



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 365 434**

51 Int. Cl.:
C07D 401/12 (2006.01) **C07D 403/12** (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01) **C07D 409/12** (2006.01)
C07D 413/12 (2006.01) **C07D 417/12** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **07820686 .9**
96 Fecha de presentación : **28.09.2007**
97 Número de publicación de la solicitud: **2084148**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **05.08.2009**

54 Título: **Derivados de N-cicloalquil-carboxamida, tiocarboxamida y carboximidamida N-sustituida fungicidas.**

30 Prioridad: **29.09.2006 EP 06356119**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
05.10.2011

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
05.10.2011

73 Titular/es: **Bayer CropScience S.A.**
16 rue Jean-Marie Leclair
69009 Lyon, FR

72 Inventor/es: **Desbordes, Philippe;**
Dunkel, Ralf;
Gary, Stéphanie;
Grosjean-Cournoyer, Marie-Claire;
Hartmann, Benoît;
Rinolfi, Philippe;
Tuch, Arounarith y
Vors, Jean-Pierre

74 Agente: **Elzaburu Márquez, Alberto**

ES 2 365 434 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).

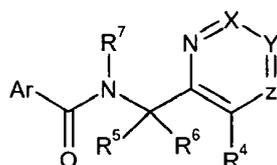
DESCRIPCIÓN

Derivados de N-cicloalquil-carboxamida, tiocarboxamida y carboximidamida N-sustituida fungicidas

5 La presente invención se refiere a derivados de N-cicloalquil-carboxamida, N-cicloalquil-tiocarboxamida y N-cicloalquil-carboximidamida N-sustituida, a su procedimiento de preparación, a su utilización como agentes fungicidas activos, particularmente en forma de composiciones fungicidas, y a métodos para el control de hongos fitopatógenos, especialmente de plantas, que utilizan estos compuestos o composiciones.

La solicitud de patente internacional WO-01/11966 menciona genéricamente determinados derivados de haloalquil-2-piridil-metilen-heterocicil-amida. Sin embargo, no existe ninguna descripción en este documento de ninguno de dichos derivados sustituidos por algún grupo cicloalquilo.

10 La solicitud de patente internacional WO-2004/074259 da a conocer los compuestos que se unen al receptor GABAA de la siguiente fórmula:



en la que Ar puede representar un heterociclo de 5 a 10, R⁷ puede representar un cicloalquilo (C₃-C₇) mientras que X, Y y Z pueden representar N o CR¹, al menos uno representando N.

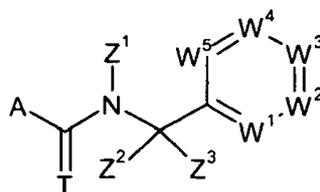
15 Sin embargo, no hay ninguna descripción en este documento de ningún compuesto que incluya un heterociclo o un cicloalquilo de 5 elementos en el átomo de nitrógeno.

La solicitud de patente internacional WO-2006/120224 describe algunos derivados de N-cicloalquil-carboxamida que no forman parte de la presente invención.

20 La solicitud de patente internacional WO 01/11966 describe derivados de carboxamida que tienen la misma actividad que los de la presente solicitud, aunque no incluyen un sustituyente cicloalquilo sobre el átomo de nitrógeno. La solicitud de patente internacional WO 2004/074280 describe compuestos similares adicionales que contienen un grupo metileno adicional en el ligante.

25 Siempre es de gran interés en el campo de la agricultura, el uso de nuevos compuestos pesticidas con objeto de evitar el desarrollo de cepas resistentes a los ingredientes activos o luchar contra ellas. Es también de gran interés el uso de nuevos compuestos que sean más activos que los ya conocidos, con objeto de reducir las cantidades de compuesto activo que se han de utilizar, manteniendo al mismo tiempo una eficacia al menos equivalente a la de los compuestos ya conocidos. Se ha encontrado ahora una nueva familia de compuestos que poseen los efectos o las ventajas mencionadas anteriormente.

Por consiguiente, la presente invención proporciona derivados de N-cicloalquil-carboxamida de fórmula (I):



(I)

30 en donde

- A representa un grupo heterociclilo de 5 elementos insaturado, unido por carbo o parcialmente saturado, que puede estar sustituido por hasta cuatro grupos R²;
- T representa O;
- 35 • Z₁ representa un cicloalquilo(C₃-C₇) sin sustituir o un cicloalquilo(C₃-C₇) sustituido por hasta 10 átomos o grupos que pueden ser iguales o diferentes y que pueden seleccionarse de la lista consistente en átomos de halógeno; ciano; alquilo(C₁-C₈); halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser

o diferentes; alquil tri(C₁-C₈)sililo y alquil tri(C₁-C₈) alquilo(C₁-C₈)sililo; alcoxi(C₁-C₈)-imino ; (alcoxi(C₁-C₈)-imino)-alquilo(C₁-C₈);

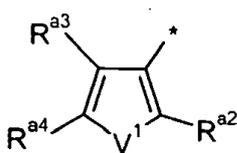
así como sales, N-óxidos e isómeros ópticamente activos o geométricos de los mismos; con la condición que R^b en W² a W⁵ no representa un halogenoalquilo(C₁-C₈) cuando W¹ representa N y que R^b en W¹ a W⁴ no represente un halogenoalquilo(C₁-C₈) cuando W⁵ representa N.

Cualquiera de los compuestos de acuerdo con la invención puede existir en forma de uno o más estereoisómeros dependiendo del número de unidades estereogénicas (como se define por las reglas de la IUPAC) en el compuesto. Por lo tanto, la invención se refiere de la misma manera a todos los estereoisómeros, y a las mezclas de todos los estereoisómeros posibles, en todas las proporciones. Los estereoisómeros pueden separarse de acuerdo con los métodos que se conocen por se por el experto en la materia.

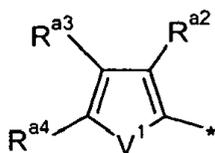
Conforme a la invención, se usan en general las expresiones genéricas siguientes, con los siguientes significados:

- halógeno significa: flúor, cloro, bromo o yodo;
- heteroátomo puede ser nitrógeno, oxígeno o azufre;
- los grupos halogenados, en particular los grupos haloalquilo, haloalcoxi y cicloalquilo, pueden comprender hasta nueve átomos de halógeno idénticos o diferentes;
- cualquier grupo alquilo, grupo alquenoilo o grupo alquinoilo puede ser lineal o ramificado ;
- el término "arilo" se refiere a fenilo o naftilo, opcionalmente sustituido por uno a cinco grupos seleccionados de la lista que consiste en halógeno, alquilo(C₁-C₆), haloalquilo(C₁-C₆), alquenoilo(C₂-C₆), haloalquenoilo(C₂-C₆), alquinoilo(C₂-C₆), haloalquinoilo(C₂-C₆), alcoxi(C₁-C₆), alcoxi [C₁-C₄]-alquilo(C₁-C₄), alcoxi(C₁-C₄)-alcoxi(C₁-C₄), haloalcoxi(C₁-C₆) y haloalcoxi(C₁-C₄)-alquilo(C₁-C₄).
- en el caso de un grupo amino o del resto amino de cualquier otro grupo que contiene amino, sustituido por dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes, los dos sustituyentes junto con el nitrógeno al que están unidos pueden formar un grupo heterociclilo, preferentemente un grupo heterociclilo de 5 a 7 elementos, que puede estar sustituido y puede contener otros heteroátomos, por ejemplo morfolino o piperidinilo.

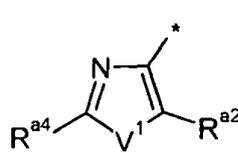
Los compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que A se selecciona de la lista que consiste en:



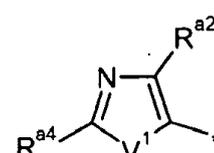
A¹



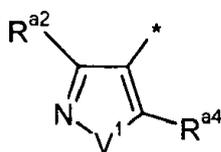
A²



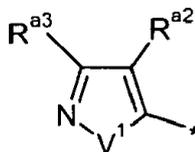
A³



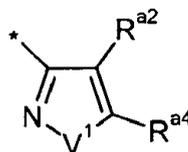
A⁴



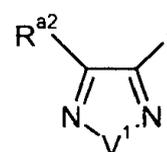
A⁵



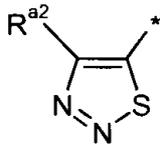
A⁶



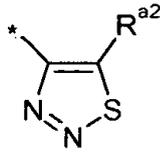
A⁷



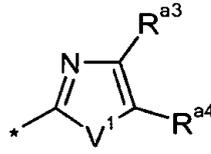
A⁸



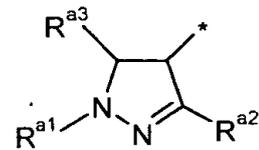
A⁹



A¹⁰



A¹¹



A¹²

en la que :

• -* representa el punto de unión al grupo carbonilo ;

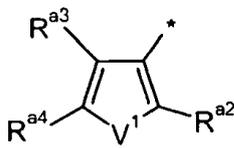
• V¹ representa O, S o NR^{a1} ;

5 • R^{a1} representa un átomo de hidrógeno; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C₁-C₈)-alquilo(C₁-C₈);

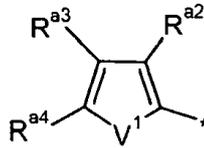
10 • R^{a2} y R^{a3}, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; ciano; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C₁-C₈) o halogenoalcoxi (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. cicloalquilo C₃-C₇;

15 • R^{a4} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno ; ciano; alquilo(C₁-C₈; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C₁-C₈) o halogenoalcoxi (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. cicloalquilo(C₃-C₇); alquil(C₁-C₈)sulfanilo; amino; alquil(C₁-C₈)amino; di-(alquil-C₁-C₈)aminocarbonilo ; alquil(C₁-C₈)-oxicarbonilo.

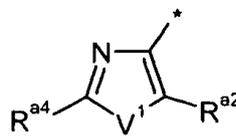
Los compuestos más preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que A se selecciona de la lista que consiste en:



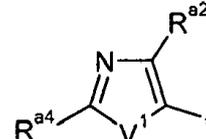
A¹



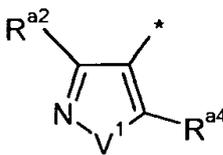
A²



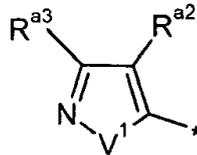
A³



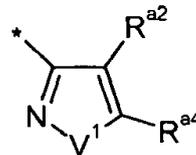
A⁴



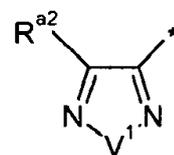
A⁵



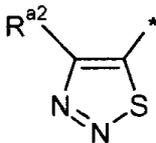
A⁶



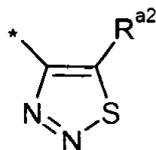
A⁷



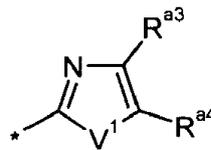
A⁸



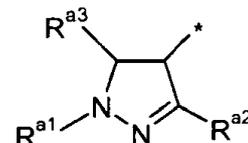
A⁹



A¹⁰



A¹¹



A¹²

20

en la que :

- -* representa el punto de unión al grupo carbonilo ;
- V^1 representa O, S o NR^{a1} ;
- R^{a1} representa un átomo de hidrogeno; alquilo(C_1-C_8); alcoxi(C_1-C_8)- alquilo(C_1-C_8) ;
- R^{a2} representa alquilo(C_1-C_8) ; halogenoalquilo(C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C_1-C_8);
- R^{a3} representa un átomo de hidrogeno; un átomo de halógeno; alquilo(C_1-C_8);
- R^{a4} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno ; alquilo(C_1-C_8); halogenoalquilo(C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

Otros compuestos más preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que

- A representa A^5 ;
- V^1 representa NR^{a1} ;
- R^{a2} representa alquilo(C_1-C_8) ;
- R^{a2} y R^{a3} , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C_1-C_8 ; halogenoalquilo C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

Otros compuestos más preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que

- A representa A^4 ;
- V^1 representa S ;
- R^{a2} representa alquilo(C_1-C_8) ; halogenoalquilo(C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;
- R^{a4} representa un átomo de hidrogeno; alquilo C_1-C_8 ; halogenoalquilo(C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Z^1 representa ciclopropilo.

- Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Z^2 y Z^3 independientemente representan un átomo de hidrógeno o alquilo (C_1-C_8).

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que

- W^1 representa N ;
- W^2 a W^5 independientemente representan CR^b ;
- R^b representa independientemente un átomo de hidrógeno ; un átomo de halógeno; alquilo(C_1-C_8); alcoxi(C_1-C_8); halogenoalcoxi(C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que

- W^2 representa N ;
- W^1 y W^3 a W^5 representan independientemente CR^b ;
- R^b representa independientemente un átomo de hidrógeno ; un átomo de halógeno; alquilo(C_1-C_8); halogenoalquilo C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes alcoxi(C_1-C_8); halogenoalcoxi(C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que

- W^3 representa N ;
- W^1 y W^2W^4 y W^5 representan independientemente CR^b ;

- R^b representa independientemente un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo(C₁-C₈); halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes, alcoxi(C₁-C₈); halogenoalcoxi(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

5 Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Q representa un átomo de halógeno. alquilo C₁-C₈; alcoxi(C₁-C₈); halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; halogenoalcoxi (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

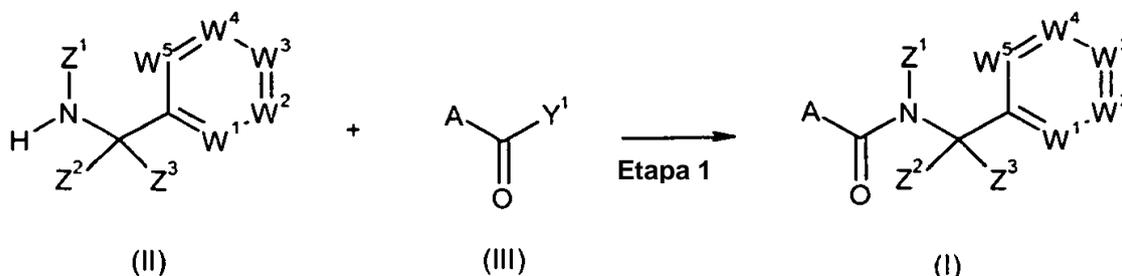
10 Las preferencias mencionadas anteriormente con respecto a los sustituyentes de los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención pueden combinarse de diversas maneras, bien individual, parcial o completamente. Estas combinaciones de características preferidas proporcionan de esta manera subclases de compuestos de acuerdo con la invención. Los ejemplos de dichas subclases de compuestos preferidos de acuerdo con la invención pueden combinar:

- 15 - características preferidas de A con características preferidas de una o más de T, Z¹ a Z³, W¹ a W⁵, R^a a R^d, V¹ y Q;
- características preferidas de T con características preferidas de una o más de A, Z¹ a Z³, W¹ a W⁵, R^a a R^d, V¹ y Q;
- características preferidas de Z¹ a Z³ con características preferidas de una o más de A, T, W¹ a W⁵, R^a a R^d, V¹ y Q;
- 20 - características preferidas de W¹ a W⁵ con características preferidas de una o más de A, T, Z¹ a Z³, R^a a R^d, V¹ y Q;
- características preferidas de R^a a R^d con características preferidas de una o más de A, T, Z¹ a Z³, W¹ a W⁵, V¹ y Q;
- 25 - características preferidas de V¹ con características preferidas de una o más de A, T, Z¹ a Z³, W¹ a W⁵, R^a a R^d y Q;
- características preferidas de V¹ con características preferidas de una o más de A, T, Z¹ a Z³, W¹ a W⁵, R^a a R^d y V¹.

30 En estas combinaciones de características preferidas de los sustituyentes de los compuestos según la invención, dichas características preferidas pueden también seleccionarse entre las características más preferidas de cada uno de A, T, Z¹ a Z³, W¹ a W⁵, R^a a R^d, V¹ y Q; para formar subclases aún más preferidas de compuestos de acuerdo con la invención.

La presente invención también se refiere a un procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (I).

35 Así, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P1 para la preparación del compuesto de fórmula (I) en el que T representa O, como se ilustra en el siguiente esquema de reacción:



Procedimiento P1

en donde

- A, Z¹ a Z³, W¹ a W⁵ son como se define en la presente memoria ;
- Y¹ representa un átomo de halógeno o un grupo saliente.

En el procedimiento P1 según la invención, la etapa 1 puede realizarse si procede en presencia de un disolvente y si corresponde en presencia de un aglutinante ácido.

5 Los derivados de N-cicloalquil-amina de fórmula (II) son conocidos o pueden prepararse por procedimientos conocidos tales como la aminación reductora de aldehído o cetona (*Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters*, 2006, pág. 2014 síntesis de los compuestos 7 y 8), o reducción de iminas (*Tetrahedron*, 2005, pág. 11689), o sustitución nucleófila de halógeno, mesilato o tosilato (*Journal of Medicinal Chemistry*, 2002, pág. 3887 preparación del producto intermedio para el compuesto 28)

10 Los derivados del ácido carboxílico de fórmula (III) son conocidos o pueden prepararse por conocidos procedimientos (documento WO-93/11117; patente EP-A 0 545 099; Nucleosides & Nucleotides, 1987, págs. 737-759, *Bioorg. Med. Chem.*, 2002, págs. 2105-2108).

15 Aglutinantes ácidos adecuados para llevar a cabo el procedimiento P1 según la invención son, en cada caso, todas las bases inorgánicas y orgánicas habituales para dichas reacciones. Se da preferencia a la utilización de metales alcalinotérreos, hidruros de metales alcalinos, hidróxidos de metales alcalinos o alcóxidos de metales alcalinos, tales como hidróxido sódico, hidruro sódico, hidróxido de calcio, hidróxido potásico, terc-butóxido potásico u otro hidróxido de amonio, carbonatos de metales alcalinos, tales como carbonato de cesio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico, acetatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, tales como acetato sódico, acetato potásico, acetato de calcio y también aminas terciarias, tal como trimetilamina, trietilamina, diisopropilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, piridina, N-metilpiperidina, N,N-dimetil-aminopiridina, diazabiciclooctano (DABCO), diazabiclononeno (DBN) o diazabicicoundeceno (DBU).

20 También es posible operar en ausencia de un agente de condensación adicional o emplear un exceso de componente amino, de manera que actúe simultáneamente como agente aglutinante ácido.

25 Los disolventes adecuados para llevar a cabo el procedimiento P1 según la invención son en cada caso todos los disolventes orgánicos inertes habituales. Se da preferencia al uso opcional de hidrocarburos halogenados alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil-t-butílico, éter metil-t-amílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o i-butironitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico; ésteres, tales como acetato de metilo o acetato de etilo, sulfóxidos, tales como sulfóxido de dimetilo o sulfonas, tales como sulfolano.

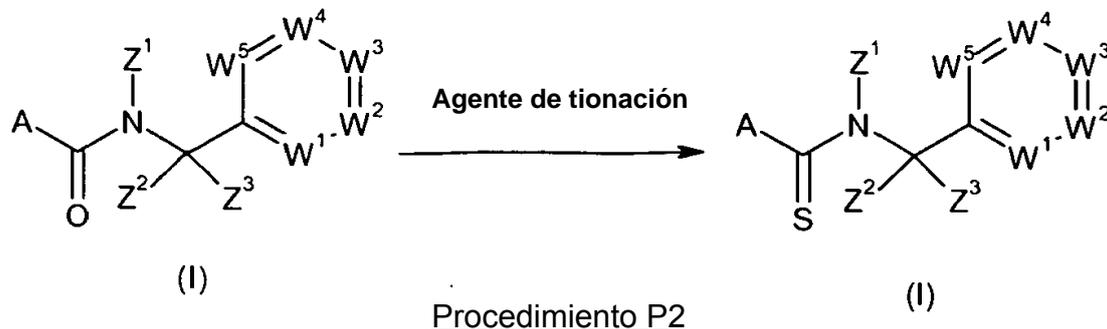
30 Cuando se realiza el procedimiento P1 según la invención, las temperaturas de reacción pueden variar independientemente dentro de un intervalo relativamente grande. Generalmente, los procedimientos según la invención se realizan a temperaturas entre 0°C y 160°C, preferentemente entre 10°C y 120°C. Una forma de controlar la temperatura en los procesos de acuerdo con la invención es usar tecnología de microondas.

35 El procedimiento P1 según la invención se realiza en general independientemente a presión atmosférica. Sin embargo, en cada caso, es también posible trabajar a presión elevada o reducida.

Cuando se realiza la etapa 1 del procedimiento P1 según la invención, generalmente 1 mol u otros de un exceso del derivado ácido de fórmula (III) y de 1 a 3 moles de aglutinante ácido se emplean por mol de amina de fórmula (II). También es posible emplear los componentes de la reacción en otras proporciones.

40 El tratamiento se realiza por métodos habituales. En general, se trata con agua la mezcla de reacción y se separa la fase orgánica y, después de secar, se concentra a presión reducida. Si procede, el residuo restante puede liberarse de cualquier impureza que todavía pueda estar presente por los métodos convencionales, tal como por cromatografía o recristalización.

45 Según un aspecto adicional de acuerdo con la presente invención, se proporciona un segundo procedimiento P2 para la preparación de un compuesto de fórmula (I) en el que T representa S, y se ilustra según el siguiente esquema de reacción:



en el que A, Z¹ a Z³, W¹ a W⁵ son como se definen en la presente memoria ;

El procedimiento P2 puede llevarse a cabo en presencia de un agente de tionación.

A partir de derivados de amida de fórmula (I) pueden prepararse según el procedimiento P1.

- 5 Los agentes de tionación adecuados para llevar a cabo el procedimiento P2 según la invención puede ser el azufre (S), ácido sulfhídrico (H₂S), sulfuro sódico (Na₂S), bisulfuro sódico (NaHS), trisulfuro de boro (B₂S₃), bisulfuro de (dietilaluminio) ((AlEt₂)₂S), sulfuro de amonio ((NH₄)₂S), pentasulfuro de fósforo (P₂S₅), reactivo de Lawesson (2,4-disulfuro de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,2,3,4-ditiadifosfetano) o un reactivo de tionación soportado al polímero tal como el descrito en J.Chem.Soc. Perkin 1, (2001), 358, en presencia o en ausencia, de una cantidad catalítica o estequiométrica o más, de una base tal como una base inorgánica y orgánica. Se da preferencia a utilizar
- 10 carbonatos de metales alcalinos, tales como el carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico; bases heterocíclicas aromáticas, tales como piridina, picolina, lutidina, colidina; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-aminopiridina o N-metilpiperidina.
- 15 Los disolventes adecuados para realizar el proceso P2 de acuerdo con la invención pueden ser disolventes orgánicos inertes habituales. Se da preferencia al uso opcional de hidrocarburos halogenados alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil t-butílico, éter metil t-amílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano o 1,2-dietoxietano; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o i-butironitrilo o benzonitrilo; disolventes sulfurosos, tales como sulfolano o disulfuro de carbono.

20 Cuando se realiza el proceso P2 de acuerdo con la invención, las temperaturas de reacción pueden variar dentro de un intervalo relativamente amplio. En general, estos procesos se realizan a temperaturas de 0°C a 160°C, preferiblemente de 10°C a 120°C. Una forma de controlar la temperatura en los procesos de acuerdo con la invención es usar tecnología de microondas.

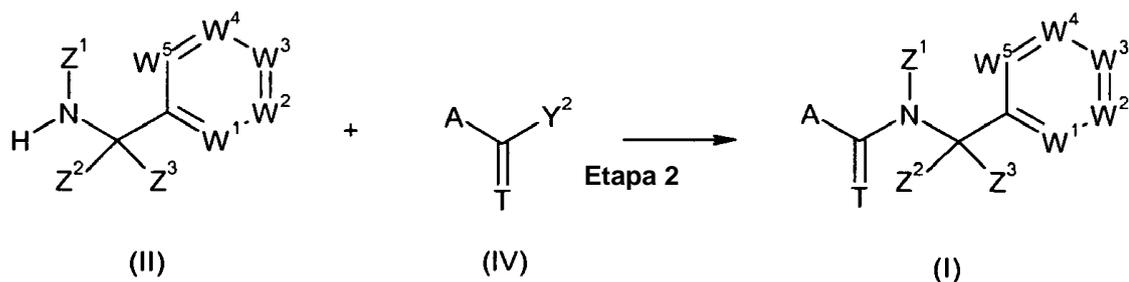
El proceso P2 de acuerdo con la invención se realiza generalmente a presión atmosférica. También es posible operar a presión elevada o reducida.

Cuando se realiza el procedimiento P2 según la invención, 1 mol o un exceso del equivalente de azufre del agente de tionación y de 1 a 3 moles de la base pueden emplearse por mol del derivado amidado (II).

- 30 También es posible emplear los componentes de la reacción en otras proporciones. El desarrollo se realiza por métodos conocidos.

En general, la mezcla de reacción se concentra a presión reducida. El residuo que queda puede separarse de cualquier impureza que pueda estar todavía presente por métodos conocidos, tales como cromatografía o recristalización.

- 35 Según un aspecto adicional de acuerdo con la invención, se proporciona un tercer procedimiento P3 para la preparación del compuesto de fórmula (I), en el que T representa NR^c, N-OR^d, N-NR^cR^d o N-CN, y se ilustra según el siguiente esquema de reacción:



Procedimiento P3

en donde

- A, Z¹ a Z³, W¹ a W⁵, R^c y R^d son como se definen en la presente memoria ;
- Y² representa un átomo de cloro.

5 En el procedimiento P3 según la invención, la etapa 2 puede realizarse en presencia de un aglutinante ácido y en presencia de un disolvente.

Los derivados de N-cicloalquil-amina de fórmula (II) son conocidos o pueden prepararse por procedimientos conocidos tales como la aminación reductora de aldehído o cetona (*Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters*, 2006, pág. 2014 síntesis de los compuestos 7 y 8), o reducción de iminas (*Tetrahedron*, 2005, pág. 11689), o sustitución nucleófila de halógeno, mesilato o tosilato (*Journal de Medicinal Chemistry*, 2002, pág. 3887 preparación del producto intermedio para el compuesto 28).

El cloruro de carboximidoilo N-sustituido de fórmula (IV) se conoce o puede prepararse por procedimientos conocidos, por ejemplo como se describe en Houben-Weyl, "Methoden der organischen Chemie" (1985), E5/1, 628-633 y Patai, "The chemistry of amidines and imidates" (1975), 296-301.

15 Los aglutinantes ácidos adecuados para realizar el procedimiento P3 según la invención pueden ser bases inorgánicas y orgánicas que son habituales para dichas reacciones. Se da preferencia al uso de hidróxidos de metales alcalinos o alcalinotérreos, tales como hidróxido de sodio, hidróxido de calcio, hidróxido de potasio u otros derivados de hidróxido de amonio; carbonatos de metales alcalinos, tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, bicarbonato de potasio, bicarbonato de sodio; acetatos de metales alcalinos o alcalinotérreos, tales como acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio; hidruros de metales alcalinotérreos o de metales alcalinos, tales como el hidruro sódico o hidruro potásico; alcoholatos de metales alcalinotérreos o metales alcalinos, tales como metilato sódico, etilato sódico, propilato sódico o t-butilato potásico; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, piridina, N-metilpiperidina, N,N-dimetil-aminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diaza-bicicloundeceno (DBU), o un eliminador de ácido soportado sobre polímero (por ejemplo como se detalla en <http://www.iris-biotech.de/downloads/scavengers.pdf>).

También es posible trabajar en ausencia de cualquier aglutinante ácido adicional.

Disolventes adecuados para realizar el procedimiento P3 según la invención pueden ser los disolventes orgánicos inertes habituales. Se da preferencia al uso opcional de hidrocarburos halogenados alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalina; clorobenceno, diclorobenceno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano o tricloroetano; éteres, tales como éter dietílico, éter diisopropílico, éter metil-t-butílico, éter metil-t-amílico, dioxano, tetrahidrofurano, 1,2-dimetoxietano, 1,2-dietoxietano o anisol; nitrilos, tales como acetonitrilo, propionitrilo, n- o i-butironitrilo o benzonitrilo; amidas, tales como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida, N-metilformanilida, N-metilpirrolidona o triamida del ácido hexametilfosfórico; ésteres, tales como acetato de metilo o acetato de etilo, sulfóxidos, tales como sulfóxido de dimetilo o sulfonas, tales como sulfolano.

Cuando se realiza el procedimiento P3 según la invención, las temperaturas de reacción pueden variar dentro de un intervalo relativamente amplio. En general, estos procesos se realizan a temperaturas de 0°C a 160°C, preferiblemente de 10°C a 120°C. Una forma de controlar la temperatura en los procesos de acuerdo con la invención es usar tecnología de microondas. El procedimiento P2 según la invención se realiza generalmente a presión atmosférica. También es posible operar a presión elevada o reducida.

Cuando se realiza el procedimiento P3 según la invención, el derivado aminado de fórmula (III) puede emplearse como su sal, tal como clorhidrato o cualquier otra sal conveniente.

Cuando se realiza el procedimiento P3 según la invención, 1 mol o un exceso del derivado aminado de fórmula (III) y de 1 a 3 moles de aglutinante ácido puede emplearse por mol de cloruro de carboximidoilo N-sustituido de fórmula (IV).

5 También es posible emplear los componentes de la reacción en otras proporciones. El desarrollo se realiza por métodos conocidos.

En general, la mezcla de reacción se concentra a presión reducida. El residuo que queda puede separarse de cualquier impureza que pueda estar todavía presente por métodos conocidos, tales como cromatografía o recristalización.

10 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden prepararse según el procedimiento descrito anteriormente. Se entenderá no obstante que, en base a su conocimiento general y a las publicaciones disponibles, el experto en la materia será capaz de adaptar estos procedimientos a las especificidades de cada uno de los compuestos de acuerdo con la invención que se desea sintetizar.

En un aspecto adicional, la presente invención también se refiere a una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz y no fitotóxica de un compuesto activo de fórmula (I).

15 La expresión "cantidad eficaz y no fitotóxica" se refiere a una cantidad de composición de acuerdo con la invención que es suficiente para controlar o destruir los hongos presentes o que pueden aparecer en los cultivos, y que no conlleva ningún síntoma apreciable de fitotoxicidad para dichos cultivos. Dicha cantidad puede variar en un amplio intervalo dependiendo del hongo que se vaya a combatir, el tipo de cultivo, las condiciones climáticas y los compuestos incluidos en la composición fungicida según la invención. Esta cantidad se puede determinar por
20 ensayos en campo sistemáticos, que están dentro de las cualidades de un experto en la técnica.

Así, de acuerdo con la invención, se proporciona una composición fungicida que comprende, como ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I), como se defina en la presente memoria y un soporte, vehículo o carga aceptable desde el punto de vista agrícola.

25 Según la presente invención, el término "soporte" indica un compuesto orgánico o inorgánico, natural o sintético, con el que se combina o asocia el compuesto de fórmula (I) para hacerlo más fácilmente aplicable, fundamentalmente sobre las partes de la planta. Así, este soporte es generalmente inerte y debería ser aceptable desde el punto de vista agrícola. El soporte puede ser un sólido o un líquido. Los ejemplos de soportes adecuados incluyen arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, agua, alcoholes, en particular butanol, disolventes orgánicos, aceites minerales y vegetales y derivados de los mismos. También se pueden usar mezclas
30 de tales soportes.

La composición de acuerdo con la invención puede comprender también componentes adicionales. En particular, la composición puede comprender además un tensioactivo. El tensioactivo puede ser un emulsionante, un agente de dispersión o un agente humectante de tipo iónico o no iónico o una mezcla de dichos tensioactivos. Se puede hacer
35 mención, por ejemplo, a sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o naftalensulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o ácidos grasos o 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 polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de polioles y derivados de los compuestos anteriores que contienen funciones sulfato, sulfonato y fosfato. La presencia de al menos un tensioactivo es por lo general esencial cuando el compuesto activo y/o el soporte inerte son insolubles en agua, y cuando el agente vector para la aplicación es agua. Preferiblemente, el contenido en
40 tensioactivo puede estar comprendido entre 5% y 40% en peso de la composición.

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

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

Las composiciones de acuerdo con la invención se pueden utilizar en diversas formas, tales como: dispensador de aerosol, suspensión en cápsulas, concentrado para fumigación en frío, polvo de espolvoreo, concentrado
50 emulsionable, emulsión de aceite en agua, emulsión de agua en aceite, granulados encapsulados, granulados finos, concentrado fluido para el tratamiento de semillas, gas (a presión), producto generador de gas, granulados, concentrado para fumigación en caliente, macrogranulados, microgranulados, polvo dispersable en aceite, concentrado fluido miscible en aceite, líquido miscible en aceite, pasta, bastoncillos vegetales, polvo para tratamiento de semillas en seco, semillas recubiertas de pesticida, concentrado soluble, polvo soluble, disolución para el tratamiento de semillas, concentrado en suspensión (concentrado fluido), líquido en volumen ultrabajo (vub),
55 suspensión en volumen ultrabajo (vub), granulado o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento en suspensión, granulados o comprimidos solubles en agua, polvo soluble en agua para el

tratamiento de semillas y polvo humectable. Estas composiciones incluyen no sólo composiciones que están listas para ser aplicadas a la planta o semilla a tratar por medio de un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo de atomización o de espolvoreo, sino también las composiciones comerciales concentradas que han de diluirse antes de la aplicación al cultivo.

- 5 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden mezclarse también con una o más sustancias activas insecticidas, fungicidas, bactericidas, atrayentes, acaricidas o feromonas u otros compuestos con actividad biológica. Las mezclas así obtenidas tienen normalmente un espectro de actividad ampliado. Las mezclas con otros compuestos fungicidas son particularmente ventajosas.

Se pueden seleccionar ejemplos de fungicidas de mezcla asociados adecuados en las siguientes listas:

- 10 B1) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de ácido nucleico tal como benalaxilo, benalaxilo-M, bupirimato, clozilación, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, mefenoxam, metalaxilo, metalaxilo-M, ofurace, oxadixilo y ácido oxolínicó;
- B2) un compuesto capaz de inhibir la mitosis y la división celular tal como benomil, carbendazim, dietofencarb, etaboxam, fuberidazol, pencicurón, tiabendazol, tiofanato-metilo y zoxamida;
- 15 B3) un compuesto capaz de inhibir la respiración, por ejemplo como inhibidor de la respiración-CI como diflumentorim;
- como inhibidor de la respiración-CII como boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanilo, furametpir, furmeciclox, mepronil, oxicarboxina, pentiopirad y tifulzamida;
- 20 como inhibidor del CIII de la respiración como amisulbrom, azoxistrobina, ciazofamida, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, trifloxistrobina;
- B4) un compuesto capaz de actuar como desacoplador tal como dinocap, fluazinam y meptildinocap;
- B5) un compuesto capaz de inhibir la producción de ATP como: acetato de fentín, cloruro de fentín, hidróxido de fentín, siltiofam;
- 25 B6) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de AA y proteínas como andoprim, blasticidina-S, ciprodinil, kasugamicina, hidrocloreto de kasugamicina hidratado, mepanipirim, pirimetanilo;
- B7) un compuesto capaz de inhibir la transducción de señales como: fenciclonilo, fludioxonilo, quinoxifeno;
- B8) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de lípidos y membrana como bifenilo, clozolinato, edifenfos, etridiazol, iodocarb, iprobenfos, iprodiona, isoprotilano, procimidona, propamocarb; hidrocloreto de propamocarb, pirazofos, tolclofos-metilo, vinclozolina;
- 30 B9) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de ergosterol tal como aldimorf, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, dodemorf, acetato de dodemorf, epoxiconazol, etaconazol, fenarimol, fenbuconazol, fenhexamida, fenpropidín, fenpropimorf, flouquinconazol, flurprimidol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, naftifina, nuarimol, oxpoconazol, paclobutrazol, pefurazoato, penconazol, procloraz, propiconazol, protioconazol, piributicarb, pirifenox, simeconazol, espiroxamina, tebuconazol, terbinafina, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, tridemorf, triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol, viniconazol y voriconazol;
- 35 B10) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de la pared celular tal como bentiavalicarb, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, mandipropamida, polioxinas, polioxorim y validamicina A;
- B11) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de melanina tal como carpropamida, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, piroquilon y triciclazol;
- B12) un compuesto capaz de inducir una defensa del hospedador como acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinilo;
- 45 B13) un compuesto capaz de actuar en múltiples puntos tal como mezcla de Bordeaux, captafol, captán, clorotalonilo, naftenato de cobre, óxido de cobre, oxicloruro de cobre, preparaciones de cobre tales como hidróxido de cobre, sulfato de cobre, diclofluánida, ditionón, dodina, base libre de dodina, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, mancopper, mancozeb, maneb, metiram, metiram cinc, oxina-cobre, propineb, azufre y preparaciones de azufre
- 50 incluyendo polisulfuro de calcio, tiram, tolilfluánid, zineb y ziram;

B14) un compuesto seleccionado de 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]fenil)etilideno]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxilato, 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, 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-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-N-[(9R)-9-isopropil-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-N-[(9S)-9-isopropil-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 3,4,5-tricloropiridina-2,6-dicarbonitrilo, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, sulfato de 8-hidroquinolina, bentiazol, betoxazin, capsimicina, carvona, quinometionato, cufraneb, ciflufenamida, cimoxanilo, dazomet, debacarb, diclorofeno, diclomezina, diclorán, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, ecomato, ferimzona, flumetover, fluopicolida, fluoroimida, flusulfamida, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, hexaclorobenceno, irumamicina, isotianilo, metasulfocarbo, (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, 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-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, N-[(5-bromo-3-cloropiridin-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-yodonicotinamida, N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-fenilacetamida, N-{2-[1,1'-bi(ciclopropil)-2-il]fenil}-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil}-2-(trifluorometil)benzamida, natamicina, N-etil-N-metil-N'-(2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil]imidofornamida, N-etil-N-metil-N'-(2-metil-5-(difluorometil)-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil]imidofornamida, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, O-{1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil}1H-imidazol-1-carbotioato, octilina, oxamocarb, oxifentiina, pentaclorofenol y sales, ácido de fósforo y sus sales, piperalina, fosetilato de propamocarb, propanosina-sodio, proquinazid, piribencarb, pirrolnitrine, quintoceno, S-alil-5-amino-2-isopropil-4-(2-metilfenil)-3-oxo-2,3-dihidro-1H-pirazol-1-carbotioato, tecloftalam, tecnazeno, triazóxido, triclamida, valifenal y zarilamida.

35 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 mezcla bactericidas asociados adecuados se pueden seleccionar de la siguiente lista: bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilina, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomycin, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

40 Los compuestos de fórmula (I) y la composición fungicida de acuerdo con la invención se pueden usar para combatir de forma terapéutica o preventiva los hongos fitopatógenos de las plantas o de los cultivos.

45 Por lo tanto, según otro aspecto de la invención, se proporciona un método para controlar, de forma terapéutica o preventiva, los hongos fitopatógenos de plantas o cultivos caracterizado porque se aplica un compuesto de fórmula (I) o una composición fungicida acorde con la invención a la semilla, a la planta, al fruto de la planta o al suelo en el que crece o en el que se desea que crezca la planta.

50 El método de tratamiento de acuerdo con la invención puede servir también para tratar material de propagación tal como tubérculos o rizomas, pero también semillas, plántulas o siembras de plántulas y plantas o siembras de plantas. Este método de tratamiento también puede ser útil para tratar raíces. El método de tratamiento de acuerdo con la invención también puede ser útil para tratar las partes aéreas de la planta tales como troncos, tallos o vástagos, hojas, flores y fruto de la planta en cuestión.

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

Entre las enfermedades de plantas o cultivos que pueden combatirse mediante el método de acuerdo con la invención, se pueden mencionar:

- Enfermedades por mildiu tales como:
 - enfermedades por Blumeria, producidas por ejemplo por *Blumeria graminis*;
 - 5 enfermedades por Podosphaera, provocadas por ejemplo por *Podosphaera leucotricha*;
 - enfermedades por Sphaerotheca, producidas por ejemplo por *Sphaerotheca fuliginea*;
 - enfermedades por Uncinula, producidas por ejemplo por *Uncinula necator*;
- enfermedades por roya, tales como:
 - enfermedades por Gymnosporangium, producidas por ejemplo por *Gymnosporangium sabinae*;
 - 10 enfermedades por Hemileia, producidas por ejemplo por *Hemileia vastatrix*;
 - enfermedades por fakopsora, producidas por ejemplo por *fakopsora pachyrhizi* o *fakopsora meibomiae*;
 - enfermedades por Puccinia, producidas por ejemplo por *Puccinia recondita*;
 - enfermedades por Uromyces, producidas por ejemplo por *Uromyces appendiculatus*;
- enfermedades por oomicetos, tales como:
 - 15 enfermedades por Bremia, producidas por ejemplo por *Bremia lactucae*;
 - enfermedades por Peronospora, producidas por ejemplo por *Peronospora pisi* o *P. brassicae*;
 - enfermedades por Phytophthora, producidas por ejemplo por *Phytophthora infestans*;
 - enfermedades por Plasmopara, producidas por ejemplo por *Plasmopara viticola*;
 - enfermedades por Pseudoperonospora, producidas por ejemplo por *Pseudoperonospora humuli* o
 - 20 *Pseudoperonospora cubensis*;
- enfermedades por Pythium, provocadas por ejemplo por *Pythium ultimum*;
- Enfermedades por manchas foliares, enrojecimientos foliares y tizón foliar tales como:
 - Enfermedades por Alternaria, producidas por ejemplo por *Alternaria solani*;
 - enfermedades por Cercospora, producidas por ejemplo por *Cercospora beticola*;
 - 25 enfermedades por Cladosporium, producidas por ejemplo por *Cladosporium cucumerinum*;
 - enfermedades por Cochliobolus, producidas por ejemplo por *Cochliobolus sativus*;
 - enfermedades por Colletotrichum, producidas por ejemplo por *Colletotrichum lindemuthanium*;
 - enfermedades por Cycloconium, producidas por ejemplo por *Cycloconium oleaginum*;
 - enfermedades por Diaporthe, producidas por ejemplo por *Diaporthe citri*;
 - 30 enfermedades por Elsinoe, producidas por ejemplo por *Elsinoe fawcettii*;
 - enfermedades por Gloeosporium, producidas por ejemplo por *Gloeosporium laeticolor*;
 - enfermedades por Glomerella, producidas por ejemplo por *Glomerella cingulata*;
 - enfermedades por Guignardia, producidas por ejemplo por *Guignardia bidwelli*;
 - enfermedades por Leptosfaeria, producidas por ejemplo por *Leptosfaeria maculans*;
 - 35 *Leptosfaeria nodorum*;
 - enfermedades por Magnaporthe, producidas por ejemplo por *Magnaporthe grisea*;
 - enfermedades por Mycosphaerella, producidas por ejemplo por *Mycosphaerella graminicola*;

Mycosphaerella arachidicola; *Mycosphaerella fijiensis*;

enfermedades por *Phaeosphaeria*, producidas por ejemplo por *Phaeosphaeria nodorum* ;

enfermedades por *Pyrenofora*, producidas por ejemplo por *Pyrenofora teres*;

enfermedades por *Ramularia*, producidas por ejemplo por *Ramularia collo-cygni* ;

5 enfermedades por *Rhynchosporium*, producidas por ejemplo por *Rhynchosporium secalis*;

enfermedades por *Septoria*, producidas por ejemplo por *Septoria apii* o *Septoria lycopersici* ;

enfermedades por *Typhula*, producidas por ejemplo por *Typhula incarnata*;

enfermedades por *Venturia*, producidas por ejemplo por *Venturia inaequalis*;

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

10 enfermedades por *Corticium*, producidas por ejemplo por *Corticium graminearum*;

enfermedades por *Fusarium*, producidas por ejemplo por *Fusarium oxysporum*;

enfermedades por *Gaeumannomyces*, producidas por ejemplo por *Gaeumannomyces graminis*;

enfermedades por *Rhizoctonia*, producidas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;

enfermedades por *Tapesia*, producidas por ejemplo por *Tapesia acuformis*;

15 enfermedades por *Thielaviopsis*, producidas por ejemplo por *Thielaviopsis basicola*;

- Enfermedades de la mazorca y de la panícula, tales como:

enfermedades por *Alternaria*, producidas por ejemplo por *Alternaria spp.*;

enfermedades por *Aspergillus*, producidas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;

enfermedades por *Cladosporium*, producidas por ejemplo por *Cladosporium spp.*;

20 enfermedades por *Claviceps*, producidas por ejemplo por *Claviceps purpurea*;

Enfermedades por *Fusarium*, producidas por ejemplo por *Fusarium culmorum*;

enfermedades por *Gibberella*, producidas por ejemplo por *Gibberella zeae*;

enfermedades por *Monograpella*, producidas por ejemplo por *Monograpella nivalis*;

- Enfermedades por Carbón y tizón, tales como:

25 enfermedades por *Sphacelotheca*, producidas por ejemplo por *Sphacelotheca reiliana*;

enfermedades por *Tilletia*, producidas por ejemplo por *Tilletia caries*;

enfermedades por *Urocystis*, producidas por ejemplo por *Urocystis occulta*;

enfermedades por *Ustilago*, producidas por ejemplo por *Ustilago nuda*;

- Enfermedades por podredumbre y moho de la fruta tales como:

30 enfermedades por *Aspergillus*, producidas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;

Enfermedades por *Botrytis*, producidas por ejemplo por *Botrytis cinerea*;

enfermedades por *Penicillium*, producidas por ejemplo por *Penicillium expansum*;

enfermedades por *Sclerotinia*, producidas por ejemplo por *Sclerotinia sclerotiorum*;

enfermedades por *Verticillium*, producidas por ejemplo por *Verticillium albo-atrum*;

35 • Enfermedades de semillas y putrefacción del suelo, mohos, marchitamiento, descomposición y encharcamiento tales como:

Enfermedades por *Fusarium*, producidas por ejemplo por *Fusarium culmorum*;

enfermedades por Phytophthora, producidas por ejemplo por *Phytophthora cactorum*;

enfermedades por Pythium, provocadas por ejemplo por *Pythium ultimum*;

enfermedades por Rhizoctonia, producidas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;

enfermedades por Sclerotium, producidas por ejemplo por *Sclerotium rolfsii*;

5 enfermedades por Microdochium, producidas por ejemplo por *Microdochium nivale*;

- Enfermedades por chancro, retama y puntiseco tales como:

enfermedades por Nectria, producidas por ejemplo por *Nectria galligena*;

- Enfermedades por tizón, tales como:

enfermedades por Monilinia, producidas por ejemplo por *Monilinia laxa*;

10 enfermedades por ampolla de la hoja o encrespamiento de la hoja, tales como:

Enfermedades por Taphrina, producidas por ejemplo por *Taphrina deformans*;

Enfermedades de deterioro de plantas madereras, tales como:

enfermedades por Esca, producidas por ejemplo por *Phaemoniella clamydospora*;

Acronecrosis por Eutypa, producida por ejemplo por *Eutypa lata*;

15 enfermedad de los olmos holandeses (Dutch elm), producida por ejemplo por *Ceratocystis ulmi*;

- Enfermedades de flores y semillas tales como:

Enfermedades por Botrytis, producidas por ejemplo por *Botrytis cinerea*;

- Enfermedades de tubérculos tales como:

enfermedades por Rhizoctonia, producidas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;

20 enfermedades por Helminthosporium, producidas por ejemplo por *Helminthosporium solani*.

La composición fungicida de acuerdo con la invención también se puede usar contra enfermedades micóticas que pueden desarrollarse sobre maderas o en el interior de las mismas. El término "madera" se refiere a todos los tipos de especies de madera, y a todos los tipos de trabajos de esta madera destinados a la construcción, por ejemplo, madera maciza, madera de alta densidad, madera laminada y contrachapado. El método para tratar la madera según la invención consiste principalmente en ponerla en contacto con uno o más compuestos según la invención, o con una composición según la invención; esto incluye, por ejemplo, aplicación directa, pulverización, inmersión, inyección o cualquier otro medio adecuado.

30 La dosis de compuesto activo aplicada normalmente en el método de tratamiento de acuerdo con la invención está general y ventajosamente entre 10 y 800 g/ha, preferiblemente, entre 50 y 300 g/ha para aplicaciones en tratamiento de las hojas. La dosis de sustancia activa aplicada es general y ventajosamente de 2 a 200 g por 100 kg de semillas, preferiblemente de 3 a 150 g por 100 kg de semillas en el caso del tratamiento de semillas.

Se entiende claramente que las dosis indicadas en la presente memoria se proporcionan como ejemplos ilustrativos del método de acuerdo con la invención. Un experto en la materia sabrá cómo adaptar la dosis de aplicación, en particular según la naturaleza de la planta o del cultivo a tratar.

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

40 Los compuestos o mezclas de acuerdo con la invención también se pueden utilizar para la preparación de una composición útil para tratar en forma terapéutica o preventiva enfermedades micóticas en seres humanos o animales tales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, tricofitosis y candidiasis o enfermedades provocadas por *Aspergillus* spp., por ejemplo *Aspergillus fumigatus*.

Varios aspectos de la invención se ilustrarán ahora con relación a las siguientes tablas de ejemplos de compuestos y la siguiente preparación o ejemplos de eficacia.

Las tablas siguientes ilustran de una forma no limitativa ejemplos de compuestos según la invención.

5 En los siguientes Ejemplos, M+H (o M-H) se refiere al pico molecular iónico, más o menos 1 u.m.a. (unidades de masa atómica) respectivamente, tal como se observa en espectroscopia de masas.

En la tabla siguiente, los valores log P se determinaron de acuerdo con la Directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Resolución) en una columna de fase inversa (C18), usando el método descrito a continuación:

10 Temperatura: 40°C; Fases móviles: Acetonitrilo y ácido fórmico acuoso al 0,1%; gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 90% de acetonitrilo.

La calibración se realizó usando alcan-2-onas sin ramificar (que comprenden de 3 a 16 átomos de carbono) con valores de log P conocidos (determinación de los valores de log P por los tiempos de retención usando interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

15 Los valores máx de lambda se determinaron en el máximo de las señales cromatográficas usando el espectro UV de 190 nm a 400 nm.

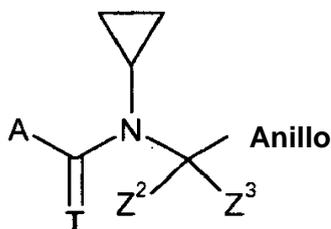
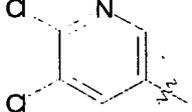
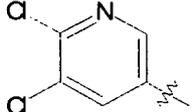
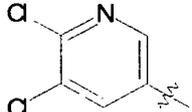
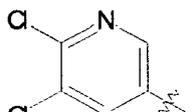
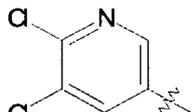
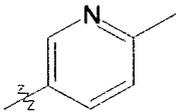
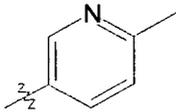
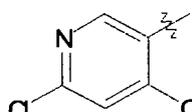
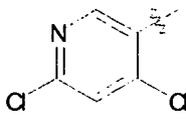
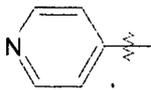
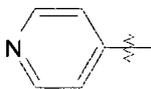
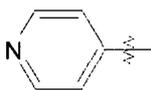
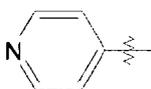
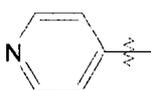
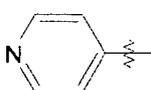
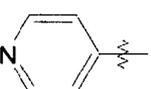
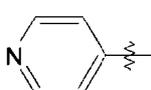
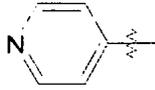
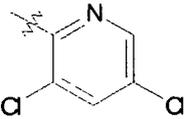
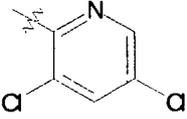
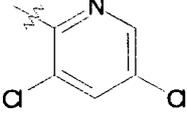
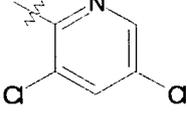
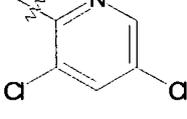
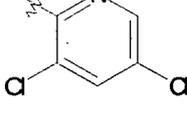
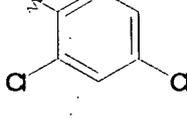


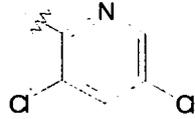
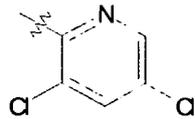
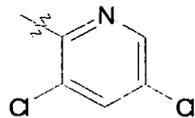
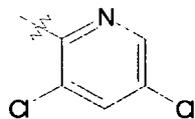
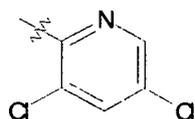
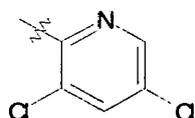
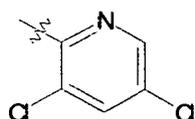
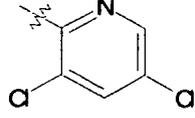
Tabla:

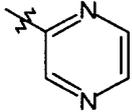
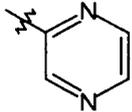
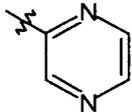
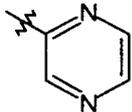
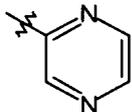
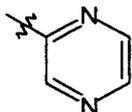
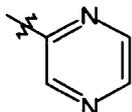
Ejemplo	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	Anillo	logP	M+H
1	A5	N-Me	CF ₃	-	H	O	Me	H		3,14	407

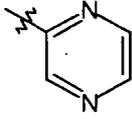
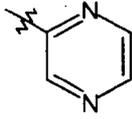
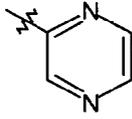
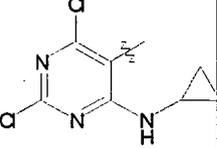
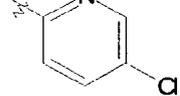
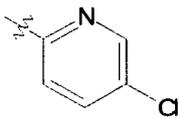
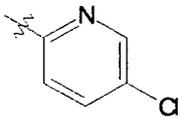
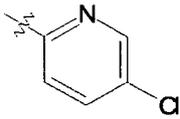
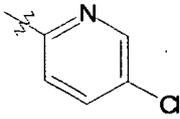
2	A1	N-Me	H	CF3	H	O	Me	H		3,34	406
3	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H		3,7	
4	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H		2,56	371
5	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H		2,67	389
6	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H		2,29	369
7	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		0,43	
8	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		0,52	321
9	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		2,28	357

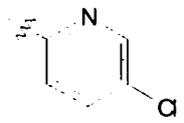
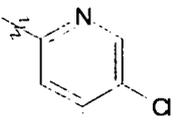
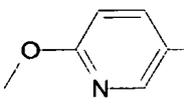
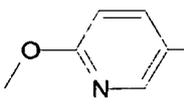
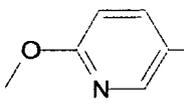
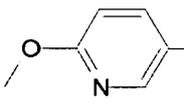
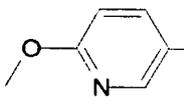
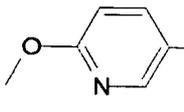
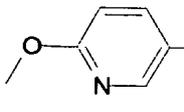
10	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		2,46	375
11	A5	N-Me	CF3	-	H	O	H	H		0,59	325
12	A1	S	I	H	H	O	H	H		1,1	385
13	A4	S	CF3	-	Me	O	H	H		0,93	342
14	A4	S	CHF2	-	Me	O	H	H		0,58	324
15	A8	N-Me	CF3	-	-	O	H	H		1,03	326
16	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H		0,99	324
17	A5	N-Me	Me	-	F	O	Et	H		0,92	317
18	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Et	H		1,79	

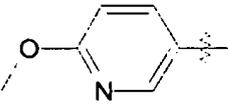
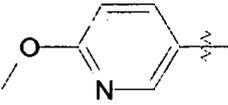
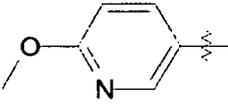
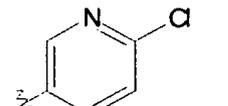
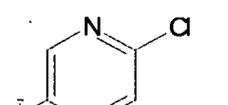
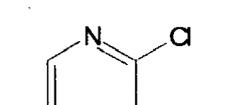
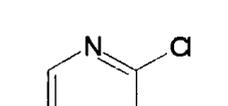
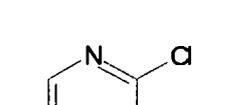
19	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			287
20	A4	S	CHF2	-	Me	O	Me	H		3,64	406
21	A5	N-Me	CF3	-	H	O	H	H		3,21	393
22	A5	N-Me	OEt	-	H	O	H	H		2,54	369
23	A4	S	CF3	-	Me	O	H	H		3,76	410
24	A4	S	CHF2	-	Me	O	H	H		3,42	392
25	A1	O	Me	H	H	O	H	H		3,22	325
26	A2	S	I	H	H	O	H	H		4,16	453

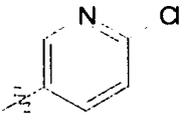
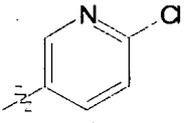
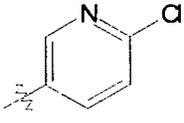
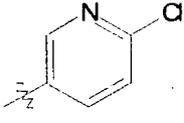
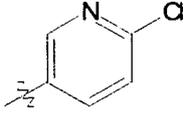
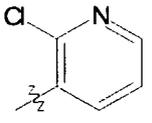
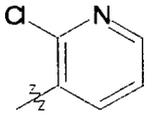
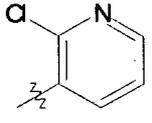
27	A5	N-Me	Me	-	H	O	Me	H		2,4	353
28	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H		2,77	371
29	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		2,56	357
30	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H		3,9	387
31	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H		3,01	389
32	A5	N-Me	CHF2	-	H	S	Me	H		4,01	405
33	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H		3,23	385
34	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		2,21	355

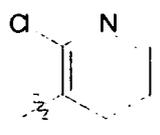
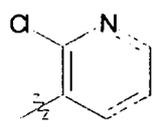
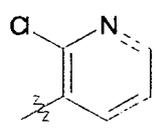
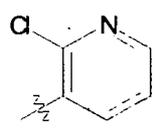
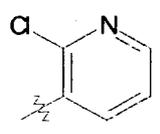
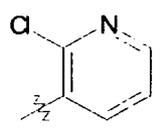
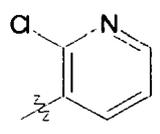
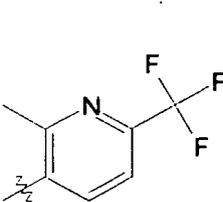
37	A1	S	I	H	H	O	Me	H		2,38	400
38	A2	O	H	H	H	O	Me	H		1,62	258
39	A3	O	Me	-	Me	O	Me	H		1,55	287
40	A5	N-Me	Me	-	H	O	Me	H		1,25	286
41	A2	O	Me	H	H	O	Me	H		2,04	272
42	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H		1,47	322
43	A5	N-Me	CHF2	-	H	S	Me	H		2,05	338

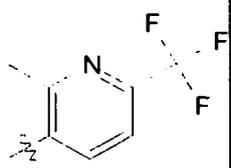
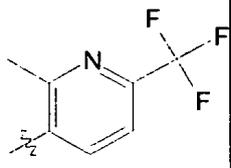
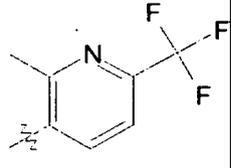
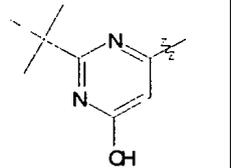
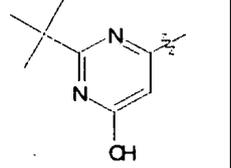
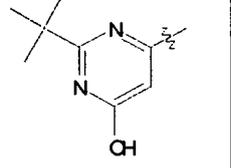
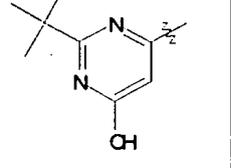
44	A4	O	Me	-	H	O	Me	H		1,37	273
45	A7	O	H	-	Me	O	Me	H		1,65	273
46	A7	N-Me	H	-	Me	O	Me	H		1,45	286
47	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		2,28	413
48	A5	N-Me	CF3	-	H	O	H	H		2,39	
49	A5	N-Me	OEt	-	H	O	H	H		1,98	
50	A1	O	CF3	H	Me	O	H	H		3,36	
51	A4	S	CF3	-	Me	O	H	H		2,93	
52	A4	S	CHF2	-	Me	O	H	H		2,54	

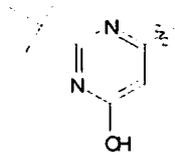
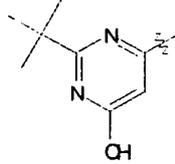
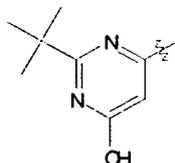
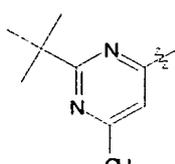
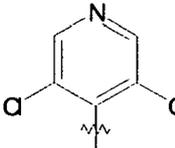
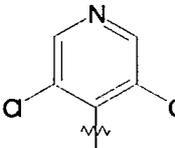
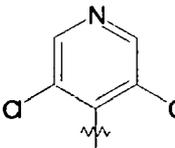
53	A2	S	I	H	H	O	H	H		3,17	
54	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		2,08	
55	A1	S	I	H	H	O	H	H		2,75	415
56	A2	O	H	H	H	O	H	H		1,97	273
57	A3	O	Me	-	Me	O	H	H		1,89	302
58	A5	N-Me	Me	-	H	O	H	H		1,53	301
59	A2	O	Me	H	H	O	H	H		2,46	287
60	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		1,64	319
61	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		1,8	337

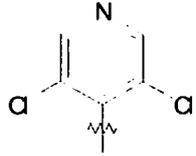
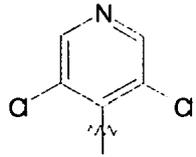
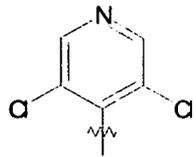
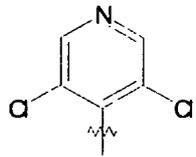
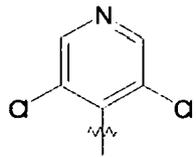
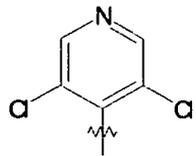
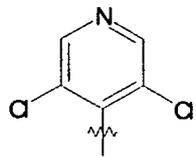
62	A4	O	Me	-	H	O	H	H		1,72	288
63	A7	O	H	-	Me	O	H	H		2,08	288
64	A7	N-Me	H	-	Me	O	H	H		1,74	301
65	A5	N-Me	CF3	-	H	O	H	H		2,02	359
66	A1	S	I	H	H	O	H	H		2,67	419
67	A4	S	CF3	-	Me	O	H	H		2,57	376
68	A4	S	CHF2	-	Me	O	H	H		2,18	358
69	A8	N-Me	CF3	-	-	O	H	H		2,62	360

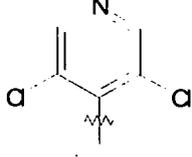
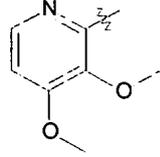
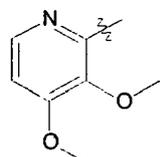
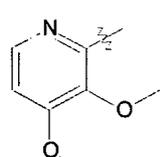
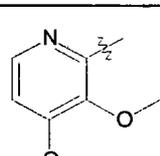
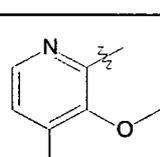
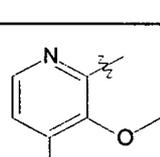
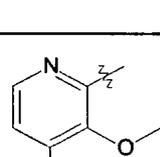
70	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H		2,45	358
71	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		1,85	323
72	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		1,97	341
73	A5	N-Me	CHF2	-	H	S	H	H		2,58	357
74	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		1,56	321
75	A1	S	I	H	H	O	Me	H		2,9	433
76	A2	O	H	H	H	O	Me	H		2,06	291
77	A3	O	Me	-	Me	O	Me	H		1,94	320

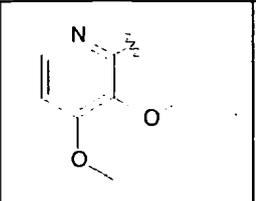
78	A5	N-Me	Me	-	H	O	Me	H		1,58	319
79	A2	O	Me	H	H	O	Me	H		2,52	305
80	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H		1,69	337
81	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H		1,88	355
82	A4	O	Me	-	H	O	Me	H		1,76	306
83	A7	O	H	-	Me	O	Me	H		2,07	306
84	A7	N-Me	H	-	Me	O	Me	H		1,78	319
85	A5	N-Me	CF3	-	H	O	H	H		2,82	407

86	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		2,32	371
87	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		2,51	389
88	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		2,02	369
89	A1	S	I	H	H	O	H	H		2,16	458
90	A4	S	CF3	-	Me	O	H	H		2,23	415
91	A4	S	CHF2	-	Me	O	H	H		1,94	397
92	A8	N-Me	CF3	-	-	O	H	H		2,3	399

93	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H		2,17	397
94	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		1,7	362
95	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		1,8	380
96	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		1,32	360
97	A1	S	I	H	H	O	H	H		3,21	453
98	A2	O	H	H	H	O	H	H		2,33	311
99	A3	O	Me	-	Me	O	H	H		2,18	340

100	A5	N-Me	Me	-	H	O	H	H		1,8	339
101	A2	O	Me	H	H	O	H	H		2,87	325
102	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		2,01	357
103	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		1,88	375
104	A5	N-Me	CHF2	-	H	S	H	H		2,93	391
105	A4	O	Me	-	H	O	H	H		2,04	326
106	A7	O	H	-	Me	O	H	H		2,4	326

107	A7	N-Me	H	-	Me	O	H	H		2	339
108	A5	N-Me	CF3	-	H	O	H	H		1,18	385
109	A1	S	I	H	H	O	H	H		1,47	445
110	A4	S	CHF2	-	Me	O	H	H		1,2	384
111	A8	N-Me	CF3	-	-	O	H	H		1,44	386
112	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H		1,32	384
113	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		1,65	349
114	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		1,05	367

115	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		0,56	347
-----	----	------	-----	---	---	---	---	---	--	------	-----

Los siguientes ejemplos ilustran de forma no limitante la preparación y eficacia de los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención.

Ejemplo 1 de preparación : N-ciclopropil-N-[(3,4-dimetoxipiridin-2-il)metil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (compuesto 113)

Etapa 1: preparación de N-[(3,4-dimetoxipiridin-2-il)metil] ciclopropilamina

Se añadieron 1,05 ml (14,9 mmoles) de ciclopropilamina a una disolución de 695 mg (2,66 mmoles) de hidrocloreto de 2-clorometil-3,4-dimetoxipiridinio en 4 ml de etanol y 4 ml de bicarbonato sódico acuoso saturado. La mezcla de reacción se agitó durante 1,5 h a 58°C y se extrajo con acetato de etilo (3 x 10 ml). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron al vacío. La cromatografía en columna (gradiente diclorometano/metanol) dio 263 mg (42% de rendimiento) de N-[(3,4-dimetoxipiridin-2-il)metil] ciclopropilamina.

Etapa 2: preparación de N-ciclopropil-N-[(3,4-dimetoxipiridin-2-il)metil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida

A temperatura ambiente una disolución de 0,14 g (0,8 mmoles) de cloruro de 5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carbonilo en 2 ml de diclorometano se añadió gota a gota a una disolución de 0,15 g (0,7 mmoles) de N-[(3,4-dimetoxipiridin-2-il)metil]ciclopropilamina y 0,3 ml de trietilamina en 4 ml de diclorometano. La mezcla de reacción se agitó durante 16 h a temperatura ambiente y se enfrió con agua. La capa acuosa se extrajo tres veces con diclorometano (3 x 10 ml), las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron al vacío. La cromatografía en columna (gradiente n-pentano/acetato de etilo) dio 0,23 mg (92% de rendimiento) de N-ciclopropil-N-[(3,4-dimetoxipiridin-2-il)metil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (M+H = 349).

Ejemplo 2 de Preparación: N-ciclopropil-N-[1-piridin-4-ilpropil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (compuesto 17)

Etapa 1: preparación de N-ciclopropil-1-piridin-4-il-propilamina

A una mezcla de 8 g de tamices moleculares y 8,4 g (148 mmoles) de ciclopropilamina en 100 ml de metanol a 0°C, se añadieron sucesivamente 11 ml de ácido acético y 10 g (74 mmoles) de 4-propionil-piridina. La mezcla de reacción se agitó durante 3 h a reflujo y se enfrió temperatura ambiente. Se añadió gota a gota una disolución de 6,9 g (185 mmoles) de cianoborohidruro sódico en 20 ml de metanol. La mezcla de reacción se agitó durante 3 h a reflujo y se enfrió temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró al vacío hasta la mitad de su volumen y se diluyó con 80 ml de diclorometano. Se añadió heptano de modo que precipitó un sólido. Se filtró el sólido. Se concentró el filtrado al vacío para dar 8,7g (66%) de N-ciclopropil-1-piridin-4-il-propilamina.

Etapa 2: preparación de N-ciclopropil-N-[1-piridin-4-il-propil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida

A temperatura ambiente una disolución de 0,16 g (0,93 mmoles) de cloruro de 5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carbonilo en 2 ml de diclorometano se añadió gota a gota a una disolución de 0,15 g (0,85 mmoles) de N-ciclopropil-1-piridin-4-il-propilamina y 0,14 ml de trietilamina en 5 ml de diclorometano. La mezcla de reacción se agitó durante 12 h a temperatura ambiente y a continuación a 40°C durante 8 h y se lavó con agua. Las capas orgánicas se filtraron sobre alúmina básica y se secaron. La cromatografía en columna (gradiente diclorometano/metanol) dio 0,18 mg (44% de rendimiento) de N-ciclopropil-N-[1-piridin-4-il-metil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida (M+H = 317).

Ejemplo 3 de preparación : tionación de la amida de fórmula (I) en el aparato Chemspeed

En un vial Chemspeed de 13 ml se pesan 0,27 mmoles pentasulfuro de fósforo (P₂S₅). Se añaden 3 ml de una disolución 0,18 molar de la amida (I) (0,54 mmoles) en dioxano y la mezcla se calienta a reflujo durante dos horas. La temperatura se enfría a continuación a 80°C y se añaden 2,5 ml de agua. La mezcla se calienta a 80°C durante una hora más. Se añaden a continuación 2 ml de agua y la mezcla de reacción se extrae dos veces con 4 ml de diclorometano. La fase orgánica se deposita sobre un cartucho de alúmina básica (2 g) y se eluye dos veces con 8 ml de diclorometano. Se eliminan los disolventes y la tioamida en bruto se analiza por LCMS y RMN. Los compuestos con pureza insuficiente se purifican más por LCMS de preparación.

Ejemplo A: Ensayo *in vivo* en *Sphaerotheca fuliginea* (polvo de mildiu)

Los ingredientes activos ensayados se prepararon por homogeneización en crisol en una mezcla de acetona/tween/DMSO/agua. Esta suspensión se diluye a continuación en agua para obtener la concentración deseada de material activo.

- 5 Plantas de pepinillo (variedad vert petit de Paris) en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y cultivadas a 20°C/23°C, se tratan en el estadio de cotiledón Z11 pulverizando con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las plantas, utilizadas como referencias, se tratan con una disolución acuosa que no contiene el material activo.

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

La clasificación (% de eficacia) se lleva a cabo 21 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de referencia.

- 15 En estas condiciones, se observa protección buena (al menos del 70%) o total con una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 4, 5, 9, 10, 20, 21, 24, 27, 29, 31, 31, 32, 33, 34, 51, 77, 80, 81, 100, 102, 103 y 114.

Ejemplo B : Ensayo *in vivo* sobre *Pyrenophora teres* (manchas reticulares de la cebada)

Se prepararon los ingredientes activos ensayados por homogeneización en una mezcla de acetona/Tween/DMSO/agua, después se diluyó con agua para obtener la concentración de material activo deseada.

- 20 Las plantas de cebada (variedad Express), sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y cultivadas a 12°C, se tratan en la etapa de 1 hoja (10 cm de altura), pulverizándolas con el ingrediente activo preparado como se describió anteriormente. Plantas, utilizadas como referencias, se tratan con la mezcla acetona/Tween/DMSO/agua que no contiene el material activo.

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

La clasificación se lleva a cabo 12 días después de la contaminación, comparando con las plantas de referencia. En estas condiciones, se observa protección buena (al menos del 70%) o total con una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 4, 5, 9, 10, 11, 17, 18, 19, 20, 21, 24, 27, 28, 31, 32, 33, 81 y 103.

- 30 **Ejemplo C : Ensayo *in vivo* sobre *Mycosphaerella graminicola* (mancha de las hojas del trigo)**

Se prepararon los ingredientes activos ensayados por homogeneización en una mezcla de acetona/Tween/DMSO/agua, después se diluyó con agua para obtener la concentración de material activo deseada.

- 35 Las plantas de trigo (variedad Scipion), en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 12°C, se tratan en la etapa de 1 hoja (10 cm de altura), pulverizándolas con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las plantas, utilizadas como referencias, se tratan con una disolución acuosa que no contiene el material activo.

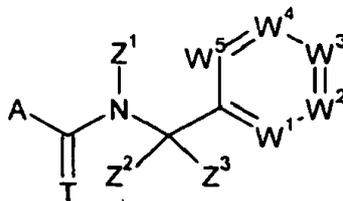
- 40 Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Mycosphaerella graminicola* (500.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de un cultivo de 7 días. Las plantas de trigo contaminadas se incuban durante 72 horas a aproximadamente 18°C y humedad relativa del 100% y a continuación durante de 21 a 28 días a humedad relativa del 90%.

La clasificación (% de eficacia) se lleva a cabo 21 a 28 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de referencia.

- 45 En estas condiciones, se observa protección buena (al menos del 70%) o total con una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 1, 4, 5, 9, 10, 11, 17, 18, 19, 20, 21, 24, 26, 28, 29, 31, 34, 42, 47, 48, 51, 52, 54, 61, 67, 74, 80, 81, 87, 96 y 102.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I)



(I)

en donde

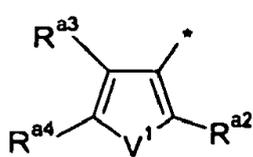
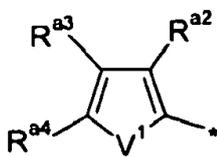
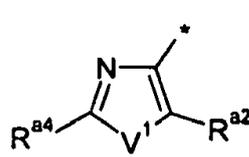
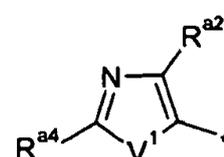
- 5
- A representa un grupo heterocíclico de 5 elementos insaturado, unido por carbo o parcialmente saturado, que puede estar sustituido por hasta cuatro grupos R^a;
 - T representa O;
 - Z¹ representa un cicloalquilo C³-C⁷ sin sustituir o un cicloalquilo C₃-C₇ sustituido por hasta 10 átomos o grupos que pueden ser iguales o diferentes y que pueden seleccionarse de la lista consistente en átomos de halógeno; ciano; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C₁-C₈); halogenoalcoxi(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C₁-C₈)-carbonilo; halogenoalcoxi(C₁-C₈) carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C₁-C₈)aminocarbonilo; di-(alquil-C₁-C₈)aminocarbonilo ;
 - 10
 - Z² y Z³ representan independientemente un átomo de hidrógeno ; un átomo de halógeno; alquilo(C₁-C₈); halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alqueno(C₂-C₈); alquino(C₂-C₈); ciano; nitro; alcoxi(C₁-C₈); alqueno(C₂-C₈); alquinox(C₂-C₈); cicloalquilo(C₃-C₇); alquil(C₁-C₈)sulfenilo; amino; alquil(C₁-C₈)-amino; di-(alquil C₁-C₈)aminocarbonilo ; alcoxi(C₁-C₈)-carbonilo; alquil(C₁-C₈)carbonilo; alquil(C₁-C₈)carbamoilo; di-(alquil-C₁-C₈)carbonilo ; N-alquil(C₁-C₈)-alcoxi(C₁-C₈)carbamoilo; o
 - 15
 - Z² y Z³ junto con el átomo de carbono al que están unidos pueden formar un cicloalquilo C₃-C₇ sustituido o sin sustituir;
 - 20
 - W¹ a W⁵ representan independientemente N o CR^b, representando al menos uno de W¹ a W⁵ N ;
 - 25
 - R^a representa independientemente un átomo de hidrógeno ; un átomo de halógeno; ciano; nitro; amino; sulfenilo; hidroxilo; pentafluoro-λ6-sulfenilo; alquil(C₁-C₈)amino; di-(alquil C₁-C₈)aminocarbonilo ; tri(alquil(C₁-C₈))sililo; tri(alquil(C₁-C₈))silil-alquilo(C₁-C₈); alquil(C₁-C₈)sulfenilo; halogenoalquil(C₁-C₈)-sulfenilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquilo(C₁-C₈); halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alqueno(C₂-C₈); halogenoalqueno(C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquino(C₂-C₈); halogenoalquino(C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C₁-C₈); alcoxi(C₁-C₈)-alquilo(C₁-C₈); alquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquinox(C₂-C₈); alquinox(C₂-C₈); cicloalquilo C₃-C₇; cicloalquilo(C₃-C₇)-alquilo(C₁-C₈); alquil(C₁-C₈)-sulfenilo; alquil(C₁-C₈)-sulfonilo ; alcoxi(C₁-C₈)imino; (alcoxi(C₁-C₈)-imino)-alquilo(C₁-C₈); alquilo(C₁-C₈)benciloxiimino; alquil(C₁-C₈)carbonilo; halogenoalquil(C₁-C₈)-carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C₁-C₈)-carbonilo; halogenoalcoxi(C₁-C₈) carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C₁-C₈)aminocarbonilo; di-(alquil C₁-C₈)aminocarbonilo ;
 - 30
 - 35
 - R^b representa independientemente un átomo de hidrógeno ; un átomo de halógeno; nitro; ciano; hidroxilo; sulfenilo ; amino; pentafluoro-λ6-sulfenilo ; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C₁-C₈)amino; di-(alquil-C₁-C₈)aminocarbonilo ; alcoxi(C₁-C₈); halogenoalcoxi(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C₁-C₈)-alquilo(C₁-C₈); alquil(C₁-C₈)-sulfenilo ; halogenoalquil(C₁-C₈)-sulfenilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C₁-C₈)-sulfenilo, halogenoalquil(C₁-C₈)-sulfenilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes, alquil(C₁-C₈)-sulfenilo, halogenoalquil (C₁-C₈)-sulfenilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes, alquil(C₁-C₈)-sulfonilo, halogenoalquil(C₁-C₈)-sulfonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alqueno(C₂-C₈); halogenoalqueno(C₂-C₈) que comprende hasta 9
 - 40
 - 45

átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquiniilo(C₂-C₈); halogenoalqueniloxi(C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alqueniloxi(C₂-C₈); halogenoalqueniloxi(C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquiniiloxi C₂-C₈; halogenoalquiniil (C₂-C₈)-oxi que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo C₃-C₇; cicloalquilo(C₃-C₇)-alquilo(C₁-C₈); halogenocicloalquilo(C₃-C₇) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; formilo; formiloxi; formilamino; carboxi; carbamoilo; N-hidroxicarbamoilo; carbamato; alquil(C₁-C₈)hidroxiimino; alquil(C₁-C₈)carbonilo; halogenoalquil(C₁-C₈)-carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; N-alquil(C₁-C₈)-alcoxi(C₁-C₈)carbamoilo; alcoxi(C₁-C₈)-carbonilo; halogenoalcoxi(C₁-C₈) carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C₁-C₈)aminocarbonilo; di-(alquil C₁-C₈)aminocarbonilo; alquil(C₁-C₈)carboniloxi; halogenoalquil(C₁-C₈)-carboniloxi que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C₁-C₈)carbonilamino; alquil(C₁-C₈)aminocarboniloxi; di-(alquil C₁-C₈)-aminocarboniloxi; alquil(C₁-C₈)-oxicarboniloxi; alcoxi(C₁-C₈)-imino; (alcoxi(C₁-C₈)-imino)-alquilo(C₁-C₈); (alquenil C₁-C₈-oxiimino)- alquil (C₁-C₈); (alquiniil-C₁-C₈-oxiimino)-alquilo(C₁-C₈); alquilo(C₁-C₈)benciloxiimino; tri(alquil(C₁-C₈))sililo; tri(alquil(C₁-C₈))silil-alquilo(C₁-C₈); fenilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; benciloxi que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilulfanilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilamino que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; fenilamino que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; fenilsulfanilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; piridinilo que puede estar sustituido por hasta cuatro grupos Q y piridiniloxi que puede estar sustituido por hasta cuatro grupos Q;

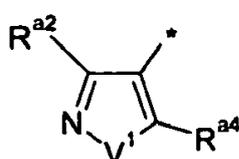
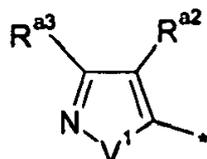
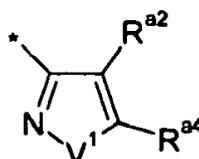
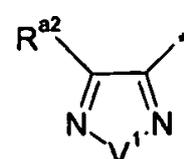
• Q, que puede ser igual o diferente, representa un átomo de halógeno; ciano; nitro; alquilo C₁-C₈; alcoxi(C₁-C₈); alquil(C₁-C₈)sulfanilo; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; halogenoalcoxi(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil tri(C₁-C₈)sililo y alquil tri(C₁-C₈) alquilo(C₁-C₈)sililo; alcoxi(C₁-C₈)-imino; (alcoxi(C₁-C₈)-imino)-alquilo(C₁-C₈);

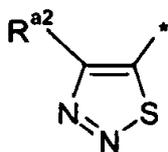
así como sales, N-óxidos e isómeros ópticamente activos o geométricos de los mismos; con la condición que R^b en W² a W⁵ no representa un halogenoalquilo(C₁-C₈) cuando W¹ representa N y que R^b en W¹ a W⁴ no represente un halogenoalquilo(C₁-C₈) cuando W⁵ representa N.

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que A se selecciona en la lista consistente en:

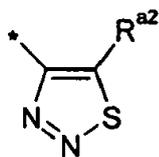
A¹A²A³A⁴

30

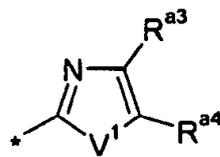
A⁵A⁶A⁷A⁸



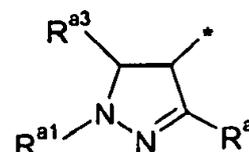
A⁹



A¹⁰



A¹¹



A¹²

en la que :

• -* representa el punto de unión al grupo carbonilo ;

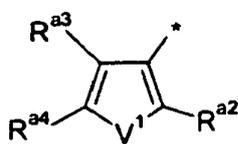
• V¹ representa O, S o NR^{a1} ;

5 • R^{a1} representa un átomo de hidrógeno; alquilo(C₁-C₈); halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C₁-C₈)-alquilo(C₁-C₈);

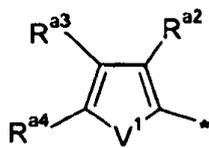
10 • R^{a2} y R^{a3}, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; ciano; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C₁-C₈) o halogenoalcoxi (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. cicloalquilo C₃-C₇;

15 • R^{a4} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno ; ciano; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C₁-C₈) o halogenoalcoxi(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Cicloalquilo(C₃-C₇); alquil(C₁-C₈)ulfanilo; amino; alquil(C₁-C₈)amino; di-(alquil-C₁-C₈)aminocarbonilo ; alquil(C₁-C₈)-oxicarbonilo.

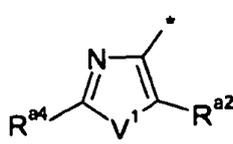
3. Un compuesto según la reivindicación 2, en el que A se selecciona en la lista consistente en:



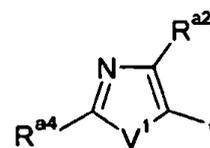
A¹



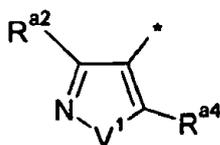
A²



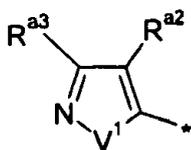
A³



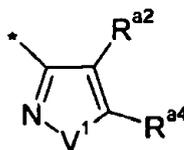
A⁴



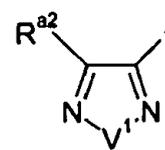
A⁵



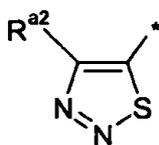
A⁶



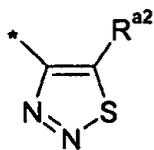
A⁷



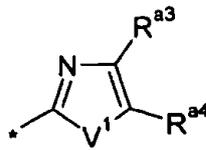
A⁸



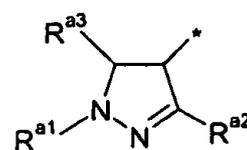
A⁹



A¹⁰



A¹¹



A¹²

20 en la que :

- -* representa el punto de unión al grupo carbonilo ;
 - V¹ representa O, S o NR^{a1} ;
 - R^{a1} representa un átomo de hidrogeno; alquilo(C₁-C₈); alcoxi (C₁ C₈)- alquilo(C₁-C₈) ;
 - R^{a2} representa alquilo (C₁-C₈) ; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C₁-C₈);
 - R^{a3} representa un átomo de hidrogeno; un átomo de halógeno; alquilo(C₁-C₈);
 - R^{a4} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno ; alquilo(C₁-C₈); halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;
- 5
4. Una composición según las reivindicaciones 2 ó 3, en la que:
- A representa A⁵;
 - V¹ representa NR^{a1};
 - R^{a1} representa alquilo(C₁-C₈);
 - R^{a2} y R^{a3}, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo(C₁-C₈); halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;
- 10
5. Un compuesto según las reivindicaciones 2 ó 3, en el que
- A representa A⁴;
 - V¹ representa S;
 - R^{a2} representa un alquilo(C₁-C₈) ; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;
 - R^{a4} representa un átomo de hidrógeno; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;
- 15
6. (eliminado).
7. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 6, en el que Z¹ representa ciclopropilo.
- 25
8. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 7, en el que Z² y Z³ representan independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo(C₁-C₈).
9. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 8, en el que
- W¹ representa N ;
 - W² a W⁵ independientemente representan CR^b ;
 - R^b representa independientemente un átomo de hidrógeno ; un átomo de halógeno; alquilo(C₁-C₈); alcoxi(C₁-C₈); halogenoalcoxi (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;
- 30
10. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 9, en el que
- W² representa N ;
 - W¹ y W³ a W⁵ representan independientemente CR^b ;
 - R^b representa independientemente un átomo de hidrógeno ; un átomo de halógeno; alquilo(C₁-C₈); halogenoalquilo C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi(C₁-C₈); halogenoalcoxi(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;
- 35
- 40
11. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 9, en el que
- W³ representa N ;
 - W¹ y W², W⁴ y W⁵ representan independientemente CR^b ;

• R^b representa independientemente un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo(C₁-C₈); halogenoalquilo (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes, alcoxi (C₁-C₈); halogenoalcoxi (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

5 12. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 11, en el que Q representa un átomo de halógeno; alquilo(C₁-C₈); alcoxi(C₁-C₈); halogenoalquilo(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; halogenoalcoxi(C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

10 13. Una composición fungicida que comprende, como ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 12 y un soporte, vehículo o carga aceptable desde un punto de vista agrícola.

15 14. Un método para controlar los hongos fitopatógenos de los cultivos, caracterizado porque se aplica una cantidad eficaz en el sector agronómico y sustancialmente no fitotóxica de un compuesto según las reivindicaciones 1 a 12 o de una composición según la reivindicación 13 en el suelo en el que crecen o pueden crecer las plantas, en las hojas y/o en los frutos o en las semillas de las plantas.