



19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 360 133**

51 Int. Cl.:  
**C07D 401/12** (2006.01)  
**C07D 409/12** (2006.01)  
**A01N 43/40** (2006.01)  
**A01N 43/56** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **06763172 .1**  
96 Fecha de presentación : **17.05.2006**  
97 Número de publicación de la solicitud: **1885712**  
97 Fecha de publicación de la solicitud: **13.02.2008**

54 Título: **Nuevos derivados de 2-piridinilcicloalquilcarboxamida como fungicidas.**

30 Prioridad: **18.05.2005 EP 05356083**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**01.06.2011**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**01.06.2011**

73 Titular/es: **Bayer CropScience AG.**  
**Alfred-Nobel-Strasse 50**  
**40789 Monheim, DE**

72 Inventor/es: **Mansfield, Darren;**  
**Coqeron, Pierre-Yves;**  
**Rieck, Heiko;**  
**Desbordes, Philippe;**  
**Villier, Alain;**  
**Grosjean-Cournoyer, Marie-Claire y**  
**Genix, Pierre**

74 Agente: **Carpintero López, Mario**

ES 2 360 133 T3

Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín europeo de patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre concesión de Patentes Europeas).

## DESCRIPCIÓN

Nuevos derivados de 2-piridinilcicloalquilcarboxamida como fungicidas

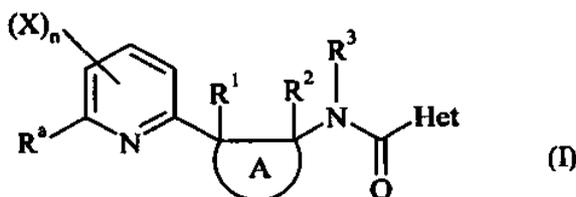
La presente invención se refiere a nuevos derivados de N-[2-(2-piridinil)etil]carboxamida, a su procedimiento de preparación, a su uso como fungicidas, particularmente en forma de composiciones fungicidas, y a procedimientos para el control de hongos fitopatógenos de plantas usando estos compuestos o sus composiciones.

La Solicitud de Patente Internacional WO 01/11965 divulga una amplia familia de compuestos fungicidas. No hay una divulgación específica de los derivados de N-[2-(2-piridinil)etil]carboxamida.

Siempre suscita gran interés, en el campo de los productos agroquímicos, el uso de compuestos pesticidas más activos que los compuestos ya conocidos por el especialista en la técnica, con lo que puede usarse una menor cantidad de compuesto mientras retiene su eficacia equivalente.

Los inventores han descubierto ahora una nueva familia de compuestos que muestran una actividad fungicida potenciada sobre la familia general conocida de dichos compuestos.

Por consiguiente, la presente invención se refiere a un derivado de N-[2-(2-piridinil)etil]carboxamida de fórmula general (I)



en la que:

- n es 1, 2 ó 3;
- X es igual 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- $\lambda^6$ -sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, un alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, un alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-amino, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-amino, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfanilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfanilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenoalqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiloxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenoalquiloxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un (N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)oxicarbamoilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un (N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carboniloxi, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilamino, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> aminocarboniloxi, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-aminocarboniloxi, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> oxicarboniloxi, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfenilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfenilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfinilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfinilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> imino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un (alquenil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> oximino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un (alquinil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> oximino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un (benciloximino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un benciloxi, un bencilulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo o un fenilamino;
- R<sup>a</sup> es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro- $\lambda^6$ -sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, un alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, un alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-amino, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-amino, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfanilo, un halogenoalquilsulfanilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenoalqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiloxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenoalquiloxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> oxicarbamoilo,

5 un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carboniloxi, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilamino, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-aminocarboniloxi, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-aminocarboniloxi, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> oxicarboniloxi, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfenilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfenilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfinilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfinilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-sulfonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> imino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un (alquenil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> oxiiimino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un (alquinil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> oxiiimino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un (benciloxiimino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un benciloxi, un bencilsulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo o un fenilamino;

- A es un carbociclo no aromático de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros;
- R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> se eligen, independientemente uno de otro, entre un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo 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 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-amino, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfanilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfanilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenil C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> oxi, un halogenoalquenil C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> oxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquinil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> oxi, un halogenoalquinil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> oxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbamoilo, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbamoilo, un N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> oxicarbamoilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbamoilo, un N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbamoilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carboniloxi, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilamino, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> aminocarboniloxi, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> aminocarboniloxi, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> oxicarboniloxi, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfenilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfenilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfinilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfinilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un bencilo, un benciloxi, un bencilsulfanilo, un bencilsulfinilo, un bencilsulfonilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo, un fenilsulfinilo, un fenilsulfonilo, un fenilamino, un fenilcarbonilamino, un grupo 2,6 diclorofenil-carbonilamino o un grupo fenilo,
- R<sup>3</sup> se elige entre un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo hidroxilo, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un halogeno C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un halogeno C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un cianoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un aminoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> amino-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> oxicarbonilo, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, un halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un benciloxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquil carbonilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfonilo o un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfinilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- Het representa un heterociclo no condensado, opcionalmente sustituido, de 5, 6 o 7 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes, estando unido Het mediante un átomo de carbono;

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

En el contexto de la presente invención :

- 45 - halógeno significa flúor, bromo, cloro o yodo.
- carboxi significa -C(=O)OH; carbonilo significa -C(=O)-; carbamoilo significa -C(=O)NH<sub>2</sub>; N-hidroxycarbamoilo significa -C(=O)NHOH;
- un grupo alquilo, un grupo alquenilo, y un grupo alquinilo, así como los restos que contienen estos términos, pueden ser lineales o ramificados.

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

Cualquiera de los compuestos de la presente invención puede existir en una o más formas isoméricas ópticas o quirales, dependiendo del número de centros asimétricos en el compuesto. La invención, por lo tanto, se refiere

igualmente a todos los isómeros ópticos y a sus mezclas recémicas o escalémicas (el término "escalémico" se refiere a una mezcla de enantiómeros en diferentes proporciones), y a las mezclas de todos los posibles estereoisómeros, en todas las proporciones. Los diaestereoisómeros y/o los isómeros ópticos pueden separarse de acuerdo con los procedimientos conocidos *per se* por el especialista en la técnica.

- 5 Cualquiera de los compuestos de la presente invención puede existir también en una o más formas isoméricas geométricas dependiendo del número de dobles enlaces en el compuesto. La invención se refiere, por lo tanto, igualmente a todos los isómeros geométricos y a todas las posibles mezclas, en todas las proporciones. Los isómeros geométricos pueden separarse de acuerdo con procedimientos generales, conocidos *per se* por el especialista en la técnica.
- 10 Cualquiera de los compuestos de fórmula general (I) en la que R<sub>1</sub> representa un grupo hidroxilo o sulfanilo, y/o X representa un grupo hidroxilo, sulfanilo o amino, puede encontrarse en su forma tautomérica resultante del desplazamiento del protón de dicho grupo hidroxilo, sulfanilo o amino. Dichas formas tautoméricas de dichos compuestos también son parte de la presente invención. Hablando de forma más general, todas las formas tautoméricas de los compuestos de fórmula general (I) en la que R<sub>1</sub> representa un grupo hidroxilo o sulfanilo, y/o X representa un grupo hidroxilo, sulfanilo o amino, así como las formas tautoméricas de los compuestos que pueden usarse opcionalmente como intermedios en los procedimientos de preparación, y que se definirán en la descripción de estos procedimientos, también son parte de la presente invención.

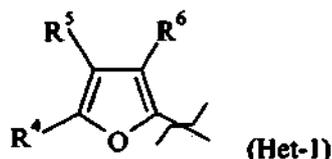
De acuerdo con la presente invención, el 2-piridilo está sustituido en la posición 6 con R<sup>a</sup> y puede estar sustituido en cualquier otra posición con (X)<sub>n</sub>, en la que R<sup>a</sup>, X y n son como se han definido anteriormente. Preferentemente, la presente invención se refiere un derivado de N-[2-(2-piridinil)etil]carboxamida de fórmula general (I) en la que las diferentes características, que pueden elegirse en solitario o en combinación, son:

- respecto a R<sup>a</sup>, R<sup>a</sup> es un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno;
  - respecto a n, n es 1 ó 2;
  - respecto a X, X es un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>;
- 25 - respecto a las posiciones en las que el resto 2-piridilo está sustituido con X, el resto 2-piridilo está sustituido con X en la posición 3 y/o 5.

De acuerdo con la presente invención, A es un carbociclo no aromático de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros. Preferentemente, A es un carbociclo no aromático de 3, 5, 6 o 7 miembros. Aún más preferentemente, A se elige entre ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo y cicloheptilo.

- 30 De acuerdo con la presente invención, dos de los átomos de carbono del resto cicloalquilo del compuesto de fórmula (I) están sustituidos, respectivamente, con R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup>. Preferentemente, la presente invención se refiere también a un derivado de N-[2-(2-piridinil)cicloalquil] carboxamida de fórmula general (I) en la que R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> pueden elegirse, independientemente uno de otro, como un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfanilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfenilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfinilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilamino, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilamino o un grupo fenilo. Más preferentemente, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> pueden elegirse, independientemente uno de otro, como un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilamino. Aún más preferentemente, R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> son ambos un átomo de hidrógeno.
- 40 De acuerdo con la presente invención, el átomo de nitrógeno del resto carboxamida del compuesto de fórmula (I) está sustituido con R<sup>3</sup>, siendo R<sup>3</sup> como se ha definido anteriormente. Preferentemente, la presente invención se refiere también un derivado de N-[2-(2-piridinil) cicloalquil]carboxamida de fórmula general (I) en la que R<sup>3</sup> puede elegirse como si fuera un átomo de hidrógeno o un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>. Aún más preferentemente, el cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> es ciclopropilo.
- 45 De acuerdo con la presente invención, "Het" del compuesto de fórmula general (I) es un heterociclo no condensado de 5, 6 o 7 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes, estando unido Het mediante un átomo de carbono y estando opcionalmente sustituido. Preferentemente, Het está sustituido en la posición orto.
- 50 De acuerdo con la presente invención, "Het" del compuesto de fórmula general (I) puede ser un anillo heterocíclico de cinco miembros. Los ejemplos específicos de compuestos de la presente invención en los que Het es un heterociclo de cinco miembros incluyen:

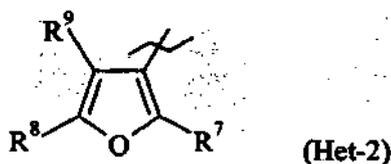
\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-1)



en la que:

- R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- 5 - R<sup>6</sup> puede ser un átomo de halógeno, un grupo nitro, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-2)

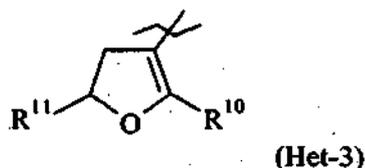


en la que:

- 10 - R<sup>7</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

con la condición de que R<sup>7</sup> y R<sup>9</sup> no sean ambos un átomo de hidrógeno.

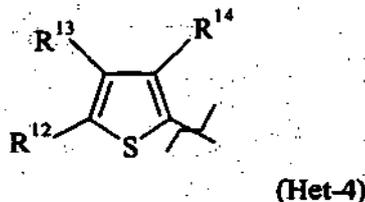
- 15 \* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-3)



en la que:

- R<sup>10</sup> puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- 20 - R<sup>11</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-4)



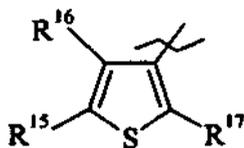
en la que:

- 25 - R<sup>12</sup> y R<sup>13</sup> pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>

sulfonilo, un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un piridilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y

- R<sup>14</sup> puede ser un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

5 \* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-5)



(Het-5)

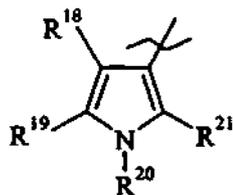
en la que:

- R<sup>15</sup> y R<sup>16</sup> pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> oxi o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y

10 - R<sup>17</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

con la condición de que R<sup>16</sup> y R<sup>17</sup> no sean ambos un átomo de hidrógeno.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-6)



(Het-6)

15 en la que:

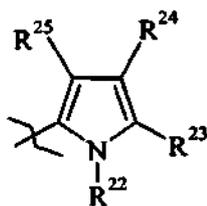
- R<sup>18</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

- R<sup>19</sup> y R<sup>21</sup> pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y

20 - R<sup>20</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un hidroxialquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sulfonilo, un di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)aminosulfonilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o un benzoílo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

con la condición de que R<sup>18</sup> y R<sup>21</sup> no sean ambos un átomo de hidrógeno.

25 \* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-7)



(Het-7)

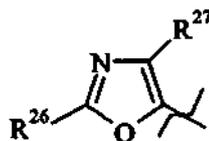
en la que:

- R<sup>22</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de

1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un hidroxialquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sulfonilo, un di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)aminosulfonilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o un benzoílo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y

- 5 - R<sup>23</sup>, R<sup>24</sup> y R<sup>25</sup> pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano,
- un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> carbonilo;
- con la condición de que R<sup>22</sup> y R<sup>25</sup> no sean ambos un átomo de hidrógeno.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-8)

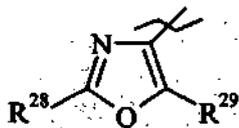


(Het-8)

10 en la que:

- R<sup>26</sup> puede ser un átomo de hidrógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y
- R<sup>27</sup> puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-9)



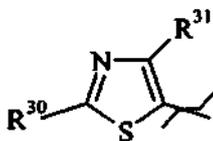
(Het-9)

15

en la que:

- R<sup>28</sup> puede ser un átomo de hidrógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y
- R<sup>29</sup> puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

20 \* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-10)



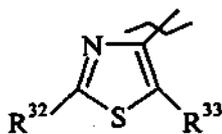
(Het-10)

en la que:

- 25 - R<sup>30</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo ciano, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> amino, un di(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)amino, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y

- R<sup>31</sup> puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-11)

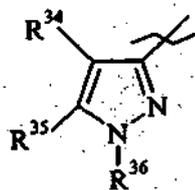


(Het-11)

en la que:

- 5
- R<sup>32</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo ciano, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> amino, un di-(alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)amino, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
  - R<sup>33</sup> puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-12)



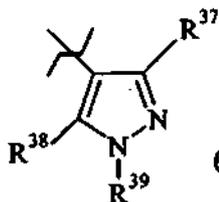
(Het-12)

10 en la que:

- R<sup>34</sup> puede ser un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un grupo aminocarbonilo o un amino-carbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;
- 15 - R<sup>35</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio; y
- R<sup>36</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un fenilo, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

20

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-13)



(Het-13)

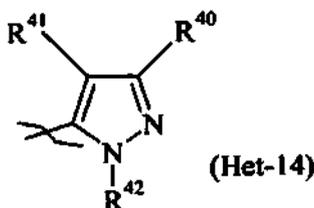
en la que:

- 25
- R<sup>37</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un aminocarbonilo o un aminocarbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;
  - R<sup>38</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio; y
  - 30 - R<sup>39</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un

halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alcoxi alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un grupo nitro;

con la condición de que R<sup>37</sup> y R<sup>38</sup> no sean ambos un átomo de hidrógeno.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-14)



5

en la que:

- R<sup>40</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un aminocarbonilo, o un aminocarbonil-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

10

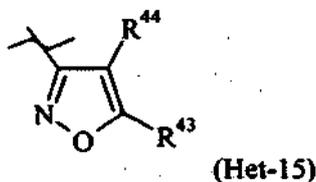
- R<sup>41</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

15

- R<sup>42</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un fenilo, un bencilo, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

con la condición de que R<sup>41</sup> y R<sup>42</sup> no sean ambos un átomo de hidrógeno.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-15)



20

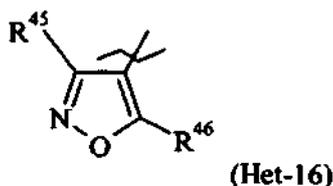
en la que:

- R<sup>43</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y

- R<sup>44</sup> puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

25

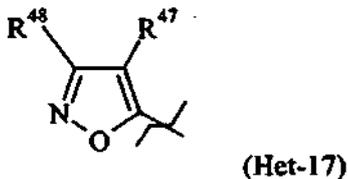
\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-16)



30

en la que R<sup>45</sup> y R<sup>46</sup> pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o un heterociclilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; con la condición de que R<sup>47</sup> y R<sup>48</sup> no sean ambos un átomo de hidrógeno.

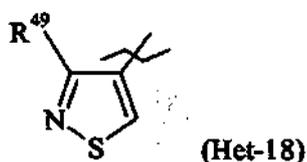
\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-17)



en la que

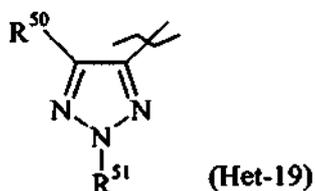
- 5
- R<sup>47</sup> puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, y
  - R<sup>48</sup> puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-18)



- 10
- en la que R<sup>49</sup> puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

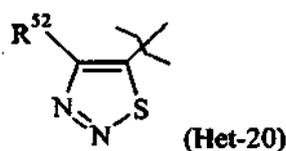
\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-19)



en la que:

- 15
- R<sup>50</sup> puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
  - R<sup>51</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-20)

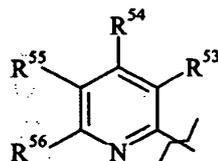


- 20
- en la que R<sup>52</sup> puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

25

De acuerdo con la presente invención, "Het" del compuesto de fórmula general (I) puede ser un anillo heterocíclico de seis miembros. Los ejemplos específicos de compuestos de la presente invención en los que Het es un heterociclo de seis miembros incluyen:

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-21)

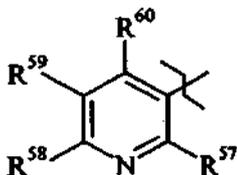


(Het-21)

en la que:

- R<sup>53</sup> puede ser un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- R<sup>54</sup>, R<sup>55</sup> y R<sup>56</sup>, que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sulfinilo o un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sulfonilo.

10 \* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-22)



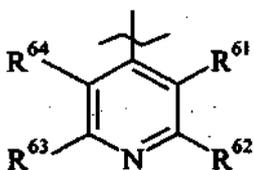
(Het-22)

en la que:

- R<sup>57</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> tio, un alquenoil C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> tio, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un feniloxi opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o un feniltio opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;
- R<sup>58</sup>, R<sup>59</sup> y R<sup>60</sup>, que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sulfinilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sulfonilo o una N-morfolina opcionalmente sustituida con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o un tienilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

con la condición de que R<sup>57</sup> y R<sup>60</sup> no sean ambos un átomo de hidrógeno.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-23)

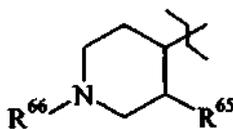


(Het-23)

- R<sup>61</sup>, R<sup>62</sup>, R<sup>63</sup> y R<sup>64</sup>, que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sulfinilo o un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> sulfonilo;

30 con la condición de que R<sup>61</sup> y R<sup>64</sup> no sean ambos un átomo de hidrógeno.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-24)

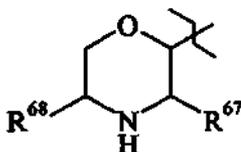


(Het-24)

en la que:

- R<sup>65</sup> puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- 5 - R<sup>66</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un bencilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno, un benciloxycarbonilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno o a heterociclilo.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-25)



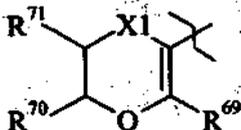
(Het-25)

10 en la que:

- R<sup>67</sup> puede ser un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> tio que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- R<sup>68</sup> puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un bencilo.

15

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-26)

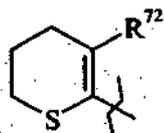


(Het-26)

en la que:

- X<sup>1</sup> puede ser un átomo de azufre, -SO-, -SO<sub>2</sub>- o -CH<sub>2</sub>-;
- 20 - R<sup>69</sup> puede ser un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R<sup>70</sup> y R<sup>71</sup> pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-27)

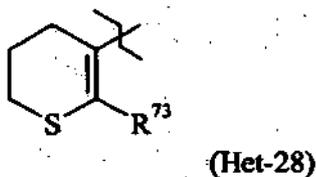


(Het-27)

en la que:

- 25 - R<sup>72</sup> puede ser un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

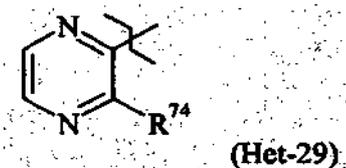
\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-28)



en la que:

-  $R^{73}$  puede ser un alquilo  $C_1-C_4$  o un halogenoalquilo  $C_1-C_4$  que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

\* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-29)

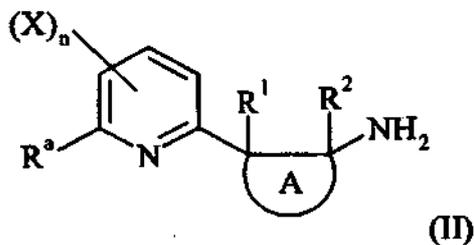


5

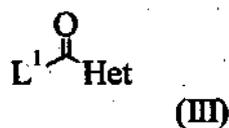
en la que  $R^{74}$  puede ser un átomo de halógeno, un alquilo  $C_1-C_4$  o un halogenoalquilo  $C_1-C_4$  que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

La presente invención también se refiere a un procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). De esta manera, de acuerdo con otro aspecto de la presente invención se proporciona un procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula general (I) como se ha definido anteriormente, que comprende hacer reaccionar un derivado de 2-piridina de fórmula general (II) o una de sus sales:

10



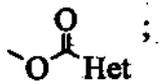
en la que X, n,  $R^a$ ,  $R^1$ ,  $R^2$  y A son como se han definido anteriormente; con un derivado de ácido carboxílico de fórmula general (III)



15

en la que:

-  $L^1$  es un grupo saliente elegido para que sea un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo,  $-OR^{75}$ ,  $-OCOR^{75}$ , siendo  $R^{75}$  un alquilo  $C_1-C_6$ , un haloalquilo  $C_1-C_6$ , un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula



20

en presencia de un catalizador y, si  $L^1$  es un grupo hidroxilo, en presencia de un agente de condensación.

El procedimiento de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de un catalizador. El catalizador adecuado puede elegirse como 4-dimetil-aminopiridina, 1-hidroxi-benzotriazol o dimetilformamida.

25

En el caso de que  $L^1$  sea un grupo hidroxilo, el procedimiento de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de un agente de condensación. El agente de condensación adecuado puede elegirse para que sea formador de haluro de ácido, tal como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo,



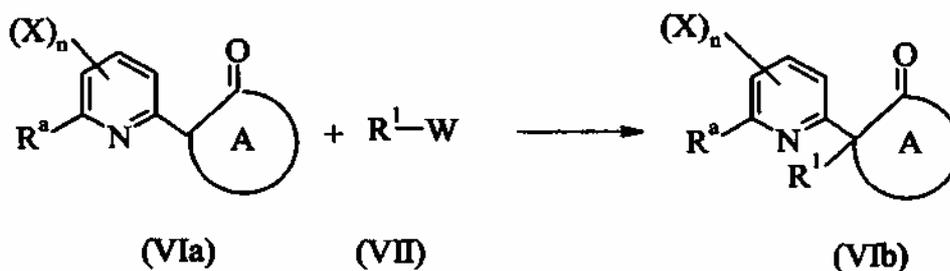
- $R^{76}$  y  $R^{77}$  son un alquilo  $C_1-C_6$  o pueden formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 o 7 miembros;
- U es un grupo saliente elegido para que sea un halógeno, un alquil  $C_1-C_6$  sulfonato o;

que comprende la arilación de un derivado de enamina de fórmula general (V) mediante un derivado de piridina de fórmula general (IV), proporcionando un derivado de 2-(piridil)cetona de fórmula general (VIa), a una temperatura de 0 °C a 200 °C;

5

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

**Esquema a-2**



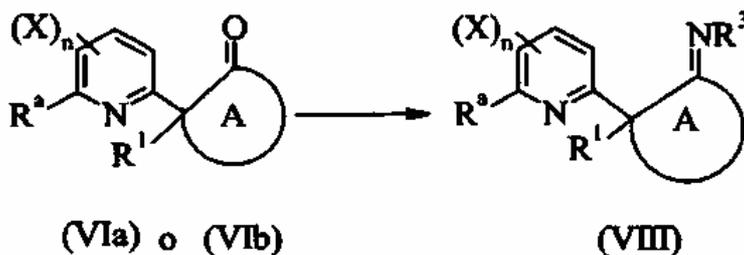
en el que:

- $R^a$ , A, X y n son como se han definido anteriormente;
- $R^1$  es un alquilo  $C_1-C_6$ ;
- W es un átomo de halógeno, un alquil  $C_1-C_6$  sulfonato, un haloalquil  $C_1-C_6$  sulfonato o un 4-metil-fenilsulfonato, que comprende la alquilación de un compuesto de fórmula general (VIa) mediante un reactivo de fórmula general (VII) proporcionando un compuesto de fórmula general (VIb);

10

- una tercera etapa de acuerdo con el esquema de reacción a-3:

**Esquema a-3**



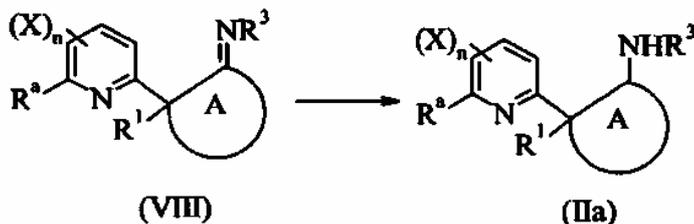
15

en el que:

- $R^a$ , A, X y n son como se han definido anteriormente;
- $R^1$  es un átomo de hidrógeno o un alquilo  $C_1-C_6$ ;
- $R^3$  es un átomo de hidrógeno, un alquilo  $C_1-C_6$ , un haloalquilo  $C_1-C_6$ , un alcoxi  $C_1-C_6$  o un cicloalquilo  $C_3-C_7$ ; que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (VIa) o (VIb) con una amina de fórmula  $R^3-NH_2$  proporcionando un derivado de imina de fórmula general (VIII);

20

- una cuarta etapa de acuerdo con el esquema a-4:

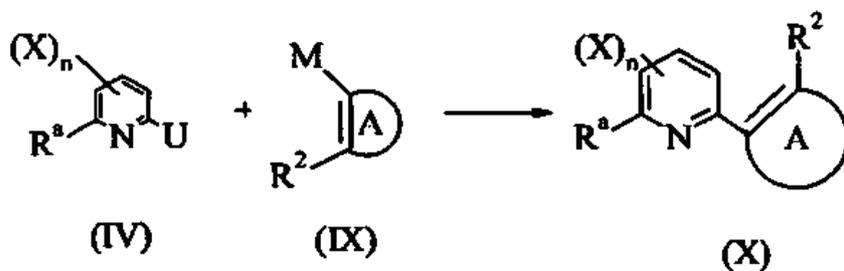
**Esquema 4**

en la que:

- $R^a$ , A, X y n son como se han definido anteriormente;
- $R^1$  es un átomo de hidrógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>,
- 5 -  $R^3$  es un átomo de hidrógeno, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>; que comprende la reducción de un derivado de imina de fórmula general (VIII) por hidrogenación o mediante un dador de hidruro, en el mismo recipiente, o en uno diferente, proporcionando un derivado de amina de fórmula general (IIa) o una de sus sales.

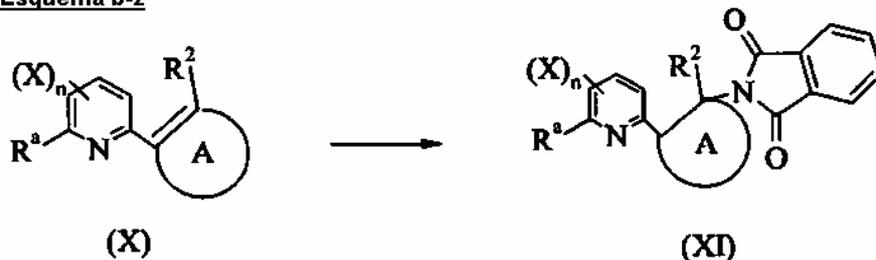
Un segundo ejemplo (b) de dicho procedimiento puede ser cuando:

- 10 -  $R^a$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ , A, X y n son como se han definido anteriormente;
- $R^1$  es un átomo de hidrógeno; después, 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 b-1:

**Esquema b-1**

15 en el que:

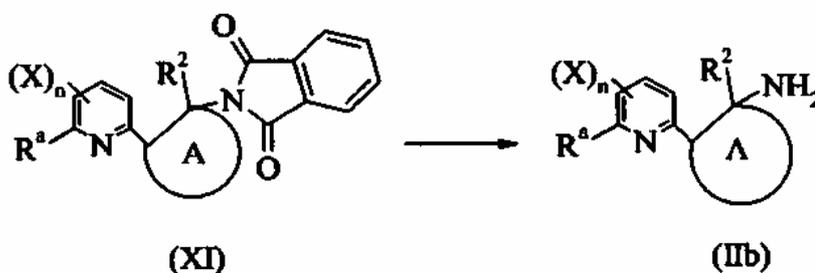
- $R^a$ ,  $R^2$ , A, X y n son como se han definido anteriormente;
- U es un grupo saliente elegido para que sea un halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfonato o un haloalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfonato;
- M es un metal o una especie metaloide;
- 20 que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de piridina de fórmula general (IV) con una especie vinílica de fórmula general (IX), a una temperatura de 0 °C a 200 °C, proporcionando un compuesto de fórmula general (X);
- una segunda etapa de acuerdo con el esquema de reacción b-2:

**Esquema b-2**

en el que  $R^a$ ,  $R^2$ , A, X y n son como se han definido anteriormente;

que comprende la adición de una ftalimida o una de sus sales sobre un compuesto de fórmula general (X), proporcionando un compuesto de fórmula general (XI);

- 5 - una tercera etapa de acuerdo con el esquema de reacción b-3:

**Esquema b-3**

en el que  $R^a$ ,  $R^2$ , A, X y n son como se han definido anteriormente; que comprende la desprotección de un compuesto de fórmula general (XI) con hidrazina hidrato o una sal de hidrazina, proporcionando un derivado de amina de fórmula general (IIb) o una de sus sales.

- 10 La primera etapa (etapa b-1) del procedimiento b de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de una especie vinílica de fórmula general (IX) en la que M puede ser un metal o una especie metaloide. Preferentemente, M es un derivado de estaño o un derivado de boro. Más preferentemente, M es un grupo tri-*n*butilestaño.

- 15 La primera etapa (etapa b-1) del procedimiento b de acuerdo con la presente invención se realiza a una temperatura de 0 °C a 200 °C.

La primera etapa (etapa b-1) del procedimiento b de acuerdo con la presente invención puede realizarse en presencia de un disolvente. Preferentemente, el disolvente se elige para que sea agua, un disolvente orgánico o una mezcla de ambos. Los disolventes orgánicos adecuados pueden ser, por ejemplo, un disolvente alifático, alicíclico o aromático.

- 20 La primera etapa (etapa b-1) del procedimiento b de acuerdo con la presente invención puede realizarse también en presencia de un catalizador. Preferentemente, el catalizador se elige para que sea sales o complejos de paladio. Más preferentemente, el catalizador se elige para que sea un complejo de paladio. Un catalizador de complejo de paladio adecuado puede generarse, por ejemplo, directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo. Los ligandos adecuados pueden ser, por ejemplo
- 25 ligandos voluminosos de fosfinas o arsinas, tales como (R)-(-)-1-[(S)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etilidiciclohexilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etildifenilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-di-*t*-butilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; o (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etilidiciclohexilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una
- 30 mezcla de ambos.

La primera etapa (etapa b-1) del procedimiento b de acuerdo con la presente invención puede realizarse también en presencia de una base. Preferentemente, la base se elige para que sea una base orgánica o inorgánica. Los ejemplos adecuados de dichas bases pueden ser, por ejemplo, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos,

carbonatos o hidrogenocarbonatos, acetatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos o aminas terciarias.

Un tercer ejemplo (c) de dicho procedimiento puede ser cuando:

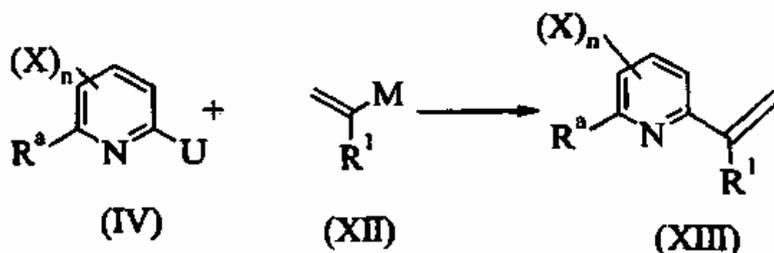
- $R^a$ ,  $R^1$ , X, n son como se han definido anteriormente;
- $R^2$ ,  $R^3$  son un átomo de hidrógeno

5 - A es un anillo de ciclopropilo;

después, 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 c-1:

**Esquema c-1**



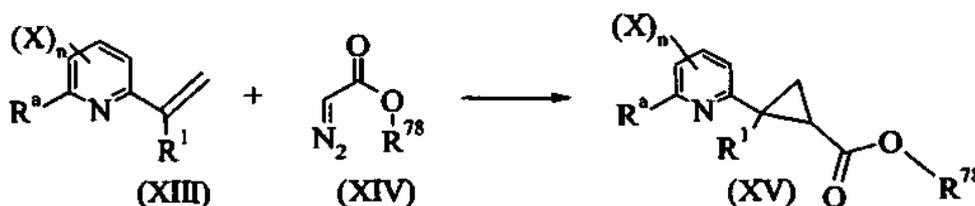
10 en el que:

- $R^a$ ,  $R^1$ , X, n son como se han definido anteriormente;
- U es un grupo saliente elegido para que sea un halógeno, un alquil  $C_1-C_6$  sulfonato o un haloalquil  $C_1-C_6$  sulfonato;
- M es un metal o una especie metaloide;

15 que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de piridina de fórmula general (IV) con una especie vinílica de fórmula general (XII), a una temperatura de 0 °C a 200 °C, proporcionando un compuesto de fórmula general (XIII);

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

**Esquema c-2**



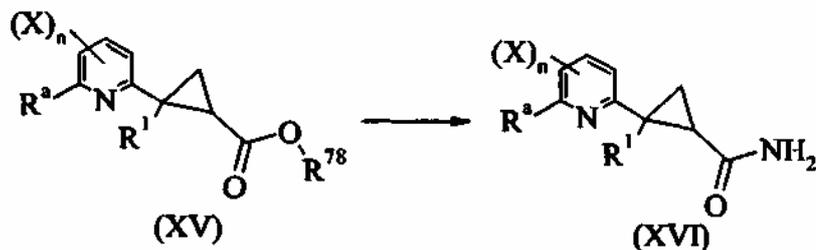
20 en el que:

- $R^a$ ,  $R^1$ , X y n son como se han definido anteriormente;
- $R^{78}$  es un grupo alquilo  $C_1-C_6$ ;

que comprende una reacción de ciclopropanación de un derivado vinílico de piridina de fórmula general (XIII) con una especie diazo de fórmula general (XIV), a una temperatura de 0 °C a 200 °C, proporcionando un compuesto de fórmula general (XV);

25

- una tercera etapa de acuerdo con el esquema de reacción c-3:

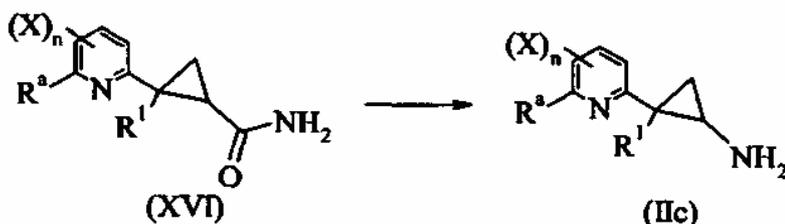
**Esquema c-3**

en el que:

- $R^a$ ,  $R^1$ ,  $X$  y  $n$  son como se han definido anteriormente;
- $R^{78}$  es un grupo alquilo  $C_1$ - $C_6$ ;

5 que comprende una reacción de amidación de un derivado éster de fórmula general (XV) proporcionando un compuesto de fórmula general (XVI);

- una cuarta etapa de acuerdo con el esquema de reacción c-4:

**Esquema c-4**

10 en el que  $R^a$ ,  $R^1$ ,  $X$  y  $n$  son como se han definido anteriormente; que comprende una reacción de redistribución de un derivado de amida primaria de fórmula general (XVI) en presencia de un agente halogenante, proporcionando una amina de fórmula general (IIc).

15 La primera etapa (etapa c-1) del procedimiento c de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de una especie vinílica de fórmula general (XII) en la que  $M$  puede ser un metal o una especie metaloide. Preferentemente  $M$  es un derivado de estaño o un derivado de boro. Más preferentemente  $M$  es un grupo tributilestaño.

La primera etapa (etapa c-1) del procedimiento c de acuerdo con la presente invención se realiza a una temperatura de  $0\text{ }^{\circ}\text{C}$  a  $200\text{ }^{\circ}\text{C}$ .

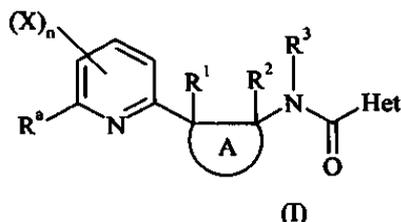
20 La primera etapa (etapa c-1) del procedimiento c de acuerdo con la presente invención puede realizarse en presencia de un disolvente. Preferentemente, el disolvente se elige para que sea agua, un disolvente orgánico o una mezcla de ambos. Los disolventes orgánicos adecuados pueden ser, por ejemplo, un disolvente alifático, alicíclico o aromático.

25 La primera etapa (etapa c-1) del procedimiento c de acuerdo con la presente invención puede realizarse también en presencia de un catalizador. Preferentemente, el catalizador se elige para que sea sales o complejos de paladio. Más preferentemente, el catalizador se elige para que sea un complejo de paladio. Un catalizador de complejo de paladio adecuado puede generarse, por ejemplo, directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo. Los ligandos adecuados pueden ser, por ejemplo  
 30 ligandos voluminosos de fosfinas o arsinas, tales como (R)-(-)-1-[(S)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etil-diciclohexilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etil-difenilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-di-t-butilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; o (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-diciclohexilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos.

La primera etapa (etapa c-1) del procedimiento c de acuerdo con la presente invención puede realizarse también en

presencia de una base. Preferentemente, la base se elige para que sea una base orgánica o inorgánica. Los ejemplos adecuados de dichas bases pueden ser, por ejemplo, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, carbonatos o hidrogenocarbonatos, acetatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos o aminas terciarias.

5 La presente invención también se refiere a otro procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I). De esta manera, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I)



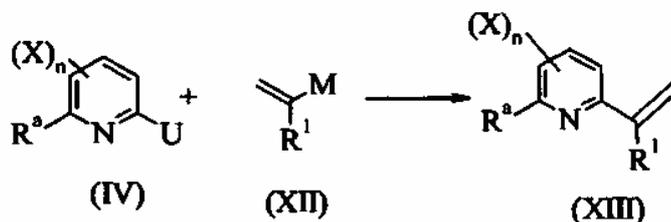
en la que:

- $R^a$ ,  $R^1$ , X, Y, n, p son como se han definido anteriormente;
- 10 -  $R^2$  y  $R^3$  son un átomo de hidrógeno; y
- A es un anillo de ciclopropilo;

comprendiendo dicho procedimiento:

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

**Esquema d-1**



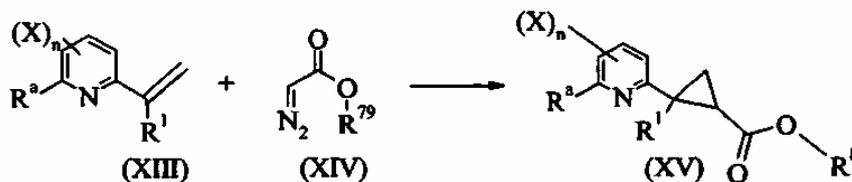
15 en el que:

- $R^a$ ,  $R^1$ , X, n son como se han definido anteriormente;
- U es un grupo saliente elegido para que sea un halógeno, un alquil  $C_1$ - $C_6$  sulfonato o un haloalquil  $C_1$ - $C_6$  sulfonato;
- M es un metal o una especie metaloide;

20 que comprende una reacción de acoplamiento de un derivado de piridina de fórmula general (IV) con una especie vinílica de fórmula general (XII), a una temperatura de 0 °C a 200 °C, proporcionando un compuesto de fórmula general (XIII);

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

**Esquema d-2**



25 en el que:

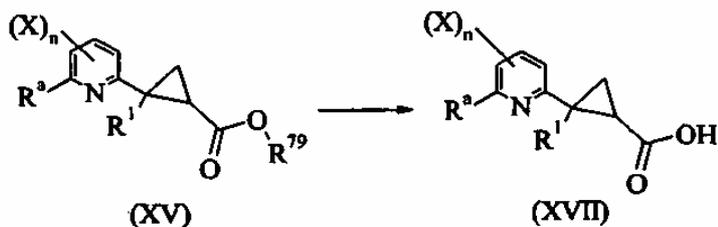
- $R^a$ ,  $R^1$ , X y n son como se han definido anteriormente;
- $R^{79}$  es un grupo alquilo  $C_1-C_6$ ;

que comprende una reacción de ciclopropanación de un derivado vinílico de piridina de fórmula general (XIII) con una especie diazo de fórmula general (XIV), a una temperatura de 0 °C a 200 °C, proporcionando un compuesto de fórmula general (XV);

5

- una tercera etapa de acuerdo con el esquema de reacción d-3:

**Esquema d-3**



en el que:

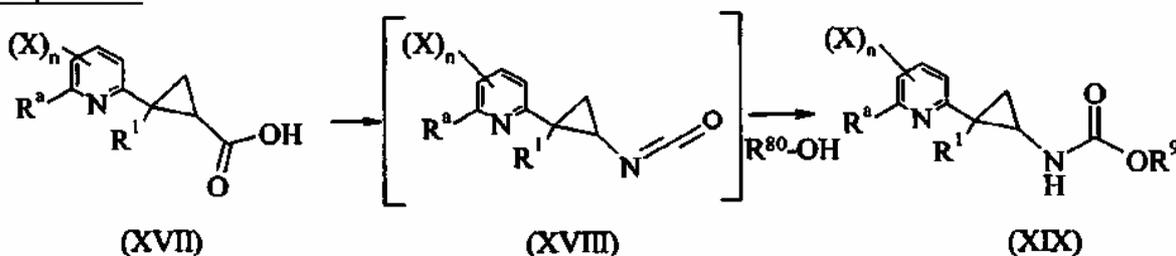
- $R^a$ ,  $R^1$ , X y n son como se han definido anteriormente;
- $R^{79}$  es un grupo alquilo  $C_1-C_6$ ;

10

que comprende una reacción de hidrólisis de un derivado éster de fórmula general (XV) proporcionando un ácido de fórmula general (XVII);

- una cuarta etapa de acuerdo con el esquema de reacción d-4:

**Esquema d-4**

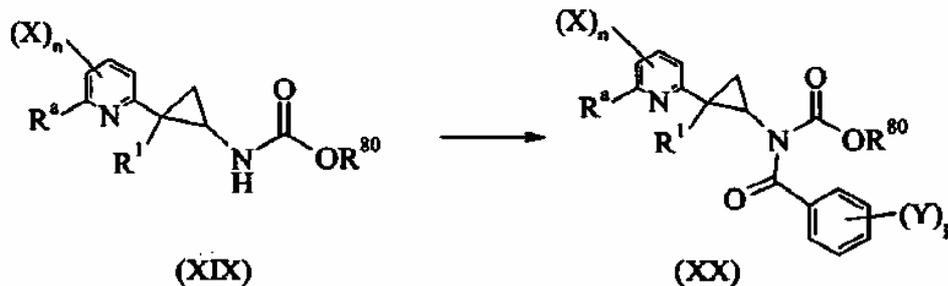


15 en el que:

- $R^a$ ,  $R^1$ , X y n son como se han definido anteriormente; y
- $R^{80}$  es un alquilo  $C_1-C_6$ , halogenoalquilo  $C_1-C_6$ , un bencilo, un alilo, un metoximetilo, un grupo 2-trimetilsilil-etilo; que comprende la conversión de un derivado de ácido de fórmula general (XVII) en un isocianato de fórmula general (XVIII) que queda atrapado *in situ* por un alcohol de fórmula general  $R^{80}-OH$ , proporcionando un carbamato de fórmula general (XIX);

20

- una quinta etapa de acuerdo con el esquema de reacción d-5:

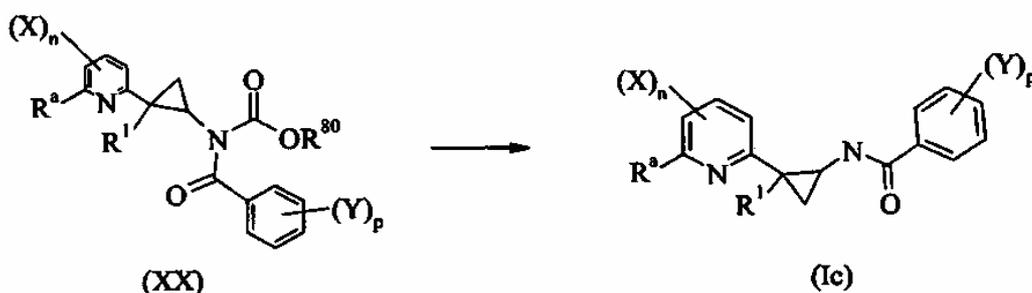
**Esquema d-5**

en el que:

- $R^a$ ,  $R^1$ , X, Y, n y p son como se han definido anteriormente; y
- $R^{80}$  es un alquilo  $C_1$ - $C_6$ , halogenoalquilo  $C_1$ - $C_6$ , un bencilo, un alilo, un metoximetilo, un grupo 2-trimetilsilil-etilo;

5 que comprende una acilación de un derivado de carbamato de fórmula general (XIX) proporcionando un compuesto de fórmula general (XX);

- una sexta etapa de acuerdo con el esquema de reacción d-6:

**Esquema d-6**

en el que:

- 10 -  $R^a$ ,  $R^1$ , X, Y, n y p son como se han definido anteriormente; y
- $R^{80}$  es un alquilo  $C_1$ - $C_6$ , halogenoalquilo  $C_1$ - $C_6$ , un bencilo, un alilo, un metoximetilo, un grupo 2-trimetilsilil-etilo;

que comprende una desprotección de un derivado de carbamato de fórmula general (XX) proporcionando un compuesto de fórmula general Ic;

15 La primera etapa (etapa d-1) del procedimiento c de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de una especie vínfica de fórmula general (XII) en la que M puede ser un metal o una especie metaloide. Preferentemente M es un derivado de estaño o un derivado de boro. Más preferentemente M es un grupo tributilestaño.

La primera etapa (etapa d-1) del procedimiento d de acuerdo con la presente invención se realiza a una temperatura de 0 °C a 200 °C.

20 La primera etapa (etapa d-1) del procedimiento d de acuerdo con la presente invención puede realizarse en presencia de un disolvente. Preferentemente, el disolvente se elige para que sea agua, un disolvente orgánico o una mezcla de ambos. Los disolventes orgánicos adecuados pueden ser, por ejemplo, un disolvente alifático, alicíclico o aromático.

25 La primera etapa (etapa d-1) del procedimiento d de acuerdo con la presente invención puede realizarse también en presencia de un catalizador. Preferentemente, el catalizador se elige para que sea sales o complejos de paladio. Más preferentemente, el catalizador se elige para que sea un complejo de paladio. Un catalizador de complejo de paladio adecuado puede generarse, por ejemplo, directamente en la mezcla de reacción añadiendo por separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo. Los ligandos adecuados pueden ser, por ejemplo ligandos voluminosos de fosfinas o arsinas, tales como (R)-(-)-1-[(S)-2-

(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1[(S)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etildifenilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-t-butilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; o (R)-(-)-1[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos.

5

La primera etapa (etapa d-1) del procedimiento d de acuerdo con la presente invención puede realizarse también en presencia de una base. Preferentemente, la base se elige para que sea una base orgánica o inorgánica. Los ejemplos adecuados de dichas bases pueden ser, por ejemplo, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, carbonatos o hidrogenocarbonatos, acetatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos o aminas terciarias.

10 La cuarta etapa (etapa d-4) del procedimiento d de acuerdo con la presente invención se realiza a una temperatura de -10 °C a 200 °C.

La cuarta etapa (etapa d-4) del procedimiento d de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de una base. Preferentemente, la base se elige para que sea una base orgánica. Los ejemplos adecuados de dichas bases pueden ser, por ejemplo, aminas terciarias.

15 La cuarta etapa (etapa d-4) del procedimiento d de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de un dador de azida. Preferentemente, el dador de azida se elige para que sea una fosforil azida. Los ejemplos adecuados de dichas fosforil azidas pueden ser, por ejemplo, difenilfosforil azida.

La cuarta etapa (etapa d-4) del procedimiento d de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de un alcohol. Preferentemente, el alcohol se elige para que sea un alcohol C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>. Los ejemplos adecuados de dicho alcohol C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> pueden ser, por ejemplo, *tert*-butanol.

20

La quinta etapa (etapa d-5) del procedimiento d de acuerdo con la presente invención se realiza a una temperatura de -80 °C a 200 °C.

La quinta etapa (etapa d-5) del procedimiento d de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de una base. Preferentemente, la base se elige para que sea una base orgánica o inorgánica. Los ejemplos adecuados de dichas bases pueden ser, por ejemplo, hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, carbonatos o hidrogenocarbonatos, acetatos de metales alcalinos o metales alcalinotérreos o aminas terciarias. Más preferentemente, la base se elige para que sea hidruros de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, o alquidos de metales alcalinos.

25

Los compuestos de acuerdo con la presente invención pueden prepararse de acuerdo con los procedimientos descritos anteriormente. No obstante, se entenderá que, en base a su conocimiento general y a las publicaciones disponibles, el especialista será capaz de adaptar estos procedimientos de acuerdo con las especificidades de cada uno de los compuestos que desee sintetizar.

30

La presente invención también se refiere a una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un material activo de fórmula general (I). De esta manera, de acuerdo con la presente invención, se proporciona una composición fungicida que comprende, como un ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula general (I), como se ha definido anteriormente, y un soporte, vehículo o carga agrícolamente aceptable.

35

En la presente memoria descriptiva, el término "soporte" se refiere a un material natural o sintético, orgánico o inorgánico, con el que se combina el material activo para hacer que sea más fácil de aplicar, en concreto a las partes de la planta. Este soporte es, por tanto, generalmente inerte, y debe ser agrícolamente aceptable. 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 mineral y vegetales y derivados de los mismos. Pueden usarse también mezclas de dichos soportes.

40

La composición puede comprender también componentes adicionales. En particular, la composición puede comprender adicionalmente 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. Puede hacerse mención, por ejemplo, a sales del ácido poliacrílico, sales del ácido lignosulfónico, sales del 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 polioxetilados, ésteres de ácido graso de polioles, y derivados de los compuestos anteriores que contienen funciones sulfato, sulfonato y fosfato. La presencia de al menos un tensioactivo es generalmente esencial cuando el material activo y/o el soporte inerte son insolubles en agua y cuando el agente vectorial para la aplicación es agua. Preferentemente, el contenido de tensioactivo puede estar comprendido entre el 5% y el 40% en peso de la composición.

50

Opcionalmente, pueden incluirse también componentes adicionales, por ejemplo coloides protectores, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, agentes de penetración, estabilizadores, agentes secuestrantes. Más generalmente, los materiales activos pueden combinarse con cualquier aditivo sólido o líquido, que se adapte a las técnicas de formulación habituales.

- 5 En general, la composición de acuerdo con la invención puede contener del 0,05 al 99% (en peso) de material activo, preferentemente del 10 al 70% en peso.

Las composiciones de acuerdo con la presente invención pueden usarse en diversas formas, tales como dosificador de aerosol, suspensión de cápsulas, concentrado de neblina fría, polvo pulverizable, concentrado emulsionable, emulsión de aceite en agua, emulsión de agua en aceite, gránulo encapsulado, gránulo fino, concentrado fluible para tratamiento de semillas, gas (a presión), producto generador de gas, gránulo, concentrado de neblina caliente, macrogránulo, microgránulo, polvo dispersable en aceite, concentrado fluible miscible en aceite, líquido miscible en aceite, pasta, varillas para plantas, polvo para tratamiento en seco de semillas, semillas revestidas con un pesticida, concentrado soluble, polvo soluble, solución para el tratamiento de semillas, concentrado en suspensión (concentrado fluible), líquido de volumen ultra bajo (vub), suspensión de volumen ultra bajo (vub), gránulos o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento en suspensión, gránulos o comprimidos solubles en agua, polvo soluble en agua para el tratamiento de semillas y polvo humedecible.

Estas composiciones incluyen no solo composiciones que están listas para aplicarlas a la planta o la semilla a tratar mediante un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo de vaporización o pulverización, sino también composiciones comerciales concentradas que deben diluirse antes de la aplicación al cultivo.

- 20 Los compuestos de la invención pueden mezclarse también con uno o más insecticidas, fungicidas, bactericidas, atractores de acaricidas o feromonas, u otros compuestos con actividad biológica. Las mezclas obtenidas de esta manera tienen un espectro de actividad ampliado. Las mezclas con otros fungicidas son particularmente ventajosas. Los ejemplos de compañeros de mezcla fungicidas adecuados pueden seleccionarse en las siguientes listas:

25 1) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de ácido nucleico, tal como benalaxilo, benalaxilo-M, bupirimato, quiralaxilo, clozilacon, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, mefenoxam, metalaxilo, metalaxilo-M, ofurace, oxadixilo, ácido oxolínico;

2) un compuesto capaz de inhibir la mitosis y la división celular, tal como benomilo, carbendazim, dietofencarb, etaboxam, fuberidazol, pencicuron, tiabendazol tiofanato-metilo, zoxamida;

3) un compuesto capaz de inhibir la respiración, por ejemplo

- 30 como inhibidor de la respiración CI, como diflumetorim;

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

35 como inhibidor de la respiración CIII, como amisulbrom, azoxistrobin, ciazofamid, dimoxistrobin, enestrobin, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobin, cresoximmetilo, metominostrobin, orisastrobin, picoxistrobin, piraclostrobin, trifloxistrobin;

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

5) un compuesto capaz de inhibir la producción de ATP como acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, siltiofam;

- 40 6) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de AA y proteínas, como andoprim, blasticidin-S, ciprodinilo, casugamicina, clorhidrato de casugamicina hidrato, mepanipirim, pirimetanil;

7) un compuesto capaz de inhibir la transducción de señales, como fencpiclonil, fludioxonil, quinoxifeno;

8) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de lípidos y membrana, como bifenilo, clozolinato, edifenfos, yodocarb, iprobenfos, iprodiona, isoprotiolano, procimidona, propamocarb, clorhidrato de propamocarb, pirazofos, tolclfosmetilo, vinclozolin;

- 45 9) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de ergosterol, como aldimorf, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, dodemorf, acetato de dodemorf, epoxiconazol, etaconazol, fenarimol, fenbuconazol, fenhexamid, fenpropidin, fenpropimorf, fluquinconazol, flurprimidol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imazalil, sulfato de imazalil, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, naftifina, nuarimol, oxpoconazol, paclobutrazol, pefurazoato, penconazol, procloraz, propiconazol, protioconazol, piributicarb, pirifenox, simeconazol, espiroxamina, tebuconazol, terbinafina,

50

tetraconazol, triadimefon, triadimenol, tridemorf, triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol, viniconazol, voriconazol;

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

5 11) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de melanina, como carpropamid, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, piroquilon, triciclazol;

12) un compuesto capaz de inducir la defensa en un huésped, como acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinil;

10 13) un compuesto capaz de tener una acción en múltiples sitios, como mezcla Bordeaux, captafol, captan, clorotalonilo, naftenato de cobre, óxido de cobre, oxiclورو de cobre, preparaciones de cobre tales como hidróxido de cobre, sulfato de cobre, dichlofluanid, 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, oxina-cobre, propineb, azufre y preparaciones de azufre incluyendo polisulfuro de calcio, tiram, tolilfluanid, zineb, ziram;

15 14) un compuesto seleccionado entre la siguiente lista: (2E)-2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (2E)-2-2-[[[(1E)-1-(3-[[[(E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, 1H-imidazol-1-carboxilato de 1-[[4-(metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropilo, 2-(4-clorofenil)-N-{2-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]etil}-2-(prop-2-in-1-iloxi)acetamida, 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)nicotinamida, 2-fenilfenol y sales, 3,4,5-tricloropiridina-2,6-dicarbonitrilo, 3,4-dicloro-N-(2-cianofenil)isotiazol-5-carboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, 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-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, sulfato de 8-hidroxiquinolina, bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvona, chinometionat, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanilo, dazomet, debacarb, diclorophen, diclomezina, dicloran, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, ferimzona, flumetover, fluopicolida, fluoroimida, flusulfamida, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, hexaclorobenceno, irumamicina, metasulfocarb, (2-cloro-5-[(1E)-N-[(6-metilpiridin-2-il)metoxi]jetanimidol]bencil)carbamato de metilo, (2E)-2-2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]fenil]-3-metoxiacrilato de metilo, 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, 3-(4-clorofenil)-3-[[N-(isopropoxycarbonil)valil]amino]propanoato de metilo, isotiocianato de metilo, metrafenona, mildiomicina, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxibenzamida, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metilbencenosulfonamida, N-[(5-bromo-3-cloro-piridin-2-il)metil]-2,4-dicloronicotinamida, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-ydonicotinamida, N-[2-(4-[[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi]-3-metoxifenil)etil]-N-[[sup>2</sup>-(metilsulfonil)valinamida, N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino] [6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, N-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluorometil)benzamida, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitroal-isopropilo, O-{1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil}1H-imidazol-1-carbotioato, octhilonona, oxamocarb, oxifentiina, pentaclorofenol y sales, ácido fosforosos y sus sales, piperalina, fosetilato de propamocarb, propanosina sódica, proquinazid, pirrolnitrina, quintozeno, tecloftalam, tecnazeno, triazóxido, triclamida y zarilamid.

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

Las composiciones fungicidas de la presente invención pueden usarse para controlar, curativa o preventivamente, los hongos fitopatógenos de cultivos. De esta manera, de acuerdo con otro aspecto de la presente invención, se proporciona un procedimiento para controlar, curativa o preventivamente, los hongos fitopatógenos de cultivos, caracterizado porque una composición fungicida, como se define posteriormente en el presente documento, se aplica a la semilla, la planta y/o al fruto de la planta o al suelo en el que está creciendo la planta o en el que se desea que crezca.

La composición como se usa contra hongos fitopatógenos de 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 de acuerdo con la invención que es suficiente para controlar o destruir los hongos presentes o susceptibles de aparecer en los cultivos, y que no

implica ningún síntoma apreciable de fitotoxicidad para dichos cultivos. Dicha cantidad puede variar dentro de un amplio intervalo, dependiendo de los hongos a controlar, del tipo de cultivo, las condiciones climáticas y los compuestos incluidos en la composición fungicida de acuerdo con la invención.

5 Esta cantidad puede determinarse mediante ensayos de campo sistémicos, que están dentro de las capacidades de un especialista en la técnica.

10 El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la presente invención es útil para tratar el material de propagación, tales como tubérculos o rizomas, aunque también semillas, plántulas o plantación de plántulas y plantas o plantación de plantas. Este procedimiento de tratamiento puede ser útil también para tratar raíces. El procedimiento de tratamiento de acuerdo con la presente invención puede ser útil para tratar la parte sobre el suelo de la planta, tal como troncos, tallos o cañas, hojas, flores y frutos de la planta en cuestión.

15 Entre las plantas que pueden protegerse mediante el procedimiento de acuerdo con la presente invención, puede hacerse mención de algodón; lino; vid; cultivos de fruto o vegetales tales como *Rosaceae sp.* (por ejemplo, frutos con pipos, tales como manzanas y peras, aunque también frutos con hueso, tales como albaricoque, almendras y melocotones), *Ribesioideae sp.*, *Juglandaceae sp.*, *Betulaceae sp.*, *Anacardiaceae sp.*, *Fagaceae sp.*, *Moraceae sp.*, *Oleaceae sp.*, *Actinidaceae sp.*, *Lauraceae sp.*, *Musaceae sp.* (por ejemplo, plataneros y bananos), *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.*, *Cucurbitaceae sp.*, *Papilionaceae sp.* (por ejemplo, guisantes), *Rosaceae sp.* (por ejemplo, fresas); cultivos mayoritarios, tales como *Graminae sp.* (por ejemplo, maíz, césped o cereales, tales como trigo, arroz, cebada y triticale), *Asteraceae sp.* (por ejemplo, girasol), *Cruciferae sp.* (por ejemplo, colza), *Fabaceae sp.* (por ejemplo, cacahuetes), *Papilionaceae sp.* (por ejemplo, semilla de soja), *Solanaceae sp.* (por ejemplo, patatas), *Chenopodiaceae sp.* (por ejemplo, remolacha); cultivos hortícolas y del bosque; así como homólogos modificados genéticamente de estos cultivos.

20 Entre las enfermedades de las plantas o cultivos que pueden controlarse mediante el procedimiento de acuerdo con la presente invención, puede hacerse mención de:

Enfermedades de tipo oídio, tales como:

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

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

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

30 Enfermedades de tipo Uncinula, causadas, por ejemplo, por *Uncinula necator*;

Enfermedades de tipo roya, tales como:

Enfermedades de tipo Gymnosporangio, causadas, por ejemplo, por *Gymnosporangio sabinae*;

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

Enfermedades de tipo Phakopsora, causadas, por ejemplo, por *Phakopsora pachyrhizi* o *Phakopsora meibomiae*;

35 Enfermedades de tipo Puccinia, causadas, por ejemplo, por *Puccinia recondita*;

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

Enfermedades de tipo Oomycete, tales como:

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

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

40 Enfermedades de tipo Phytophthora, causadas, por ejemplo, por *Phytophthora infestans*;

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

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

Enfermedades de tipo Pythio, causadas, por ejemplo, por *Pythio ultimum*;

Enfermedades de tipo manchas en las hojas, imperfecciones en las hojas y añublo en las hojas, tales como:

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

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

Enfermedades de tipo *Cladosporium*, causadas, por ejemplo, por *Cladosporio cucumerinum*;

5 Enfermedades de tipo *Cochliobolus*, causadas, por ejemplo, por *Cochliobolus sativus*;

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

Enfermedades de tipo *Cicloconio*, causadas, por ejemplo, por *Cicloconio oleaginum*;

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

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

10 Enfermedades de tipo *Gloeosporio*, causadas, por ejemplo, por *Gloeosporio laeticolor*,

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

Enfermedades de tipo *Guignardia*, causadas, por ejemplo, por *Guignardia bidwellii*;

Enfermedades de tipo *Leptosphaeria*, causadas, por ejemplo, por *Leptosphaeria maculans*;

*Leptosphaeria nodorum*;

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

Enfermedades de tipo *Mycosphaerella*, causadas, por ejemplo, por *Mycosphaerella graminicola*;

*Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;

Enfermedades de tipo *Phaeosphaeria*, causadas, por ejemplo, por *Phaeosphaeria nodorum*;

Enfermedades de tipo *Pirenophora*, causadas, por ejemplo, por *Pirenophora teres*;

20 Enfermedades de tipo *Ramularia*, causadas, por ejemplo, por *Ramularia colloocygni*;

Enfermedades de tipo *Rhynchosporio*, causadas, por ejemplo, por *Rhynchosporio secalis*;

Enfermedades de tipo *Septoria*, causadas, por ejemplo, por *Septoria apii* o *Septoria lycopersici*;

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

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

25 Enfermedades de la raíz y el tallo, tales como:

Enfermedades de tipo *Corticium*, causadas, por ejemplo, por *Corticium graminarum*;

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

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

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

30 Enfermedades de tipo *Tapesia*, causadas, por ejemplo, por *Tapesia acuformis*;

Enfermedades de tipo *Thielaviopsis*, causadas, por ejemplo, por *Thielaviopsis basicola*;

Enfermedades de la espiga y el panículo, tales como:

Enfermedades de tipo *Alternaria*, causadas, por ejemplo, por *Alternaria spp.*;

Enfermedades de tipo *Aspergillus*, causadas, por ejemplo, por *Aspergillus flavus*;

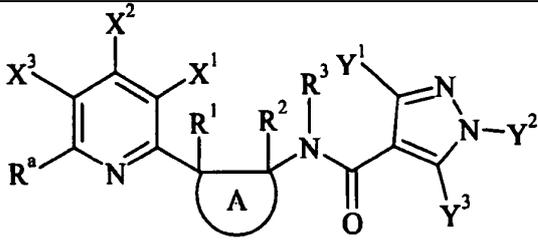
35 Enfermedades de tipo *Cladosporio*, causadas, por ejemplo, por *Cladosporio spp.*;

- Enfermedades de tipo *Claviceps*, causadas, por ejemplo, por *Claviceps purpurea*;
- Enfermedades de tipo *Fusarium*, causadas, por ejemplo, por *Fusarium culmorum*;
- Enfermedades de tipo *Gibberella*, causadas, por ejemplo, por *Gibberella zeae*;
- Enfermedades de tipo *Monographella*, causadas, por ejemplo, por *Monographella nivalis*;
- 5 Enfermedades de tipo tizón y añublo, tales como:
- Enfermedades de tipo *Sphacelotheca*, causadas, por ejemplo, por *Sphacelotheca reiliana*;
- Enfermedades de tipo *Tilletia*, causadas, por ejemplo, por *Tilletia caries*;
- Enfermedades de tipo *Urocystis*, causadas, por ejemplo, por *Urocystis occulta*;
- Enfermedades de tipo *Ustilago*, causadas, por ejemplo, por *Ustilago nuda*;
- 10 Enfermedades de tipo putrefacción y moho de los frutos, tales como:
- Enfermedades de tipo *Aspergillus*, causadas, por ejemplo, por *Aspergillus flavus*;
- Enfermedades de tipo *Botrytis*, causadas, por ejemplo, por *Botrytis cinerea*;
- Enfermedades de tipo *Penicillium*, causadas, por ejemplo, por *Penicillium expansum*;
- Enfermedades de tipo *Sclerotinia*, causadas, por ejemplo, por *Sclerotinia sclerotiorum*;
- 15 Enfermedades de tipo *Verticillio*, causadas, por ejemplo, por *Verticillio alboatrum*;
- Enfermedades de tipo pudrición de las semillas y soporte terroso, carcomido, marchitamiento, putrefacción y caída de las plántulas:
- Enfermedades de tipo *Fusarium*, causadas, por ejemplo, por *Fusarium culmorum*;
- Enfermedades de tipo *Phytophthora*, causadas, por ejemplo, por *Phytophthora cactorum*;
- 20 Enfermedades de tipo *Pythio*, causadas, por ejemplo, por *Pythio ultimum*;
- Enfermedades de tipo *Rhizoctonia*, causadas, por ejemplo, por *Rhizoctonia solani*;
- Enfermedades de tipo *Sclerotio*, causadas, por ejemplo, por *Sclerotio rolfsii*;
- Enfermedades de tipo *Microdochio*, causadas, por ejemplo, por *Microdochio nivale*;
- Enfermedades de tipo cancro, de retamas, y podredumbre peduncular, tales como:
- 25 Enfermedades de tipo *Nectria*, causadas, por ejemplo, por *Nectria galligena*;
- Enfermedades de tipo añublo, tales como:
- Enfermedades de tipo *Monilinia*, causadas, por ejemplo, por *Monilinia laxa*;
- Enfermedades de tipo ampollas en las hojas o enroscado de las hojas, tales como:
- Enfermedades de tipo *Taphrina*, causadas, por ejemplo, por *Taphrina deformans*;
- 30 Enfermedades de tipo decaimiento de plantas madereras, tales como:
- Enfermedades de tipo Esca, causadas, por ejemplo, por *Phaemoniella clamydospora*;
- Enfermedades de flores y semillas, tales como:
- Enfermedades de tipo *Botrytis*, causadas, por ejemplo, por *Botrytis cinerea*;
- Enfermedades de tubérculos, tales como:
- 35 Enfermedades de tipo *Rhizoctonia*, causadas, por ejemplo, por *Rhizoctonia solani*.

La composición fungicida de acuerdo con la presente invención puede usarse también contra enfermedades

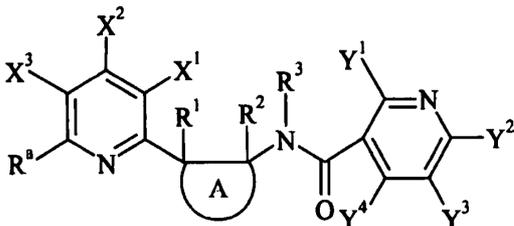
- 5 fúngicas susceptibles de desarrollarse sobre o dentro del maderamen. El término "maderamen" significa todo tipo de especies de madera, y todo tipo de trabajado de esta madera, destinado a la construcción, por ejemplo madera sólida, madera de alta densidad, madera laminada, y contrachapado. El procedimiento para tratar maderamen de acuerdo con la invención consiste, principalmente, en poner en contacto uno o más compuestos de la presente invención, o una composición de acuerdo con la invención; esto incluye, por ejemplo, aplicación directa, pulverización, inmersión, inyección o cualquier otro medio adecuado.
- 10 La dosis de material activo aplicada normalmente en el tratamiento de acuerdo con la presente invención es general y ventajosamente entre 10 y 800 g/ha, preferentemente entre 50 y 300 g/ha para aplicaciones en tratamiento foliar. La dosis de sustancia activa aplicada es general y ventajosamente entre 2 y 200 g por 100 kg de semilla, preferentemente entre 3 y 150 g por 100 kg de semilla en el caso de tratamiento de semillas. Se entiende claramente que las dosis indicadas anteriormente se dan como ejemplos ilustrativos de la invención. Un especialista en la técnica sabrá cómo adaptar las dosis de aplicación de acuerdo con la naturaleza del cultivo a tratar.
- 15 La composición fungicida de acuerdo con la presente invención puede usarse también en el tratamiento de organismos modificados genéticamente con los compuestos de acuerdo con la invención o las composiciones agroquímicas de acuerdo con la invención. Las plantas modificadas genéticamente son plantas en cuyo genoma se ha integrado de forma estable un gen heterólogo que codifica una proteína de interés. La expresión "gen heterólogo que codifica una proteína de interés" significa esencialmente genes que dan a la planta transformada nuevas propiedades agronómicas, o genes para mejorar la calidad agronómica de la planta transformada.
- 20 Las composiciones de acuerdo con la presente invención pueden usarse también para la preparación de una composición útil para tratar, curativa o preventivamente, enfermedades fúngicas humanas y animales tales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, enfermedades tricofitón y candidiasis o enfermedades causadas por *Aspergillus spp.*, por ejemplo *Aspergillus fumigatus*.
- 25 Los aspectos de la presente invención se ilustrarán ahora con referencia a las siguientes tablas de compuestos y ejemplos. Las siguientes Tablas A a V ilustran, de una manera no limitante, ejemplos de compuestos fungicidas de acuerdo con la presente invención. En los siguientes Ejemplos, M+1 (o M-1) significa el pico iónico molecular, más o menos 1 u.m.a. (unidades de masa atómica) respectivamente, como se observa en espectroscopía de masas

Tabla A



Compuesto n°	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>a</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	A	(M+1)
A-1	Cl	H	Cl	H	H	H	H	CHF <sub>2</sub>	Me	H	<i>Cis</i> -ciclohexilo	403
A-2	Cl	H	Cl	H	H	H	H	CHF <sub>2</sub>	Me	H	<i>Trans</i> -ciclohexilo	403
A-3	Cl	H	Cl	H	H	H	H	CHF <sub>2</sub>	Me	H	ciclopropilo	361
A-4	Cl	H	Cl	H	H	H	H	Me	Me	F	ciclopropilo	343

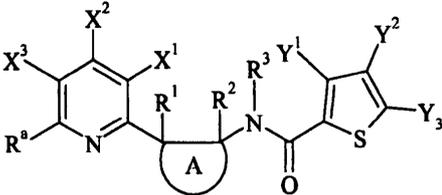
Tabla B



Compuesto n°	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>a</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	Y <sup>4</sup>	A	(M+1)
B-1	Cl	H	Cl	H	H	H	H	Cl	H	H	H	<i>Trans</i> -ciclopropilo	340

5

Tabla C



Compuesto n°	X <sup>1</sup>	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	R <sub>1</sub>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>a</sup>	Y <sup>1</sup>	Y <sup>2</sup>	Y <sup>3</sup>	A	(M+1)
C-1	Cl	H	Cl	H	H	H	H	I	H	H	<i>Trans</i> -ciclopropilo	439

**Ejemplos de procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I)****Ejemplo 1: Preparación de N-{2-[3,5-dicloro-2-piridinil]trans-ciclohexil}1-metil-3-(difluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida (Compuesto A-1) y N-{2-[3,5-dicloro-2-piridinil]cis-ciclohexil}1-metil-3-(difluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida (Compuesto A-2)**5 Preparación de 2-[3,5-dicloro-2-piridinil]ciclohexanona

Se agitan juntos 5,00 g (0,030 mol) de 3,5-dicloro-2-fluoropiridina y 5,01 g de 1-(1-ciclohexen-1-il)pirrolidina (0,033 mol) puros a temperatura ambiente durante 1 h y se dejan a temperatura ambiente durante una noche. La mezcla de reacción se inactiva con 40 ml de ácido sulfúrico 2 M. Se añade agua a la mezcla de reacción (100 ml), que se extrae tres veces con acetato de etilo (50 ml). Las fases orgánicas combinadas se lavan con agua (150 ml) y salmuera (100 ml). Después de la separación, la fase orgánica se seca sobre sulfato de magnesio, se filtra, se concentra a sequedad y se purifica sobre gel de sílice produciendo 0,22 g de 2-[3,5-dicloro-2-piridinil]ciclohexanona (2%).

Espectro de masas: [M+1] = 244.

Preparación de clorhidrato de 2-[3,5-dicloro-2-piridinil]ciclohexanamina:

15 Se calientan a reflujo 0,22 g (0,86 mmol) de 2-[3,5-dicloro-2-piridinil]ciclohexanona, 0,2 g de tamices moleculares 3 Å, 0,53 g (6,85 mmol) de acetato amónico en 5 ml de metanol durante 3 horas. De vuelta a temperatura ambiente, se añaden 93 mg (0,018 mol) de cianoborohidruro sódico, la mezcla de reacción se calienta a reflujo durante una hora y se deja durante una noche a temperatura ambiente. El medio se filtra, se concentra a sequedad y se añaden 20 10 ml de hidróxido sódico acuoso 1 M. La fase acuosa se extrae tres veces con 10 ml de diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se lavan dos veces con 10 ml de agua, se secan sobre sulfato de magnesio, se filtran y se concentran. Se añaden 3 ml de una solución de cloruro de hidrógeno en éter dietílico (1 M) al material bruto. El precipitado se filtra y se lava con éter dietílico para producir 0,15 g de clorhidrato de 2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]ciclohexanamina (56%).

Espectro de masas: [M+1-36] = 245.

25 Preparación de N-{2-[3,5-dicloro-2-piridinil]trans-ciclohexil}1-metil-3-(difluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida (Compuesto A-1) y N-{2-[3,5-dicloro-2-piridinil]cis-ciclohexil}1-metil-3-(difluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida (Compuesto A-2)

Se diluyen 0,031 g de cloruro de oxalilo (0,0025 mmol) en 2 ml de diclorometano. Se añade una gota de dimetilformamida a la mezcla de reacción. Después de 30 min de agitación a temperatura ambiente, se añaden 30 0,70 g de clorhidrato 2-[3,5-dicloro-2-piridinil]ciclohexanamina (0,00022 mol) y 0,07 ml de trietilamina a la mezcla de reacción, que se agita a temperatura ambiente durante una noche. Se añade diclorometano (5 ml) a la mezcla de reacción, que se lava dos veces con agua (5 ml). Después de la separación, la fase orgánica se seca sobre sulfato de magnesio, se filtra, se concentra a sequedad y se purifica sobre sílice produciendo:

- 42 mg de N-{2-[3,5-dicloro-2-piridinil]cis-ciclohexil} 1-metil-3-(difluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida (44%) (espectro de masas: [M+1] = 417); y
- 20 mg de N-{2-[3,5-dicloro-2-piridinil]trans-ciclohexil} 1-metil-3-(difluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida (21%) (espectro de masas: [M+1] = 417).

**Ejemplo 2: Preparación de N-[2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropil]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (Compuesto A-3)**40 Preparación de 3,5-dicloro-2-vinilpiridina

Se calientan a reflujo 20,06 g de 3,5-dicloro-2-fluoropiridina (0,110 mol), 30,46 ml de tributilvinil-estannano (0,103 mol), 6,00 g (0,00518 mol) de Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub> en 400 ml de tolueno durante cinco horas. La mezcla de reacción se lava tres veces con una solución saturada acuosa de fluoruro potásico (200 ml), una vez con agua (300 ml), una vez con salmuera (300 ml). Las fases acuosas combinadas se extraen con 100 ml de tolueno. Después de la separación, 45 las fases orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de magnesio, se filtran, se concentran a sequedad y se purifican sobre sílice produciendo 15,05 g de 3,5-dicloro-2-vinilpiridina (62%) con una pureza del 75%.

Espectro de masas: [M+1] = 174.

Preparación de 2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropanocarboxilato de etilo

Una mezcla de 0,485 g de 3,5-dicloro-2-vinilpiridina (0,0014 mol) y 0,15 ml de diazoacetato de etilo (0,00127 mol)

se añade gota a gota a 5 ml de xileno a reflujo. La mezcla de reacción se calienta a reflujo durante treinta minutos y se deja a temperatura ambiente durante una noche. Después de la concentración a sequedad y purificación sobre sílice, se obtienen 250 mg de 2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropanocarboxilato de etilo básicamente puro (75%).

Espectro de masas:  $[M+1] = 260$ .

5 Preparación de ácido 2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropanocarboxílico

Se disuelven 1,65 g de 2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropanocarboxilato de etilo (0,00634 mol) en 20 ml de etanol, se añaden 9,5 ml de hidróxido sódico 1 M a la mezcla de reacción, que se calienta a reflujo durante 4 horas y se deja a temperatura ambiente durante una noche. Después de la concentración al vacío, se añaden 30 ml de agua a la mezcla de reacción, que se extrae dos veces con acetato de etilo (20 ml). La fase acuosa se acidifica con HCl 1 M. El precipitado que se forma se filtra y se seca al aire produciendo 1,35 g de ácido 2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropanocarboxílico (87%).

Espectro de masas:  $[M+1] = 232$ .

Preparación de [2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropil]carbamato de terc-butilo

15 Se calientan a reflujo 1,76 g de ácido 2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropanocarboxílico (0,00758 mol), 1,17 ml de trietilamina (0,00834 mol), 2,50 g (0,00901 mol) de difenilfosforil azida durante 4 horas en 25 ml de *terc*-butanol.

A temperatura ambiente, la mezcla de reacción se inactiva con 100 ml de agua y 10 ml de una solución saturada de bicarbonato sódico. Después de la separación, la fase acuosa se extrae dos veces con 50 ml de acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de magnesio, se filtran, se concentran a sequedad y se purifican sobre sílice produciendo 1,23 g de [2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropil]carbamato de *terc*-butilo (48%).

20 Espectro de masas:  $[M+1] = 303$ .

Preparación de [2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropil][3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-il]carbonil]carbamato de terc-butilo

25 En una atmósfera de argón, se disuelven 0,50 g de [2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropil]carbamato de *terc*-butilo (0,00148 mol), en 10 ml de tetrahidrofurano a -70 °C. Se añade *n*-butillitio (0,00226 mol) en solución en hexanos. Después de 5 minutos de agitar a -70 °C, se añaden gota a gota 0,46 g de cloruro de 3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carbonilo (0,00166 mol) en solución en 50 ml de tetrahidrofurano. La mezcla de reacción se agita a -70 °C durante dos horas y después se deja a temperatura ambiente durante una noche.

30 La mezcla de reacción se inactiva con 50 ml de una solución saturada de cloruro de amonio. Después de la separación, la fase acuosa se extrae dos veces con 20 ml de acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de magnesio, se filtran, se concentran a sequedad y se purifican sobre sílice produciendo 205 mg de [2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropil][3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-il]carbonil]carbamato de *terc*-butilo (26%). Espectro de masas:  $[M+1] = 461$ .

Preparación de N-[2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropil]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (Compuesto A-3)

35 Se disuelven 0,200 g de [2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropil][3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-il]carbonil]carbamato de *terc*-butilo (0,00039 mol) en 5 ml de diclorometano. Se añaden 0,50 ml de ácido trifluoroacético a la mezcla de reacción, que se deja en agitación a temperatura ambiente durante una noche. La mezcla de reacción se inactiva con 15 ml de una solución acuosa saturada de bicarbonato sódico. Después de la separación, la fase acuosa se extrae con diclorometano (10 ml). Las fases orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de magnesio, se filtran, se concentran a sequedad y se purifican sobre sílice produciendo 120 mg de N-[2-(3,5-dicloropiridin-2-il)ciclopropil]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (76%).

40 Espectro de masas:  $[M+1] = 361$ .

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

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

45 Los ingredientes activos ensayados se prepararon por homogenización en una mezcla de DMSO (dimetilsulfóxido)/acetona/tween/agua. Esta suspensión se diluye después con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

Las plantas de rábano (variedad Pernot) en cubetas de inicio, sembradas en un sustrato de suelo de turba-puzolana

50/50 y cultivadas a 18-20 °C, se tratan en la fase cotiledón por pulverización con la suspensión acuosa descrita anteriormente.

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

5 Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria brassicae* (40.000 esporas por cm<sup>3</sup>). Las esporas se recogen de un cultivo de 12-13 días de antigüedad.

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

La gradación se realiza de 6 a 7 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de control.

10 En estas condiciones, bueno (al menos 70%) respecto a protección total se observa a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: A-1 y A-3.

**Ejemplo B: ensayo *in vivo* sobre *Pirenophora teres* (helmintoporiasis de la cebada).**

Los ingredientes activos ensayados se prepararon por homogenización en una mezcla de DMSO (dimetilsulfóxido)/acetona/tween/agua. Esta suspensión se diluye después con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

15 cebada plantas (variedad Express o Plaisant) en cubetas de inicio, sembradas en un sustrato de suelo de turba-puzolana 50/50 y cultivadas a 12 °C, se tratan en la fase de 1-hoja (10 cm de altura) por pulverización con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las plantas, usadas como controles, se tratan con una solución acuosa que no contiene el material activo.

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

La gradación se realiza 12 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de control.

25 En estas condiciones, bueno (al menos 70%) respecto a protección total se observa a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: A-1, A-3, A-4, B-1 y C-1.

**Ejemplo C: ensayo *in vivo* sobre *Botrytis cinerea* (moho gris del pepinillo)**

Los ingredientes activos ensayados se prepararon por homogenización en una mezcla de DMSO (dimetilsulfóxido)/acetona/tween/agua. Esta suspensión se diluye después con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

30 Las plantas de pepinillo (variedad Petit Vert de París) en cubetas de inicio, sembradas en un sustrato de suelo de turba-puzolana 50/50 y cultivadas a 18-20 °C, se tratan en la fase de cotiledón Z11 por pulverización con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las plantas, usadas como controles, se tratan con una solución acuosa que no contiene el material activo.

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

- 20 g/l de gelatina
- 50 g/l de caña de azúcar
- 2 g/l de NH<sub>4</sub>NO<sub>3</sub>

40 - 1 g/l de KH<sub>2</sub>PO<sub>4</sub>

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

La gradación se realiza 5/7 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de control.

45 En estas condiciones, bueno (al menos 70%) o total protección se observa a una dosis de 500 o 125 ppm con los siguientes compuestos: A-3, B-1 y C-1.

**Ejemplo D: ensayo *in vivo* sobre *Sphaerotheca fuliginea* (oídio)**

Los ingredientes activos ensayados se prepararon por homogenización en una mezcla de DMSO (dimetilsulfóxido)/acetona/tween/agua. Esta suspensión se diluye después con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

- 5 Las plantas de pepinillo (variedad Vert petit de París) en cubetas de inicio, sembradas en un sustrato de suelo de turba-puzolana 50/50 y cultivada a 20 °C / 23 °C, se tratan en la fase de cotiledón por pulverización con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las plantas, usadas como controles, se tratan con una solución acuosa que no contiene el material activo.

- 10 Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Sphaerotheca fuliginea* (100.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de plantas contaminadas. Las plantas de pepinillo contaminadas se incuban a aproximadamente 20 °C/25 °C y una humedad relativa del 60/70%.

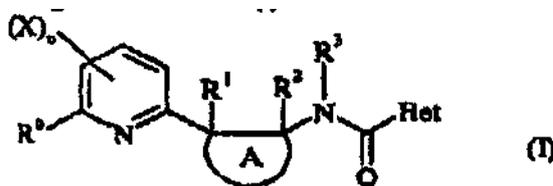
La gradación (% de eficacia) se realiza 13 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de control.

En estas condiciones, bueno (al menos 70%) se observa a una dosis de 600 g/ha con el siguiente compuesto: A-2.

- 15 En estas condiciones, bueno (al menos 70%) respecto a protección total se observa a una dosis de 125 ppm con los siguientes compuestos: A-3 y C-1.

## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula general (I)



5 en la que:

- n es 1, 2 ó 3;

- X es igual 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- $\lambda^6$ -sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, un alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, un alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-amino, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-amino, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfanilo, un halogenoalquilsulfanilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueniloxi C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenoalquinoxiloxi C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiniloxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenoalquinoxiloxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo, halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un (N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)oxicarbamoilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un (N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carboniloxi, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilamino, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-aminocarboniloxi, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-aminocarboniloxi, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> oxicarboniloxi, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfenilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfenilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfinilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfinilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> imino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un (alquenil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> oxiiimino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> oxiiimino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un (benciloxi-imino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, un benciloxi, un bencilulfanilo, un bencilamino, fenoxi, un fenilsulfanilo o un fenilamino;

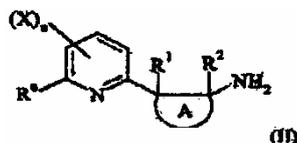
- R<sup>a</sup> es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo sulfanilo, un grupo pentafluoro- $\lambda^6$ -sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, un alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, un alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-amino, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-amino, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfanilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfanilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenil C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> oxiloxi, un halogenoalquinoxiloxi C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> oxiloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquinil C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> oxiloxi, un halogenoalquinoxiloxi C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> oxiloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, un halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> oxicarbamoilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbamoilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carboniloxi, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carboniloxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilamino, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-aminocarboniloxi, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-aminocarboniloxi, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> oxicarboniloxi, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-sulfenilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfenilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfinilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfinilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> sulfonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un (alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> imino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, un (alquenil C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub> oxiiimino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un (alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> oxiiimino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un (benciloxiimino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un benciloxi, un bencilulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo o un fenilamino;

- A es un carbociclo no aromático de 3, 4, 5, 6 o 7 miembros;

- R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> se eligen, independientemente uno de otro, entre un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo sulfanilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carboxi, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquenilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un di-

- alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> amino, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogeno C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfanilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfanilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenil C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> oxi, un halogenoalquenil C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> oxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquinil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> oxi, un halogenoalquinil C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> oxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, un halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbamoilo, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbamoilo, un N-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbamoilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbamoilo, un N-alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbamoilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbanilo, un halogenoalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbanilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbanilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbanilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilamino, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilamino que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> aminocarbonilo, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-aminocarbonilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> oxicarbonilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfenilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfenilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfinilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfinilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un bencilo, un benciloxi, un bencilsulfanilo, un bencilsulfinilo, un bencilsulfonilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo, un fenilsulfinilo, un fenilsulfonilo, un fenilamino, un fenilcarbonilamino, un grupo 2,6 diclorofenil-carbonilamino o un grupo fenilo,
- R<sup>3</sup> se elige entre un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo hidroxilo, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un halogeno C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>, un alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un cianoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> un aminoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-amino-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> oxicarbonilo, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, un halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un benciloxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo o un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfinilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- Het representa un heterociclo no condensado, opcionalmente sustituido, de 5, 6 o 7 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes, estando unido Het mediante un átomo de carbono; así como sus sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloides e isómeros ópticamente activos.
2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque R<sup>a</sup> es un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno.
3. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2, caracterizado porque n es 1 ó 2.
4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, caracterizado porque X es un átomo de halógeno o un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>.
5. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4, caracterizado porque el resto 2-piridilo está sustituido con X en la posición 3 y/o 5.
6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, caracterizado porque A se elige entre ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo y cicloheptilo.
7. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, caracterizado porque R<sup>3</sup> y R<sup>2</sup> se eligen, independientemente uno de otro, entre un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un halogeno C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alquilo, que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfanilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfenilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfinilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilamino, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carboniloxi, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilamino o un grupo fenilo.
8. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7, caracterizado porque R<sup>3</sup> se elige entre un átomo de hidrógeno o un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>.
9. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, caracterizado porque Het está sustituido en la posición orto.
10. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9, caracterizado porque Het es un heterociclo de cinco miembros.
11. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, caracterizado porque Het es un heterociclo de seis miembros.

12. Un procedimiento para la preparación del compuesto de fórmula general (I) como se ha definido en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, que comprende hacer reaccionar un derivado de 2-piridina de fórmula general (II) o una de sus sales:



5 en la que X, n, R<sup>a</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y A son como se han definido anteriormente; con un derivado de ácido carboxílico de fórmula general (III)



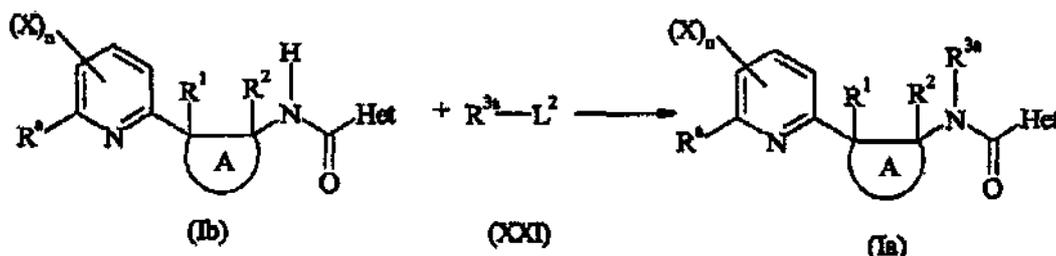
en la que:

10 - L<sup>1</sup> es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, -OR<sup>75</sup>, -OCOR<sup>75</sup>, siendo R<sup>75</sup> un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula



en presencia de un catalizador y, si L<sup>1</sup> es un grupo hidroxilo, en presencia de un agente de condensación.

15 13. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 12, caracterizado porque R<sup>3</sup> es un átomo de hidrógeno y porque el procedimiento se completa mediante una etapa adicional de acuerdo con el siguiente esquema de reacción:



en el que:

20 - R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, A, R<sup>a</sup>, X, n y Het son como se han definido anteriormente;

- R<sup>3a</sup> se elige entre un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo hidroxilo, un alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un halogenoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un halogeno C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> alcoxi que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un cianoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un aminoalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un di-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-amino-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> oxicarbonilo, un cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, un halogenocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquil C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, un benciloxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> carbonilo, un alquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> sulfonilo o un halogenoalquil C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-sulfonilo que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

25 y

30 - L<sup>2</sup> es un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un 4-metil fenilsulfonilo o un metilsulfonilo; que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Ia) con un compuesto de fórmula general (XXI) para proporcionar un compuesto de fórmula general (I).

14. Una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 y un soporte agrícolamente aceptable.

5 15. Un procedimiento para combatir, preventiva o curativamente, los hongos fitopatógenos de los cultivos, **caracterizado porque** se aplica una cantidad eficaz y no fitotóxica de una composición de acuerdo con la reivindicación 14 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 que se desea que crezcan.