



Organización CSA Ltda.

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

PCT

SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION

08-10096

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO « NUEVOS DERIVADOS DE LA

BENZOHETEROCICLILETILBENZAMIDA⁷¹



51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE BAYER PROSCIENCE S.A.

DOMICILIO LYON, FRANCIA

74. APODERADO ALVARO CORREA ORDÓÑEZ.
T.P. 20.281

22. BOGOTÁ, D. C., FEBRERO 1, 2008

PETITORIO

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-010096-00000-0000

Fecha: 2008-02-01 17:00:06
Tra. 11 PATENTEIYII
Act. 411 PRESENTACIONDep. 2020 NUECREACION
Eve: 378 FASENACIONALI
Folios: 148

ión

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

12 Feb 2008

①

SOLICITUD DE :

☒

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☒

Capítulo I.

☐

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)

(72)

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 Tourvén, 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

⑤

PCT (85)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2006/063987

Fecha 06-JUL-06

Publicación Internacional No. WO/2007/006734

Fecha 18-ENE-07

⑥

Título (54)

NUEVOS DERIVADOS DE LA BENZOHETEROCICLILETILBENZAMIDA

⑦

Clasificación Internacional (51)

C07D 209/16, A01N 43/12, A01N 43/38, A01N 43/42, A01N 43/52, C07D 215/12, C07D 235/14, C07D 307/81, C07D 333/58, C07D 333/62

⑧

Prioridad

SI

☒

NO

☐

(33) País de Origen

EP

(32) Fecha

12-JUL-05

(31) Número de Solicitud

05356116.3

⑨

Comprobante de pago No.

Fecha

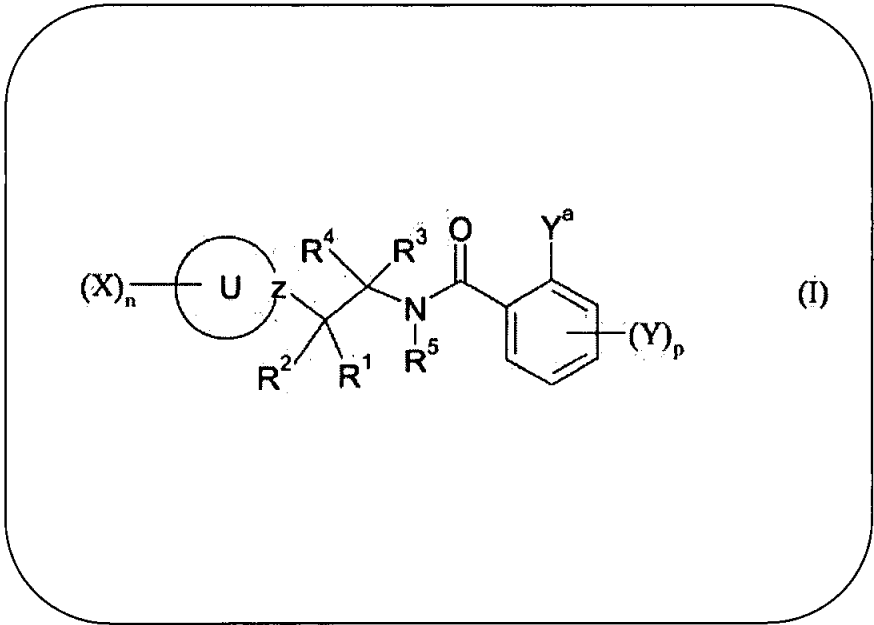
Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página

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 ORDÓÑEZ

FIRMA:

C/C: 79.143.366 de Usaquén T.P.: 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- 2005.



BAKER & MCKENZIE

Raisbeck, 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.**

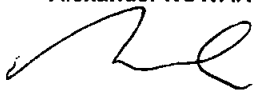
with domicile at Av. 82 No. 10 – 62, 6th floor, of Bogotá D. C., Colombia, a full and sufficient power of attorney to obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities 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^e GAREL-GALATI
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

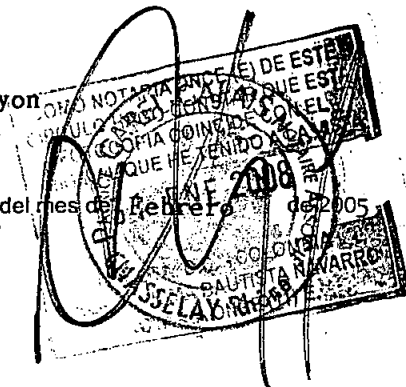
declara por el presente que otorga a

**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



APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

Colombie

- 1. — République française
- Le représentant public
- 2. — a été signé par GARZEL GARCIA, Patrice
- 3. — en sa qualité de Notaire
- 4. — est revêtu du sceau de son étude
- à CHASSELAY (69)

Attesté

à Lyon le 16/10/05

Par le Procureur général près la cour d'appel

sous n° 273

10. — Signature



[Signature]

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

BAKER & MCKENZIE

2

NOTARIAL CERTIFICATION

On this _____ day of 10 Mars
2005, the undersigned Notary

CERTIFIES**Alexander NOWAK**

1. That _____
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 Crop Science 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 _____
mayor y domiciliado en Neunhouse Wej 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:

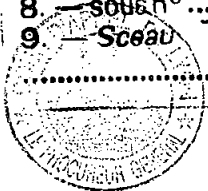


APOSTILLE
(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

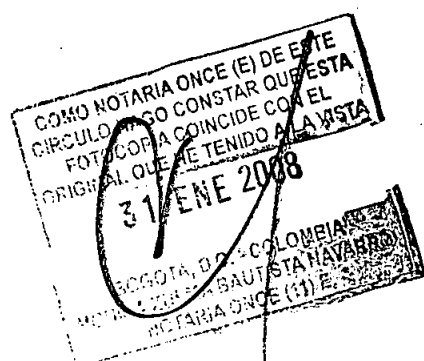
- Colombie.....
1. — République française
Le présent acte public
2. — a été signé par BOREL Gilbert Rédic
3. — agissant en qualité de Natale
4. — est revêtu du sceau de son étude à
Chapelain (Monsieur)

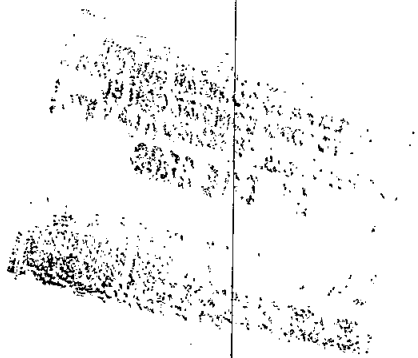
Attesté

5. — à Monsieur 6. — le 12 Mars 2005
7. — Par le Procureur général près la cour d'appel
8. — sous n° 152
9. — Sceau 10. — Signature



[Handwritten signature]







PCT

1 2 3 4 5 6 7 8 9 10 11 12 13 14 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28 29 30 31 32 33 34 35 36 37 38 39 40 41 42 43 44 45 46 47 48 49 50 51 52 53 54 55 56 57 58 59 60 61 62 63 64 65 66 67 68 69 70 71 72 73 74 75 76 77 78 79 80 81 82 83 84 85 86 87 88 89 90 91 92 93 94 95 96 97 98 99 100 101 102 103 104 105 106 107 108 109 110 111 112 113 114 115 116 117 118 119 120 121 122 123 124 125 126 127 128 129 130 131 132 133 134 135 136 137 138 139 140 141 142 143 144 145 146 147 148 149 150 151 152 153 154 155 156 157 158 159 160 161 162 163 164 165 166 167 168 169 170 171 172 173 174 175 176 177 178 179 180 181 182 183 184 185 186 187 188 189 190 191 192 193 194 195 196 197 198 199 200 201 202 203 204 205 206 207 208 209 210 211 212 213 214 215 216 217 218 219 220 221 222 223 224 225 226 227 228 229 230 231 232 233 234 235 236 237 238 239 240 241 242 243 244 245 246 247 248 249 250 251 252 253 254 255 256 257 258 259 260 261 262 263 264 265 266 267 268 269 270 271 272 273 274 275 276 277 278 279 280 281 282 283 284 285 286 287 288 289 290 291 292 293 294 295 296 297 298 299 300 301 302 303 304 305 306 307 308 309 310 311 312 313 314 315 316 317 318 319 320 321 322 323 324 325 326 327 328 329 330 331 332 333 334 335 336 337 338 339 340 341 342 343 344 345 346 347 348 349 350 351 352 353 354 355 356 357 358 359 360 361 362 363 364 365 366 367 368 369 370 371 372 373 374 375 376 377 378 379 380 381 382 383 384 385 386 387 388 389 390 391 392 393 394 395 396 397 398 399 400 401 402 403 404 405 406 407 408 409 410 411 412 413 414 415 416 417 418 419 420 421 422 423 424 425 426 427 428 429 430 431 432 433 434 435 436 437 438 439 440 441 442 443 444 445 446 447 448 449 450 451 452 453 454 455 456 457 458 459 460 461 462 463 464 465 466 467 468 469 470 471 472 473 474 475 476 477 478 479 480 481 482 483 484 485 486 487 488 489 490 491 492 493 494 495 496 497 498 499 500 501 502 503 504 505 506 507 508 509 510 511 512 513 514 515 516 517 518 519 520 521 522 523 524 525 526 527 528 529 530 531 532 533 534 535 536 537 538 539 540 541 542 543 544 545 546 547 548 549 550 551 552 553 554 555 556 557 558 559 560 561 562 563 564 565 566 567 568 569 570 571 572 573 574 575 576 577 578 579 580 581 582 583 584 585 586 587 588 589 590 591 592 593 594 595 596 597 598 599 600 601 602 603 604 605 606 607 608 609 610 611 612 613 614 615 616 617 618 619 620 621 622 623 624 625 626 627 628 629 630 631 632 633 634 635 636 637 638 639 640 641 642 643 644 645 646 647 648 649 650 651 652 653 654 655 656 657 658 659 660 661 662 663 664 665 666 667 668 669 670 671 672 673 674 675 676 677 678 679 680 681 682 683 684 685 686 687 688 689 690 691 692 693 694 695 696 697 698 699 700 701 702 703 704 705 706 707 708 709 710 711 712 713 714 715 716 717 718 719 720 721 722 723 724 725 726 727 728 729 730 731 732 733 734 735 736 737 738 739 740 741 742 743 744 745 746 747 748 749 750 751 752 753 754 755 756 757 758 759 760 761 762 763 764 765 766 767 768 769 770 771 772 773 774 775 776 777 778 779 780 781 782 783 784 785 786 787 788 789 790 791 792 793 794 795 796 797 798 799 800 801 802 803 804 805 806 807 808 809 810 811 812 813 814 815 816 817 818 819 820 821 822 823 824 825 826 827 828 829 830 831 832 833 834 835 836 837 838 839 840 841 842 843 844 845 846 847 848 849 850 851 852 853 854 855 856 857 858 859 860 861 862 863 864 865 866 867 868 869 870 871 872 873 874 875 876 877 878 879 880 881 882 883 884 885 886 887 888 889 890 891 892 893 894 895 896 897 898 899 900 901 902 903 904 905 906 907 908 909 910 911 912 913 914 915 916 917 918 919 920 921 922 923 924 925 926 927 928 929 930 931 932 933 934 935 936 937 938 939 940 941 942 943 944 945 946 947 948 949 950 951 952 953 954 955 956 957 958 959 960 961 962 963 964 965 966 967 968 969 970 971 972 973 974 975 976 977 978 979 980 981 982 983 984 985 986 987 988 989 990 991 992 993 994 995 996 997 998 999 1000 1001 1002 1003 1004 1005 1006 1007 1008 1009 1010 1011 1012 1013 1014 1015 1016 1017 1018 1019 1020 1021 1022 1023 1024 1025 1026 1027 1028 1029 1030 1031 1032 1033 1034 1035 1036 1037 1038 1039 1040 1

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).

PCT/EP2006/063987

(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

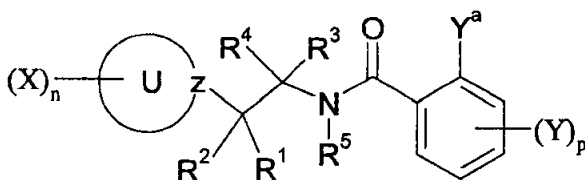
For two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guidance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the beginning of each regular issue of the PCT Gazette.

(I) **(57) Abstract:** The present invention relates to novel benzoheterocyclylethylbenzamide 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, and methods for the control of phytopathogenic fungi of plants

I

(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). **GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire** [FR/FR]; Le Trève

(54) Title: NEW BENZOHETEROCYCLYLETHYLBENZAMIDE DERIVATIVES



using these compounds or their compositions.

WO 2007/006734 A1

New Benzoheterocyclylethylbenzamide derivatives

The present invention relates to novel benzoheterocyclylethylbenzamide
5 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.

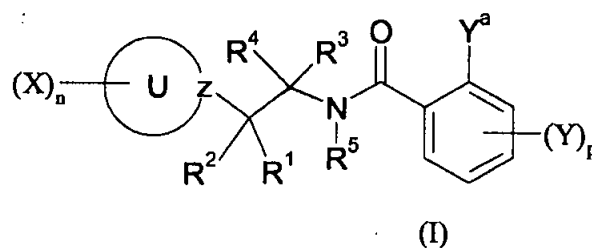
In the Chinese patent application CN 1365971, certain
10 benzoheterocyclylethylbenzamide derivatives in which the benzoheterocycle is the 3-
1*H*-2*H*-indolyl are generically embraced in a broad disclosure of numerous *N*-
acyltryptamine compounds. However, the said compounds are not included in the
benzoheterocyclylethylbenzamide derivatives concerned by the present invention,
and in addition, this document does not specifically disclose nor suggest to select
15 such compounds.

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.

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

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

25

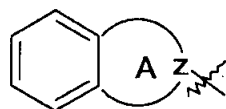


in which :

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

- p is 1, 2, 3 or 4;

- U is :



wherein A represents a 5- or 6-membered heterocycle with one, two or three
 5 heteroatoms which may be the same or different; fused with a phenyl ring to form a
 benzoheterocycle provided that this benzoheterocycle is different from 3-1H-2H-
 indolyl

- 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
 10 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-
 15 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-
 20 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
 25 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
 30 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 ;

5 - 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-halogenoalkyl having 1
10 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 carbamoyl group, a (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a C₁-C₈-alkyl, a C₂-
15 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 or a C₁-C₈-alkoxycarbamoyl ;

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

20 - Y is the same or different and is a hydrogen atom, a halogen atom, a nitro group, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ⁶-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-
25 alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₁-C₈-alkylamino, a di-C₁-C₈-alkylamino, a C₁-C₈-alkoxy, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, 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
30 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-

12

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 or a (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl; and

- Y^a is a halogen atom, a cyano group, a sulfanyl group, a pentafluoro-λ⁶-sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino 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-alkoxy, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, 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-halogenoalkyl-

13
sulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₆-alkoxyimino, a (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkenyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl or a (C₁-C₆-alkynyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl;

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

In an embodiment of the present invention, 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 to form a benzoheterocycle provided that this
10 benzoheterocycle is different from 3-2H-indolyl, then Z, X, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, Y, Y^a are as defined above.

In the context of the present invention :

- halogen means fluorine, bromine, chlorine or iodine.
- 15 -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.

20 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
25 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
30 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 mixtures, in all proportions. The geometric isomers can be separated according to
5 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 tautomeric forms of such compounds are also part of the present invention. More
10 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.

15 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 heterocyclylethylbenzamide derivative of general formula (I) in which the different characteristics may be chosen alone or in combination as being :

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

25 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 a benzoheterocyclylethylbenzamide derivative of general formula (I) in which the different characteristics may be chosen alone or in combination as being :

- 30 - 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,

- 15 a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms; and
- 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,
- 5 a C₃-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

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.

10

According to the present invention, the phenyl moiety is substituted in the ortho position by Y^a and may be substituted in any other position by (Y)_p, in which Y^a, Y and p are defined as above. Preferably, the present invention relates to a benzoheterocyclylethylbenzamide derivative of the general formula (I) in which the different characteristics may be chosen alone or in combination as being:

15

-as regards Y^a, Y^a is chosen as being a halogen atom, a pentafluoro-λ⁶-sulfanyl group, a C₁-C₈-alkyl, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms;

20

-as regards p, p is 1;

as regards Y, Y is chosen as being a hydrogen atom or a halogen atom, more preferably Y is a hydrogen atom.

25 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 benzoheterocyclylethylbenzamide derivative of general formula (I) in which the different characteristics may be chosen alone or in combination as being :

30

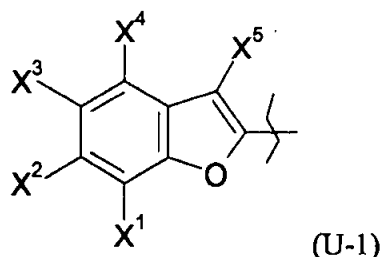
- U is chosen as being a 2-benzothiophene, a 3-benzothiophene, a 1-indole, a 2-indole, a 3-indole provided it is substituted in the 1- or in the 2- position, a 2-

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 :

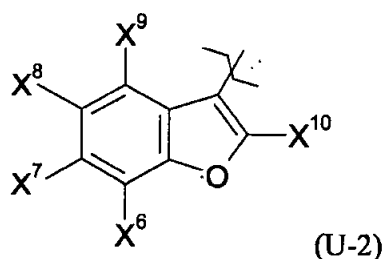
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-1)



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

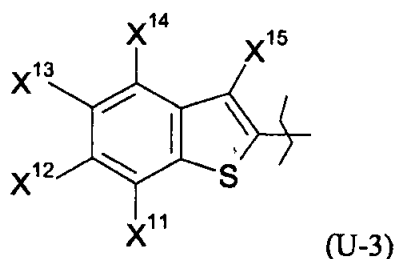
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-2)



in which :

- 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 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.

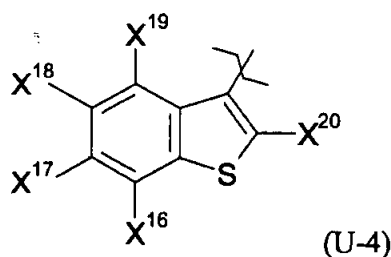
- * U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-3)



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 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

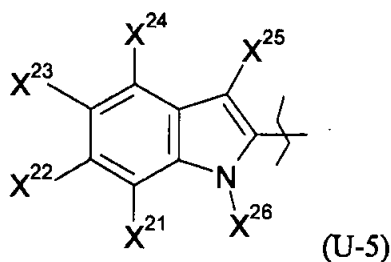
- * U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-4)



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.

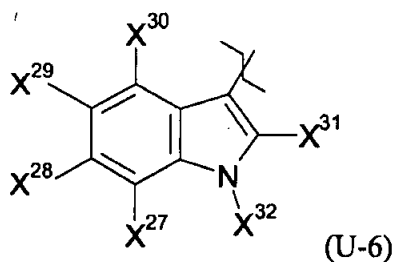
- * U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-5)



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 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

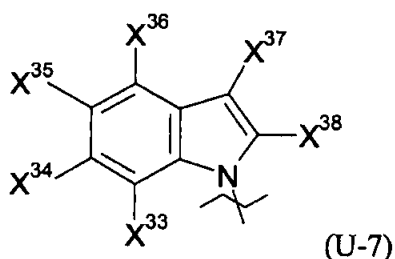
- * U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-6)



in which :

- X²⁷, X²⁸, X²⁹, X³⁰, X³¹ and X³² 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; provided that X³¹ and X³² are not both a hydrogen atom

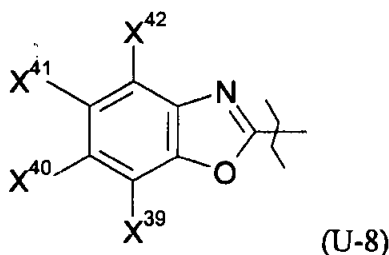
- * U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-7)



in which :

- X³³, X³⁴, X³⁵, X³⁶, X³⁷ and X³⁸ 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.

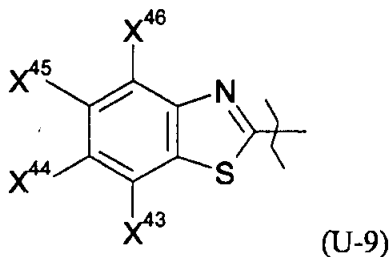
- * U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-8)



in which :

- 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 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.

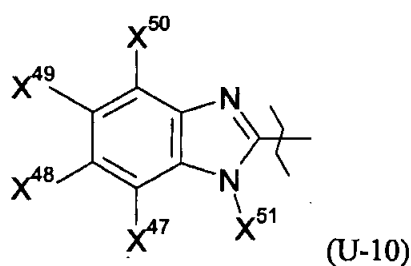
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-9)



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 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.

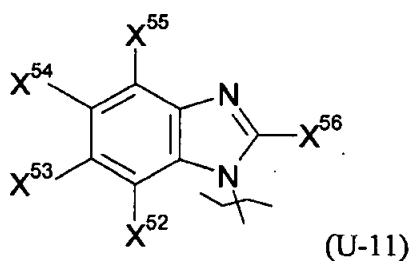
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-10)



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 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.

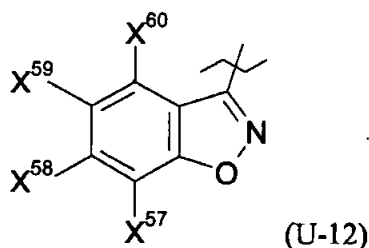
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-11)



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 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.

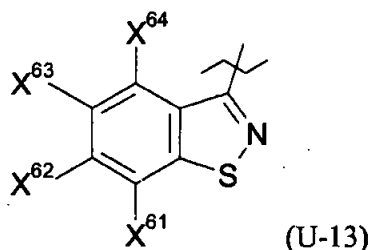
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-12)



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.

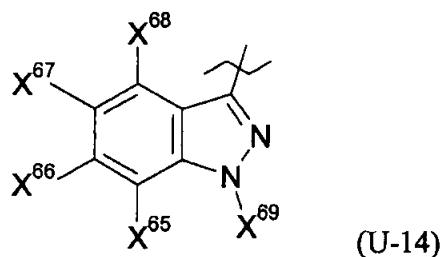
* U represents a benzoheterocycle of the general formula (U-13)



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.

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

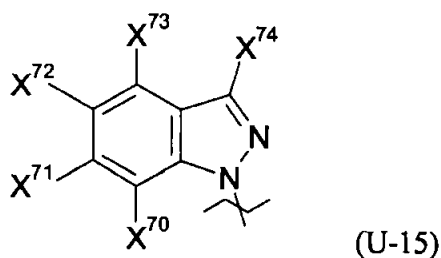


in which :

- X^{65} , X^{66} , X^{67} , X^{68} and X^{69} may be the same or different and may be a
 5 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)

10



in which :

- X^{70} , X^{71} , X^{72} , X^{73} and X^{74} may be the same or different and may be a
 15 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)

20

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.

The first step (step B-1) according to the present invention may be conducted in the presence of a buffer. Preferably the buffer is AcONH_4 .

The second step (step B-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 LiAlH_4 , NaBH_4 , KBH_4 , B_2H_6 .

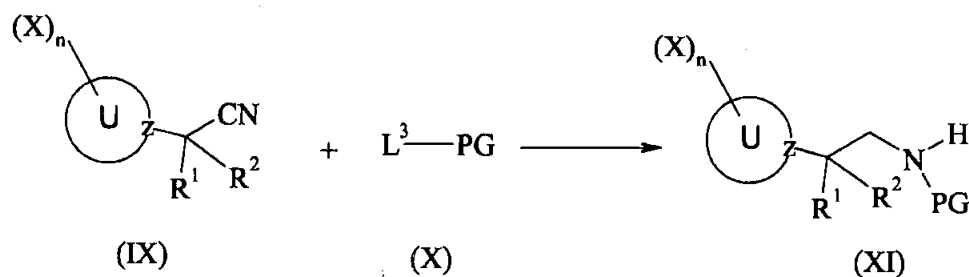
The second step (step B-2) according to the present invention is conducted at a temperature of from 0°C to 200°C . Preferably the temperature is of from 10°C to 120°C . More preferably, the temperature is of from 10°C to 80°C .

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.

When R^5 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;

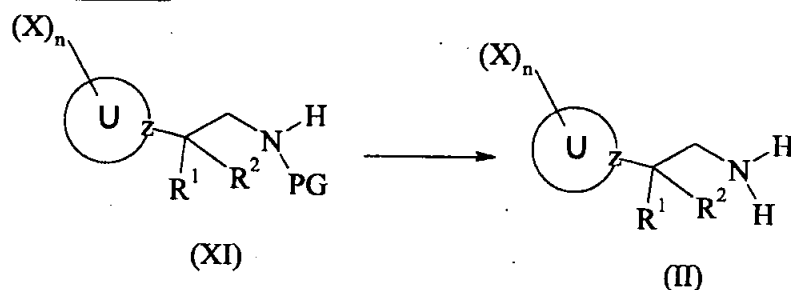
- L³ is a leaving group chosen as being a -OR⁷ group or a -OCOR⁷ group, R⁷ being a C₁-C₆ alkyl, a C₁-C₆ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

- PG represents a protecting group which may be a $-\text{COOR}^7$ group or $-\text{COR}^7$ group, R^7 being a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ 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;

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

Scheme C-2



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

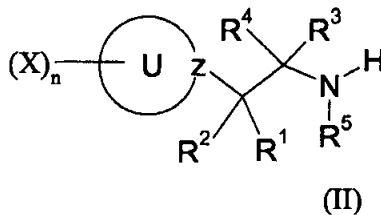
20 - PG represents a protecting group which may be a $-\text{COOR}^7$ group or $-\text{COR}^7$ group, R^7 being a $\text{C}_1\text{-C}_6$ alkyl, a $\text{C}_1\text{-C}_6$ haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl or pentafluorophenyl;

comprising a deprotection reaction, in an acidic or in a basic medium, of a compound of general formula (XI) to provide an amine derivative of general formula (II) or one of its salt.

The compound according to the present invention can be prepared according to the general processes of preparation described above. It will nevertheless be understood that, on the basis of his general knowledge and of available publications, the skilled worker will be able to adapt this method according to the specifics of each of the compounds, which it is desired to synthesise.

On the basis of his general knowledge and of available publications, the skilled worker will also be able to prepare intermediate compounds of formula (V) (VII) and (IX) according to the present invention.

The present invention also relates to a benzoheterocyclylethylamine derivative of general formula (II) or one of its salt, and to its use as intermediate compound in the processes of preparation described above:



in which U, X, n, Z, R¹, R², R³, R⁴ and R⁵ are as defined above;

The present invention also relates to a fungicidal composition comprising an effective amount of an active material of general formula (I). Thus, according to the present invention, there is provided a fungicidal composition comprising, as an active ingredient, an effective amount of a compound of general formula (I) as defined above and an agriculturally acceptable support, carrier or filler.

In the present specification, the term "support" denotes a natural or synthetic, organic or inorganic material with which the active material is combined to make it easier to apply, notably to the parts of the plant. This support is thus generally inert and should be agriculturally acceptable. The support may be a solid or a liquid. Examples of suitable supports include clays, natural or synthetic silicates, silica, resins, waxes, solid fertilisers, water, alcohols, in particular butanol, organic solvents,

mineral and plant oils and derivatives thereof. Mixtures of such supports may also be used.

The composition may also comprise additional components. In particular, the composition may further comprise a surfactant. The surfactant can be an emulsifier, a dispersing agent or a wetting agent of ionic or non-ionic type or a mixture of such surfactants. Mention may be made, for example, of polyacrylic acid salts, lignosulphonic acid salts, phenolsulphonic or naphthalenesulphonic acid salts, polycondensates of ethylene oxide with fatty alcohols or with fatty acids or with fatty amines, substituted phenols (in particular alkylphenols or arylphenols), salts of sulphosuccinic acid esters, taurine derivatives (in particular alkyl taurates), phosphoric esters of polyoxyethylated alcohols or phenols, fatty acid esters of polyols, and derivatives of the above compounds containing sulphate, sulphonate and phosphate functions. The presence of at least one surfactant is generally essential when the active material and/or the inert support are water-insoluble and when the vector agent for the application is water. Preferably, surfactant content may be comprised between 5% and 40% by weight of the composition.

Optionally, additional components may also be included, e.g. protective colloids, adhesives, thickeners, thixotropic agents, penetration agents, stabilisers, sequestering agents. More generally, the active materials can be combined with any solid or liquid additive, which complies with the usual formulation techniques.

In general, the composition according to the invention may contain from 0.05 to 99% (by weight) of active material, preferably 10 to 70% by weight.

Compositions according to the present invention can be used in various forms such as aerosol dispenser, capsule suspension, cold fogging concentrate, dustable powder, emulsifiable concentrate, emulsion oil in water, emulsion water in oil, encapsulated granule, fine granule, flowable concentrate for seed treatment, gas (under pressure), gas generating product, granule, hot fogging concentrate, macrogranule, microgranule, oil dispersible powder, oil miscible flowable concentrate, oil miscible liquid, paste, plant rodlet, powder for dry seed treatment, seed coated with a pesticide, soluble concentrate, soluble powder, solution for seed treatment, suspension concentrate (flowable concentrate), ultra low volume (ulv) liquid, ultra low volume (ulv) suspension, water dispersible granules or tablets, water

dispersible powder for slurry treatment, water soluble granules or tablets, water soluble powder for seed treatment and wettable powder.

These compositions include not only compositions which are ready to be applied to the plant or seed to be treated by means of a suitable device, such as a 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 diflumerimor;

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, quinoxifen;

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, pyrifenoxy, 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 bentiavalicarb, 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, mancozeb, 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, 5 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, 10 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, 15 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- α -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.

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
5 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
10 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
15 plantins), *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
20 instance maize, lawn or cereals such as wheat, rice, barley and triticale), *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.

25 Among the diseases of plants or crops that can be controlled by the method 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*;

30 Sphaerotheca diseases, caused for example by *Sphaerotheca fuliginea*;

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*;

Phakopsora diseases, caused for example by *Phakopsora pachyrhizi* or
5 *Phakopsora meibomiae*;

Puccinia diseases, caused for example by *Puccinia recondita*;

Uromyces diseases, caused for example by *Uromyces appendiculatus*;

Oomycete diseases such as :

Bremia diseases, caused for example by *Bremia lactucae*;

10 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 humuli* or *Pseudoperonospora cubensis*;

15 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*;

Cladosporium diseases, caused for example by *Cladosporium cucumerinum*;

20 Cochliobolus diseases, caused for example by *Cochliobolus sativus*;

Colletotrichum diseases, caused for example by *Colletotrichum lindemuthianum*;

Cycloconium diseases, caused for example by *Cycloconium oleaginum*;

Diaporthe diseases, caused for example by *Diaporthe citri*;

25 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*;

30 *Leptosphaeria nodorum*;

Magnaporthe diseases, caused for example by *Magnaporthe grisea*;

- 44
- Mycosphaerella diseases, caused for example by *Mycosphaerella graminicola*;
Mycosphaerella arachidicola; *Mycosphaerella fijiensis*;
Phaeosphaeria diseases, caused for example by *Phaeosphaeria nodorum*;
Pyrenophora diseases, caused for example by *Pyrenophora teres*;
5 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*;
Venturia diseases, caused for example by *Venturia inaequalis*;
- 10 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*
graminis;
- 15 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 :
Alternaria diseases, caused for example by *Alternaria spp.*;
- 20 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*;
Gibberella diseases, caused for example by *Gibberella zeae*;
- 25 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*;
Urocystis diseases, caused for example by *Urocystis occulta*;
- 30 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*;
Sclerotinia diseases, caused for example by *Sclerotinia sclerotiorum*;
Verticillium diseases, caused for example by *Verticillium alboatrum*;
- 5 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*;
Pythium diseases, caused for example by *Pythium ultimum*;
Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani*;
- 10 Sclerotium diseases, caused for example by *Sclerotium rolfsii*;
Microdochium diseases, caused for example by *Microdochium nivale*;
Canker, broom and dieback diseases such as :
Nectria diseases, caused for example by *Nectria galligena*;
Blight diseases such as :
- 15 Monilinia diseases, caused for example by *Monilinia laxa*;
Leaf blister or leaf curl diseases such as :
Taphrina diseases, caused for example by *Taphrina deformans*;
Decline diseases of wooden plants such as :
Esca diseases, caused for example by *Phaemoniella clamydospora*;
- 20 Diseases of flowers and Seeds such as :
Botrytis diseases, caused for example by *Botrytis cinerea*;
Diseases of tubers such as :
Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani*.
- 25 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
30 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.

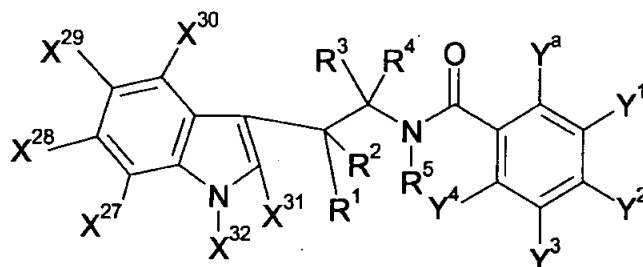
The dose of active material usually applied in the treatment according to the present invention is generally and advantageously between 10 and 800 g/ha, preferably between 50 and 300 g/ha for applications in foliar treatment. The dose of active substance applied is generally and advantageously between 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.

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 "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.

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*.

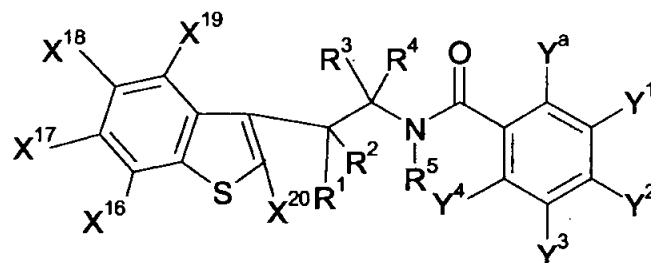
The aspects of the present invention will now be illustrated with reference to the following tables of compounds and examples. The following Table illustrates in a non-limiting manner examples of fungicidal compounds according to the present invention. In the following Examples, M+1 (or M-1) means the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

Table A



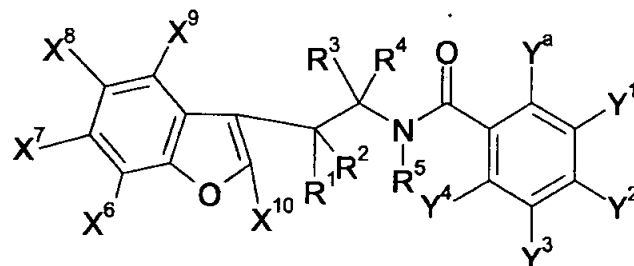
Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
A-1	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	329
A-2	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	293
A-3	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	347
A-4	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	329
A-5	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	OMe	H	H	CH ₃	329
A-6	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	H	H	OMe	H	H	CH ₃	388
A-7	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	OMe	H	H	CH ₃	435

Table B

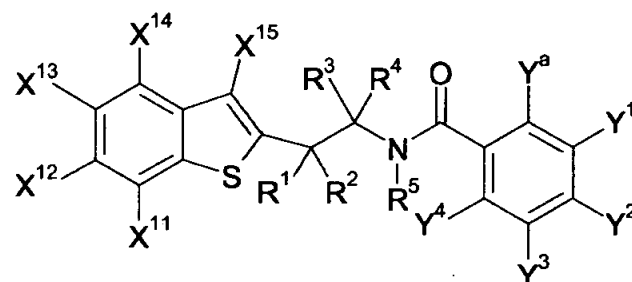
[illegible]

4a

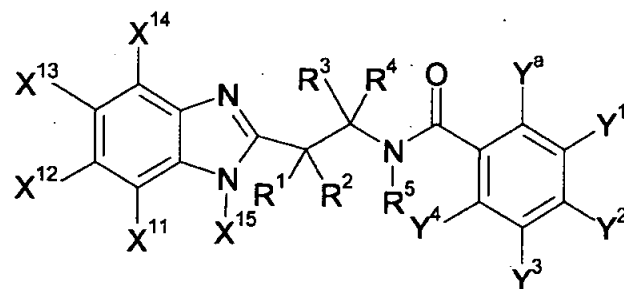
Table C



Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹	X ¹⁰	M+1
C-1	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	H	H	H	H	H	344
C-2	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	H	H	H	392
C-3	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	H	334

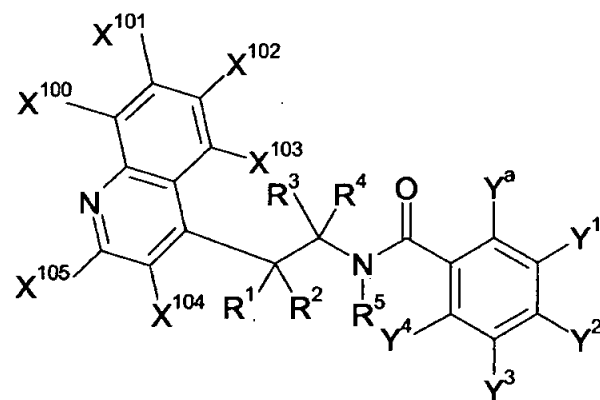
**Table D**

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
D-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	364
D-2	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	398
D-3	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	422
D-4	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	374
D-5	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	408
D-6	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	364
D-7	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	330
D-8	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	456
D-9	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	380
D-10	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	310
D-11	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	346

Table E

Cmpd	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
E-1	Me	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	362
E-2	Me	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	420

Table F

[illegible]

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

Synthesis of N-[2-(5-chloro-1-benzothien-3-yl)ethyl]-2-(trifluoromethyl)

benzamide (Compound B-4)

Preparation of tert-butyl [2-(5-chloro-1-benzothien-3-yl)ethyl]carbamate

To a stirred solution of (5-chloro-1-benzothien-3-yl) acetonitrile (5.30 g, 25.6 mmol),
10 Nickel (II) chloride hexahydrate (6.05 g, 25.6 mmol), and di-*tert*-butyl dicarbonate
(11.1 g, 51.0 mmol) in methanol (150 mL) under an inert atmosphere of nitrogen was
added sodium borohydride (4.8 g, 126 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 washed with brine (300 mL). The organic
15 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 7.8 g (98%) of *tert*-butyl [2-(5-chloro-1-benzothien-3-yl)ethyl]carbamate.

¹HNMR (250MHz, CDCl₃): δ 7.76 - 7.69 (2H, m); 7.36 - 7.15 (2H, m); 4.72 - 4.60
20 (N-H, b); 3.57 - 3.40 (2H, m); 3.1 - 2.95 (2H, m); 1.4 (9H, s).

Preparation of 2-(5-chloro-1-benzothien-3-yl)ethanamine

25

A stirred solution of *tert*-butyl [2-(5-chloro-1-benzothien-3-yl)ethyl]carbamate (7.8
g, 25.1 mmol) in dichloromethane (100 mL) was treated with trifluoroacetic acid
(28.5 g, 250 mmol) and the reaction mixture was stirred at RT for 16 h. An aqueous
30 solution of sodium hydroxide (200 mL, 1N) was carefully added and the temperature
was maintained below 20 °C. The reaction mixture was stirred for 30 min and the

organic layer was dried (MgSO₄), filtered and concentrated *in vacuo* to afford 4.9 g of the desired amine (92%).

¹HNMR (250MHz, CDCl₃): δ 7.82 - 7.70 (2H, m); 7.4 - 7.1 (2H, m); 3.16 - 2.90 (4H, m); 1.6 - 1.4 (NH₂, b).

The hydrochloride salt was obtained by addition of ethereal hydrochloric acid and filtration of the colorless precipitate.

Synthesis of N-[2-(5-chloro-1-benzothien-3-yl)ethyl]-2-(trifluoromethyl) benzamide (Compound B-4)

A mixture of 2-(5-chloro-1-benzothien-3-yl)ethanamine (90.0 mg, 42.5 mmol) and triethylamine (43.5 mg, 42.5 mmol) in THF (5 mL) was treated with 2-trifluoromethylbenzoyl chloride (89.0 mg, 42.5 mmol) and the mixture was heated at reflux for 2 h. After cooling to RT, the mixture was concentrated *in vacuo* and the residue taken up in ethyl acetate (50 mL) and washed with water (50 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 160 mg (94%) of N-[2-(5-chloro-1-benzothien-3-yl)ethyl]-2-(trifluoromethyl) benzamide (Compound B-4).

Mass Spectrum : [M+1] = 384.

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

Example A: *in vivo* test on *Alternaria brassicae*

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.

Radish plants (Pernot variety) in starter cups, sown on a 50/50 peat
10 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.

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

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

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

Under these conditions, good (at least 50%) to total protection is observed at a dose of 330 ppm with the following compounds: D1, D2, D3 and D4 according to the invention and at a dose of 500 ppm with the following compounds: B1, B2, C3, D6, D8 and E1 according to the invention.

25 On the contrary, weak protection (less than 30%) to no protection at all is observed with *N*-benzoyltryptamine compounds. These *N*-benzoyltryptamine compounds are respectively:

N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-yl)ethyl]-2-(trifluoromethyl)benzamide, tested at a dose of 330 ppm;

30 *N*.[2-(5-bromo-1H-indol-3-yl)ethyl]-2-chlorobenzamide, tested at a dose of 500 ppm;

N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-yl)ethyl]-2-(difluoromethyl)benzamide, tested at a dose of 500 ppm.

These results show that the compounds according to the invention have a much better biological activity than the structurally closest compounds disclosed in the Chinese patent application CN 1365971.

5

Example B: *in vivo* test on *Pyrenophora teres*

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

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.
15 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.

20 Grading is carried out 12 days after the contamination, in comparison with the control plants.

Under these conditions, good (at least 50%) to total protection is observed at a dose of 330 ppm with the following compounds: D1 and D2 and at a dose of 500 ppm with the following compounds: C3, D3, D8 and F1.

25 On the contrary, no protection at all is observed with *N*-benzoyltryptamine compounds. These *N*-benzoyltryptamine compounds are respectively:

N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-yl)ethyl]-2-(trifluoromethyl)benzamide, tested at a dose of 330 ppm;

N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-yl)ethyl]-2-chlorobenzamide, tested at a dose of 500 ppm;

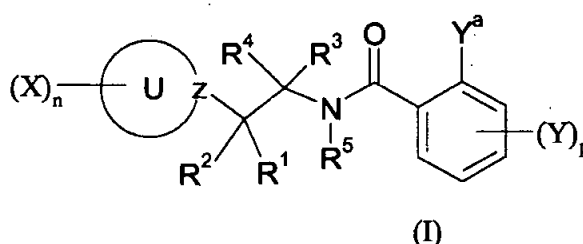
30 *N*.[2-(5-bromo-1H-indol-3-yl)ethyl]-2-iodobenzamide, tested at a dose of 500 ppm;

N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-yl)ethyl]-2-(difluoromethyl)benzamide, tested at a dose of 500 ppm.

Again, this confirm that the compounds according to the invention have a much better biological activity than the structurally closest compounds disclosed in the Chinese patent application CN 1365971.

CLAIMS

1. A compound of general formula (I)

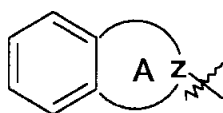


in which :

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

- p is 1, 2, 3 or 4;

- U is :



wherein A represents a 5- or 6-membered heterocycle including one, two or three heteroatoms which may be the same or different; fused with a phenyl ring to form a benzoheterocycle provided that this benzoheterocycle is different from 3-*1H*-2*H*-indolyl

- 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-alkoxy carbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyl-C₁-C₈-alkoxy carbamoyl, a C₁-C₈-alkoxy carbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxy carbonyl 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-alkylsulphiny, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphiny 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-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxy carbamoyl, a C₁-C₈-alkoxy carbonyl or a C₁-C₈-halogenoalkoxy carbonyl having 1 to 5 halogen atoms;

- R³ and R⁴ are the same or different and are a hydrogen atom, a formyl 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 or a C₁-C₈-alkoxy carbamoyl ;

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

- Y is the same or different and is a hydrogen atom, 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 di-C₁-C₈-alkylamino, a C₁-C₈-alkoxy, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, 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 or a (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl; and

- Y^a is a halogen atom, a cyano group, a sulfanyl group, a pentafluoro- λ^6 -sulfanyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino 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-alkoxy, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, 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 or a (C₁-C₆-alkynyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl;
- 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.
3. A compound according to claim 1 or 2, characterized in that X is chosen as being a C₁-C₄-alkyl group, a halogen atom, a hydroxyl group, an amino group, a nitro group, a C₁-C₄-alkoxy group, a C₁-C₄-alkylthio, a C₁-C₄-alkylsulphonyl, a C₁-C₄-halogenoalkyl 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. 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.

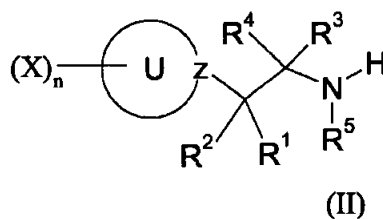
6. A compound according to any of the claims 1 to 5, characterized in that Y^a is chosen as being a halogen atom, a pentafluoro-λ⁶-sulfanyl group, a C₁-C₈-alkyl, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms or a C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms.

7. A compound according to any of the claims 1 to 6, characterized in that p is 1.

8. A compound according to any of the claims 1 to 7, characterized in that Y is chosen as being a hydrogen atom or a halogen atom, preferably a hydrogen atom.

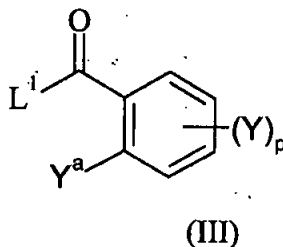
9. A compound according to any of the claims 1 to 8, characterized in that U is chosen as being a 2-benzothiophene, a 3-benzothiophene, a 1-indole, a 2-indole, a 3-indole provided it is substituted in the 1- or in the 2- position, a 2-benzofuran, a 3-benzofuran, a 2-benzoxazole, a 2-benzothiazole, a 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.

10. A process for the preparation of a compound of general formula (I) as defined in any of the claims 1 to 9, which comprises reacting a benzoheterocyclylethylamine derivative of general formula (II) or one of its salt :



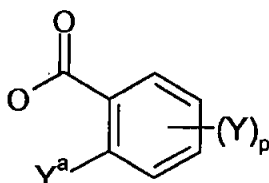
in which U, X, n, Z, R¹, R², R³, R⁴ and R⁵ are as defined in any of the claims 1 to 9;

with a carboxylic acid derivative of the general formula (III)



in which :

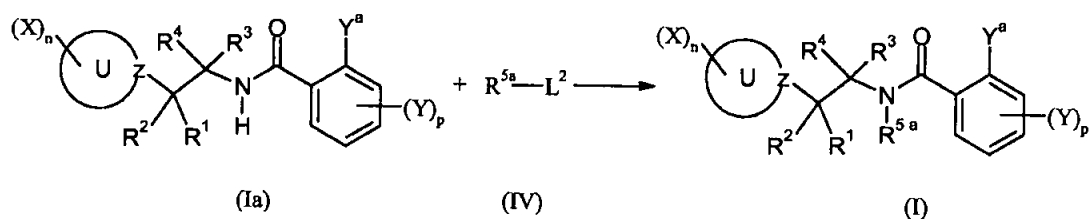
- Y^a , Y and p are as defined in any of the claims 1 to 8; and
- L^1 is a leaving group chosen as being a halogen atom, a hydroxyl group, $-OR^6$, -
- 10 $OCOR^6$, R^6 being a C_1 - C_6 alkyl, a C_1 - C_6 haloalkyl, a benzyl, 4-methoxybenzyl, pentafluorophenyl or a group of formula



- 15 in the presence of a catalyst and, if L^1 is a hydroxyl group, in the presence of a condensing agent.

11. A process according to claim 10, characterized in that R^5 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, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , Y^a , Y and p are as defined in claim

10;

25

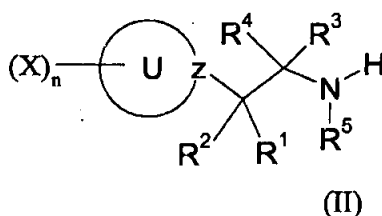
- R^{5a} is a C_1 - C_6 -alkyl, or a C_3 - C_7 -cycloalkyl;

- L² 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

12. 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 9.

10

13. Fungicide composition comprising an effective amount of a compound according to any of the claims 1 to 9 and an agricultural acceptable support.

14. 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 13 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.

15

(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 2007/006734 A1

- (51) Clasificación Internacional de Patentes⁷:
- | | |
|-----------------------|-----------------------|
| C07D 209/16 (2006.01) | C07D 215/12 (2006.01) |
| C07D 333/62 (2006.01) | A01N 43/12 (2006.01) |
| C07D 333/58 (2006.01) | A01N 43/38 (2006.01) |
| C07D 307/81 (2006.01) | A01N 43/52 (2006.01) |
| C07D 235/14 (2006.01) | A01N 43/42 (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) Agente: GUITTON, Carole; BAYER CROPSCIENCE SA,
Patents & Licensing Department, 14/20 Rue Pierre Baizet,
F-69009 Lyon (FR).

- (21) Número de solicitud internacional:
PCT/EP2006/063987

- (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

- (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

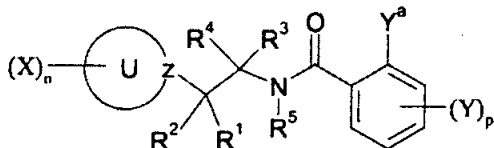
- (84) Estados designados (a menos que se indique otra cosa,
para todo tipo de protección regional disponible): ARIPO
(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), Euroasiática (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,
TM), Europea (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES,
FI, FR, GB, GR, HU, IE,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



(I)

- (57) Resumen: La presente invención se refiere a nuevos
derivados de benzoheterociclicetilbenzamida 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 y métodos para luchar contra hongos
fitopatógenos de plantas, usando estos compuestos o sus
composiciones.

Nuevos derivados de la Benzoheterocicliletilbenzamida

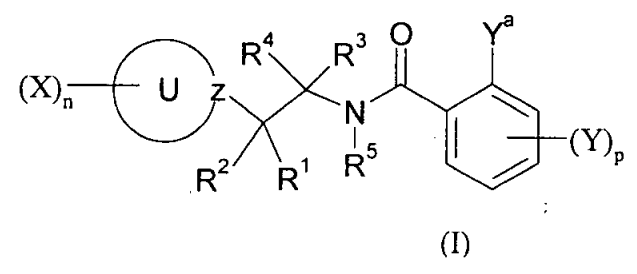
La presente invención se refiere a nuevos derivados de la benzoheterocicliletilbenzamida, su procedimiento de preparación, su utilización como fungicidas, particularmente en forma de composiciones fungicidas y a métodos para el control de hongos fitopatógenos de plantas que utilizan estos compuestos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

En la solicitud de patente china CN 1365971, algunos derivados de la benzoheterocicliletilbenzamida en que el benzoheterociclo es el 3-1H-2H-indolilo se incluyen genéricamente en una extensa descripción de numerosos compuestos de la N-aciltriptamina. Sin embargo, dichos compuestos no están incluidos en los derivados de la benzoheterocicliletilbenzamida afectados por la presente invención y además este documento no describe ni sugiere específicamente seleccionar dichos compuestos.

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.

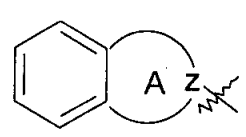
Se ha encontrado ahora una nueva familia de compuestos que poseen las características mencionadas anteriormente.

Por consiguiente, la presente invención se refiere a un derivado de la benzoheterocicliletilbenzamida de fórmula general (I):



en la que:

- n es 0, 1, 2, 3, 4, 5 ó 6;
- p es 1, 2, 3 ó 4;
- 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, condensados con un anillo de fenilo para formar un benzoheterociclo siempre que este benzoheterociclo sea diferente de 3-1H-2H-indolilo

5 - 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
10 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] que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un di-[alquil C₁-C₈]amino, un alcoxi C₁-C₈, un halogeno[alcoxi C₁-C₈] que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfanilo, un halogeno[alquil
15 C₁-C₈]sulfanilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil C₂-C₈]oxi, un halogeno[alquenil C₂-C₈]oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquinil C₃-C₈]oxi, un halogeno[alquinil C₃-C₈]oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno,
20 un [alquil C₁-C₈]carbamoilo, un di-[alquil C₁-C₈]carbamoilo, un N-[alquil C₁-C₈]oxycarbamoilo, 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carboniloxi, un halogeno[alquil C₁-C₈]carboniloxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilamino,
25 un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilamino que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]aminocarboniloxi, un di-[alquil C₁-C₈]aminocarboniloxi, un [alquil C₁-C₈]oxycarboniloxi, un [alquil C₁-C₈]sulfenilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfenilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfinilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfinilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfonilo, un halogeno[alquil
30 C₁-C₈]sulfonilo que tiene 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno;
- 10 - R³ y R⁴ son el mismo o diferentes y son: un átomo de hidrógeno, un grupo formilo, 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbamoilo, un di-[alquil C₁-C₈]carbamoilo o un [alcoxi C₁-C₈]carbamoilo;
- 15 - R⁵ es un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₆ o un cicloalquilo C₃-C₇;
- Y es el mismo o diferente y es: un átomo de hidrógeno, 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 di-[alquil C₁-C₈]amino, un alcoxi C₁-C₈, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfanilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfanilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil C₂-C₈]oxi, un halogeno[alquenil C₂-C₈]oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquinil C₃-C₈]oxi, un halogeno[alquinil C₃-C₈]oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo que tiene 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carboniloxi, un halogeno[alquil C₁-C₈]carboniloxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilamino, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilamino que tiene 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfinilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfinilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfonilo, un halogeno[(alquil C₁-C₈)]sulfonilo que tiene 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-
 10 C₆, un [(alquinil C₁-C₆)oxiimino]-alquilo C₁-C₆ o un (benciloxiimino)-alquilo C₁-C₆ y

- Y^a es: un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ⁶-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo
 (hidroxiimino)-alquilo C₁-C₆, un alquilo C₁-C₈, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un
 15 alcoxi C₁-C₈, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfanilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfanilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil C₂-C₈]oxi, un halogeno[alquenil C₂-C₈]oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquinil C₃-C₈]oxi, un halogeno[alquinil C₃-C₈]oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno,
 20 un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo que tiene 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 que tiene
 25 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carboniloxi, un halogeno[alquil C₁-C₈]carboniloxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilamino, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilamino que tiene 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 que tiene
 30 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfinilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfinilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfonilo que tiene 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 o un [(alquinil

C₁-C₆)oxiimino)]-alquilo C₁-C₆, un (benciloxiimino)-alquilo C₁-C₆;

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

5 En una realización de la presente invención, A representa un heterociclo de 5 ó 6 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser el mismo o diferentes, condensados con un anillo de fenilo para formar un benzoheterociclo siempre que este benzoheterociclo sea diferente de 3-2H-indolilo, entonces Z, X, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, Y, Y^a son como se definió anteriormente.

10

En el contexto de la presente invención:

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

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

15

- 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.

20 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.

25 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" denota una mezcla de enantiómeros en diferentes proporciones) y a las mezclas de todos los posibles estereoisómeros, en todas las proporciones. Pueden separarse los diaestereoisómeros y/o los isómeros ópticos de acuerdo con los métodos que son conocidos *per se* por cualquier experto en la materia.

30

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. Pueden

separarse los isómeros geométricos de acuerdo con métodos generales, que son conocidos *per se* 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 tautómeras 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 grupo hidroxilo, un 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 heterocicliletilbenzamida 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 que sea: un grupo alquilo C_1-C_4 , un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, 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 que tiene 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 también se refiere a un derivado de la benzoheterocicliletilbenzamida de fórmula general (I) en que las diferentes características se pueden elegir solas o en combinación siendo:

- en relación con R^1 y R^2 , R^1 y R^2 se eligen, independientemente uno de otro, que sean: 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno y

- en relación con R³ y R⁴, R³ y R⁴ se eligen, independientemente uno de otro, siendo: un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₈, un alqueno C₂-C₈, un alquino C₂-C₈, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

5

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.

10

De acuerdo con la presente invención, el resto fenilo se sustituye en la posición orto por Y^a y se puede sustituir en cualquier otra posición por (Y)_p, en que Y^a, Y y p se definen como anteriormente. Preferiblemente, la presente invención se refiere a un derivado de la benzoheterociclietilbenzamida de la fórmula general (I) en que las

15

diferentes características se pueden elegir solas o en combinación siendo:

- en relación con Y^a, Y^a se elige entre: un átomo de halógeno, un grupo pentafluoro-λ⁶-sulfanilo, un alquilo C₁-C₈, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno;

- en relación con p, p es 1;

20

- en relación con Y, Y se elige entre un átomo de hidrógeno ó un átomo de halógeno, más preferiblemente Y es un átomo de hidrógeno.

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 benzoheterociclietilbenzamida de fórmula general (I) en que las diferentes características se pueden elegir solas o en combinación siendo:

25

- U se elige entre: un 2-benzotiofeno, un 3-benzotiofeno, un 1-indol, un 2-indol, un 3-indol siempre que esté sustituido en la posición 1 o en la 2, 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

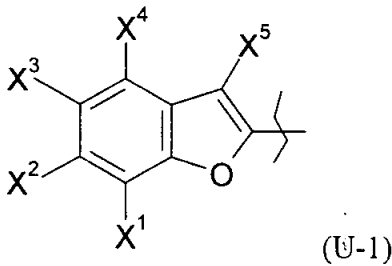
30

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, siendo: 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

Los ejemplos específicos de grupo "U" incluyen:

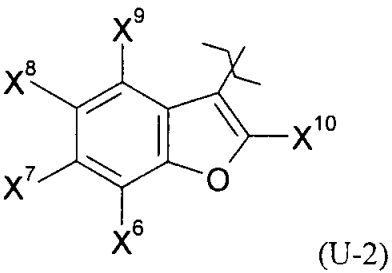
* U representa un benzoheterociclo de fórmula general (U-1):



en 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno

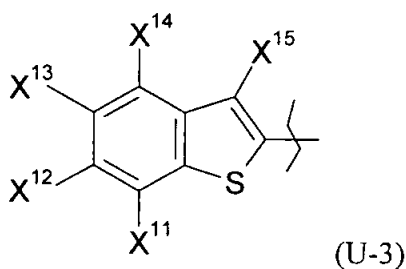
* U representa un benzoheterociclo de fórmula general (U-2):



en que :

- 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

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

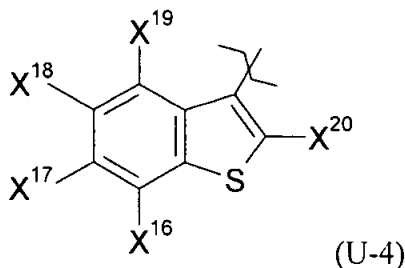


10

en 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno

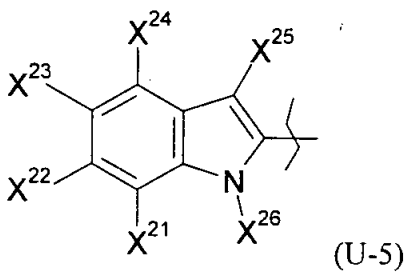
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-4):



en que :

- 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-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

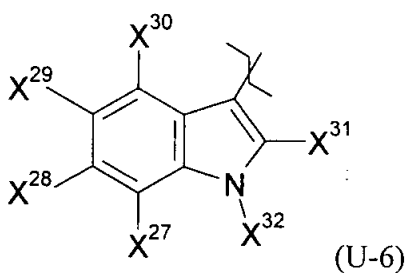
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-5):



en que :

- 5 - X^{21} , X^{22} , X^{23} , X^{24} , X^{25} y X^{26} 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno

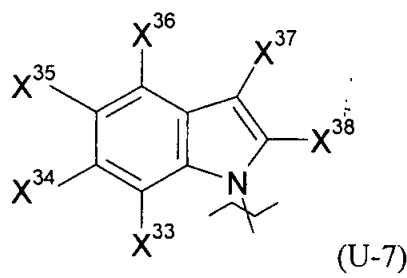
10 * U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-6):



en que :

- 15 - X^{27} , X^{28} , X^{29} , X^{30} , X^{31} y X^{32} 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno; siempre que X^{31} y X^{32} no sean un átomo de hidrógeno

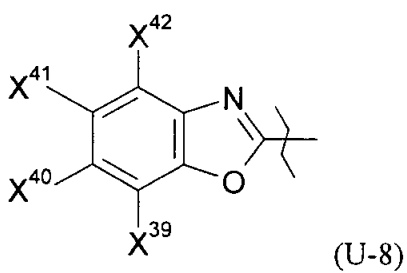
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-7):



en que :

- 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

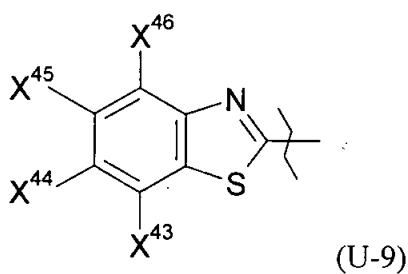
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-8):



en 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

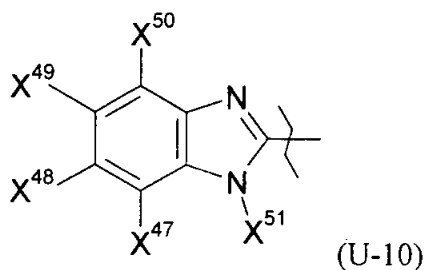
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-9):



en que :

- X^{43} , X^{44} , X^{45} y X^{46} 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

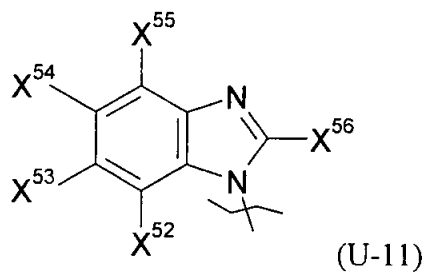
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-10):



en 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

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

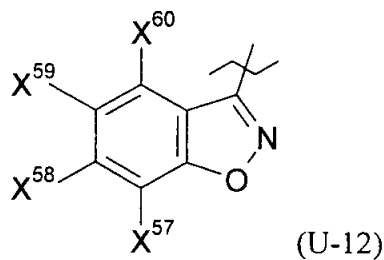


en que :

- 5 - X⁵², X⁵³, X⁵⁴, X⁵⁵ y X⁵⁶ 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

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

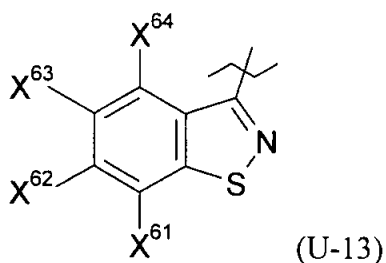
10



en que :

- 15 - X⁵⁷, X⁵⁸, X⁵⁹ y X⁶⁰ 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

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

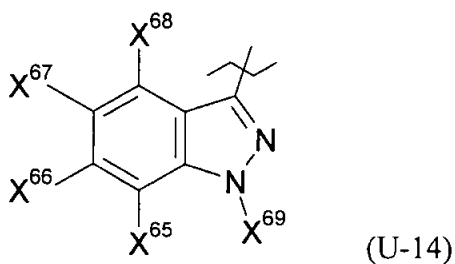


en que:

- 5 - 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

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

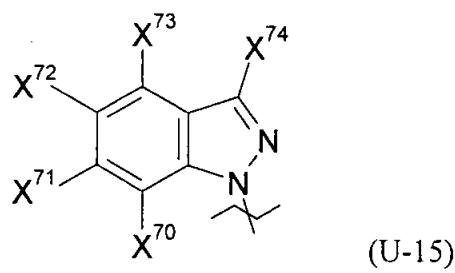
10



en que :

- 15 - 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

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

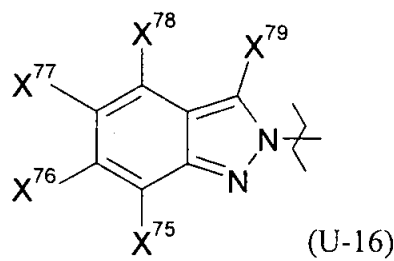


en que :

- X⁷⁰, X⁷¹, X⁷², X⁷³ y X⁷⁴ pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un
5 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

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

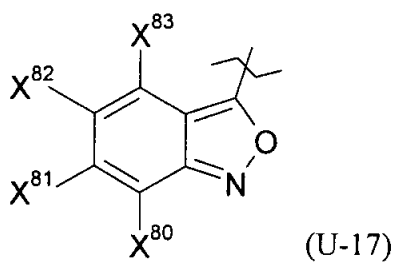
10



en que :

- X⁷⁵, X⁷⁶, X⁷⁷, X⁷⁸ y X⁷⁹ pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un
15 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

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

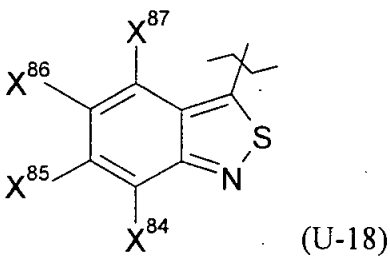


en que :

- X⁸⁰, X⁸¹, X⁸² y X⁸³ pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo
5 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

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

10



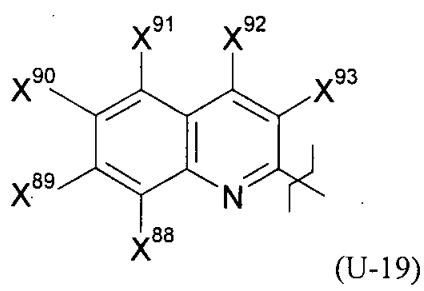
en que :

- X⁸⁴, X⁸⁵, X⁸⁶ y X⁸⁷ pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo
15 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

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

20

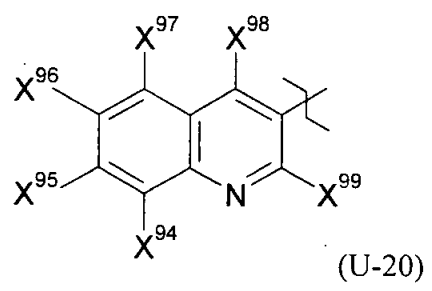
17



en que :

- X⁸⁸, X⁸⁹, X⁹⁰, X⁹¹, X⁹² y X⁹³ 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

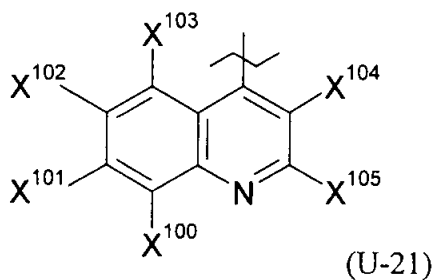
* U representa un benzoheterociclo de la fórmula general (U-20):



en que :

- X⁹⁴, X⁹⁵, X⁹⁶, X⁹⁷, X⁹⁸ y X⁹⁹ 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

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

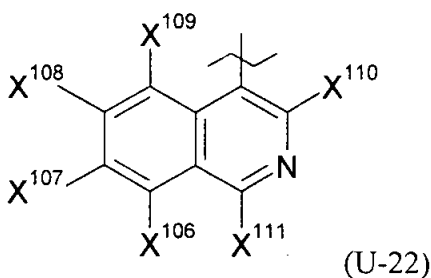


(U-21)

en 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno

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



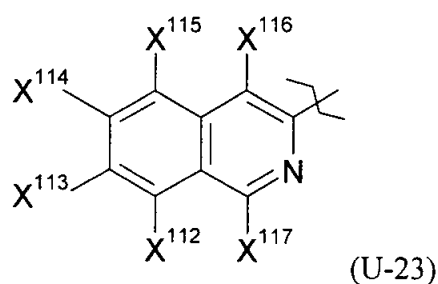
(U-22)

en que :

- X^{106} , X^{107} , X^{108} , X^{109} , X^{110} y X^{111} 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

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

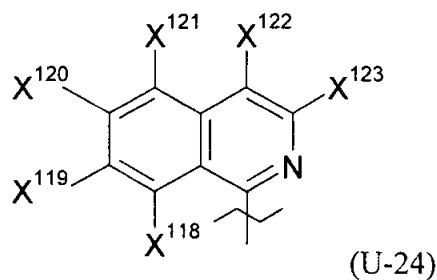
19



en que :

- 5 - X^{112} , X^{113} , X^{114} , X^{115} , X^{116} y X^{117} 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

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

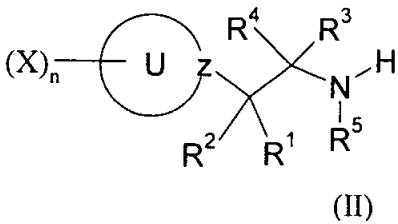


en que :

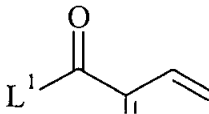
- 15 - X^{118} , X^{119} , X^{120} , X^{121} , X^{122} y X^{123} pueden ser el mismo o diferentes y pueden ser: un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C_1-C_4 , un grupo alcoxi C_1-C_4 , un [alquil C_1-C_4]tio, un [alquil C_1-C_4]sulfonilo o un halogenoalquilo C_1-C_4 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

- 20 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 preparación de un compuesto de fórmula general (I) como se definió anteriormente,

que comprende hacer reaccionar un derivado de benzoheterocicliletilamina de fórmula general (II) o una de sus sales:

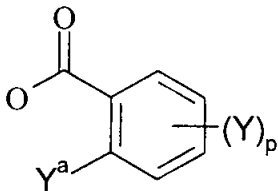


5 en que U, X, n, Z, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ son como se definió anteriormente;
con un derivado de ácido carboxílico de la fórmula general (III):



en que:

- Y^a, Y y p son como se definió anteriormente y
- 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:



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

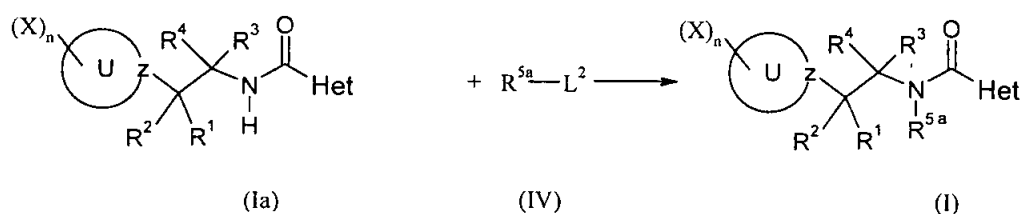
15

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.

20 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 agente de condensación adecuado se puede elegir siendo formador de haluro de ácido, tal como: fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxidotricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; formador 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-etoxycarbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ), trifenilfosfina/tetraclorometano, cloruro de 4-(4,6-dimetoxi[1.3.5]triazin-2-il)-4-metilmorfolino hidratado o hexafluorofosfato de bromo-tripirrolidino-fosfonio, 1-Hidroxibenzotriazol (HOBT).

Cuando R^5 es un átomo de hidrógeno, el procedimiento anteriormente mencionado 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 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 que se elige 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).

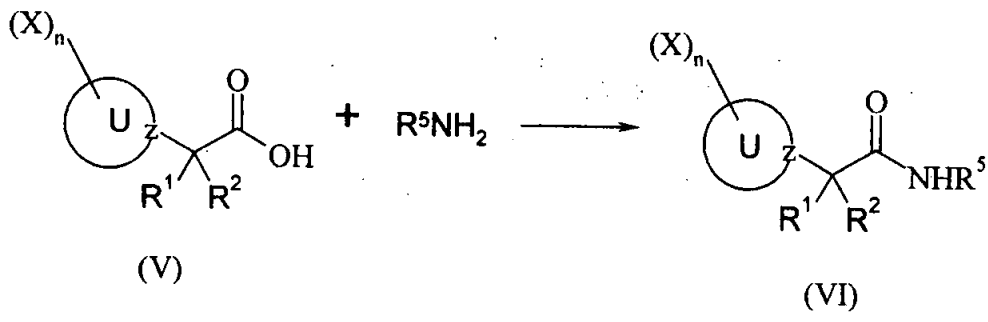
Dependiendo de la definición de R^1 , R^2 , R^3 , R^4 o R^5 , pueden prepararse derivados de aminas de fórmula general (II) por diferentes procedimientos. Un ejemplo (A) de uno de tales procedimientos puede ser cuando:

- 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) puede prepararse de acuerdo con un procedimiento que comprende:

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

Esquema A-1



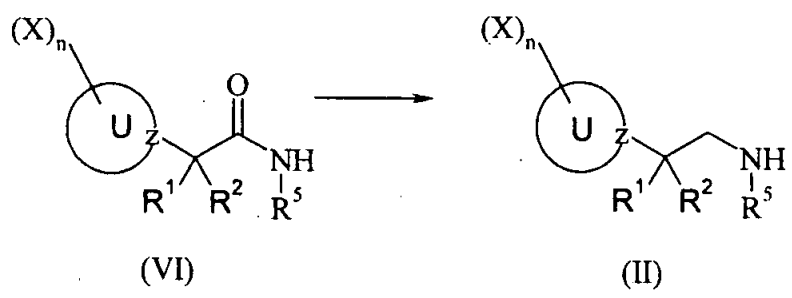
en que :

- 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 benzoheterocicilil-amida de fórmula general (VI), en presencia de un derivado amínico 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 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 benzoheterociclicetilamina de fórmula general (II), en presencia de un donador de hidruro, a una temperatura de 0°C a 200°C;

5 La primera etapa (etapa A-1) se lleva a cabo en presencia de un agente de condensación. El agente de condensación adecuado se puede elegir siendo formador de haluro de ácido, tal como: fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxidotricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; cloruro de sulfurilo; formador 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.

15 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.

20

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 .

25 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.

30

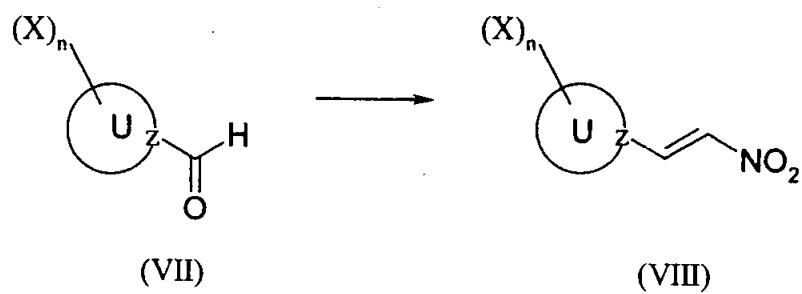
La segunda etapa (etapa A-2) de acuerdo con la presente invención se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente orgánico, de agua o de una mezcla de los mismos. Preferiblemente, el disolvente se elige entre: éter, alcohol, ácido carboxílico o

una mezcla 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 :

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

Esquema B-1

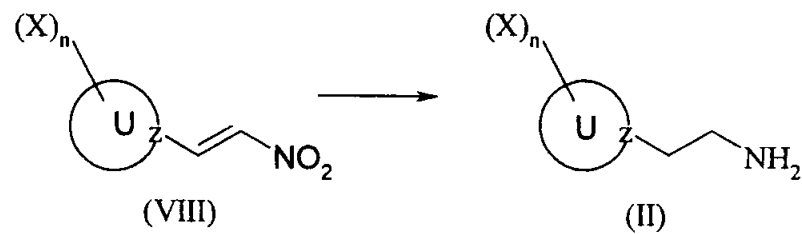


en que : -X, U, Z y n son como se definió anteriormente;

- 10 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



15

en 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;
- 20

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.

5 La primera etapa (etapa B-1) 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 de los mismos con agua o agua pura.

10 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.

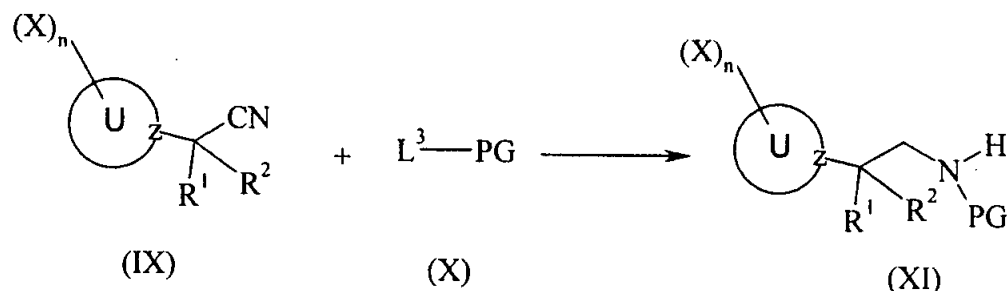
20 La segunda etapa (etapa B-2) de acuerdo con la presente invención se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente orgánico, de agua o de una mezcla de los mismos. Preferiblemente, el disolvente se elige entre: éter, alcohol, ácido carboxílico o una mezcla de los mismos con agua o agua pura.

25 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 C-1:

30

Esquema C-1



en que:

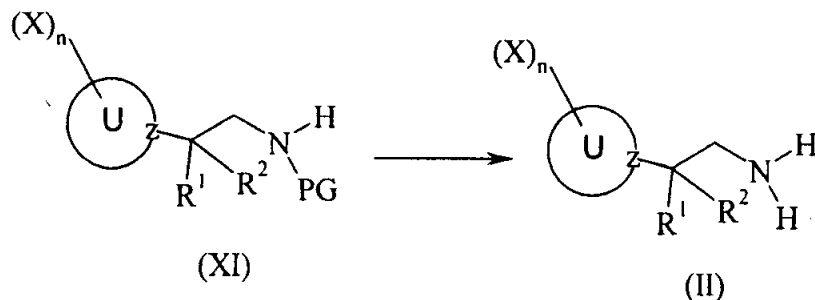
- U, X, Z, n son como se definió anteriormente;
- R¹ es un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₆;
- R² es un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₆;
- L³ es un grupo saliente elegido entre: un grupo -OR⁷ o un grupo -OCOR⁷, siendo R⁷ un alquilo (C₁-C₆), un haloalquilo (C₁-C₆), un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

- 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 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 que :

- U, X, Z, n son como se definió anteriormente;

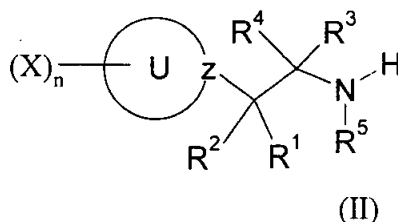
- R¹ es un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₆;
- R² es un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₆
- PG representa un grupo protector que puede ser un grupo -COOR⁷ o grupo -COR⁷, siendo R⁷ un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

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

El compuesto de acuerdo con la presente invención puede prepararse según 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:



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, conforme a la presente invención, se proporciona una composición fungicida que comprende, como ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula 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, fundamentalmente sobre las partes de la planta. 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 mezclas de tales soportes.

La composición también puede comprender componentes adicionales. En particular, la composición puede comprender además 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 dichos tensioactivos. Se puede hacer mención, por ejemplo, de 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 alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres del ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (en particular tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polioxietilados, ésteres de ácidos grasos de polioles y derivados de los compuestos anteriores 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. Con preferencia, el contenido en tensioactivo puede estar comprendido entre 5% y 40% en peso de la composición.

Opcionalmente, también pueden incluirse otros componentes, por ejemplo, coloides protectores, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, agentes de penetración, estabilizadores, 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.

En general, la composición conforme a 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, 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 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 ultra bajo (ulv), suspensión de volumen ultra bajo (ulv), gránulos o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento de lodos, gránulos o comprimidos solubles en agua, polvo soluble en agua para tratamiento de semillas y polvo mojable.

Estas composiciones incluyen no sólo composiciones que están listas para ser aplicadas a la planta o semilla que se tiene que tratar por medio de un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo pulverizador o de aplicación de polvo fino, sino también las composiciones concentradas comerciales que han de diluirse antes de la aplicación al 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:

B1) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de ácidos nucleicos como: benalaxil, benalaxil-M, bupirimato, chiralaxil, clozilacón, 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, pencicurón, tiabendazol, tiofanato-metilo, zoxamida;

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, tifluzamida;

como inhibidor de la respiración CIII como: azoxistrobin, ciazofamid, dimoxistrobin, enestrobin, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobin, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, piraclostrobin, picoxistrobin, trifloxistrobin;

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

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

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

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

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

B9) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de ergosterol como:
20 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,
25 oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol, aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin, espiroxamina, naftifina, piributicarb, terbinafina;

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

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

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
5 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 que incluyen polisulfuro de calcio, tiram, tolilfluanid, zineb, ziram;

10 B14) un compuesto seleccionado de la siguiente lista: 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,
15 hexaclorobenzeno, 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, triclámda, 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-piridincaboxamida, 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-
25 tricloro-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-feniletil)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-carbotioico.

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

Las composiciones fungicidas de la presente invención se pueden utilizar para controlar con medidas curativas o preventivas los hongos fitopatógenos de los cultivos. Así, según 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 usa contra hongos fitopatogénicos 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" significa una cantidad de composición según la invención que es suficiente para controlar o destruir los hongos presentes o que pueden aparecer en los cultivos y que no conlleva ningún 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 según la invención.

Esta cantidad se puede determinar por ensayos en campo sistemáticos, que están entre las capacidades de un especialista en la técnica.

El método de tratamiento de acuerdo con la presente invención es útil para tratar material de propagación tal como tubérculos o rizomas, pero también semillas,
 5 plántulas o siembras de plántulas y plantas o siembras de plantas. Este método de tratamiento también puede servir para tratar raíces. El método de 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.

10 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 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.,
 15 *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (por ejemplo, árboles del plátano y plataneros), *Rubiaceae* 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.,
 20 *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, guisantes), *Rosaceae* sp. (por ejemplo, fresas); grandes cultivos tales como *Graminae* sp. (por ejemplo, maíz, césped 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),
 25 *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 combatir por el método de acuerdo con la presente invención se pueden mencionar:

Enfermedades por oídio, tales como :

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

Enfermedades por *Podosphaera*, causadas por ejemplo por *Podosphaera leucotricha*;

Enfermedades por *Sphaerotheca*, causadas por ejemplo por *Sphaerotheca*

fuliginea;

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

Enfermedades por roya, tales como:

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

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

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

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

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

Enfermedades por oomicetos tales como:

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

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

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

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

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

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

Enfermedades por manchas foliares, enrojecimiento foliar y tizón foliar tales
como:

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

25 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;

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

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 laeticolor*;
- 5 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*;
- 10 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 nodorum*;
- 15 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*;
- Enfermedades por *Septoria*, causadas por ejemplo por *Septoria apii* o *Septoria lycopersici*;
- 20 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:
- Enfermedades por *Corticium*, causadas por ejemplo por *Corticium*
- 25 *graminaarum*;
- 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*;
- 30 Enfermedades por *Tapesia*, causadas por ejemplo por *Tapesia acuformis*;
- Enfermedades por *Thielaviopsis*, causadas por ejemplo por *Thielaviopsis basicola* ;
- 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.;
- 5 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*;
- 10 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*;
- 15 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*;
- 20 Enfermedades por *Sclerotinia*, causadas por ejemplo por *Sclerotinia* *sclerotiorum*;
- Enfermedades por *Verticillium*, causadas por ejemplo por *Verticillium alboatrum*;
- Enfermedades por putrefacción de las semillas y del suelo, moho, marchitez,
- 25 podredumbre 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*;
- 30 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*;

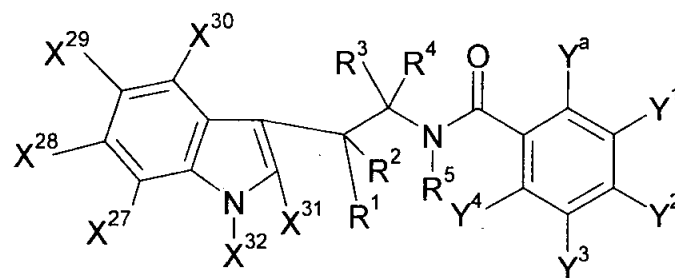
- Enfermedades por cancro, escoba y puntiseco tales como:
- Enfermedades por Nectria, causadas por ejemplo por *Nectria galligena*;
- Enfermedades por tizón, tales como:
- Enfermedades por Monilinia, causadas por ejemplo por *Monilinia laxa*;
- 5 Enfermedades por ampolla de la hoja o encrespamiento de la hoja, tales como:
- 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;
- 10 Enfermedades de flores y Semillas tales como:
- 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 funguicida de acuerdo con la presente invención también se
- 15 puede utilizar contra enfermedades micóticas susceptibles de desarrollarse sobre la
madera o en su interior. La terminología "madera" se refiere a todos los tipos de
especies de madera y a todos los tipos de trabajos 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
- 20 consiste fundamentalmente en ponerla en contacto con uno o más compuestos de la
presente invención o una composición de acuerdo con la invención; esto incluye por
ejemplo, la aplicación directa, pulverización, inmersión, inyección o cualquier otro
medio adecuado.
- La dosis de material activo aplicada normalmente en el tratamiento de acuerdo
- 25 con la presente invención se encuentra general y ventajosamente entre 10^{-3} y 8×10^{-2}
 g/m^2 (10 y 800 g/ha), preferiblemente, entre 5×10^{-3} y 3×10^{-2} g/m^2 (50 y 300 g/ha) para
aplicaciones en tratamiento de las hojas. La dosis de sustancia activa aplicada está
general y ventajosamente entre 2 y 200 g por 100 kg de semillas, preferentemente
entre 3 y 150 g por 100 kg de semillas en el caso del tratamiento de semillas. Se
- 30 sobreentiende claramente que las dosis indicadas anteriormente se proporcionan
como ejemplos ilustrativos de la invención. Un experto en la materia sabrá cómo
adaptar las dosis de aplicación de acuerdo con la naturaleza del cultivo que se tiene
que tratar.

La composición fungicida de acuerdo con la presente invención también se puede usar en el tratamiento de organismos modificados genéticamente con los compuestos conformes a la invención o las composiciones agroquímicas conformes a 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 genes que aportan a la planta transformada nuevas propiedades agrónomas o genes para mejorar la calidad agronómica de la planta transformada.

La composición de acuerdo con la presente invención se puede usar también para la preparación de una composición útil para tratar de forma curativa o preventiva enfermedades fúngicas en humanos y animales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, enfermedades por *trichophyton* y *candidiasis* o enfermedades causadas por *Aspergillus spp.*, por ejemplo *Aspergillus fumigatus*.

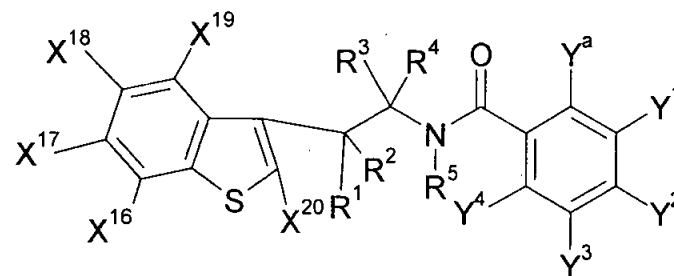
Los aspectos de la presente invención se ilustrarán a continuación con referencia a las siguientes tablas de compuestos y ejemplos. La siguiente Tabla ilustra de una forma no limitativa ejemplos de compuestos fungicidas conforme a la presente invención. En los Ejemplos siguientes, M+1 (ó M-1) se refiere al pico del ión molecular, más o menos 1 u.m.a. (unidades de masa atómica), respectivamente, cuando 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



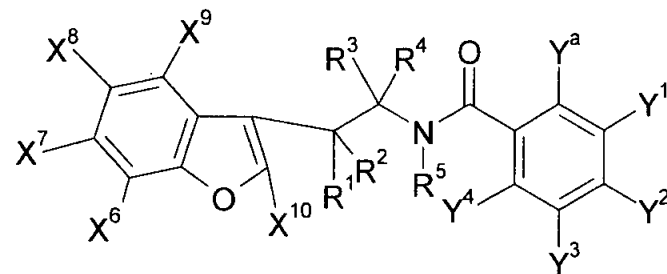
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ²⁷	X ²⁸	X ²⁹	X ³⁰	X ³¹	X ³²	M+1
A-1	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	329
A-2	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	293
A-3	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	347
A-4	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	329
A-5	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	OMe	H	H	CH ₃	329
A-6	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	H	H	OMe	H	H	CH ₃	388
A-7	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	OMe	H	H	CH ₃	435

Tabla B

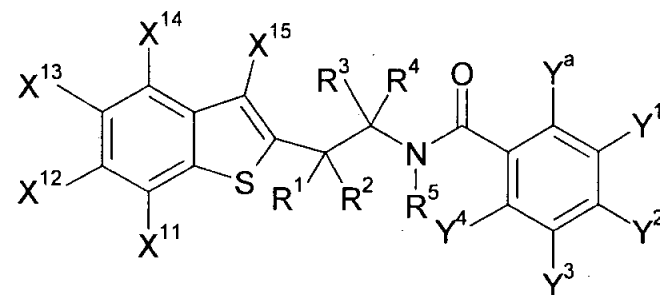


Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ¹⁶	X ¹⁷	X ¹⁸	X ¹⁹	X ²⁰	M+1
B-1	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	H	H	Cl	H	H	366
B-2	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	H	H	Cl	H	H	394
B-3	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	Cl	H	H	442
B-4	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	Cl	H	H	384
B-5	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	H	H	H	H	H	360
B-6	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	H	H	H	408
B-7	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	H	350

Tabla C

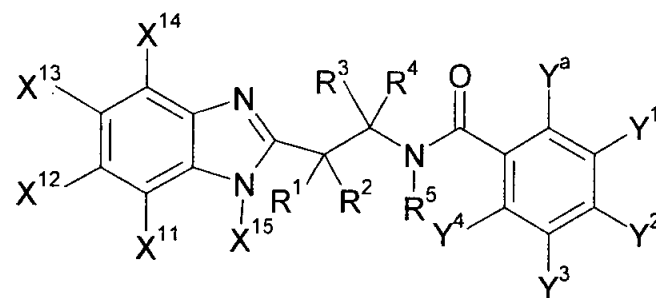


Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ⁶	X ⁷	X ⁸	X ⁹	X ¹⁰	M+1
C-1	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	H	H	H	H	H	344
C-2	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	H	H	H	392
C-3	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	H	334

Tabla D

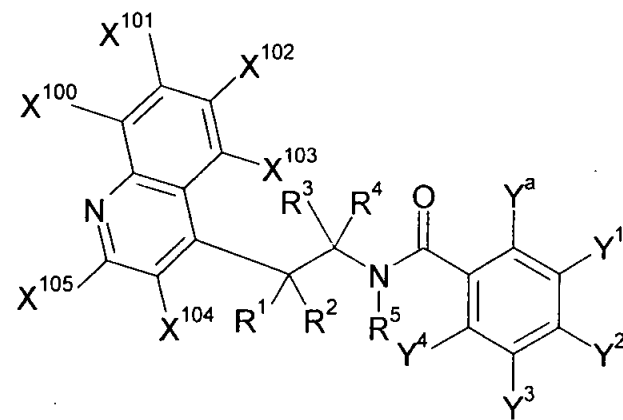
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
D-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	364
D-2	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	398
D-3	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	422
D-4	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	374
D-5	H	H	H	H	H	Br	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	408
D-6	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	364
D-7	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	330
D-8	H	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	456
D-9	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃	380
D-10	H	H	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	310
D-11	H	H	H	H	H	CHF ₂	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	346

Tabla E



Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ¹¹	X ¹²	X ¹³	X ¹⁴	X ¹⁵	M+1
E-1	Me	H	H	H	H	I	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	362
E-2	Me	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	420

Tabla F



Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	Y ^a	Y ¹	Y ²	Y ³	Y ⁴	X ¹⁰⁰	X ¹⁰¹	X ¹⁰²	X ¹⁰³	X ¹⁰⁴	X ¹⁰⁵	M+1
F-1	H	H	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	H	H	H	H	H	H	345

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

Síntesis de la N-[2-(5-cloro-1-benzotien-3-il)etil]-2-(trifluorometil) benzamida (Compuesto B-4)

Preparación de [2-(5-cloro-1-benzotien-3-il)etil]carbamato de terc-butilo

A una disolución agitada de (5-cloro-1-benzotien-3-il)acetonitrilo (5,30 g, 25,6 mmoles), cloruro de níquel (II) hexahidratado (6,05 g, 25,6 mmoles) y dicarbonato de di-terc-butilo (11,1 g, 51,0 mmoles) en metanol (150 ml) en una atmósfera inerte de nitrógeno, se añadió borohidruro de sodio (4,8 g, 126 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 lavó con salmuera (300 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 7,8 g (98%) de [2-(5-cloro-1-benzotien-3-il)etil]carbamato de terc-butilo.

RMN de ¹H (250 MHz, CDCl₃): δ 7,76 - 7,69 (2H, m); 7,36 - 7,15 (2H, m); 4,72 - 4,60 (N-H, b); 3,57 - 3,40 (2H, m); 3,1 - 2,95 (2H, m); 1,4 (9H, s);

Preparación de 2-(5-cloro-1-benzotien-3-il)etanamina

Se trató una disolución agitada de [2-(5-cloro-1-benzotien-3-il)etil]carbamato de terc-butilo (7,8 g, 25,1 mmoles) en diclorometano (100 ml) con ácido trifluoroacético (28,5 g, 250 mmoles) y se agitó la mezcla de reacción a TA durante 16 h. Se añadió cuidadosamente una disolución acuosa de hidróxido de sodio (200 ml, 1N) y se mantuvo la temperatura por debajo de 20 °C. Se agitó la mezcla de reacción durante 30 min y se secó la capa orgánica (MgSO₄), se filtró y se concentró a vacío para proporcionar 4,9 g de la amina deseada (92%).

RMN de ^1H (250 MHz, CDCl_3): δ 7,82 - 7,70 (2H, m); 7,4 - 7,1 (2H, m); 3,16 - 2,90 (4H, m); 1,6 - 1,4 (NH_2 , b).

La sal hidrocioruro se obtuvo por adición de ácido clorhídrico etéreo y filtración
5 del precipitado incoloro.

Síntesis de la N-[2-(5-cloro-1-benzotien-3-il)etil]-2-(trifluorometil) benzamida
(Compuesto B-4)

10 Se trató una mezcla de 2-(5-cloro-1-benzotien-3-il)etanamina (90,0 mg, 42,5 mmoles) y trietilamina (43,5 mg, 42,5 mmoles) en THF (5 ml) con cloruro de 2-trifluorometilbenzoilo (89,0 mg, 42,5 mmoles) y se calentó la mezcla para hacerla hervir a reflujo durante 2 h. Después de enfriar a TA, la mezcla se concentró a vacío y se absorbió el residuo en acetato de etilo (50 ml) y se lavó con agua (50 ml). Se secó
15 la capa orgánica (MgSO_4), 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 160 mg (94%) de N-[2-(5-cloro-1-benzotien-3-il)etil]-2-(trifluorometil) benzamida (Compuesto B-4).

20 Espectro de Masas: $[M+1] = 384$.

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

Ejemplo A : ensayo *in vivo* en *Alternaria brassicae*

25

El ingrediente activo ensayado se prepara por homogeneización potter en una suspensión concentrada tipo formulación a 100 g/l. Esta suspensión se diluye después con agua para obtener la concentración de material activo deseada.

30 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 cotiledón pulverizándolas con la suspensión acuosa descrita anteriormente.

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

Después de 24 horas, las plantas se contaminaron pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria brassicae* (40.000 esporas por cm³). Las esporas se recogen de un cultivo de 12 a 13 días.

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

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

En estas condiciones, se observó protección de buena (al menos 50%) a total en una dosis de 330 ppm con los siguientes compuestos: D1, D2, D3 y D4 de acuerdo
10 con la invención y en una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: B1, B2, C3, D6, D8 y E1 de acuerdo con la invención.

Por el contrario, se observa de protección débil (menos del 30%) a sin protección, con N-benzoiltriptaminocompuestos. Estos N-benzoiltriptaminocompuestos son respectivamente:

15 N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-(trifluorometil)benzamida, ensayada en una dosis de 330 ppm;

N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-clorobenzamida, ensayada en una dosis de 500 ppm;

20 N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-(difluorometil)benzamida, ensayada en una dosis de 500 ppm.

Estos resultados muestran que los compuestos de acuerdo con la invención presentan una actividad biológica mucho mejor que los compuestos más próximos estructuralmente descritos en la solicitud de patente china CN 1365971.

25 **Ejemplo B: ensayo *in vivo* en *Pirenofora teres***

El ingrediente activo ensayado se prepara por homogeneización potter en una suspensión concentrada tipo formulación a 100 g/l. Esta suspensión se diluye después con agua para obtener la concentración de material activo deseada.

30 Las plantas de cebada (variedad Express), en semilleros, sembradas en un substrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 12°C, se trataron en la etapa de 1 hoja (10 cm de alto), 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 *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 a
5 100% de humedad relativa y a continuación durante 12 días a 80% de humedad relativa.

La clasificación se lleva a cabo 12 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de control.

En estas condiciones, se observó protección de buena (al menos 50%) a total
10 en una dosis de 330 ppm con los siguientes compuestos: D1y D2 y en una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: C3, D3, D8 y F1.

Por el contrario, no se observa protección con N-benzotriptaminocompuestos. Estos N-benzotriptaminocompuestos son respectivamente:

N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-(trifluorometil)benzamida, ensayada en una
15 dosis de 330 ppm;

N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-clorobenzamida, ensayada en una dosis de 500 ppm;

N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-iodobenzamida, ensayada en una dosis de 500 ppm;

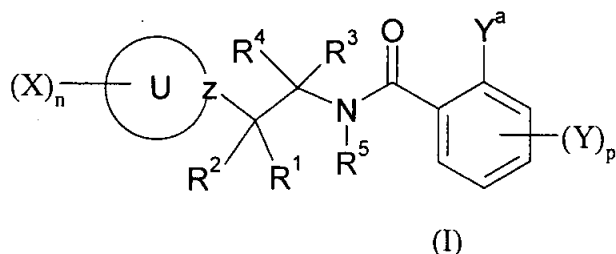
20 N.[2-(5-bromo-1H-indol-3-il)etil]-2-(difluorometil)benzamida, ensayada en una dosis de 500 ppm.

Estos resultados muestran de nuevo que los compuestos de acuerdo con la invención presentan una actividad biológica mucho mejor que los compuestos más próximos estructuralmente descritos en la solicitud de patente china CN 1365971.

25

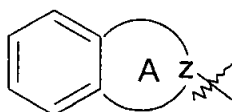
REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula general (I):



en que :

- n es 0, 1, 2, 3, 4, 5 ó 6;
- p es 1, 2, 3 ó 4;
- U es :



en la que A representa un heterociclo de 5 ó 6 miembros que incluye uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser el mismo o diferentes, condensado con un anillo de fenilo para formar un benzoheterociclo siempre que este benzoheterociclo sea diferente de 3-1*H*-2*H*-indolilo

- 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-C₈, un alquilo C₁-C₈, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un [alquil C₁-C₈]amino, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un di-[alquil C₁-C₈]amino, un alcoxi C₁-C₈, un halogenoalcoxi C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfanilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfanilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil C₂-C₈]oxi, un halogeno[alquenil C₂-C₈]oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquinil C₃-C₈]oxi,

un halogeno[alquínil C₃-C₈]oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbamoílo, un di-[alquil C₁-C₈]carbamoílo, un N-[alquil C₁-C₈]oxicarbamoílo, un [alcoxi C₁-C₈]carbamoílo, un N-[alquil C₁-C₈]-[alcoxi C₁-C₈]carbamoílo, un [alcoxi C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alcoxi C₁-C₈]carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carboniloxi, un halogeno[alquil C₁-C₈]carboniloxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilamino, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilamino que tiene 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfinilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfinilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alcoxi C₁-C₈]imino, un [alcoxi (C₁-C₆-)imino]-alquilo C₁-C₆, un [(alquenil C₁-C₆)oxiimino]-alquilo C₁-C₆, un [(alquínil 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 carbamoílo, un grupo (hidroxiimino)-alquilo C₁-C₆, un alquilo C₁-C₈, un alquenilo C₂-C₈, un alquínilo C₂-C₈, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbamoílo, un di-[alquil C₁-C₈]carbamoílo, un [alcoxi C₁-C₈]carbamoílo, un [alcoxi C₁-C₈]carbonilo o un halogeno[alcoxi C₁-C₈]carbonilo que tiene 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 carbamoílo, un grupo (hidroxiimino)-alquilo C₁-C₆, un alquilo C₁-C₈, un alquenilo C₂-C₈, un alquínilo C₂-C₈, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbamoílo, un di-[alquil C₁-C₈]carbamoílo o un [alcoxi C₁-C₈]carbamoílo;

- R⁵ es: un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₆ o un cicloalquilo C₃-C₇;

- Y es el mismo o diferente y es: un átomo de hidrógeno, 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 di-[alquil C₁-C₈]amino, un alcoxi C₁-C₈, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfanilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfanilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil C₂-C₈]oxi, un halogeno[alquenil C₂-C₈]oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquinil C₃-C₈]oxi, un halogeno[alquinil C₃-C₈]oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo que tiene 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carboniloxi, un halogeno[alquil C₁-C₈]carboniloxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilamino, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilamino que tiene 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfinilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfinilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfonilo que tiene 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 o un (benciloxiimino)-alquilo C₁-C₆ y

- Y^a es: un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro-λ⁶-sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, 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 alcoxi C₁-C₈, un halogeno[alquilo C₁-C₈] que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfanilo, un

halogeno[alquil C₁-C₈]sulfanilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquenil C₂-C₈]oxi, un halogeno[alquenil C₂-C₈]oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquinil C₃-C₈]oxi, un halogeno[alquinil C₃-C₈]oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilo que tiene 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carboniloxi, un halogeno[alquil C₁-C₈]carboniloxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]carbonilamino, un halogeno[alquil C₁-C₈]carbonilamino que tiene 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 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfinilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfinilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un [alquil C₁-C₈]sulfonilo, un halogeno[alquil C₁-C₈]sulfonilo que tiene 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 o un [(alquinil C₁-C₆)oxiimino]-alquilo C₁-C₆, un (benciloxiimino)-alquilo C₁-C₆;

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 grupo alquilo C₁-C₄, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo nitro, un grupo alcoxi C₁-C₄, un [alquil C₁-C₄]tio, un [alquil C₁-C₄]sulfonilo, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene 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, siendo: un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₈, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un cicloalquilo C₃-C₈, un halogenocicloalquilo C₃-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno,

un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado por que R^3 y R^4 se eligen, independientemente uno de otro, siendo: un
5 átomo de hidrógeno, un alquilo C_1-C_8 , un alquenoilo C_2-C_8 , un alquiniilo C_2-C_8 , un cicloalquilo C_3-C_8 , un halogenocicloalquilo C_3-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

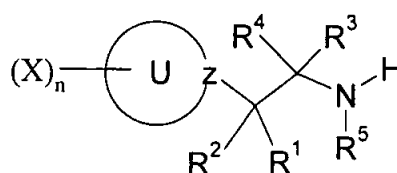
6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5,
10 caracterizado porque Y^a se elige entre: un átomo de halógeno, un grupo pentafluoro- λ^6 -sulfanilo, un alquilo C_1-C_8 , un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi C_1-C_8 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

7. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6,
15 caracterizado por que p es 1.

8. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizado por que Y se elige entre un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno, preferiblemente un átomo de hidrógeno.
20

9. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizado por que U se elige entre: un 2-benzotiofeno, un 3-benzotiofeno, un 1-indol, un 2-indol, un 3-indol siempre que esté sustituido en la posición 1 o en la 2, 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
25 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.

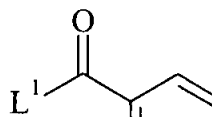
30 10. Un procedimiento para la preparación de un compuesto de fórmula general (I) como se define en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, que comprende hacer reaccionar un derivado de benzoheterociclicetilamina de fórmula general (II) o una de sus sales:



(II)

en que U, X, n, Z, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ son como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9;

con un derivado de ácido carboxílico de la fórmula general (III):



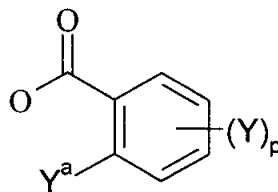
5

en que :

- Y^a, Y y p son como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 y

- 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,

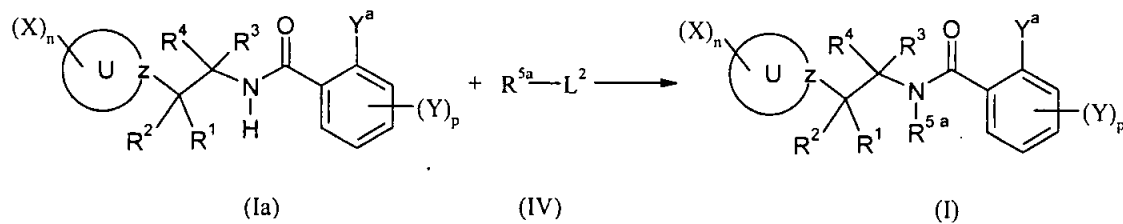
10 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula:



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

15

11. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 10, caracterizado por que R⁵ es un átomo de hidrógeno y por que el procedimiento se completa mediante una etapa más de acuerdo con el siguiente esquema de reacción:



20

en que : - U, X, n, z, R¹, R², R³, R⁴, Y^a, Y y p son como se definen en la

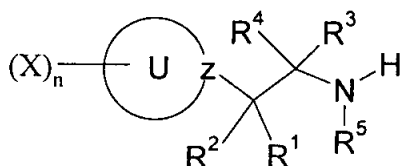
reivindicación 10;

- 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-fenilsulfoniloxi o un metilsulfoniloxi;

- 5 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).

12. Un compuesto de fórmula general (II):



(II)

10 en que U , X , n , Z , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y R^5 son como se definió en cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 3, 4, 5 ó 9.

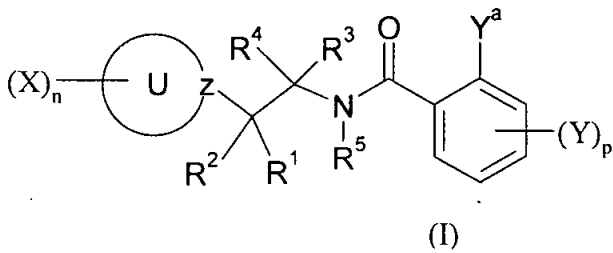
13. Una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un
15 compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 y un soporte aceptable desde el punto de vista agrícola.

- 20 14. Un 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 13 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 están creciendo las plantas o en el que se desea que crezcan.

RESUMEN

5

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



INFORME DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Nº de solicitud internacional
PCT/EP2006/063987

A. CLASIFICACIÓN DEL OBJETO DE LA SOLICITUD

INV. C07D209/16 C07D333/62 C07D333/58 C07D307/81 C07D235/14
C07D215/12 A01N43/12 A01N43/38 A01N43/52 A01N43/42

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, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES

Categoría *	Documentos citados, con indicación, si procede, de las partes relevantes	Relevante para las reivindicaciones Nº
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399390 No. de Registro Database 7549930 resumen & J. MASS. SPECTROMET., vol. 31, no. 6, 1996, páginas 913-920, -----	1,2,4-6 8
X	TETSUJI KAMETANI ET AL.: "Studies on the Synthesis of Heterocyclic Compounds part 698. An Alternative Ptotoberberine Synthesis" J. CHEM. SOC. PERKIN TRANS. 1, 1977, páginas 1151-1155, XP002399377 compuesto 12b, 12d ----- -/--	1,2,4-6 8

• 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.

"G" documento que forma parte de la misma familia de patentes

Fecha en que se ha concluido efectivamente la búsqueda internacional

21 Septiembre 2006

Fecha de expedición del informe de búsqueda internacional

04/10/2006

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

Diederer, Jeroen

INFORME DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Nº de solicitud internacional

PCT/EP2006/063987

C. (Continuación) DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES

Categoría *	Documentos citados, con indicación, si procede, de las partes relevantes	Relevante para las reivindicaciones Nº
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399391 No. de Registro Database 7496976 resumen & CAPPELLI ANDREA ET AL: J. MED. CHEM., vol. 39, no. 4, 1996, páginas 860-872, -----	1,2,4-6 8
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399392 No. de Registro Database 7495580 resumen & J. ORG. CHEM., vol. 618, no. 8, 1996, páginas 2780-2782, -----	1,2,4-6 8
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399393 No. de Registro Database 369910 resumen & J. INDIAN CHEM. SOC., vol. 14, 1937, página 144, -----	1-8
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399394 No. de Registro Database 349250 resumen & J. INDIAN CHEM. SOC., vol. 14, 1937, página 144, -----	1-6,8
X	DATABASE CHEMCATS CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, USA; XP002399395 número de orden: A3715/0157368, A3715/0157367, PHAR067498, PHAR127422, PHAR080483, PHAR125660, F0585-1132, F0585-1100, F0585-0876 F0585-0844, F0585-0828, F0585-0812, F0585-1197 & "Ambinter Stock Screening Collection" 3 Julio 2005 (03-07-2005), AMBINTER , 50, AVENUE DE VERSAILLES, PARIS, F-75016, FRANCIA ----- -/--	1-10

129

INFORME DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Nº de solicitud internacional
PCT/EP2006/063987

C. (Continuación) DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES

Categoría *	Documentos citados, con indicación, si procede, de las partes relevantes	Relevante para las reivindicaciones Nº
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399396 No. de Registro Database 118116 resumen & J. AM. CHEM. SOC, vol. 75, 1953, página 697, -----	12
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399397 No. de Registro Database 1240271 resumen & J. MED. CHEM., vol. 6, 1963, páginas 711-716, -----	12
X	DATABASE CROSS BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399398 No. de Registro Database 1367391 resumen & GB 1 174 411 A (ASPRA-NICHOLAS LTD.) 17 Diciembre 1969 (17-12-1969) -----	12
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399399 No. de Registro Database 4010005 resumen & J. CHEM. SOC. C, 1970, páginas 1013-1016, -----	12
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399400 No. de Registro Database 1307248 resumen & BULL. SOC. CHIM. BELG., vol. 71, 1962, página 592, -----	12
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399401 No. de Registro Database 1368375 resumen -/--	12

INFORME DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Nº de solicitud internacional
PCT/EP2006/063987

C. (Continuación) DOCUMENTOS CONSIDERADOS RELEVANTES		
Categoría *	Documentos citados, con indicación, si procede, de las partes relevantes	Relevante para las reivindicaciones Nº
A	& CHEM. HETEROCYCL. COMPD. (ENGL. TRANSL.), vol. 9, 1973, página 552, ----- CN 1 365 971 A (CHINESE AGRICULTRAL UNIV) 28 Agosto 2002 (28-08-2002) citado en la solicitud el documento completo -----	1,10, 12-14

INFORME DE BÚSQUEDA INTERNACIONAL

Información relativa a miembros de familia de patentes

☐ de solicitud internacional

PCT/EP2006/063987

Documento de patente citado en el informe de búsqueda	Fecha de publicación	Miembro(s) de la familia de patentes	Fecha de publicación
GB 1174411	A	17-12-1969	DE 1593743 A1 10-09-1970
			DE 1645928 A1 29-10-1970
			GB 1161802 A 20-08-1969
			GB 1161801 A 20-08-1969
			US 3502668 A 24-03-1970
CN 1365971	A	28-08-2002	NINGUNO

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2006/063987

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. C07D209/16 C07D333/62 C07D333/58 C07D307/81 C07D235/14
C07D215/12 A01N43/12 A01N43/38 A01N43/52 A01N43/42

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, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFURT AM MAIN, DE; XP002399390 Database accession no. 7549930 abstract & J. MASS. SPECTROMET., vol. 31, no. 6, 1996, pages 913-920,	1, 2, 4-6, 8
X	TETSUJI KAMETANI ET AL.: "Studies on the Synthesis of Heterocyclic Compounds part 698. An Alternative Ptoberberine Synthesis" J. CHEM. SOC. PERKIN TRANS. 1, 1977, pages 1151-1155, XP002399377 compound 12b, 12d ----- -/-	1, 2, 4-6, 8

☒ 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

21 September 2006

Date of mailing of the international search report

04/10/2006

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

Diederer, Jeroen

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2006/063987

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399391 Database accession no. 7496976 abstract & CAPPELLI ANDREA ET AL.: J. MED. CHEM., vol. 39, no. 4, 1996, pages 860-872,	1,2,4-6, 8
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399392 Database accession no. 7495580 abstract & J. ORG. CHEM., vol. 618, no. 8, 1996, pages 2780-2782,	1,2,4-6, 8
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399393 Database accession no. 369910 abstract & J. INDIAN CHEM. SOC., vol. 14, 1937, page 144,	1-8
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399394 Database accession no. 349250 abstract & J. INDIAN CHEM. SOC., vol. 14, 1937, page 144,	1-6,8
X	DATABASE CHEMCATS CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, USA; XP002399395 order number: A3715/0157368, A3715/0157367, PHAR067498, PHAR127422, PHAR080483, PHAR125660, F0585-1132, F0585-1100, F0585-0876 F0585-0844, F0585-0828, F0585-0812, F0585-1197 & "Ambinter Stock Screening Collection" 3 July 2005 (2005-07-03), AMBINTER, 50, AVENUE DE VERSAILLES, PARIS, F-75016, FRANCE	1-10
	-/--	

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

129

International application No
PCT/EP2006/063987

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399396 Database accession no. 118116 abstract & J. AM. CHEM. SOC., vol. 75, 1953, page 697, -----	12
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399397 Database accession no. 1240271 abstract & J. MED. CHEM., vol. 6, 1963, pages 711-716, -----	12
X	DATABASE CROSS BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399398 Database accession no. 1367391 abstract & GB 1 174 411 A (ASPRA-NICHOLAS LTD.) 17 December 1969 (1969-12-17) -----	12
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399399 Database accession no. 4010005 abstract & J. CHEM. SOC. C, 1970, pages 1013-1016, -----	12
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399400 Database accession no. 1307248 abstract & BULL. SOC. CHIM. BELG., vol. 71, 1962, page 592, -----	12
X	DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399401 Database accession no. 1368375 abstract ----- -/--	12

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/EP2006/063987

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	& CHEM. HETEROCYCL. COMPD. (ENGL. TRANSL.), vol. 9, 1973, page 552, ----- CN 1 365 971 A (CHINESE AGRICULTURAL UNIV) 28 August 2002 (2002-08-28) cited in the application the whole document -----	1, 10, 12-14

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/EP2006/063987

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
GB 1174411	A	17-12-1969	DE 1593743 A1 10-09-1970
			DE 1645928 A1 29-10-1970
			GB 1161802 A 20-08-1969
			GB 1161801 A 20-08-1969
			US 3502668 A 24-03-1970
CN 1365971	A	28-08-2002	NONE

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2006/063987

From the INTERNATIONAL BUREAU

PCT

NOTIFICATION 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) 23 November 2006 (23.11.2006)	
Applicant's or agent's file reference BCS 05-4020	IMPORTANT NOTIFICATION
International application No. PCT/EP2006/063987	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)

05356116.3

EP

30 October 2006 (30.10.2006)

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

Form PCT/IB/304 (October 2005)

1/C18H05EJ0

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 05-4020	FOR FURTHER ACTION	See item 4 below
International application No. PCT/EP2006/063987	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 9 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).

	Date of issuance of this report 16 January 2008 (16.01.2008)
The International Bureau of WIPO 34, chemin des Colombettes 1211 Geneva 20, Switzerland	Authorized officer Yolaine Cussac
Facsimile No. +41 22 338 82 70	e-mail: pt11.pct@wipo.int

PATENT COOPERATION TREATY

From the
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY

To:

see form PCT/ISA/220

PCT

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/EP2006/063987

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. C07D209/16 C07D333/62 C07D333/58 C07D307/81 C07D235/14 C07D215/12 A01N43/12 A01N43/38
A01N43/52 A01N43/42

Applicant
BAYER CROPSCIENCE S.A.

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 - P.B. 5818 Patentlaan 2
NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas
Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl
Fax: +31 70 340 - 3016

Date of completion of
this opinion

see form
PCT/ISA/210

Authorized Officer

Diederer, Jeroen

Telephone No. +31 70 340-1097



**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY**

International application No.
PCT/EP2006/063987

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

136
International application No.
PCT/EP2006/063987

Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of

☐ the entire international application

☒ claims Nos. 1-12 (in part)

because:

☐ the said international application, or the said claims Nos. relate to the following subject matter which does not require an international search (*specify*):

☐ the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

☐ the claims, or said claims Nos. are so inadequately supported by the description that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

☒ no international search report has been established for the whole application or for said claims Nos. 1-12 (in part)

☐ a meaningful opinion could not be formed without the sequence listing; the applicant did not, within the prescribed time limit:

☐ furnish a sequence listing on paper complying with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions, and such listing was not available to the International Searching Authority in a form and manner acceptable to it.

☐ furnish a sequence listing in electronic form complying with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions, and such listing was not available to the International Searching Authority in a form and manner acceptable to it.

☐ pay the required late furnishing fee for the furnishing of a sequence listing in response to an invitation under Rules 13ter.1(a) or (b).

☐ a meaningful opinion could not be formed without the tables related to the sequence listings; the applicant did not, within the prescribed time limit, furnish such tables in electronic form complying with the technical requirements provided for in Annex C-bis of the Administrative Instructions, and such tables were not available to the International Searching Authority in a form and manner acceptable to it.

☐ the tables related to the nucleotide and/or amino acid sequence listing, if in electronic form only, do not comply with the technical requirements provided for in Annex C-bis of the Administrative Instructions.

☐ See Supplemental Box for further details

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING AUTHORITY**

International application No.
PCT/EP2006/063987

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	10,11,
	No: Claims	1-9,12
Inventive step (IS)	Yes: Claims	13,14
	No: Claims	1-12
Industrial applicability (IA)	Yes: Claims	1-14
	No: Claims	

2. Citations and explanations

see separate sheet

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING
AUTHORITY (SEPARATE SHEET)**

International application No.

PCT/EP2006/063987

Re Item III.

The initial phase of the search revealed a very large number of documents relevant to the issue of novelty. So many documents were retrieved that it is impossible to determine which parts of the claims 1-12 may be said to define subject-matter for which protection might legitimately be sought (Article 6 PCT). The search was restricted to the examples only.

Re Item V.

1 Reference is made to the following documents:

- D1 : DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR
FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM
MAIN, DE; XP002399390 Database accession no.
7549930
- D2 : TETSUJI KAMETANI ET AL.: "Studies on the Synthesis of Heterocyclic
Compounds part 698. An Alternative Ptotoberberine Synthesis" J. CHEM.
SOC. PERKIN TRANS. 1, 1977, pages 1151-1155, XP002399377
- D3 : DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR
FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM
MAIN, DE; XP002399391 Database accession no.
7496976
- D4 : DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR
FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM
MAIN, DE; XP002399392 Database accession no.
7495580
- D5 : DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR
FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM
MAIN, DE; XP002399393 Database accession no.
369910
- D6 : DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR
FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM
MAIN, DE; XP002399394 Database accession no.
349250
- D7 : DATABASE CHEMCATS CHEMICAL ABSTRACTS

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING
AUTHORITY (SEPARATE SHEET)**

International application No.

PCT/EP2006/063987

SERVICE, COLUMBUS, OHIO, USA; XP002399395

D8 : DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR
FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM
MAIN, DE; XP002399396 Database accession no.
118116

D9 : DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE ZUR
FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN, FRANKFIRT AM
MAIN, DE; XP002399397 Database accession no.
1240271

D10 : DATABASE CROSS BEILSTEIN INSTITUTE ZUR
FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN,
FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399398
Database accession no. 1367391

D11 : DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE
ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN,
FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399399
Database accession no. 4010005

D12 : DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE
ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN,
FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399400
Database accession no. 1307248

D13 : DATABASE CROSSFIRE BEILSTEIN BEILSTEIN INSTITUTE
ZUR FOERDERUNG DER CHEMISCHEN WISSENSCHAFTEN,
FRANKFIRT AM MAIN, DE; XP002399401
Database accession no. 1368375

D14 : CN 1 365 971 A (CHINESE AGRICULTURAL UNIV) 28 August 2002
(2002-08-28) cited in the application

1. Novelty (Article 33(2) PCT)

The present application does not meet the criteria of Article 33(1) PCT, because the subject-matter of claims 1-9,12 is not new in the sense of Article 33(2) PCT.

Document D1 discloses a compound which is novelty destroying for claims 1,2,4-6,8 of the present application.

Document D2 discloses compounds 12b,12d which are novelty destroying for claims

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING
AUTHORITY (SEPARATE SHEET)**

International application No.

PCT/EP2006/063987

1,2,4-6,8 of the present application.

Document D3 discloses a compound which is novelty destroying for claims 1,2,4-6,8 of the present application.

Document D4 discloses a compound which is novelty destroying for claims 1,2,4-6,8 of the present application.

Document D5 discloses a compound which is novelty destroying for claims 1-8 of the present application.

Document D6 discloses a compound which is novelty destroying for claims 1-6,8 of the present application.

Document D7 discloses a compound which is novelty destroying for claims 1-10 of the present application.

Document D8 discloses a compound which is novelty destroying for claim 12 of the present application.

Document D9 discloses a compound which is novelty destroying for claim 12 of the present application.

Document D10 discloses a compound which is novelty destroying for claim 12 of the present application.

Document D11 discloses a compound which is novelty destroying for claim 12 of the present application.

Document D12 discloses a compound which is novelty destroying for claim 12 of the present application.

Document D13 discloses a compound which is novelty destroying for claim 12 of the present application.

2. Inventive Step (Article 33(3) PCT)

**WRITTEN OPINION OF THE
INTERNATIONAL SEARCHING
AUTHORITY (SEPARATE SHEET)**

International application No.

PCT/EP2006/063987

The present application does not meet the criteria of Article 33(1) PCT, because the subject-matter of claims 1-12 does not involve an inventive step in the sense of Article 33(3) PCT.

Claims 1-10,12 are not novel and can therefore not be considered inventive. Claims 10,11 are processes for the preparation of known and non-inventive compounds. These claims are not considered inventive.

Claims 13,14 concern the use of the compounds of the present invention for use as antifungals. The closest prior art is document D14. The difference of the subject-matter of the present application and the disclosure in D14 is that different heterocyclic groups are used. The problem to be solved by the applicant was to provide alternative compounds for use as antifungals. Starting from D14 it would not be obvious to arrive at the subject-matter of the present application as there are no pointers or indications in the prior art to change the 3-1H-2H-indolyl group. It is therefore considered that the subject-matter of claims 12,13 (in as far they concern novel compounds) are inventive.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-010096- -00000-0000

Fecha: 2008-02-01 17:00:06 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONAL
Act. 411 PRESENTACION Folios: 148

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 07 - 102,599
FECHA : DICIEMBRE 18 DE 2007

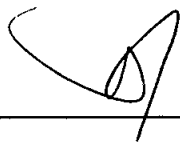
***** CONSIGNACION *****

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	482,000.00
1		TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	482,000.00
		TOTAL :	\$ 482,000.00

SON: CUATROCIENTOS OCHENTA Y DOS MIL PESOS

RESPONSABLE : 

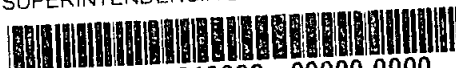
RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

143

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-010096- -00000-0000

Fecha: 2008-02-01 17:00:06
Tra. 11 PATENTEIYII
Act. 411 PRESENTACION

Dep. 2020 NUECREACIONE
Eve: 378 FASENACIONALI
Folios: 148

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 931
FECHA : ENERO 3 DE 2008

***** CONSIGNACION *****

VISITANTE	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 *****

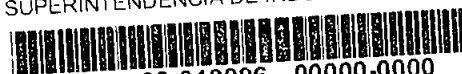
CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		998 VALOR COMPLEMENTO TARIFA A#0 ANTR	3,000.00
		TOTAL :	\$ 3,000.00

SON: TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

144
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-010096- -00000-0000

Fecha: 2008-02-01 17:00:06
Tra. 11 PATENTE IYII
Act. 411 PRESENTACION

Dep. 2020 NUECREACION
Eve: 378 FASENACIONAL
Folios: 148

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 07 - 53,021
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. _____

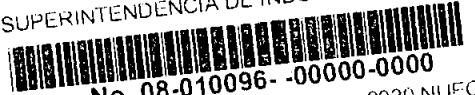
ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 900176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 08 - 1.137
FECHA : ENERO 3 DE 2008

145
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-010096- -00000-0000

Fecha: 2008-02-01 17:00:06 Dep. 2020 NUECREACION
Tra. 11 PATENTEIYI Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 148

***** 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 : 

RECIBO 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		146
(21) N° de solicitud:		(51) Int Cl: C07D 209/16, A01N 43/12, A01N 43/38, A01N 43/42, A01N 43/52, C07D 215/12, C07D 235/14, C07D 307/81, C07D 333/58, C07D 333/62		
22) Fecha de solicitud:		(71) Solicitante(s) BAYER CROPSCIENCE S.A.		
(30) Prioridad	(31) No. 05356116.3	32) Fecha 12/07/05	(33) Pais 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/2007/006734
	No. de solicitud PCT/EP2006/063987			
(54) Titulo: NUEVOS DERIVADOS DE LA BENZOHETEROCICLILETILBENZAMIDA				

La presente invención se refiere a nuevos derivados de benzoheterocicliletilbenzamida 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 y métodos para luchar contra hongos fitopatógenos de plantas, usando estos compuestos o sus composiciones:

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 08-010096-00000-0000

Fecha: 2008-02-01 17:00:06 Dep. 2020 NUECREACIONI
Tra. 11: PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 148

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

148

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 10096
	Solicitud internacional	PCT/EP2006/063987
	Fecha inicio fase nacional	12/02/2008
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	2718

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 22 FEB. 2008
jfernand