas de dichos compuestos también forman parte de la presente invención. Hablando de forma más general, también forman parte de la presente invención todas las formas tautómeras de compuestos de fórmula general (I), en las que X representa un hidroxilo, un grupo sulfanilo o un grupo amino, así como las formas tautómeras de los compuestos que pueden utilizarse opcionalmente como compuestos intermedios en los procedimientos de preparación y que se definirán en la descripción de estos procedimientos.

De acuerdo con la presente invención, el grupo "U" puede estar sustituido en cualquier posición por $(X)_n$, en que X y n son como se definió anteriormente. Preferiblemente, la presente invención se refiere a un derivado de la benzoheterociclicetilcarboxamida de fórmula general (I) en que las diferentes características se pueden elegir solas o en combinación como:

- en relación con n, n es 0, 1 ó 2 y
- en relación con X, X se elige entre: un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo, un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

De acuerdo con la presente invención, los átomos de carbono del resto carboxamida del compuesto de fórmula (I) se sustituyen por: R^1 , R^2 , R^3 y R^4 ; siendo R^1 , R^2 , R^3 y R^4 como se definieron anteriormente. Preferiblemente, la presente invención se refiere también a un derivado de la benzoheterociclicetilcarboxamida de fórmula general (I) en que las diferentes características se pueden elegir solas o en combinación como:

- en relación con R^1 y R^2 , R^1 y R^2 se eligen, independientemente uno de otro, entre: un átomo de hidrógeno, un alquilo C_1-C_8 , un alquenilo C_2-C_8 , un alquinilo C_2-C_8 , un cicloalquilo C_3-C_8 , un halogenocicloalquilo C_3-C_8 con 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C_1-C_8 con 1 a 5 átomos de halógeno y
- en relación con R^3 y R^4 , R^3 y R^4 se eligen, independientemente uno de otro, entre: un átomo de hidrógeno, un alquilo C_1-C_8 , un alquenilo C_2-C_8 , un alquinilo C_2-C_8 ,

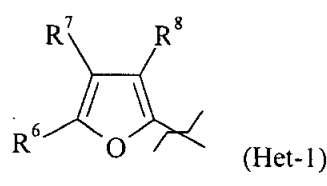
un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C₁-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno.

De acuerdo con la presente invención, el átomo de nitrógeno del resto carboxamida del compuesto de fórmula (I) está sustituido por R⁵, siendo R⁵ un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₆ o un cicloalquilo C₃-C₇. Preferiblemente, el cicloalquilo C₃-C₇ es ciclopropilo.

De acuerdo con la presente invención, "Het" del compuesto de fórmula general (I) es un heterociclo no condensado de 5 ó 6 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes, estando Het unido por un átomo de carbono y estando sustituido al menos en posición orto. Preferiblemente, la presente invención también se refiere al derivado de la benzoheterocicliletilcarboxamida de fórmula general (I) en que Het se selecciona entre: 2-furano, 3-furano, 4,5-dihidro-3-furano, 2-tiofeno, 3-tiofeno, 2-pirrol, 3-pirrol, 5-oxazol, 4-oxazol, 5-tiazol, 4-tiazol, 5-pirazol, 4-pirazol, 3-pirazol, 3-isoxazol, 4-isoxazol, 5-isoxazol, 3-isotiazol, 4-1,2,3-triazol, 4-tiadiazol, 5-tidiazol, 2-piridina, 3-piridina, 4-piridina, 2-oxatiina, 4,5-dihidro-3-pirano 4,5-dihidro-2-tiopirano, 4,5-dihidro-3-tiopirano o 2-pirazina.

De acuerdo con la presente invención, "Het" del compuesto de fórmula general (I) puede ser un heterociclo anular de cinco miembros. Ejemplos específicos de compuestos de la presente invención en los que Het es un heterociclo de cinco miembros incluyen:

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-1)

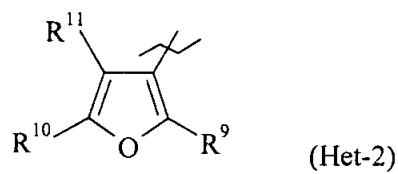


en la que:

- R⁶ y R⁷ pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno y

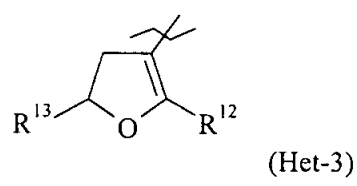
- R⁸ puede ser: un átomo de halógeno, un grupo nitro, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het representa un heterociclo de la fórmula general (Het-2)



en la que:

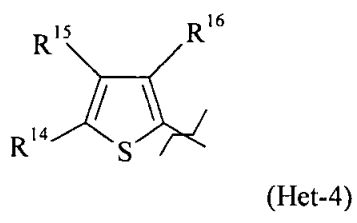
- R⁹ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno y
- 5 - R¹⁰ y R¹¹ pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno;
- con tal de que R⁹ y R¹¹ no sean ambos un átomo de hidrógeno.
- * Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-3)



10

en la que:

- R¹² puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno y
- R¹³ puede ser: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un
- 15 halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno.
- * Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-4)

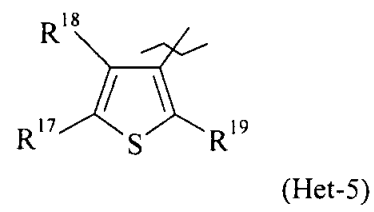


en la que:

- R¹⁴ y R¹⁵ pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de
- 20 hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C₁-C₄)-tio, un alquil (C₁-C₄)-sulfonilo, un fenilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄) o un piridilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄) y
- R¹⁶ puede ser: un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄), un

halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-5)

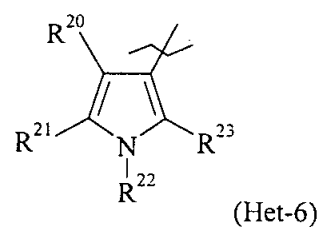


5 en la que:

- R¹⁷ y R¹⁸ pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄), un alquil (C₁-C₄)-oxi o un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno y

- R¹⁹ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; con tal de que R¹⁸ y R¹⁹ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-6)



en la que:

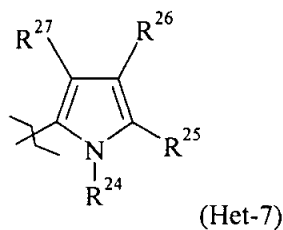
15 - R²⁰ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno;

- R²¹ y R²³ pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno y

20 - R²² puede ser: un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un hidroxí-alquilo C₁-C₄, un [alquil C₁-C₄]sulfonilo, un di(alquil C₁-C₄)-aminosulfonilo, un [alquil C₁-C₆]carbonilo, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄ o un benzoilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄;

con tal de que R²⁰ y R²³ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-7)

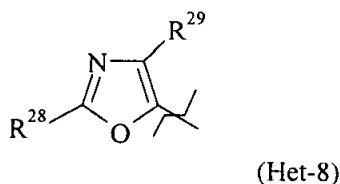


en la que:

- R^{24} puede ser: un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un halogenoalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), un hidroxialquilo (C_1-C_4), un [alquil (C_1-C_4)]sulfonilo, un di[alquil (C_1-C_4)]aminosulfonilo, un [alquil (C_1-C_6)]carbonilo, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4) o un benzoílo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4) y

- R^{25} , R^{26} y R^{27} pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C_1-C_4), un halogenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno o un [alquil (C_1-C_4)]-carbonilo; con tal de que R^{24} y R^{27} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-8)

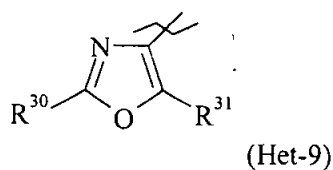


en la que:

- R^{28} puede ser un átomo de hidrógeno o un alquilo (C_1-C_4) y

- R^{29} puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo C_1-C_4 o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-9)

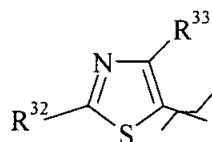


en la que:

- R^{30} puede ser un átomo de hidrógeno o un alquilo (C_1-C_4) y

- R³¹ puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄).

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-10)



(Het-10)

5

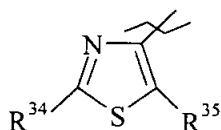
en la que:

- R³² puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo ciano, un [alquil (C₁-C₄)]amino, un di[alquil (C₁-C₄)]-amino, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄) y

10

- R³³ puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-11)



(Het-11)

15

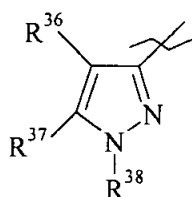
en la que:

- R³⁴ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo ciano, un [alquil (C₁-C₄)]-amino, un di[alquil (C₁-C₄)]-amino, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno y

- R³⁵ puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

20

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-12)



(Het-12)

en la que:

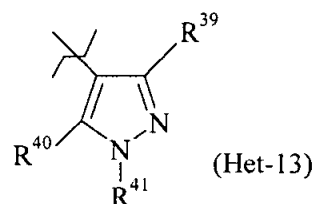
- R³⁶ puede ser: un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un

alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C₃-C₆), un alcoxi (C₁-C₄), un halogenoalcoxi (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₄)]-tio, un halogeno[alquil (C₁-C₄)]-tio con 1 a 5 átomos de halógeno, un grupo aminocarbonilo o un aminocarbonil-alquilo (C₁-C₄);

5 - R³⁷ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo (C₁-C₄), un alcoxi (C₁-C₄) o un [alquil (C₁-C₄)]-tio y

- R³⁸ puede ser: un átomo de hidrógeno, un fenilo, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo (C₁-C₄), un alquenilo (C₂-C₆), un cicloalquilo (C₃-C₆), un [alquil (C₁-C₄)]-tio-alquilo (C₁-C₄), un
10 halogeno[alquil (C₁-C₄)]-tio-alquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-13)



15 en la que:

- R³⁹ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C₃-C₆), un alcoxi (C₁-C₄), un halogenoalcoxi (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C₁-C₄)-tio, un halogeno[alquil (C₁-C₄)]-tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un aminocarbonilo o un
20 aminocarbonil-alquilo (C₁-C₄);

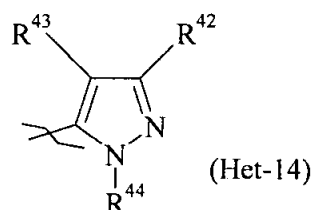
- R⁴⁰ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un alcoxi C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno o un [alquil C₁-C₄]-tio
25 y

- R⁴¹ puede ser: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo (C₁-C₄), un alquenilo (C₂-C₆), un cicloalquilo (C₃-C₆), un alquil (C₁-C₄)-tio-alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquil (C₁-C₄)-tio-alquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₄)-
30 alquilo (C₁-C₄), un halogenoalcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de

halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido por: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄), un alcoxialquilo (C₁-C₄) o un grupo nitro;

con tal de que R³⁹ y R⁴⁰ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-14)



5

en la que:

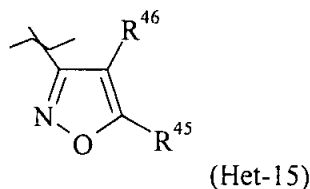
- R⁴² puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo (C₃-C₆), un alcoxi (C₁-C₄), un halogenoalcoxi (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil (C₁-C₄)-tio, un halogeno[alquil (C₁-C₄)]-tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un aminocarbonilo o un aminocarbonil-alquilo (C₁-C₄);

- R⁴³ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄), un alcoxi (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₄)]-tio o un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

- R⁴⁴ puede ser: un átomo de hidrógeno, un fenilo, un bencilo, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo (C₁-C₄), un alquenilo (C₂-C₆), un cicloalquilo (C₃-C₆), un [alquil (C₁-C₄)]-tio-alquilo (C₁-C₄), un halogeno[alquil (C₁-C₄)]-tio-alquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un [alcoxi (C₁-C₄)]-alquilo (C₁-C₄), un halogeno[alcoxi (C₁-C₄)]-alquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

con tal de que R⁴³ y R⁴⁴ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-15)



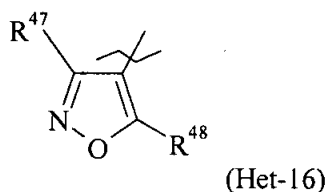
25

en la que:

- R⁴⁵ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno y

- R^{46} puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo C_1-C_4 o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

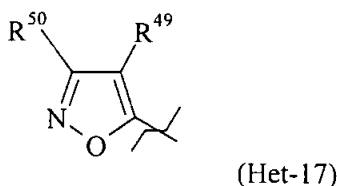
* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-16)



5 en la que R^{47} y R^{48} pueden ser iguales o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4), un halogenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4) o un heterociclilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C_1-C_4);

10 con tal de que R^{47} y R^{48} no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-17)

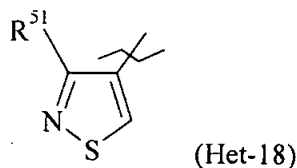


en la que:

- R^{49} puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un halogenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno y

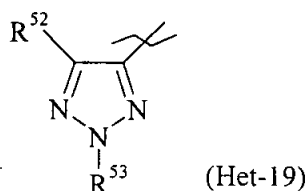
- R^{50} puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un halogenoalquilo (C_1-C_4) con 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-18)



20 en la que R^{51} puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C_1-C_4) o un halogenoalquilo (C_1-C_4) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

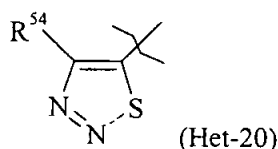
* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-19)



en la que:

- R⁵² puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno y
- R⁵³ puede ser: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄).

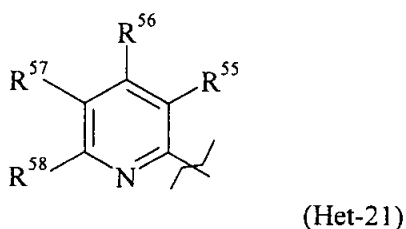
* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-20)



en la que R⁵⁴ puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

De acuerdo con la presente invención, "Het" en el compuesto de fórmula general (I) puede ser un heterociclo anular de seis miembros. Ejemplos específicos de compuestos de la presente invención en los que Het es un heterociclo de seis miembros incluyen:

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-21)

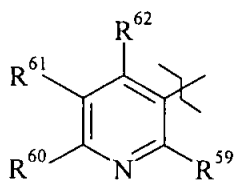


en la que:

- R⁵⁵ puede ser: un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₄)]-tio, un halogeno[alquil (C₁-C₄)]-tio con 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno;

- R⁵⁶, R⁵⁷ y R⁵⁸, que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₄)]-tio, un halogenoalcoxi (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₄)]-sulfínilo o un [alquil (C₁-C₄)]-sulfonilo.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-22)



(Het-22)

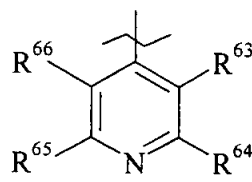
en la que:

- R⁵⁹ puede ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₅)]-tio un [alquénil (C₂-C₅)]-tio, un halogeno[alquil (C₁-C₄)]-tio con 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un feniloxi opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄) o un feniltio opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄);

- R⁶⁰, R⁶¹ y R⁶², que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₄)]-tio, un halogenoalcoxi (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₄)]-sulfínilo, un [alquil (C₁-C₄)]-sulfonilo o un N-morfolino opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄) o un tienilo opcionalmente sustituido por un átomo de halógeno o un alquilo (C₁-C₄);

con tal de que R⁵⁹ y R⁶² no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-23)



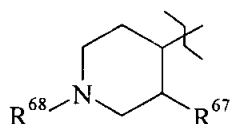
(Het-23)

en la que R⁶³, R⁶⁴, R⁶⁵ y R⁶⁶, que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser:

un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₄)]-tio, un halogeno[alquil (C₁-C₄)]-tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil (C₁-C₄)]-sulfinilo o un [alquil (C₁-C₄)]-sulfonilo;

con tal de que R⁶³ y R⁶⁶ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-24)



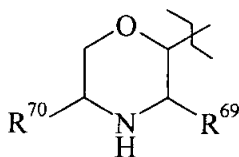
(Het-24)

en la que:

- R⁶⁷ puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno;

- R⁶⁸ puede ser: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alcoxi (C₁-C₆)]-carbonilo, un bencilo opcionalmente sustituido por 1 a 3 átomos de halógeno, un benciloxicarbonilo opcionalmente sustituido por 1 a 3 átomos de halógeno o un heterociclilo.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-25)



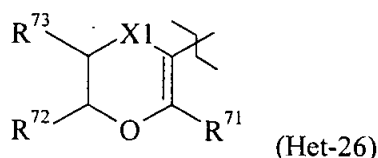
(Het-25)

en la que:

- R⁶⁹ puede ser: un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi (C₁-C₄), un [alquil (C₁-C₄)]-tio, un halogeno[alquil (C₁-C₄)]-tio con 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno;

- R⁷⁰ puede ser: un átomo de hidrógeno, un alquilo (C₁-C₄), un halogenoalquilo (C₁-C₄) que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un bencilo.

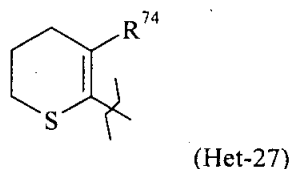
* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-26)



en la que:

- X¹ puede ser: un átomo de azufre, -SO-, -SO₂- o -CH₂-;
- 5 - R⁷¹ puede ser: un halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1a 5 átomos de halógeno y
- R⁷² y R⁷³ pueden ser iguales o diferentes y pueden ser un átomo de hidrógeno o un alquilo (C₁-C₄).

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-27)

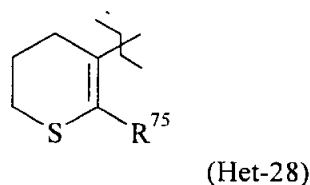


10

en la que:

- R⁷⁴ puede ser: un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-28)

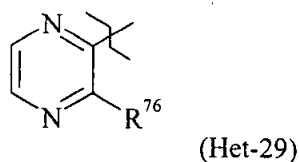


15

en la que:

- R⁷⁵ puede ser: un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno.

* Het representa un heterociclo de fórmula general (Het-29)



20

en la que R⁷⁶ puede ser: un átomo de halógeno, un alquilo (C₁-C₄) o un halogenoalquilo (C₁-C₄) con 1 a 5 átomos de halógeno.

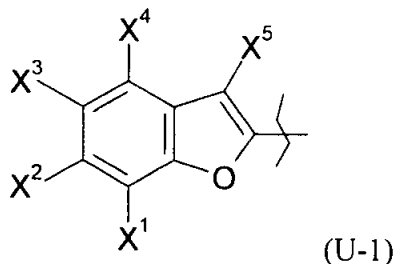
De acuerdo con la presente invención, el grupo "U" del compuesto de fórmula general (I) es un benzoheterociclo donde el heterociclo condensado con el anillo de fenilo es un anillo de cinco o seis miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser el mismo o diferentes. Preferiblemente, la presente invención también se refiere a un derivado de la benzoheterocicliletilcarboxamida de fórmula general (I) en que las diferentes características se pueden elegir solas o en combinación entre:

- U se elige entre: un 2-benzotiofeno, un 3-benzotiofeno, un 1-indol, un 2-indol, un 3-indol, un 2-benzofurano, un 3-benzofurano, un 2-benzoxazol, un 2-benzotiazol, un 1-benzimidazol, un 2-benzimidazol, un 3-benz-1,2-isoxazol, un 3-benz-2,1-isoxazol, un 3-benz-1,2-isotiazol, un 3-benz-2,1-isotiazol, un 1-benzopirazol, un 2-benzopirazol, un 3-benzopirazol, una 2-quinolina, una 3-quinolina, una 4-quinolina, una 1-isoquinolina, una 3-isoquinolina, una 4-isoquinolina.

-U no está sustituido o está sustituido por 1, 2, 3, 4, 5 ó 6 grupos que se eligen, independientemente uno de otro, entre: un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un grupo alcoxi C₁-C₄, un [alquil C₁-C₄]tio, un [alquil C₁-C₄]sulfonilo, un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno.

Los ejemplos específicos de grupo "U" incluyen:

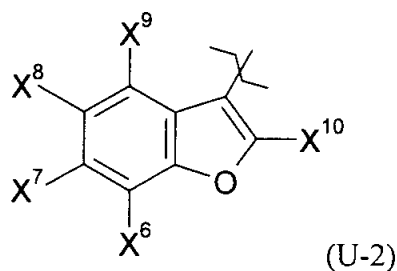
* U representa un benzoheterociclo de fórmula general (U-1)



en la que:

- X¹, X², X³, X⁴ y X⁵ pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un grupo alcoxi C₁-C₄, un [alquil C₁-C₄]tio, un [alquil C₁-C₄]sulfonilo o un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno.

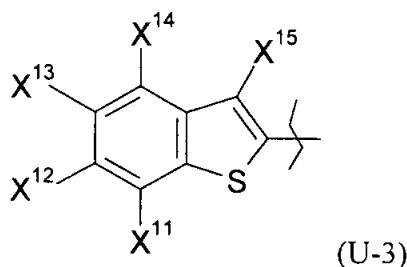
* U representa un benzoheterociclo de fórmula general (U-2)



en la que:

- 5 - X^6 , X^7 , X^8 , X^9 y X^{10} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1 - C_4 , un grupo alcoxi C_1 - C_4 , un [alquil C_1 - C_4]tio, un [alquil C_1 - C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1 - C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

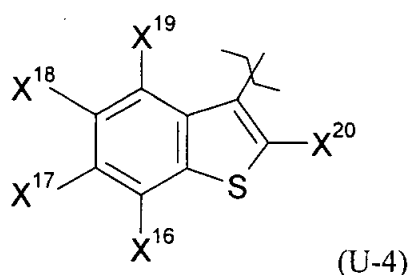
* U representa un benzoheterociclo de fórmula general (U-3)



10 en la que:

- X^{11} , X^{12} , X^{13} , X^{14} y X^{15} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1 - C_4 , un grupo alcoxi C_1 - C_4 , un [alquil C_1 - C_4]tio, un [alquil C_1 - C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1 - C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno

15 * U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-4):

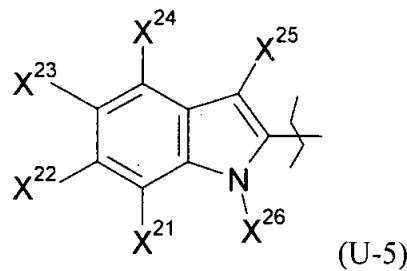


en la que:

- 20 - X^{16} , X^{17} , X^{18} , X^{19} y X^{20} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1 - C_4 , un grupo alcoxi C_1 - C_4 , un [alquil C_1 - C_4]tio, un [alquil C_1 -

C₄]sulfonilo o un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno.

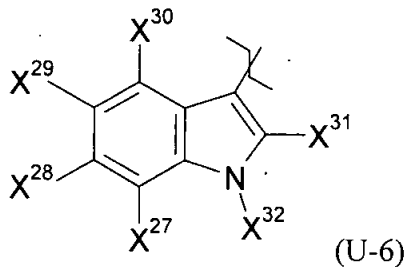
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-5):



en la que:

- 5 - X²¹, X²², X²³, X²⁴, X²⁵ y X²⁶ pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un grupo alcoxi C₁-C₄, un [alquil C₁-C₄]tio, un [alquil C₁-C₄]sulfonilo o un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno.

* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-6):

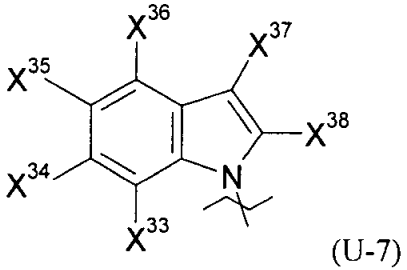


10

en la que:

- 15 - X²⁷, X²⁸, X²⁹, X³⁰, X³¹ y X³² pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un grupo alcoxi C₁-C₄, un [alquil C₁-C₄]tio, un [alquil C₁-C₄]sulfonilo o un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno;

* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-7):

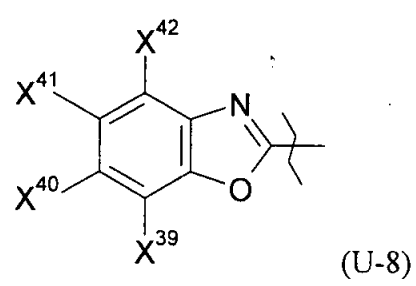


en la que:

- 20 - X³³, X³⁴, X³⁵, X³⁶, X³⁷ y X³⁸ pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un

grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un grupo alcoxi C₁-C₄, un [alquil C₁-C₄]tio, un [alquil C₁-C₄]sulfonilo o un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno.

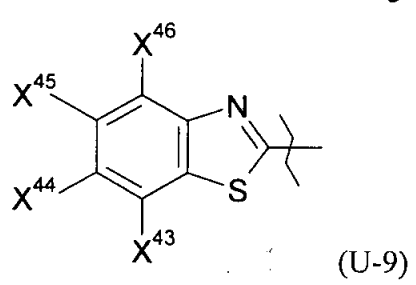
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-8):



5 en la que:
- X³⁹, X⁴⁰, X⁴¹ y X⁴² pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un grupo alcoxi C₁-C₄, un [alquil C₁-C₄]tio, un [alquil C₁-C₄]sulfonilo o un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno.

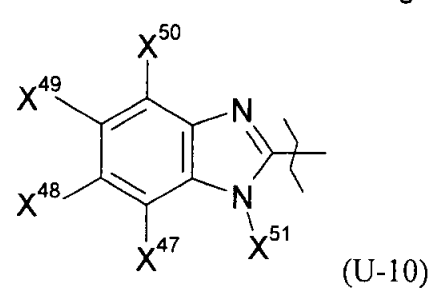
10

* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-9):



en la que:
- X⁴³, X⁴⁴, X⁴⁵ y X⁴⁶ pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un grupo alcoxi C₁-C₄, un [alquil C₁-C₄]tio, un [alquil C₁-C₄]sulfonilo o un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno.

* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-10):

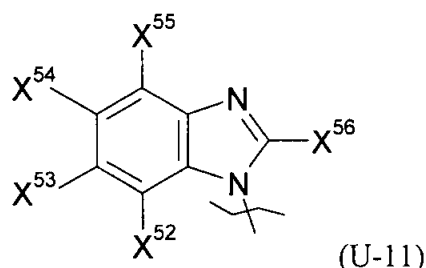


20

en la que:

- X^{47} , X^{48} , X^{49} , X^{50} y X^{51} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

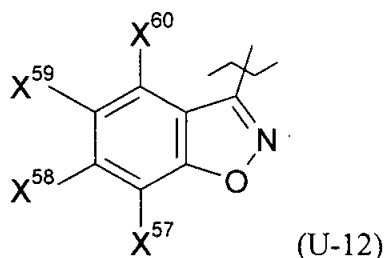
5 * U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-11):



en la que:

10 - X^{52} , X^{53} , X^{54} , X^{55} y X^{56} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

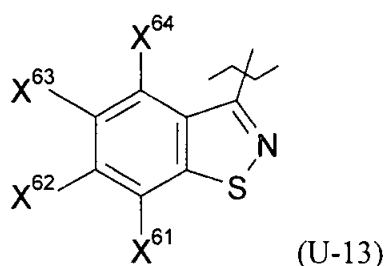
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-12):



en la que:

15 - X^{57} , X^{58} , X^{59} y X^{60} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-13):

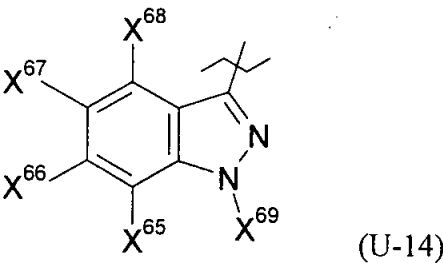


20

en la que:

- X^{61} , X^{62} , X^{63} y X^{64} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

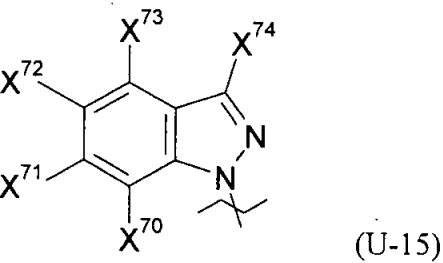
5 * U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-14):



en la que:

- X^{65} , X^{66} , X^{67} , X^{68} y X^{69} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

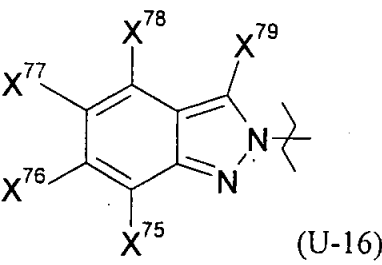
10 * U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-15):



en la que:

15 - X^{70} , X^{71} , X^{72} , X^{73} y X^{74} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

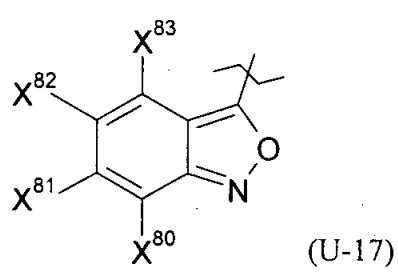
 * U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-16):



en la que:

- X^{75} , X^{76} , X^{77} , X^{78} y X^{79} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

5 * U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-17)

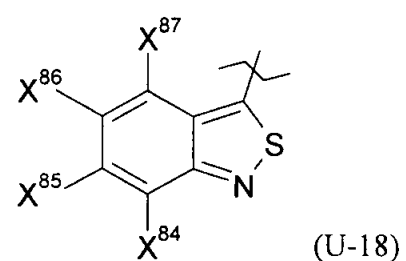


en la que:

- X^{80} , X^{81} , X^{82} y X^{83} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

10

* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-18):

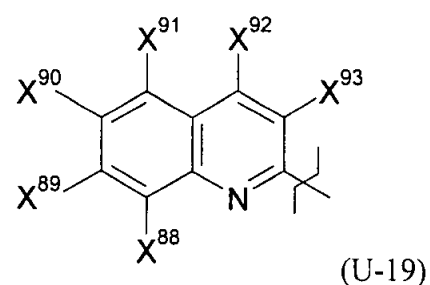


en la que:

- X^{84} , X^{85} , X^{86} y X^{87} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

15

* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-19):

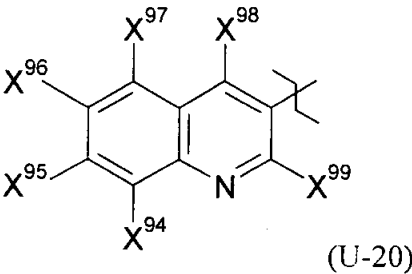


20

en la que:

- X^{88} , X^{89} , X^{90} , X^{91} , X^{92} y X^{93} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

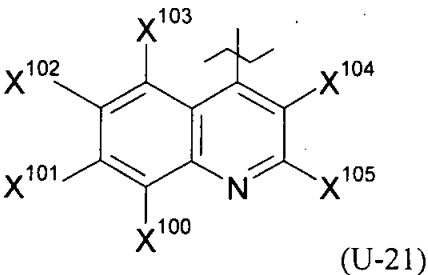
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-20):



en la que:

- X^{94} , X^{95} , X^{96} , X^{97} , X^{98} y X^{99} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

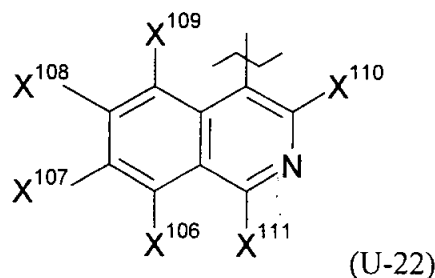
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-21):



en la que:

- X^{100} , X^{101} , X^{102} , X^{103} , X^{104} y X^{105} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 con 1 a 5 átomos de halógeno.

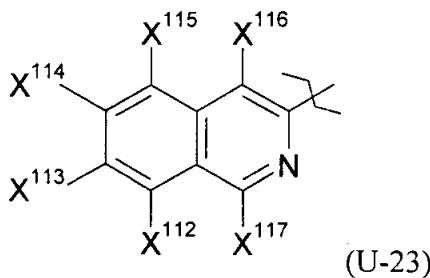
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-22):



en la que:

- 5 - X¹⁰⁶, X¹⁰⁷, X¹⁰⁸, X¹⁰⁹, X¹¹⁰ y X¹¹¹ pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un grupo alcoxi C₁-C₄, un [alquil C₁-C₄]tio, un [alquil C₁-C₄]sulfonilo o un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno.

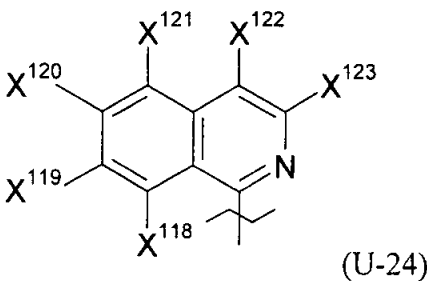
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-23):



10 en la que:

- X¹¹², X¹¹³, X¹¹⁴, X¹¹⁵, X¹¹⁶ y X¹¹⁷ pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un grupo alcoxi C₁-C₄, un [alquil C₁-C₄]tio, un [alquil C₁-C₄]sulfonilo o un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno.

15 * U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-24):

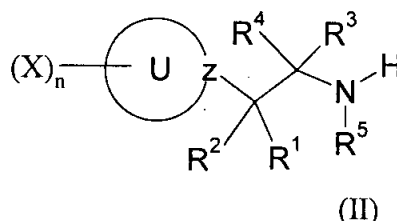


en la que:

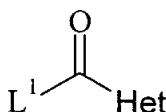
- 20 - X¹¹⁸, X¹¹⁹, X¹²⁰, X¹²¹, X¹²² y X¹²³ pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un grupo alcoxi C₁-C₄, un [alquil C₁-C₄]tio, un

[alquil C₁-C₄]sulfonilo o un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno.

La presente invención también se refiere a un procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). Así, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento para la
5 preparación de un compuesto de fórmula general (I) como se definió anteriormente, que comprende hacer reaccionar un derivado de benzoheterociclietilamina de fórmula general (II) o una de sus sales:

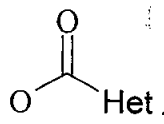


en que U, X, n, Z, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ son como se definió anteriormente;
10 con un derivado de ácido carboxílico de fórmula general (III)



en la que:

- Het es como se definió anteriormente;
- L¹ es un grupo saliente elegido entre: un átomo de halógeno, un grupo
15 hidroxilo, -OR⁶, -OCOR⁶, siendo R⁶: un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula:



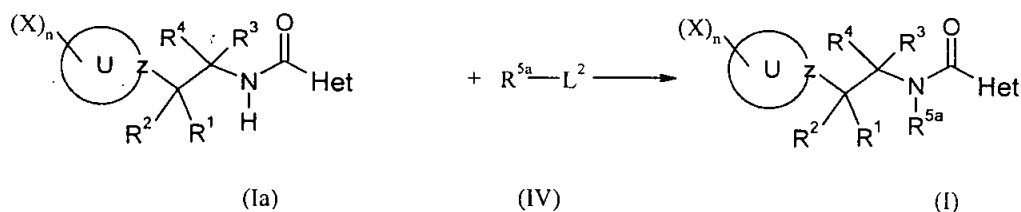
en presencia de un catalizador y, si L¹ es un grupo hidroxilo, en presencia de un agente de condensación.

20 El procedimiento de acuerdo con la presente invención se lleva a cabo en presencia de un catalizador. El catalizador adecuado puede seleccionarse que sea: 4-dimetil-aminopiridina, 1-hidroxibenzotriazol o dimetilformamida.

En caso de que L¹ sea un grupo hidroxilo, el procedimiento de acuerdo con la presente invención se lleva a cabo en presencia de un agente de condensación. El
25 agente de condensación adecuado puede elegirse entre: un generador de haluro de ácido, tal como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxido de tricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; generador de anhídrido, tal

como cloroformiato de etilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de isobutilo o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidas, tales como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC), PS-DCC u otros agentes de condensación habituales, tales como: pentóxido de fósforo, poli(ácido fosfórico), N,N'-carbonil-diimidazol, 2-etoxi-N-etoxicarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano, cloruro de 4-(4,6-dimetoxi[1.3.5]triazin-2-il)-4-metilmorfolinio hidratado o hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidino-fosfonio, 1-hidroxibenzotriazol (HOBT).

Cuando R^5 es un átomo de hidrógeno, el procedimiento mencionado anteriormente para la preparación de un compuesto de fórmula general (I) puede completarse opcionalmente mediante una etapa adicional de acuerdo con el siguiente esquema de reacción:



en la que: - U, X, n, z, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y Het son como se definió anteriormente;

- R^{5a} es un alquilo C_1 - C_6 o un cicloalquilo C_3 - C_7 ;
- L^2 es un grupo saliente elegido entre: un átomo de halógeno, un 4-metil-fenilsulfonilo o un metilsulfonilo;

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Ia) con un compuesto de fórmula general (IV) para proporcionar un compuesto de fórmula general (I).

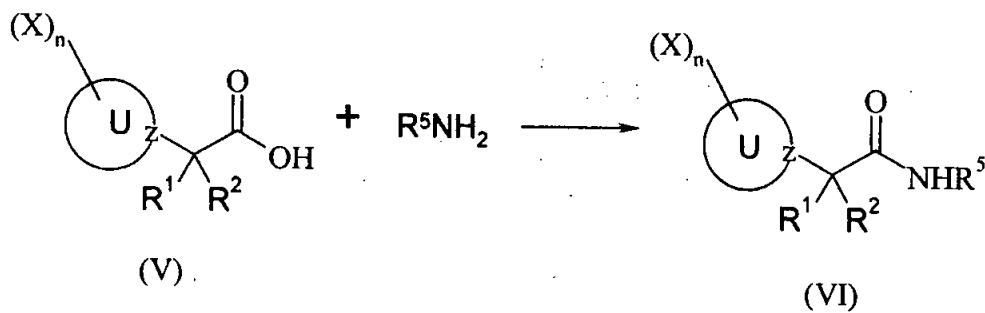
Dependiendo de la definición de R^1 , R^2 , R^3 , R^4 o R^5 , pueden prepararse derivados de aminas de fórmula general (II) por diferentes procedimientos. Un ejemplo (A) de uno de tales procedimientos puede ser cuando:

- U, X, n, z y R^5 son como se definió anteriormente;
- R^1 es un átomo de hidrógeno o un alquilo (C_1 - C_6);
- R^2 es un átomo de hidrógeno o un alquilo C_1 - C_6 y
- R^3 y R^4 son átomos de hidrógeno;

entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar de acuerdo con un procedimiento que comprende:

- una primera etapa de acuerdo con el esquema de reacción A-1:

Esquema A-1



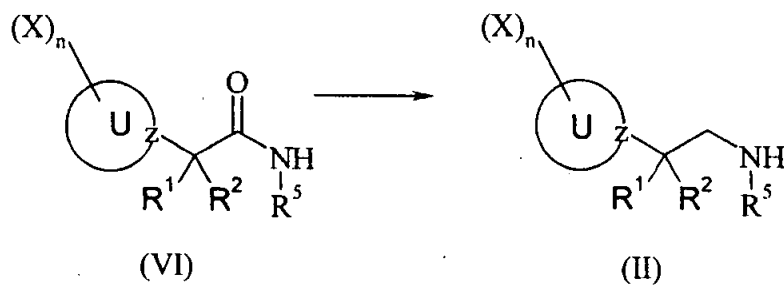
en el que:

- U, X, n, z y R⁵ son como se definió anteriormente;
- R¹ es un átomo de hidrógeno o un alquilo (C₁-C₆) y
- R² es un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₆

que comprende la transformación de un ácido carboxílico benzoheterocíclico de fórmula general (V) para proporcionar un derivado de la benzoheterociclil-amida de fórmula general (VI), en presencia de un aminoderivado y un agente de condensación, a una temperatura de 0°C a 200°C;

- una segunda etapa de acuerdo con el esquema de reacción A-2:

Esquema A-2



en el que:

- U, X, n, z y R⁵ son como se definió anteriormente;
- R¹ es un átomo de hidrógeno o un alquilo (C₁-C₆) y
- R² es un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₆

que comprende una reducción de un compuesto de fórmula general (VI) para proporcionar, un derivado de la benzoheterociclil-etilamina de fórmula general (II), en presencia de un donador de hidruro, a una temperatura de 0°C a 200°C;

La primera etapa (etapa A-1) se lleva a cabo en presencia de un agente de condensación. El agente de condensación adecuado puede elegirse entre: un generador de haluro de ácido, tal como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxido de tricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; cloruro de sulfurilo; generador de anhídrido, tal como: cloroformiato de etilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de isobutilo o cloruro de metanosulfonilo;

La primera etapa (etapa A-1) de acuerdo con la presente invención se lleva a cabo a una temperatura de 0°C a 200°C. Preferiblemente, la primera etapa (etapa A-1) se lleva a cabo a una temperatura de 0°C a 120°C.

La primera etapa (etapa A-1) de acuerdo con la presente invención puede llevarse a cabo en presencia o no de un disolvente. Cuando se usa un disolvente, se elige preferiblemente que el disolvente sea: agua, un disolvente orgánico o una mezcla de ambos. Disolventes orgánicos adecuados pueden ser, por ejemplo, disolventes alifáticos, alicíclicos o aromáticos.

La segunda etapa (etapa A-2) de acuerdo con la presente invención se lleva a cabo en presencia de un donador de hidruro. Preferiblemente, el donante de hidruros se elige entre hidruros de metales o metaloides tales como: LiAlH_4 , NaBH_4 , KBH_4 , B_2H_6 .

La segunda etapa (etapa A-2) de acuerdo con la presente invención puede llevarse a cabo en presencia de un catalizador. Preferiblemente, el catalizador se elige entre un ácido de Lewis tal como: TiCl_4 , AlCl_3 , $\text{BF}_3 \cdot \text{Et}_2\text{O}$, CeCl_3 .

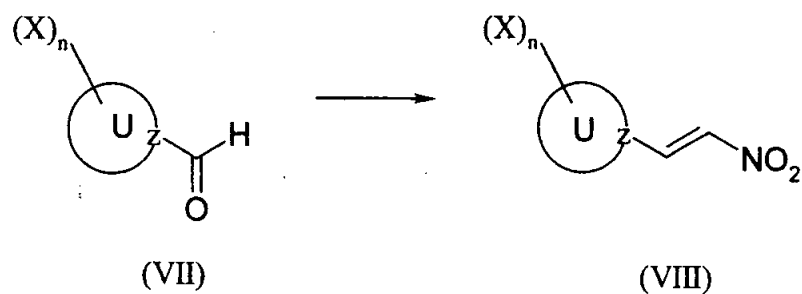
La segunda etapa (etapa A-2) de acuerdo con la presente invención se lleva a cabo a una temperatura de 0°C a 200°C. Preferiblemente, la temperatura es de 10°C a 120°C. Más preferiblemente, la temperatura es de 10°C a 80°C.

La segunda etapa (etapa A-2) de acuerdo con la presente invención se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente orgánico, de agua o de una mezcla de los mismos. Preferiblemente, el disolvente se elige entre: éter, alcohol, ácido carboxílico o una mezcla del mismo con agua o agua pura.

Cuando R5 es un átomo de hidrógeno, el derivado de amina de fórmula general (II) también se puede preparar de acuerdo con un procedimiento que comprende:

- una primera etapa de acuerdo con el esquema de reacción B-1:

Esquema B-1



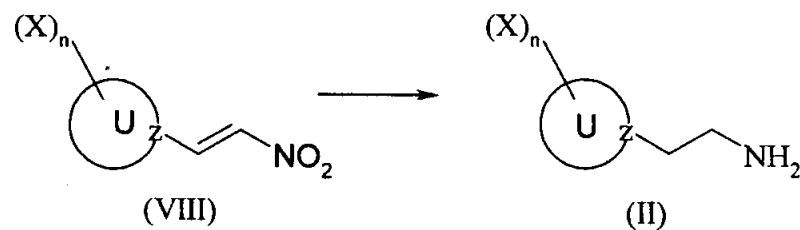
en la que:

- X, U, z y n son como se definió anteriormente;

5 que comprende la transformación de un aldehído benzoheterocíclico de fórmula general (VII) para proporcionar un derivado de benzoheterocicilil-nitroalqueno de fórmula general (VIII), a una temperatura de 0°C a 200°C;

- una segunda etapa de acuerdo con el esquema de reacción B-2:

Esquema B-2



10 en el que:

- X, U, z y n son como se definió anteriormente;

 que comprende una reducción de un compuesto de fórmula general (VIII) para proporcionar, un derivado de la benzoheterocicililetilamina de fórmula general (II), en presencia de un donador de hidruro, a una temperatura de 0°C a 200°C;

15 La primera etapa (etapa B-1) de acuerdo con la presente invención se lleva a cabo a una temperatura de 0°C a 200°C. Preferiblemente, la primera etapa (etapa A-1) se lleva a cabo a una temperatura de 0°C a 150°C, más preferiblemente a una temperatura de 50°C a 150°C.

 La primera etapa (etapa B-1) de acuerdo con la presente invención se puede
20 llevar a cabo en presencia de un disolvente orgánico, de agua o de una mezcla de los mismos. Preferiblemente, el disolvente se elige entre: éter, alcohol, ácido carboxílico o

una mezcla del mismo con agua o agua pura.

La primera etapa (etapa B-1) de acuerdo con la presente invención puede llevarse a cabo en presencia de un tampón. Preferiblemente el tampón es AcONH_4 .

La segunda etapa (etapa B-2) de acuerdo con la presente invención se lleva a cabo en presencia de un donador de hidruro. Preferiblemente, el donante de hidruros se elige entre hidruros de metales o metaloides tales como: LiAlH_4 , NaBH_4 , KBH_4 , B_2H_6 .

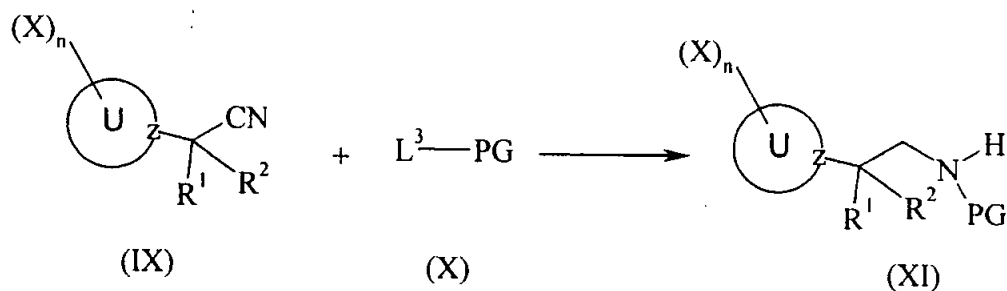
La segunda etapa (etapa B-2) de acuerdo con la presente invención se lleva a cabo a una temperatura de 0°C a 200°C . Preferiblemente, la temperatura es de 10°C a 120°C . Más preferiblemente, la temperatura es de 10°C a 80°C .

La segunda etapa (etapa B-2) de acuerdo con la presente invención se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente orgánico, de agua o de una mezcla de los mismos. Preferiblemente, el disolvente se elige entre: éter, alcohol, ácido carboxílico o una mezcla del mismo con agua o agua pura.

Cuando R^5 es un átomo de hidrógeno, el derivado de amina de fórmula general (II) también se puede preparar de acuerdo con un procedimiento que comprende:

- una primera etapa de acuerdo con el esquema de reacción C-1:

Esquema C-1



en el que:

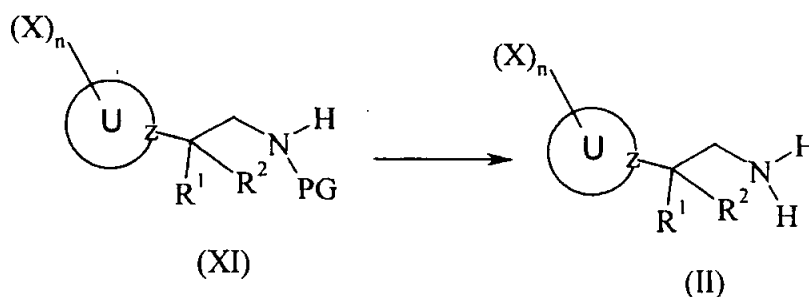
- U , X , z , n son como se definió anteriormente;
- R^1 es un átomo de hidrógeno o un alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$);
- R^2 es un átomo de hidrógeno o un alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$
- L^3 es un grupo saliente elegido entre un grupo $-\text{OR}^7$ o un grupo $-\text{OCOR}^7$, siendo R^7 : un alquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), un haloalquilo ($\text{C}_1\text{-C}_6$), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
- PG representa un grupo protector que puede ser un grupo $-\text{COOR}^7$ o grupo $-\text{COR}^7$, siendo R^7 : un alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, un haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, un

bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende la reducción, por hidrogenación o mediante un donador de hidruro, de un compuesto de fórmula general (IX), en presencia de un catalizador y en presencia de un compuesto de fórmula general (X), para producir un compuesto de fórmula general (XI), a una temperatura de 0°C a 150°C y a una presión de 10⁵ Pa a 10⁷ Pa (1 bar a 100 bar);

- una segunda etapa de acuerdo con el esquema de reacción C-2:

Esquema C-2



en el que:

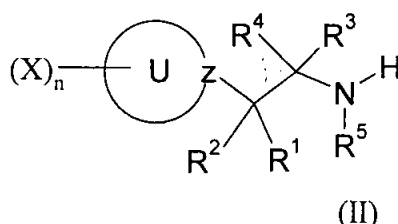
- U, X, z, n son como se definió anteriormente;
- R¹ es un átomo de hidrógeno o un alquilo (C₁-C₆);
- R² es un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₆
- PG representa un grupo protector que puede ser un grupo -COOR⁷ o grupo -COR⁷, siendo R⁷: un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende una reacción de desprotección, en un medio ácido o en uno básico, de un compuesto de fórmula general (XI), para proporcionar un aminoderivado de fórmula general (II) o una de sus sales;

El compuesto de acuerdo con la presente invención puede prepararse de acuerdo con los procedimientos generales de preparación descritos anteriormente. Debe entenderse sin embargo que, en base a su conocimiento general y en las publicaciones disponibles, el experto en la materia será capaz de adaptar este método de acuerdo con las características de cada uno de los compuestos, que se desean sintetizar.

Basándose en este conocimiento general y en las publicaciones disponibles, el especialista experto también será capaz de preparar compuestos intermedios de fórmula (V) (VII) y (IX) de acuerdo con la presente invención.

La presente invención también se refiere a un derivado de la benzoheterocicliletilamina de fórmula general (II) o una de sus sales y a su uso como compuesto intermedio en los procedimientos de preparación descritos anteriormente:



- 5 en que U, X, n, z, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ son como se definió anteriormente;

La presente invención también se refiere a una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un material activo de fórmula general (I). Así, de acuerdo con la presente invención, se proporciona una composición fungicida que comprende, como ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula
10 general (I), como se definió anteriormente y un soporte, vehículo o carga aceptable desde el punto de vista agrícola.

En la presente memoria descriptiva, la terminología "soporte" se refiere a un material orgánico o inorgánico, natural o sintético, con el que se combina el material activo para hacerlo más fácilmente aplicable, en particular a las partes de la planta.
15 Así, este soporte es generalmente inerte y debería ser aceptable desde el punto de vista agrícola. El soporte puede ser un sólido o un líquido. Los ejemplos de soportes adecuados incluyen: arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, agua, alcoholes, en particular butanol, disolventes orgánicos, aceites minerales y vegetales y derivados de los mismos. También se pueden utilizar
20 mezclas de tales soportes.

La composición también puede comprender componentes adicionales. En particular, la composición puede comprender también un tensioactivo. El tensioactivo puede ser un emulsionante, un agente dispersante o un agente humectante de tipo iónico o no iónico o una mezcla de estos tensioactivos. Se puede hacer mención, por
25 ejemplo, a sales de poli(ácido acrílico), sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (en particular alquifenoles o arilfenoles), sales de ésteres del ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (en particular tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles
30 polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de polioles y derivados de los compuestos descritos anteriormente que contienen funciones sulfato, sulfonato y fosfato. La

presencia de al menos un tensioactivo es por lo general esencial cuando el material activo y/o el soporte inerte son insolubles en agua y cuando el agente vector para la aplicación es agua. Preferiblemente, el contenido en tensioactivo puede estar comprendido entre 5% y 40% en peso de la composición.

5 Opcionalmente, también pueden incluirse otros componentes, por ej., coloides protectores, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, agentes de penetración, estabilizantes, agentes secuestrantes. Más generalmente, los materiales activos se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido, que se adapte a las técnicas convencionales de formulación.

10 En general, la composición de acuerdo con la invención puede contener de 0,05 a 99% (en peso) de material activo, preferiblemente, de 10 a 70% en peso.

Las composiciones de acuerdo con la presente invención se pueden usar en diversas formas tales como: difusor de aerosol, suspensión en cápsula, concentrado de nebulización en frío, polvo, concentrado emulsionable, emulsión de aceite en agua,
15 emulsión de agua en aceite, gránulo encapsulado, gránulo fino, concentrado autosuspensible para tratamiento de semillas, gas (a presión), producto generador de gas, gránulos, concentrado de nebulización en caliente, macrogránulos, microgránulos, polvo dispersable en aceite, concentrado autosuspensible miscible con aceite, líquido miscible con aceite, pasta, varilla vegetal, polvo para tratamiento en
20 seco de semillas, semillas recubiertas con un plaguicida, concentrado soluble, polvo soluble, disolución para tratamiento de semillas, concentrado en suspensión (concentrado autosuspensible), líquido de volumen ultrabajo (ulv), suspensión de volumen ultrabajo (ulv), gránulos o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento de lodos, gránulos o comprimidos solubles en
25 agua, polvo soluble en agua para tratamiento de semillas y polvo mojable.

Estas composiciones incluyen no sólo las composiciones que están listas para ser aplicadas a la planta o semilla que se va a tratar por medio de un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo de atomización o de pulverización, sino también las composiciones comerciales concentradas que deben diluirse antes de la aplicación al
30 cultivo.

Los compuestos de la invención pueden mezclarse también con uno o más insecticidas, fungicidas, bactericidas, acaricidas atrayentes o feromonas u otros compuestos con actividad biológica. Las mezclas así obtenidas tienen un espectro de actividad más amplio. Las mezclas con otros fungicidas son particularmente ventajosas.

Ejemplos de compañeros fungicidas de mezcla adecuados pueden seleccionarse de las siguientes listas:

5 B1) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de ácidos nucleicos como: benalaxil, benalaxil-M, bupirimato, quiralexil, clozylacon, dimetirimol, etirimol, furalaxil, himexazol, metalaxil-M, ofurace, oxadixil, ácido oxolínico ;

B2) un compuesto capaz de inhibir la mitosis y división celular como: benomil, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicuron, tiabendazol, tiofanato-metilo, zoxamida;

10 B3) un compuesto capaz de inhibir la respiración, por ejemplo: como inhibidor de la respiración-CI como diflumetorim;

como inhibidor de la respiración CII como: boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronil, oxicarboxina, pentiopirad, tifulzamida;

15 como inhibidor de la respiración CIII como: azoxistrobina, ciazofamida, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, piraclostrobina, picoxistrobina, trifloxistrobina;

B4) un compuesto capaz de actuar como desacoplador como dinocap, fluazinam;

B5) un compuesto capaz de inhibir la producción de ATP como: acetato de fentín, cloruro de fentín, hidróxido de fentín, siltiofam;

20 B6) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de AA y proteínas como: andoprim, blastidina-S, ciprodinil, kasugamicina, hidrocloreto de kasugamicina hidratado, mepanipirim, pirimetanil;

B7) un compuesto capaz de inhibir la transducción de señales como: fenpiclonil, fludioxonil, quinoxifeno;

25 B8) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de lípidos y membrana como: clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolin, pirazofos, edifenfos, iprobenfos (IBP), isoprotilano, tolclofos-metilo, bifenilo, yodocarb, propamocarb, propamocarb-hidrocloreto;

30 B9) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de ergosterol como: fenhexamid, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefon,

triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalil, sulfato de imazalil, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol, aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin, espiroxamina, naftifina, piributicarb, terbinafina;

- 5 B10) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de la pared celular como: bentiavalicarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas, polioxorim, validamicina A;

B11) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de melanina como: carpropamid, diclocimet, fenoxanil, ftalida, piroquilon, triciclazol;

- 10 B12) un compuesto capaz de inducir una defensa del hospedador como: acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinil;

B13) un compuesto capaz de tener una acción multi-sitio como: captafol, captan, clorotalonil, preparaciones de cobre tales como: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, oxina-cobre y mezcla
15 Bordeaux, diclofluanid, ditianon, dodina, base libre de dodina, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, mancozeb, mancozeb, maneb, metiram, metiram cinc, propineb, azufre y preparaciones de azufre incluyendo: polisulfuro de calcio, tiram, tolilfluanid, zineb, ziram;

- 20 B14) un compuesto seleccionado de la lista siguiente: amibromdol, bentiazol, betoxazin, capsimicina, carvona, chinometionat, cloropicrin, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanil, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofen, dicloran, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, fluopicolida, fluoroimida,
25 hexaclorobenceno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, octilinona, oxamocarb, oxifentiin, pentaclorofenol y sales, 2-fenilfenol y sales, ácido fosforoso y sus sales, piperalin, propanosina-sodio, proquinazid, pirrolnitrina, quintozeno, tecloftalam, tecnazeno, triazóxido, triclámida,
30 zarilamid y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, N-(4-Cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, 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, 3,4,5-

127

triclora-2,6-piridindicarbonitrilo, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-.alfa-(metoximetileno)-bencenoacetato de metilo, 4-Cloro-alfa-propinilo-N-[2-[3-metoxi-4-(2-propinilo)fenil]etil]-bencenoacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1.2.4]triazolo[1.5-a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1.2.4]triazolo[1.5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1.2.4]triazolo[1.5-a]pirimidin-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-iodo-3-propil-benzopiranon-4-ona, N-{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-fenilacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxi-benzamida, 2-[[[1-[3(1Fluoro-2-fenilet)oxi]fenil]etilideno]amino]oxi]metil]-alfa-(metoxiimino)-N-metil-alfaE-bencenoacetamida, N-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carboxílico.

La composición de acuerdo con la invención que comprende una mezcla de un compuesto de fórmula (I) con un compuesto bactericida puede ser también particularmente ventajosa. Ejemplos de compañeros bactericidas de mezcla adecuados pueden seleccionarse en la siguiente lista: bronopol, diclorofen, nitrapirin, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilina, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomycin, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Las composiciones fungicidas de la presente invención se pueden usar para combatir de forma curativa o preventiva los hongos fitopatógenos de los cultivos. Así, de acuerdo con otro aspecto de la presente invención, se proporciona un método para combatir de forma curativa o preventiva los hongos fitopatógenos de cultivos, caracterizado porque se aplica una composición fungicida, como se ha descrito anteriormente en la presente memoria, a la semilla, a la planta y/o al fruto de la planta o al suelo en el que crece o en el que se desea que crezca la planta.

La composición tal como la que se utiliza contra hongos fitopatógenos de los cultivos comprende una cantidad eficaz y no fitotóxica de un material activo de fórmula

general (I).

La expresión "cantidad eficaz y no fitotóxica" se refiere a una cantidad de composición de acuerdo con la invención que es suficiente para combatir o destruir los hongos presentes o que pueden aparecer en los cultivos y que no conlleva ningún
5 síntoma apreciable de fitotoxicidad para dichos cultivos. Dicha cantidad puede variar en un amplio intervalo dependiendo del hongo que se va a combatir, el tipo de cultivo, las condiciones climáticas y los compuestos incluidos en la composición fungicida conforme a la invención.

Esta cantidad se puede determinar por ensayos sistemáticos en campo, que
10 están dentro de las capacidades de un experto en la materia.

El método de tratamiento de acuerdo con la presente invención sirve para tratar material de propagación tal como tubérculos o rizomas, pero también semillas, plantas de semillero o plantas de semillero trasplantadas y plantas o plantas para trasplante. Este método de tratamiento también puede ser útil para tratar raíces. El método de
15 tratamiento de acuerdo con la presente invención también puede ser útil para tratar las partes aéreas de la planta tales como: troncos, tallos o vástagos, hojas, flores y frutos de la planta en cuestión.

Entre las plantas que se pueden proteger por el método de acuerdo con la presente invención se pueden mencionar: algodón; lino; vid; cultivos frutales o
20 vegetales tales como: *Rosaceae* sp. (por ejemplo, frutos con pepitas tales como manzanas y peras, pero también frutos con hueso tales como: albaricoques, almendras y melocotones), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (por ejemplo, árbol del plátano y plataneros), *Rubiaceae*
25 sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (por ejemplo limones, naranjas y pomelos); *Solanaceae* sp. (por ejemplo, tomates), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (por ejemplo, lechugas), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, guisantes), *Rosaceae* sp. (por ejemplo, fresas); grandes cultivos tales como *Graminae* sp. (por ejemplo, maíz, césped
30 o cereales tales como el trigo, arroz, cebada y tritical), *Asteraceae* sp. (por ejemplo, girasol), *Cruciferae* sp. (por ejemplo, colza), *Fabaceae* sp. (por ejemplo cacahuetes), *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, soja), *Solanaceae* sp. (por ejemplo, patatas), *Chenopodiaceae* sp. (por ejemplo, remolachas); cultivos hortícolas y arbóreos; así como los homólogos genéticamente modificados de estos cultivos.

Entre las enfermedades de plantas o cultivos que se pueden controlar por el método de acuerdo con la presente invención, se pueden mencionar :

Enfermedades por mildiu, tales como :

Enfermedades por Blumeria, causadas por ejemplo por *Blumeria graminis*;

5 Enfermedades por Podosphaera, causada por ejemplo por *Podosphaera leucotricha*;

Enfermedades por Sphaerotheca, causadas por ejemplo por *Sphaerotheca fuliginea*;

Enfermedades por Uncinula, causadas por ejemplo por *Uncinula necator*;

10 Enfermedades por roya, tales como:

Enfermedades por Gymnosporangium, causadas por ejemplo por *Gymnosporangium sabinae*;

Enfermedades por Hemileia, causadas por ejemplo por *Hemileia vastatrix*;

15 Enfermedades por Phakopsora, causadas por ejemplo por *Phakopsora pachyrhizi* o *Phakopsora meibomia*;

Enfermedades por Puccinia, causadas por ejemplo por *Puccinia recondita*;

Enfermedades por Uromyces, causadas por ejemplo por *Uromyces appendiculatus*;

Enfermedades por Oomycete tales como :

20 Enfermedades por Bremia, causadas por ejemplo por *Bremia lactucae* ;

Enfermedades por Peronospora, causadas por ejemplo por *Peronospora pisi* o *P. brassicae*;

Enfermedades por Phytophthora, causadas por ejemplo por *Phytophthora infestans* ;

25 Enfermedades por Plasmopara, causadas por ejemplo por *Plasmopara viticola*;

Enfermedades por Pseudoperonospora, causadas por ejemplo por *Pseudoperonospora humuli* o *Pseudoperonospora cubensis*;

Enfermedades por Pythium, causadas por ejemplo por *Pythium ultimum*;

30 Enfermedades por manchas foliares, enrojecimientos foliares y tizón foliar tales como:

Enfermedades por Alternaria, causadas por ejemplo por *Alternaria solani*;

Enfermedades por Cercospora, causadas por ejemplo por *Cercospora beticola*;

Enfermedades por Cladosporium, causadas por ejemplo por *Cladosporium cucumerinum*;

Enfermedades por *Cochliobolus*, causadas por ejemplo por *Cochliobolus sativus*;

Enfermedades por *Colletotrichum*, causadas por ejemplo por *Colletotrichum lindemuthianum*;

5 Enfermedades por *Cycloconium*, causadas por ejemplo por *Cycloconium oleaginum*;

Enfermedades por *Diaporthe*, causadas por ejemplo por *Diaporthe citri*;

Enfermedades por *Elsinoe*, causadas por ejemplo por *Elsinoe fawcettii*;

Enfermedades por *Gloeosporium*, causadas por ejemplo por *Gloeosporium*
10 *laeticolor*;

Enfermedades por *Glomerella*, causadas por ejemplo por *Glomerella cingulata*;

Enfermedades por *Guignardia*, causadas por ejemplo por *Guignardia bidwelli*;

Enfermedades por *Leptosphaeria*, causadas por ejemplo por *Leptosphaeria*
maculans; *Leptosphaeria nodorum*;

15 Enfermedades por *Magnaporthe*, causadas por ejemplo por *Magnaporthe grisea*;

Enfermedades por *Mycosphaerella*, causadas por ejemplo por *Mycosphaerella graminicola*; *Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;

Enfermedades por *Phaeosphaeria*, causadas por ejemplo por *Phaeosphaeria*
20 *nodorum*;

Enfermedades por *Pyrenophora*, causadas por ejemplo por *Pyrenophora teres*;

Enfermedades por *Ramularia*, causadas por ejemplo por *Ramularia collo-cygni*;

Enfermedades por *Rhynchosporium*, causadas por ejemplo por
Rhynchosporium secalis;

25 Enfermedades por *Septoria*, causadas por ejemplo por *Septoria apii* o *Septoria lycopersici*;

Enfermedades por *Typhula*, causadas por ejemplo por *Typhula incarnata*;

Enfermedades por *Venturia*, causadas por ejemplo por *Venturia inaequalis*;

Enfermedades de la raíz y el tallo, tales como :

30 Enfermedades por *Corticium*, causadas por ejemplo por *Corticium graminearum*;

Enfermedades por *Fusarium*, causadas por ejemplo por *Fusarium oxysporum*;

Enfermedades por *Gaeumannomyces*, causadas por ejemplo por
Gaeumannomyces graminis;

- Enfermedades por *Rhizoctonia*, causadas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;
 Enfermedades por *Tapesia*, causadas por ejemplo por *Tapesia acuformis*;
 Enfermedades por *Thielaviopsis*, causadas por ejemplo por *Thielaviopsis basicola*;
- 5 Enfermedades de la mazorca y de la panícula, tales como:
 Enfermedades por *Alternaria*, causadas por ejemplo por *Alternaria spp.*;
 Enfermedades por *Aspergillus*, causadas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;
 Enfermedades por *Cladosporium*, causadas por ejemplo por *Cladosporium spp.*;
- 10 Enfermedades por *Claviceps*, causadas por ejemplo por *Claviceps purpurea*;
 Enfermedades por *Fusarium*, causadas por ejemplo por *Fusarium culmorum*;
 Enfermedades por *Gibberella*, causadas por ejemplo por *Gibberella zeae*;
 Enfermedades por *Monographella*, causadas por ejemplo por *Monographella nivalis*;
- 15 Enfermedades por Carbón y tizón, tales como :
 Enfermedades por *Sphacelotheca*, causadas por ejemplo por *Sphacelotheca reiliana*;
 Enfermedades por *Tilletia*, causadas por ejemplo por *Tilletia caries*;
 Enfermedades por *Urocystis*, causadas por ejemplo por *Urocystis occulta*;
- 20 Enfermedades por *Ustilago*, causadas por ejemplo por *Ustilago nuda*;
 Enfermedades por moho y roña de la fruta tales como:
 Enfermedades por *Aspergillus*, causadas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;
 Enfermedades por *Botrytis*, causadas por ejemplo por *Botrytis cinerea*;
 Enfermedades por *Penicillium*, causadas por ejemplo por *Penicillium expansum*;
- 25 Enfermedades por *Sclerotinia*, causadas por ejemplo por *Sclerotinia sclerotiorum*;
 Enfermedades por *Verticillium*, causadas por ejemplo por *Verticillium alboatrum*;
 Enfermedades por podredumbre de las semillas y del suelo, moho, marchitez,
- 30 roña y caída de almáciga :
 Enfermedades por *Fusarium*, causadas por ejemplo por *Fusarium culmorum*;
 Enfermedades por *Phytophthora*, causadas por ejemplo por *Phytophthora cactorum*;
 Enfermedades por *Pythium*, causadas por ejemplo por *Pythium ultimum*;

Enfermedades por *Rhizoctonia*, causadas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;
 Enfermedades por *Sclerotium*, causadas por ejemplo por *Sclerotium rolfsii*;
 Enfermedades por *Microdochium*, causadas por ejemplo por *Microdochium nivale*;

5 Enfermedades por chancro, rétama, puntiseco tales como:

Enfermedades por *Nectria*, causadas por ejemplo por *Nectria galligena*;

Enfermedades por tizón, tales como:

Enfermedades por *Monilinia*, causadas por ejemplo por *Monilinia laxa*;

Enfermedades por ampolla de la hoja o encrespamiento de la hoja, tales como:

10 Enfermedades por *Taphrina*, causadas por ejemplo por *Taphrina deformans*;

Enfermedades de deterioro de plantas madereras tales como:

Enfermedades por Esca, causadas por ejemplo por *Phaemoniella clamydospora*;

Enfermedades de flores y semillas tales como:

15 Enfermedades por *Botrytis*, causadas por ejemplo por *Botrytis cinerea*;

Enfermedades de tubérculos tales como:

Enfermedades por *Rhizoctonia*, causadas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;

La composición fungicida de acuerdo con la presente invención también se puede usar contra enfermedades fúngicas que pueden desarrollarse sobre la madera o en el interior de la misma. La terminología "madera" se refiere a todos los tipos de especies de madera y a todos los tipos de labores de esta madera destinados a la construcción, por ejemplo, madera maciza, madera de alta densidad, madera laminada y contrachapado. El método para tratar la madera de acuerdo con la invención comprende fundamentalmente poner en contacto uno o más compuestos de la presente invención o una composición de acuerdo con la invención; esto incluye por ejemplo, la aplicación directa, la pulverización, la inmersión, la inyección o cualquier otro medio adecuado.

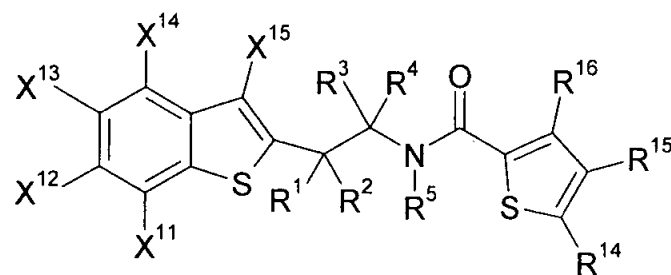
La concentración de material activo aplicada normalmente en el tratamiento de acuerdo con la presente invención se encuentra general y ventajosamente entre 10^{-3} y 8×10^{-2} g/m² (10 y 800 g/ha), preferiblemente, entre 5×10^{-3} y 3×10^{-2} g/m² (50 y 300 g/ha) para aplicaciones en el tratamiento de las hojas. La concentración de sustancia activa aplicada varía de forma general y ventajosa entre 2 y 200 g por 100 kg de semillas, preferiblemente entre 3 y 150 g por 100 kg de semillas en el caso del tratamiento de semillas. Se sobreentiende claramente que las concentraciones indicadas anteriormente

se proporcionan como ejemplos ilustrativos de la invención. Un experto en la materia sabrá como adaptar las concentración de aplicación de acuerdo con la naturaleza del cultivo que se tiene que tratar.

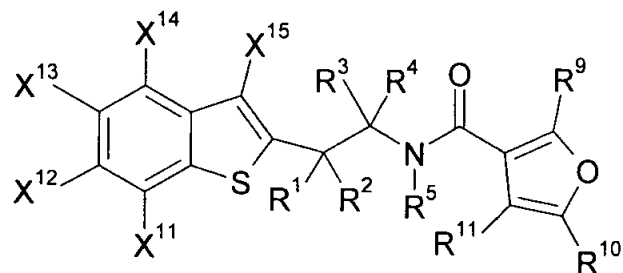
La composición de acuerdo con la presente invención también se puede usar
5 en el tratamiento de organismos modificados genéticamente con los compuestos de acuerdo con la invención o las composiciones agroquímicas de acuerdo con la invención. Las plantas modificadas genéticamente son plantas en cuyo genoma se ha integrado de forma estable un gen heterólogo que codifica una proteína de interés. La expresión "gen heterólogo que codifica una proteína de interés" significa básicamente
10 genes que aportan a la planta transformada nuevas propiedades agronómicas o genes para mejorar la calidad agronómica de la planta transformada.

Las composiciones de acuerdo con la presente invención se pueden utilizar también para la preparación de una composición útil para tratar de forma curativa o preventiva enfermedades micóticas en personas o animales tales como, por ejemplo,
15 micosis, dermatosis, enfermedades por trichophyton y candidiasis o enfermedades causadas por *Aspergillus spp.*, por ejemplo *Aspergillus fumigatus*.

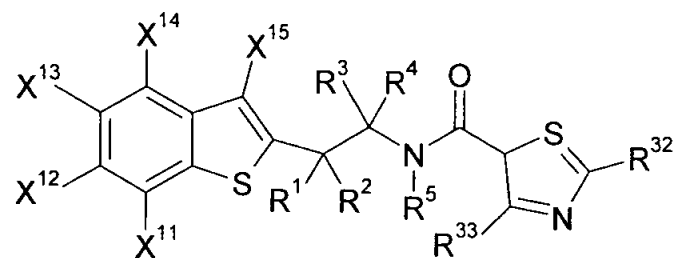
Los aspectos de la presente invención se ilustrarán a continuación con referencia a las siguientes tablas de compuestos y ejemplos. La siguiente Tabla ilustra de una forma no limitativa ejemplos de compuestos fungicidas conforme a la presente
20 invención. En los Ejemplos siguientes, M+1 (o M-1) se refiere al pico del ión molecular, más o menos 1 u.m.a. (unidades de masa atómica), respectivamente, tal como se observa en espectroscopía de masas y M (Apcl+) se refiere al pico del ión molecular que se encontró por ionización química a presión atmosférica positiva en espectroscopía de masas.

Tabla A

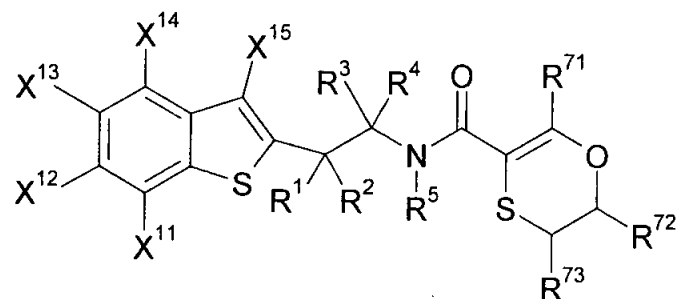
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
A-1	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	Cl	H	CH ₃	414
A-2	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	Cl	H	CH ₃	462
A-3	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	316
A-4	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	CH ₃	380
A-5	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	CH ₃	428

Tabla B

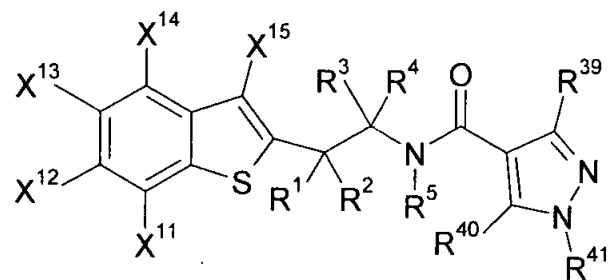
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
B-1	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	Cl	H	CH ₃	348
B-2	H	H	H	H	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	Cl	H	CH ₃	402
B-3	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	446
B-4	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	300
B-5	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	314
B-6	H	H	H	H	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	368
B-7	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	CH ₃	412

Tabla C

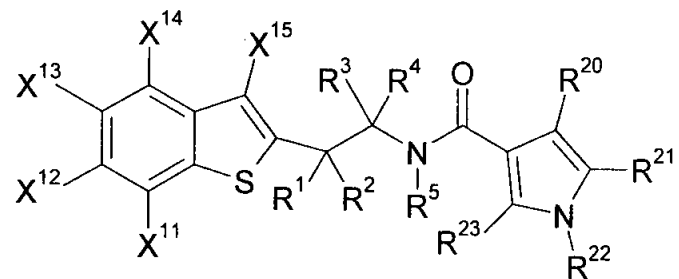
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³²	R ³³	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
C-1	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	Cl	H	CH ₃	419
C-2	H	H	H	H	H	CH ₃	CHF ₂	H	H	Cl	H	CH ₃	401
C-3	H	H	H	H	H	CH ₃	CHF ₂	H	H	H	H	CH ₃	367

Tabla D

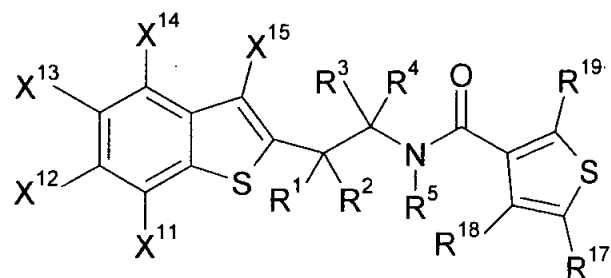
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁷¹	R ⁷²	R ⁷³	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
D-1	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	368
D-2	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	422
D-3	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	334
D-4	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	368

Tabla E

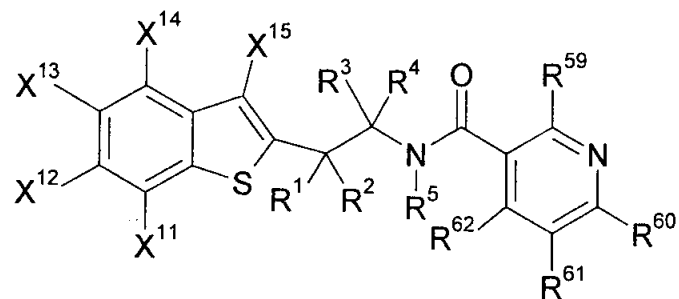
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³⁹	R ⁴⁰	R ⁴¹	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
E-1	H	H	H	H	H	CH ₃	F	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	332
E-2	H	H	H	H	H	CH ₃	F	CH ₃	H	H	Cl	H	CH ₃	366
E-3	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	Cl	H	CH ₃	402
E-4	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	Cl	H	CH ₃	384
E-5	H	H	H	H	H	CH ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	368
E-6	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	350

Tabla F

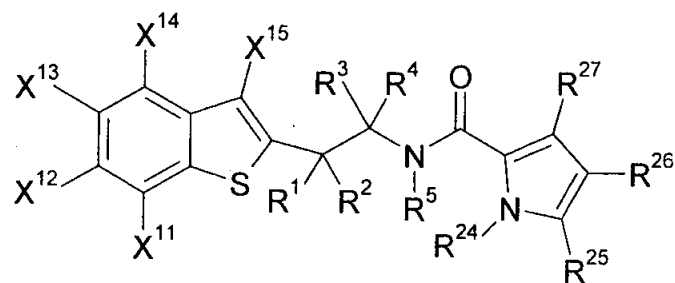
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ²⁰	R ²¹	R ²²	R ²³	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
F-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	Cl	H	CH ₃	401
F-2	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	367

Tabla G

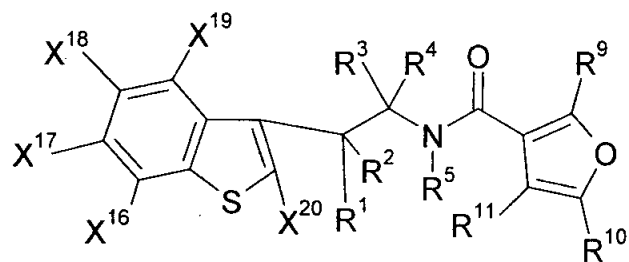
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
G-1	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	Cl	H	CH ₃	462
G-2	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	CH ₃	428

Tabla H

Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁵⁹	R ⁶⁰	R ⁶¹	R ⁶²	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
H-1	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	331
H-2	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	365

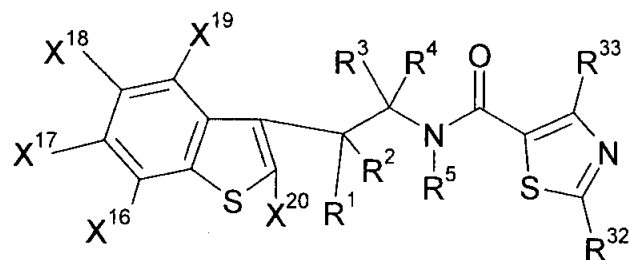
Tabla I

Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ²⁴	R ²⁵	R ²⁶	R ²⁷	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
I-1	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	I	H	H	H	H	CH ₃	425

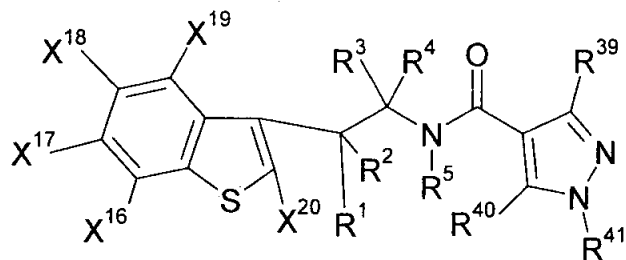
Tabla K

5

Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁰	R ¹⁰	R ¹¹	X ¹⁶	X ¹⁷	X ¹⁸	X ¹⁹	X ²⁰	M+1
K-1	H	H	H	H	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	Cl	H	H	388

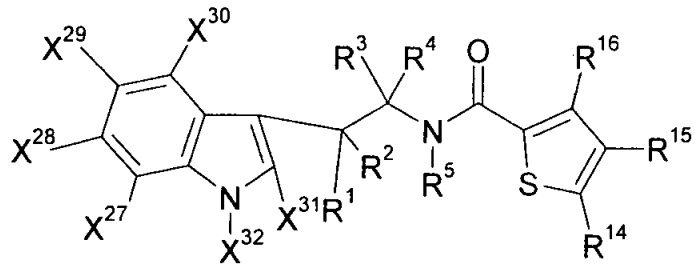
Tabla L

Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³²	R ³³	X ¹⁶	X ¹⁷	X ¹⁸	X ¹⁹	X ²⁰	M+1
L-1	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	Cl	H	H	405
L-2	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	H	H	H	371

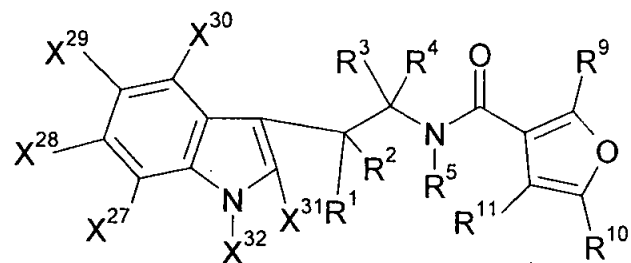
Tabla M

Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³⁹	R ⁴⁰	R ⁴¹	X ¹⁶	X ¹⁷	X ¹⁸	X ¹⁹	X ²⁰	M+1
M-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	Cl	H	H	388
M-2	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	Cl	H	H	370

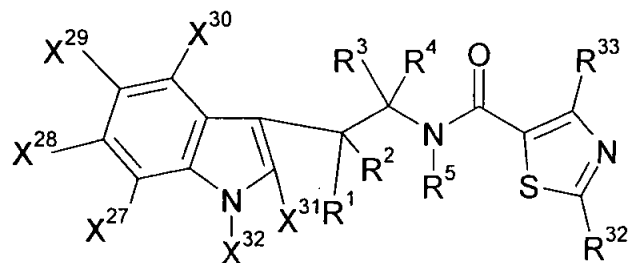
Tabla O



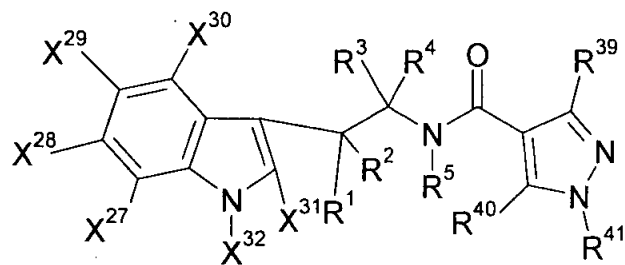
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
O-1	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	CH ₃	H	363
O-2	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	CH ₃	H	411
O-3	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	H	299
O-4	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	OH	H	H	H	301
O-5	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	OMe	H	H	H	379
O-6	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	H	Br	H	H	H	427
O-7	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	CH ₃	411
O-8	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	OMe	H	H	CH ₃	441

Tabla P

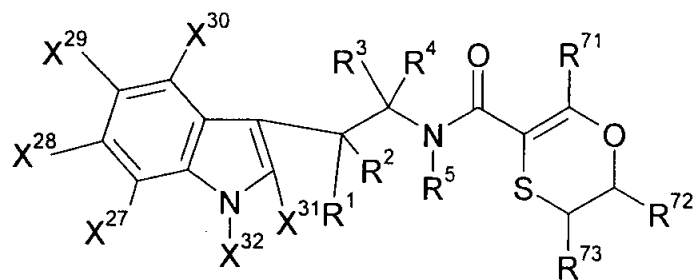
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
P-1	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	283
P-2	H	H	H	H	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	H	351
P-3	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	H	297
P-4	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	395
P-5	H	H	H	H	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	Br	H	H	H	415
P-6	H	H	H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	Br	H	H	H	361
P-7	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	Br	H	H	H	459
P-8	H	H	H	H	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	351

Tabla Q

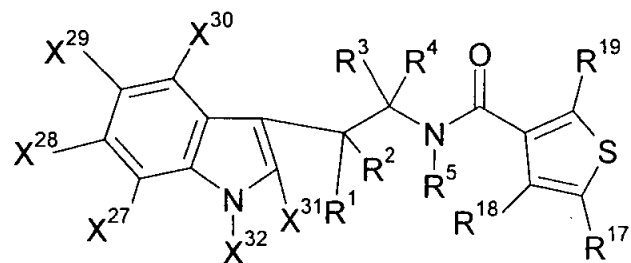
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³²	R ³³	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
Q-1	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	H	H	CH ₃	H	368
Q-2	H	H	H	H	H	CH ₃	CHF ₂	H	H	H	H	CH ₃	H	350
Q-3	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	OMe	H	H	H	384
Q-4	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	Br	H	H	H	432
Q-5	H	H	H	H	H	CH ₃	CHF ₂	H	H	Br	H	H	H	414
Q-6	H	H	H	H	H	CH ₃	CF ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	368
Q-7	H	H	H	H	H	CH ₃	CHF ₂	H	H	H	H	H	CH ₃	350

Tabla R

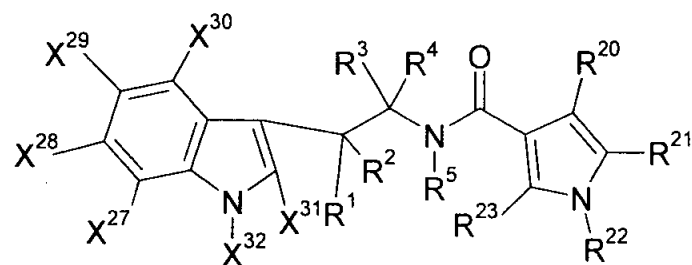
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ³⁹	R ⁴⁰	R ⁴¹	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
R-1	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	OH	H	H	H	335
R-2	H	H	H	H	H	CH ₃	F	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	H	315
R-3	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	H	351
R-4	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	H	333
R-5	H	H	H	H	H	CH ₃	F	CH ₃	H	H	Br	H	H	H	379
R-6	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	Br	H	H	H	415
R-7	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	Br	H	H	H	397
R-8	H	H	H	H	H	CH ₃	F	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	315
R-9	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	351
R-10	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	333
R-11	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	OMe	H	H	CH ₃	381

Tabla S

Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁷¹	R ⁷²	R ⁷³	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
S-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	371
S-2	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	317
S-3	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	OH	H	H	H	373
S-4	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	OMe	H	H	H	387
S-5	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	Br	H	H	H	381
S-6	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	Br	H	H	H	435
S-7	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	317
S-8	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	371

Tabla T

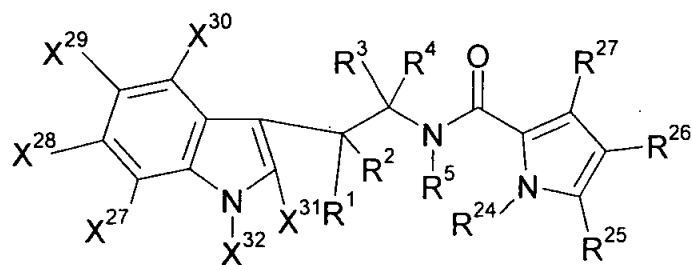
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹⁷	R ¹⁸	R ¹⁹	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
T-1	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	CH ₃	H	411
T-2	H	H	H	H	H	H	H	I	H	H	Br	H	H	H	475

Tabla U

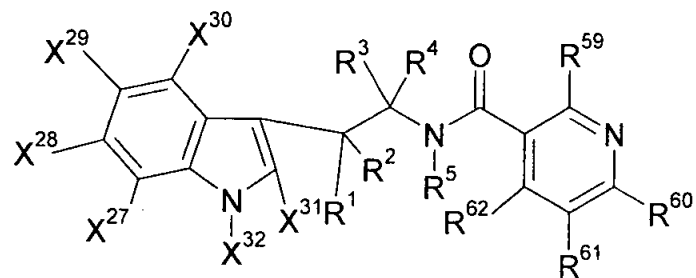
5

Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ²⁰	R ²¹	R ²²	R ²³	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
U-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	H	CH ₃	H	350
U-2	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	Br	H	H	H	414
U-3	H	H	H	H	H	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	CH ₃	350

15A

Tabla V

Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ²⁴	R ²⁵	R ²⁶	R ²⁷	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
V-1	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	I	H	H	H	H	CH ₃	H	408

Tabla W

Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁵⁹	R ⁶⁰	R ⁶¹	R ⁶²	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
W-1	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	MeO	H	H	H	330
W-2	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	OH	H	H	H	316
W-3	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	378
W-4	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	H	H	H	H	Br	H	H	H	392

Ejemplos de procedimientos de preparación del compuesto de fórmula general (I)

5 Síntesis de la N-[2-(1-benzotien-3-il)etil]-3-iodotiofeno-2-carboxamida (Compuesto J-2)

Preparación de [2-(1- benzotien-3-il)etil]carbamato de terc-butilo

10 A una disolución agitada de (1-benzotien-3-il)acetonitrilo (3,00 g; 17,3 mmoles), cloruro de níquel (II) hexahidratado (4,11 g; 17,3 mmoles) y dicarbonato de di-terc-butilo (7,55 g; 34,6 mmoles) en metanol (150 ml) en una atmósfera inerte de nitrógeno se añadió borohidruro de sodio (3,20 g; 84,2 mmoles) en porciones durante un periodo de 10 min, manteniendo la temperatura por debajo de 45 °C. Se agitó la mezcla de reacción durante 16 h y se diluyó con acetato de etilo (300 ml) y se añadió
15 cuidadosamente agua (500 ml). La mezcla se filtró por *kieselghur* y se añadió acetato de etilo (200 ml). La capa orgánica se secó (MgSO₄), se filtró y se concentró a vacío para proporcionar un aceite. La purificación por cromatografía por desorción súbita usando una mezcla 4:1 de Heptano:Acetato de etilo proporcionó 2,07 g (43%) de [2-(1-benzotien-3-il)etil]carbamato de terc-butilo.

20

RMN de ¹H (250 MHz, CDCl₃): δ 7,73 - 7,63 (1H, m); 7,61 - 7,55 (1H, m); 7,29 - 7,14 (2H, m); 7,0 (1H, s); 4,5 - 4,34 (N-H, b); 3,4 - 3,24 (2H, m); 2,94 - 2,80 (2H, m); 1,24 (9H, s);

25 N-[2-(1-benzotien-3-il)etil]-3-iodotiofeno-2-carboxamida (Compuesto J-2)

Se trató una disolución agitada de [2-(5-cloro-1-benzotien-3-il)etil]carbamato de terc-butilo (0,16 g; 0,56 mmoles) en diclorometano (5 ml) con ácido trifluoroacético (0,63 g; 5,60 mmoles) y se agitó la mezcla de reacción a TA durante 24 h. Se añadió
30 cuidadosamente una disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio hasta que terminó la efervescencia. La capa orgánica se secó (MgSO₄), se filtró y se concentró a vacío para proporcionar 0,1 g de 2-(1-benzotien-3-il)etanamina.

Se trató una mezcla de 2-(1- benzotien-3-il)etanamina (100 mg; 0,56 mmoles) y trietilamina (57,0 mg; 0,56 mmoles) en THF (5 ml) con cloruro de 3-iodotiofeno-2-carbonilo (154 mg; 0,56 mmoles) y se calentó la mezcla para hacerla hervir a reflujo
35

164

durante 3 h. Después de enfriar a TA, la mezcla se vertió en agua (15 ml) y se absorbió en acetato de etilo (15 ml). Se secó la capa orgánica (MgSO₄), se filtró y se concentró a vacío. La purificación del residuo por cromatografía por desorción súbita usando una mezcla 4:1 de Heptano:Acetato de etilo proporcionó 120 mg (49%) de N-

5 [2-(1- benzotien-3-il)etil]-3-iodotiofeno-2-carboxamida (Compuesto J-2).

Espectro de Masas: [M+1] = 414.

Ejemplos de actividad biológica del compuesto de fórmula general (I)

10

Ejemplo A : ensayo *in vivo* sobre *Alternaria brassicae* (Mancha de las hojas de las crucíferas)

El ingrediente activo ensayado se prepara mediante homogeneización de

15 Potter en una formulación del tipo suspensión concentrada a 100 g/l. Esta suspensión se diluye a continuación con agua para obtener la concentración de material activo deseada.

Las plantas de rábanos (variedad Pernot), en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 18-20°C, se tratan en el estadio de

20 cotiledón pulverizándolas con la suspensión acuosa descrita anteriormente.

Las plantas, usadas como controles, se tratan con una disolución acuosa que no contiene el material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria brassicae* (40.000 esporas por cm³). Las

25 esporas se han obtenido en un cultivo de 12 a 13 días.

Las plantas de rábano contaminadas se incuban durante 6-7 días a aproximadamente 18°C, en una atmósfera húmeda.

La clasificación se lleva a cabo 6 a 7 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de control.

30 En estas condiciones, se observa protección buena (al menos 50%) o total en una concentración de 500 ppm con los siguientes compuestos: E1, E2, K1, M2, P7, Q5, R6, S5, S6, T2, AA 1 y AC1 y en una concentración de 250 ppm con los siguientes compuestos: A5, B1, B2, B7, C1 y H2.

35

Ejemplo B: ensayo in vivo sobre *Botrytis cinerea* (moho gris del pepino)

El ingrediente activo ensayado se prepara mediante homogeneización de Potter en una formulación del tipo suspensión concentrada a 100 g/l. Esta suspensión
5 se diluye a continuación con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

Las plantas de pepino (variedad Marketer), en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 18-20°C, se tratan en el estado cotiledóneo Z11 pulverizándolos con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las
10 plantas, usadas como controles, se tratan con una disolución acuosa que no contiene el material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan depositando gotas de una suspensión acuosa de esporas de *Botrytis cinerea* (150.000 esporas por ml) sobre la superficie superior de las hojas. Las esporas se recogen de un cultivo de 15 días y se
15 ponen en suspensión en una disolución de nutrientes compuesta de:

- 20 g/l de gelatina
- 50 g/l de azúcar de caña
- 2 g/l de NH_4NO_3
- 1 g/l de KH_2PO_4

20 Las plantas de pepino contaminadas se mantienen durante 5/7 días en una habitación climatizada a 15-11°C (día/noche) y una humedad relativa de 80%.

La clasificación se lleva a cabo 5/7 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de control. En estas condiciones, se observa protección buena (al menos 50%) o total en una concentración de 500 ppm con los siguientes
25 compuestos: E1, E2, E3, E4, C2, F1, G2, H1 y S3.

Ejemplo C : ensayo in vivo sobre *Pyrenophora teres* (manchas reticulares de la cebada)

30 El ingrediente activo ensayado se prepara mediante homogeneización de Potter en una formulación del tipo suspensión concentrada a 100 g/l. Esta suspensión se diluye a continuación con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

Las plantas de cebada (variedad Express), en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 12°C, se tratan en la etapa de 1
35

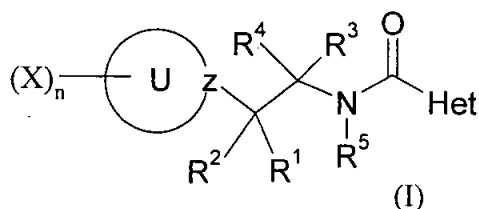
hoja (10 cm), pulverizándolas con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las plantas, usadas como controles, se tratan con una disolución acuosa que no contiene el material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una
5 suspensión acuosa de esporas de *Pyrenophora teres* (12.000 esporas por ml). Las esporas se obtienen de un cultivo de 12 días. Las plantas de cebada contaminadas se incuban durante 24 horas a aproximadamente 20°C y humedad relativa de 100% y a continuación durante 12 días a humedad relativa del 80%.

La clasificación se lleva a cabo 12 días después de la contaminación,
10 comparando con las plantas de control. En estas condiciones, se observa protección buena (al menos 50%) o total en una concentración de 500 ppm con los siguientes compuestos: A1, A2, B3, C2, D1, D2, E1, E2, E3, E4, F1, G1, G2, H1, K1, M2, P5, X1, Y1, Z1 y AB1; en una concentración de 330 ppm con los siguientes compuestos: P4, R1 y U1 y en una concentración de 250 ppm con los siguientes compuestos: A5, B1,
15 B2, B7, C1 y H2.

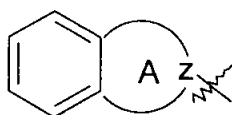
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula general (I):



en la que:

- n es 0, 1, 2, 3, 4, 5 ó 6;
- U es :



en la que A representa un heterociclo de 5 ó 6 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser el mismo o diferentes, condensado con un anillo de fenilo.

- Z es un átomo de carbono o un heteroátomo que no puede estar sustituido por X;

- X es el mismo o diferente y es: un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ⁶-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxycarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-[alquilo C₁-C₆], un alquilo C₁-C₈, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un [alquil C₁-C₈]amino, un halogeno[alquilo C₁-C₈] con 1 a 5 átomos de halógeno, un di-[alquil C₁-C₈]amino, un alcoxi C₁-C₈, un halogenoalcoxi C₁-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfanilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfanilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil C₂-C₈]oxi, un halogeno[alquenil C₂-C₈]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquinil C₃-C₈]oxi, un halogeno[alquinil C₃-C₈]oxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbamoilo, un di-[alquil C₁-C₈]carbamoilo, un N-[alquil C₁-C₈]oxicarbamoilo, un [alcoxi C₁-C₈]carbamoilo, un N-[alquil C₁-C₈]-[alcoxi C₁-C₈]carbamoilo, un [alcoxi C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alcoxi

C₁-C₈]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carboniloxi, un halogeno[alquil C₁-C₈]carboniloxi con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilamino, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilamino con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]aminocarboniloxi, un di-[alquil C₁-C₈]aminocarboniloxi, un
 5 [alquil C₁-C₈]oxicarboniloxi, un [alquil C₁-C₈]sulfenilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfenilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfinilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfinilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alcoxi C₁-C₈]imino, un [(alcoxi C₁-C₈)imino]-[alquilo C₁-C₈], un [(alquenil C₁-C₆)oxiimino]-[alquilo C₁-C₆], un [(alquinil C₁-C₆)oxiimino]-[alquilo C₁-C₆], un (benciloxiimino)-[alquilo C₁-C₆], un benciloxi, un
 10 bencilsulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo un fenilo o un fenilamino;

- R¹ y R² son el mismo o diferentes y son: un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo (hidroxiimino)-alquilo C₁-C₆, un alquilo C₁-C₈, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un
 15 cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C₁-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbamoilo, un di-[alquil C₁-C₈]carbamoilo, un [alcoxi C₁-C₈]carbamoilo, un [alcoxi C₁-C₈]carbonilo o un halogeno[alcoxi C₁-C₈]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno;

20 - R³ y R⁴ son el mismo o diferentes y son: un átomo de hidrógeno, un grupo formilo, un grupo (hidroxiimino)-alquilo C₁-C₆, un alquilo C₁-C₈, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo con 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalquilo C₁-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno;

25 - R⁵ es: un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₆ o un cicloalquilo C₃-C₇;

- Het representa un heterociclo no condensado de 5 ó 6 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser el mismo o diferentes, estando Het unido por un átomo de carbono y estando al menos sustituido en posición orto;

30 así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloides e isómeros ópticamente activos.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado por que n es 0, 1 ó 2.

3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, caracterizado por que X se elige entre: un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo
 35 nitro, un alquilo C₁-C₄, un grupo alcoxi C₁-C₄, un [alquil C₁-C₄]tio, un [alquil C₁-

C₄]sulfonilo o un halogenoalquilo C₁-C₄ con 1 a 5 átomos de halógeno.

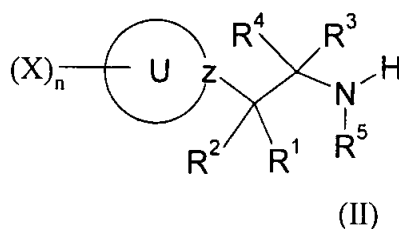
4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, caracterizado por que R¹ y R² se eligen, independientemente uno de otro, entre: un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₈, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C₁-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno.

5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado por que R³ y R⁴ se eligen, independientemente uno de otro, entre: un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₈, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C₁-C₈ con 1 a 5 átomos de halógeno.

6- Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado por que Het se selecciona entre: 2-furano, 3-furano, 4,5-dihidro-3-furano, 2-tiofeno, 3-tiofeno, 2-pirrol, 3-pirrol, 5-oxazol, 4-oxazol, 5-tiazol, 4-tiazol, 5-pirazol, 4-pirazol, 3-pirazol, 3-isoxazol, 4-isoxazol, 5-isoxazol, 3-isotiazol, 4-1,2,3-triazol, 4-tiadiazol, 5-tiadiazol, 2-piridina, 3-piridina, 4-piridina, 2-oxatiina, 4,5-dihidro-3-pirano 4,5-dihidro-2-tiopirano, 4,5-dihidro-3-tiopirano o 2-pirazina.

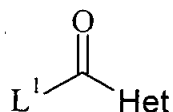
7- Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado por que U se elige entre: un 2-benzotiofeno, un 3-benzotiofeno, un 1-indol, un 2-indol, un 3-indol, un 2-benzofurano, un 3-benzofurano, un 2-benzoxazol, un 2-benzotiazol, un 1-benzimidazol, un 2-benzimidazol, un 3-benz-1,2-isoxazol, un 3-benz-2,1-isoxazol, un 3-benz-1,2-isotiazol, un 3-benz-2,1-isotiazol, un 1-benzopirazol, un 2-benzopirazol, un 3-benzopirazol, una 2-quinolina, una 3-quinolina, una 4-quinolina, una 1-isoquinolina, una 3-isoquinolina, una 4-isoquinolina.

8. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula general (I) como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, que comprende hacer reaccionar un derivado de la benzoheterocicliletilamina de fórmula general (II) o una de sus sales:



en que: U, X, n, z, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ son como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7;

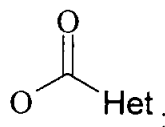
con un derivado de ácido carboxílico de fórmula general (III)



en la que:

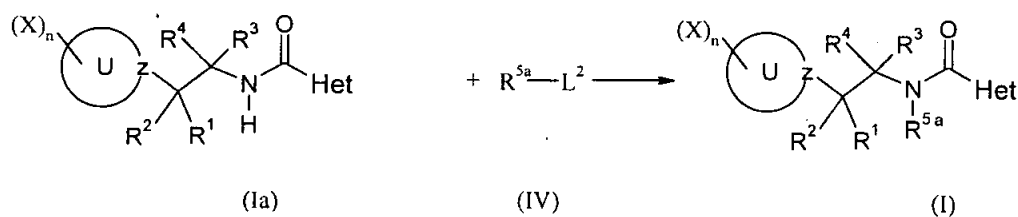
-Het es como se define en la reivindicación 1 o la reivindicación 6;

- 5 - L¹ es un grupo saliente elegido entre: un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, -OR⁶, -OCOR⁶, siendo R⁶: un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula:



- 10 en presencia de un catalizador y, si L¹ es un grupo hidroxilo, en presencia de un agente de condensación.

9. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 8, caracterizado por que R⁵ es un átomo de hidrógeno y por que el procedimiento se completa mediante una etapa adicional de acuerdo con el siguiente esquema de reacción:



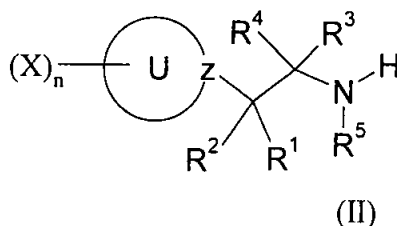
- 15 en el que: - U, X, n, z, R¹, R², R³, R⁴ y Het son como se definió en la reivindicación 8;

- R^{5a} es un alquilo C₁-C₆ o un cicloalquilo C₃-C₇;

- L² es un grupo saliente elegido entre: un átomo de halógeno, un 4-metil-fenilsulfonilo o un metilsulfonilo;

- 20 que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Ia) con un compuesto de fórmula general (IV) para proporcionar un compuesto de fórmula general (I).

10. Un compuesto de fórmula general (II):



en que: U, X, n, z, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ son como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5 ó 7.

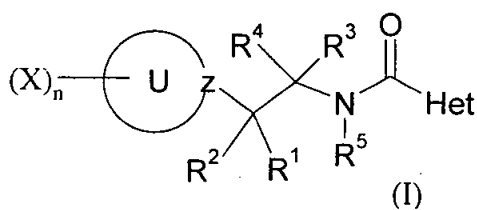
11. Composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 y un soporte
5 aceptable desde el punto de vista agrícola.

12. Método para combatir de forma preventiva o curativa los hongos fitopatogénicos de cultivos, caracterizado por que se aplica una cantidad eficaz y no fitotóxica de una composición de acuerdo con la reivindicación 11 a las semillas de la planta o a las hojas de la planta y/o a los frutos de las plantas o al suelo en el que
10 están creciendo las plantas o en el que se desea que crezcan.

RESUMEN

5 La presente invención se refiere a nuevos derivados de la benzoheterocicliletilcarboxamida de fórmula (I), en la que los sustituyentes son según la memoria descriptiva, su procedimiento de preparación, su uso como fungicidas, particularmente en forma de composiciones fungicidas, métodos para luchar contra hongos fitopatógenos de plantas usando estos compuestos o sus composiciones:

10



INFORME DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Nº de solicitud internacional
PCT/EP2006/063992

A. CLASIFICACIÓN DEL OBJETO DE LA SOLICITUD

INV. C07D333/38 C07D409/12 C07D417/12 C07D411/12 C07D405/12
C07D403/12 C07D401/12 A01N43/12 A01N43/78 A01N43/32
A01N43/56 A01N43/36 A01N43/40 A01N43/38

De acuerdo con la Clasificación Internacional de Patentes (CIP) o según la clasificación nacional y la CIP

B. SECTORES COMPRENDIDOS POR LA BÚSQUEDA

Documentación mínima consultada (sistema de clasificación, seguido de los símbolos de la clasificación)
C07D A01N

Otra documentación consultada, además de la documentación mínima, en la medida en que tales documentos formen parte de los sectores comprendidos por la búsqueda

Bases de datos electrónicas consultadas durante la búsqueda internacional (nombre de la base de datos y, si es posible, términos de búsqueda utilizados)

EPO-Internal, CHEM ABS Data

C. DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES

Categoría *	Documentos citados, con indicación, si procede, de las partes relevantes	Relevante para las reivindicaciones N°
X	CN 1 166 637 C (CHINA AGRICULTURE UNIVERSITY) 15 Septiembre 2004 (15-09-2004) página 2, fórmula [1]; página 6, primera fórmula; páginas 8 y 9, páginas 13-15, 17-24, fórmula; página 24, líneas 6-10 -----	1-5,7, 11,12
A	WO 03/042184 A (NOVARTIS AG; NOVARTIS PHARMA GMBH; DUCRAY, PIERRE; GOEBEL, THOMAS) 22 Mayo 2003 (22-05-2003) citado en la solicitud reivindicación 1; ejemplo 1 ----- -/--	1,8,10

* En la continuación del recuadro C se relacionan otros documentos.

* Los documentos de familia de patentes se indican en el anexo.

* Categorías especiales de los documentos citados:

"A" documento que define el estado general de la técnica no considerado como particularmente relevante

"E" solicitud de patente o patente anterior pero publicada en la fecha de presentación internacional o en fecha posterior

"L" documento que puede plantear dudas sobre una reivindicación de prioridad o que se cita para determinar la fecha de publicación de otra cita o por una razón especial (como la indicada)

"O" documento que se refiere a una divulgación oral, a una utilización, a una exposición o a cualquier otro medio

"P" documento publicado antes de la fecha de presentación internacional pero con posterioridad a la fecha de prioridad reivindicada

"T" documento ulterior publicado con posterioridad a la fecha de presentación internacional o de prioridad que no pertenece al estado de la técnica pertinente pero que se cita por permitir la comprensión del principio o teoría que constituye la base de la invención

"X" documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse nueva o que implique una actividad inventiva por referencia al documento aisladamente considerado

"Y" documento particularmente relevante; la invención reivindicada no puede considerarse que implique una actividad inventiva cuando el documento se asocia a otros documentos de la misma naturaleza, cuya combinación resulta evidente para un experto en la materia.

"Z" documento que forma parte de la misma familia de patentes

Fecha en que se ha concluido efectivamente la búsqueda internacional

8 Agosto 2006

Fecha de expedición del informe de búsqueda internacional

17/08/2006

Nombre y dirección postal de la ISA
Oficina Europea de Patentes, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HL Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax. (+31-70) 340-3016

Funcionario autorizado

Hass, C

N^o de solicitud internacional

PCT/EP2006/063992

INFORME DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

C. (Continuación) DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES		
Categoría *	Documentos citados, con indicación, si procede, de las partes relevantes	Relevante para las reivindicaciones N ^o
A	BURDICK D J ET AL: "N-Benzoyl Amino Acids As LFA-1/ICAM Inhibitors 1: Amino Acid Structure-Activity Relationship" BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, OXFORD, GB Vol. 13, no. 6, 2003, páginas 1015-1018, XP002313197 ISSN: 0960-894X página 1015, columna de la derecha, figura 2, "Series 1"; página 1016, columna de la derecha, tabla 1, compuesto 4	1
A	----- EP 1 428 817 A (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD) 16 Junio 2004 (16-06-2004) tablas 11,12,35 -----	1

INFORME DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Información relativa a miembros de familia de patentes

Nº de solicitud internacional
PCT/EP2006/063992

Documento de patente citado en el informe de búsqueda	Fecha de publicación	Miembro(s) de la familia de patentes	Fecha de publicación
CN 1166637 C	15-09-2004	CN 1365971 A	28-08-2002
WO 03042184 A	22-05-2003	BR 0214151 A	14-09-2004
		CA 2466971 A1	22-05-2003
		CN 1599725 A	23-03-2005
		EP 1446386 A1	18-08-2004
		JP 2005518351 T	23-06-2005
		MX PA04004605 A	07-03-2005
		NZ 532864 A	25-11-2005
		US 2005026972 A1	03-02-2005
EP 1428817 A	16-06-2004	CA 2460789 A1	03-04-2003
		WO 03027059 A1	03-04-2003
		US 2004254237 A1	16-12-2004

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No
PCT/EP2006/063992

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER				
INV.	C07D333/38	C07D409/12	C07D417/12	C07D411/12
	C07D403/12	C07D401/12	A01N43/12	A01N43/78
	A01N43/56	A01N43/36	A01N43/40	A01N43/38
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC				
B. FIELDS SEARCHED				
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)				
C07D A01N				
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched				
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)				
EPO-Internal, CHEM ABS Data				
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT				
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages			Relevant to claim No.
X	CN 1 166 637 C (CHINA AGRICULTURE UNIVERSITY) 15 September 2004 (2004-09-15) page 2, formula [1]; page 6, first formula; pages 8 and 9, pages 13-15, 17-24, formulae; page 24, lines 6-10			1-5, 7, 11, 12
A	WO 03/042184 A (NOVARTIS AG; NOVARTIS PHARMA GMBH; DUCRAY, PIERRE; GOEBEL, THOMAS) 22 May 2003 (2003-05-22) cited in the application claim 1; example 1			1, 8, 10

-/--				
☒ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.				
* Special categories of cited documents : *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance *E* earlier document but published on or after the international filing date *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified) *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed *T* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention *X* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone *Y* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art. *&* document member of the same patent family				
Date of the actual completion of the international search			Date of mailing of the international search report	
8 August 2006			17/08/2006	
Name and mailing address of the ISA/ European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016			Authorized officer Hass, C	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2006/063992

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
CN 1166637	C	15-09-2004	CN 1365971 A	28-08-2002
WO 03042184	A	22-05-2003	BR 0214151 A	14-09-2004
			CA 2466971 A1	22-05-2003
			CN 1599725 A	23-03-2005
			EP 1446386 A1	18-08-2004
			JP 2005518351 T	23-06-2005
			MX PA04004605 A	07-03-2005
			NZ 532864 A	25-11-2005
			US 2005026972 A1	03-02-2005
EP 1428817	A	16-06-2004	CA 2460789 A1	03-04-2003
			WO 03027059 A1	03-04-2003
			US 2004254237 A1	16-12-2004

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCTNOTIFICATION CONCERNING
SUBMISSION OR TRANSMITTAL
OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

To:

GUITTON, Carole
BAYER CROPSCIENCE SA
Patents & Licensing Department
14/20 Rue Pierre Baizet
F-69009 Lyon
FRANCE

Date of mailing (day/month/year) 29 November 2006 (29.11.2006)	
Applicant's or agent's file reference BCS 05-4021	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP2006/063992	International filing date (day/month/year) 06 July 2006 (06.07.2006)
International publication date (day/month/year) Not yet published	Priority date (day/month/year) 12 July 2005 (12.07.2005)
Applicant BAYER CROPSCIENCE SA et al	

- By means of this Form, which replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents, the applicant is hereby notified of the date of receipt by the International Bureau of the priority document(s) relating to all earlier application(s) whose priority is claimed. Unless otherwise indicated by the letters "NR", in the right-hand column or by an asterisk appearing next to a date of receipt, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).
- (If applicable)* The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which, **on the date of mailing of this Form, had not yet been received by the International Bureau** under Rule 17.1(a) or (b). Where, under Rule 17.1(a), the priority document must be submitted by the applicant to the receiving Office or the International Bureau, but the applicant fails to submit the priority document within the applicable time limit under that Rule, **the attention of the applicant is directed** to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.
- (If applicable)* An asterisk (*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b) (the priority document was received after the time limit prescribed in Rule 17.1(a) or the request to prepare and transmit the priority document was submitted to the receiving Office after the applicable time limit under Rule 17.1(b)). Even though the priority document was not furnished in compliance with Rule 17.1(a) or (b), the International Bureau will nevertheless transmit a copy of the document to the designated Offices, for their consideration. In case such a copy is not accepted by the designated Office as the priority document, Rule 17.1(c) provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

Priority date	Priority application No.	Country or regional Office or PCT receiving Office	Date of receipt of priority document
12 July 2005 (12.07.2005)	05356117.1	EP	06 November 2006 (06.11.2006)

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer Yolaine Cussac
Facsimile No. +41 22 338 82 70	Facsimile No. +41 22 338 70 80 Telephone No. +41 22 338 90 12

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

(Chapter I of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Rule 44bis)

Applicant's or agent's file reference BCS 05-4021	FOR FURTHER ACTION		See item 4 below
International application No. PCT/EP2006/063992	International filing date (day/month/year) 06 July 2006 (06.07.2006)	Priority date (day/month/year) 12 July 2005 (12.07.2005)	
International Patent Classification (8th edition unless older edition indicated) See relevant information in Form PCT/ISA/237			
Applicant BAYER CROPSCIENCE SA			

1.	This international preliminary report on patentability (Chapter I) is issued by the International Bureau on behalf of the International Searching Authority under Rule 44 bis.1(a).		
2.	This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet.		
In the attached sheets, any reference to the written opinion of the International Searching Authority should be read as a reference to the international preliminary report on patentability (Chapter I) instead.			
3.	This report contains indications relating to the following items:		
☒	Box No. I	Basis of the report	
☐	Box No. II	Priority	
☐	Box No. III	Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability	
☐	Box No. IV	Lack of unity of invention	
☒	Box No. V	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement	
☐	Box No. VI	Certain documents cited	
☐	Box No. VII	Certain defects in the international application	
☒	Box No. VIII	Certain observations on the international application	
4.	The International Bureau will communicate this report to designated Offices in accordance with Rules 44bis.3(c) and 93bis.1 but not, except where the applicant makes an express request under Article 23(2), before the expiration of 30 months from the priority date (Rule 44bis .2).		

The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland		Date of issuance of this report 16 January 2008 (16.01.2008)
Facsimile No. +41 22 338 82 70		Authorized officer Yolaine Cussac
Form PCT/IB/373 (January 2004)		e-mail: pt11.pct@wipo.int

PATENT COOPERATION TREATY

From the
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

PCT

To:

see form PCT/ISA/220

WRITTEN OPINION OF THE INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY (PCT Rule 43bis.1)

Date of mailing
(day/month/year) see form PCT/ISA/210 (second sheet)

Applicant's or agent's file reference
see form PCT/ISA/220

FOR FURTHER ACTION
See paragraph 2 below

International application No.
PCT/EP2006/063992

International filing date (day/month/year)
06.07.2006

Priority date (day/month/year)
12.07.2005

International Patent Classification (IPC) or both national classification and IPC
INV. C07D333/38 C07D409/12 C07D417/12 C07D411/12 C07D405/12 C07D403/12 C07D401/12 A01N43/12
A01N43/78 A01N43/32 A01N43/56 A01N43/36 A01N43/40 A01N43/38

Applicant
BAYER CROPSCIENCE SA

1. This opinion contains indications relating to the following items:

- ☒ Box No. I Basis of the opinion
- ☐ Box No. II Priority
- ☐ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- ☐ Box No. IV Lack of unity of invention
- ☒ Box No. V Reasoned statement under Rule 43bis.1(a)(i) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- ☐ Box No. VI Certain documents cited
- ☐ Box No. VII Certain defects in the international application
- ☒ Box No. VIII Certain observations on the international application

2. **FURTHER ACTION**

If a demand for international preliminary examination is made, this opinion will usually be considered to be a written opinion of the International Preliminary Examining Authority ("IPEA") except that this does not apply where the applicant chooses an Authority other than this one to be the IPEA and the chosen IPEA has notified the International Bureau under Rule 66.1bis(b) that written opinions of this International Searching Authority will not be so considered.

If this opinion is, as provided above, considered to be a written opinion of the IPEA, the applicant is invited to submit to the IPEA a written reply together, where appropriate, with amendments, before the expiration of 3 months from the date of mailing of Form PCT/ISA/220 or before the expiration of 22 months from the priority date, whichever expires later.

For further options, see Form PCT/ISA/220.

3. For further details, see notes to Form PCT/ISA/220.

Name and mailing address of the ISA:



European Patent Office - Gitschiner Str. 103
D-10958 Berlin
Tel. +49 30 25901 - 0
Fax: +49 30 25901 - 840

Date of completion of
this opinion

see form
PCT/ISA/210

Authorized Officer

Hass, C

Telephone No. +49 30 25901-340



**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY**

International application No.
PCT/EP2006/063992

Box No. I Basis of the opinion

1. With regard to the **language**, this opinion has been established on the basis of:
 - ☒ the international application in the language in which it was filed
 - ☐ a translation of the international application into , which is the language of a translation furnished for the purposes of international search (Rules 12.3(a) and 23.1 (b)).
2. With regard to any **nucleotide and/or amino acid sequence** disclosed in the international application and necessary to the claimed invention, this opinion has been established on the basis of:
 - a. type of material:
 - ☐ a sequence listing
 - ☐ table(s) related to the sequence listing
 - b. format of material:
 - ☐ on paper
 - ☐ in electronic form
 - c. time of filing/furnishing:
 - ☐ contained in the international application as filed.
 - ☐ filed together with the international application in electronic form.
 - ☐ furnished subsequently to this Authority for the purposes of search.
3. ☐ In addition, in the case that more than one version or copy of a sequence listing and/or table relating thereto has been filed or furnished, the required statements that the information in the subsequent or additional copies is identical to that in the application as filed or does not go beyond the application as filed, as appropriate, were furnished.
4. Additional comments:

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY**

International application No.
PCT/EP2006/063992

Box No. V Reasoned statement under Rule 43*bis*.1(a)(i) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Yes: Claims	1-12
	No: Claims	
Inventive step (IS)	Yes: Claims	
	No: Claims	1-12
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	1-12
	No: Claims	

2. Citations and explanations

see separate sheet

Box No. VIII Certain observations on the international application

The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

see separate sheet

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING
AUTHORITY (SEPARATE SHEET)**

International application No.

PCT/EP2006/063992

Re Item V

**Reasoned statement with regard to novelty, inventive step or industrial applicability;
citations and explanations supporting such statement**

V.1 Cited documents

- D1: CN-C-1 166 637 (CHINA AGRICULTURE UNIVERSITY) 15 September 2004 (2004-09-15)
D2: WO 03/042184 A (NOVARTIS AG; NOVARTIS PHARMA GMBH; DUCRAY, PIERRE; GOEBEL, THOMAS) 22 May 2003 (2003-05-22)
D3: BURDICK D J ET AL: "N-Benzoyl Amino Acids as LFA-1/ICAM Inhibitors 1: Amino Acid Structure-Activity Relationship" BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, OXFORD, GB, vol. 13, no. 6, 2003, pages 1015-1018, XP002313197 ISSN: 0960-894X
D4: EP-A-1 428 817 (ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD) 16 June 2004 (2004-06-16)

The indicated designations will be used throughout the procedure.

V.2 Novelty

The subject-matter of present claim 1 is different from D1 and from compound 4 of D3 with regard to the moiety "Het".

The subject-matter of claim 1 is different from D2 since neither R³ nor R⁴ of present formula (I) can be -CN.

The subject-matter of claim 1 differs from D4 in that in the D4 compounds the R¹- and R²-corresponding groups are always combined with their C atom to a C=O group.

The subject-matter of the claims on file is thus novel.

V.3 Inventive step

V.3.1 According to the description, the problem underlying the present application can be seen in the provision of further compounds having fungicidal properties.

V.3.2 D2, D3 and D4 are silent of fungicidal activity. Therefore the closest prior art is

D1, which comes structurally very close to the present compounds and which discloses compounds apparently having fungicidal properties (see D1, page 24).

V.3.3 The only structural difference to the D1 compounds is the moiety "Het", which is always phenyl in D1. "Het" must always be at least mono-substituted; the phenyl ring in D1 can also be substituted (which is actually verified in D1). "Het" can also be pyridinyl, which comes structurally very close to phenyl.

V.3.4 The skilled person, in order to solve the above-defined problem, would certainly modify the published phenyl substituent of the D1 compound such that it would be replaced by any heterocycle (e.g. pyridine). Since phenyl and pyridinyl are classical isosteres, it could be expected that the modified compounds, in view of D1, in principle would also exhibit fungicidal activity.

V.3.5 Consequently, the solution of the problem as defined above must be considered obvious in view of D1. Inventive step must be denied for all claims on file (claims 1-12).

V.4 Industrial applicability

The subject-matter of claims 1-12 is industrially applicable.

Re Item VIII

Certain observations on the international application

"Het" is defined as "being at least substituted in ortho position". However, no concrete substituents are given in this connection. But since "Het" seems to represent the only novelty feature which makes the application different from D1, the substituents of "Het" should have been properly defined. At the moment, however, the term "substituted" is considered unclear in the sense of Art. 6 PCT.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-010094- -00000-0000

Fecha: 2008-02-01 16:57:28 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 192

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 102,600
FECHA : DICIEMBRE 18 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	72421434	17/12/2007	68,183,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN 482,000.00
			TOTAL : \$ 482,000.00

CON: CUATROCIENTOS OCHENTA Y DOS MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 80017602

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 932
FECHA : ENERO 3 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

POSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	4051023	03/01/2008	12,953,500.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	998 VALOR COMPLEMENTO TARIFA A#0 ANTR
		TOTAL :	\$ 3,000.00

SON: TRES MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 08-010094-00000-0000

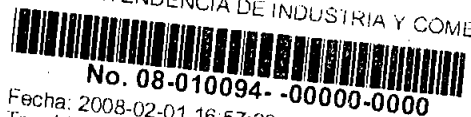
Fecha: 2008-02-01 16:57:28 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTE IYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 192

01

188

000000014

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-010094-00000-0000

Fecha: 2008-02-01 16:57:28 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 192

NIT: 800170000

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 07 - 53,022
FECHA : JUNIO 29 DE 2007

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	Nº. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
RAISBECK LARA RODRIGUEZ	CONSIGNACION	BANCO POPULAR	050-00110-6	49375977	29/06/2007	64,444,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	5,000.00
		TOTAL :	\$ 5,000.00

SON: CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

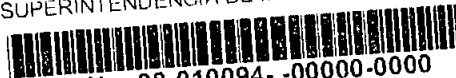
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 8001761

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-010094- -00000-0000

Fecha: 2008-02-01 16:57:28 Dep. 2020 NUECREACIONE
Tia. 11 PATENTEIYII Eva: 373 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 192

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 1,138
FECHA : ENERO 3 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

OSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	4051023	03/01/2008	12,953,500.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	21 CERTIFICACIONES
			11,000.00
		TOTAL :	\$ 11,000.00

SON: ONCE MIL PESOS

RESPONSABLE :

.CIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No.

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT		190
(21) N° de solicitud:		(51) Int Cl: C07D 333/38, A01N 43/12, A01N 43/32, A01N 43/36, A01N 43/38, A01N 43/40, A01N 43/56, A01N 43/78, C07D 401/12, C07D 403/12, C07D 405/12, C07D 409/12, C07D 411/12, C07D 417/12		
22) Fecha de solicitud:		(71) Solicitante(s) BAYER CROPSCIENCE S.A.		
(30) Prioridad	(31) No. 05356117.1	32) Fecha 12/07/05	(33) País EP	(72) Inventor(es) MANSFIELD, Darren COQUERON, Pierre-Yves y otros (74) Apoderado: ALVARO CORREA ORDOÑEZ
(85)	Fecha limite inicio fase nacional: 12/02/08		(87) Publicación internacional	
(86)	Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT		Fecha: 18/01/07	
	Fecha de presentación de la solicitud: 06/07/06		N° publicación: WO/2007/006739	
	No. de solicitud PCT/EP2006/063992			
(54) Titulo: NUEVOS DERIVADOS DE LA BENZOHETEROCICLILETILCARBOXAMIDA				

La presente invención se refiere a nuevos derivados de la benzoheterocicliletilcarboxamida de fórmula (I), en la que los sustituyentes son según la memoria descriptiva, su procedimiento de preparación, su uso como fungicidas, particularmente en forma de composiciones fungicidas, métodos para luchar contra hongos fitopatógenos de plantas usando estos compuestos o sus composiciones:



Fecha: 2008-02-01 16:57:28
Tra. 11 PATENTE IYII
Act. 411 PRESENTACION
Dep. 2020 NUECREACION
Eve: 378 FASENACIONAL
Folios: 192



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACIÓN Y AGILIZACIÓN DEL TRAMITE

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

Firma Responsable:

Fecha:

FEBRERO 1, 2008

REPUBLICA DE COLOMBIA
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

Bogotá,
2020

Doctor(a)
CORREA ORDOÑEZ ALVARO
Apoderado(a) y/o Representante de
BAYER CROPSCIENCE S.A.

REFERENCIA	Radicación No.	8 10094
	Solicitud internacional	PCT/EP2006/063992
	Fecha inicio fase nacional	12/02/2008
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	2717

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 Unica 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 52 FEB. 2008
jfernand