

19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 371 136**

51 Int. Cl.:  
**C07D 401/04** (2006.01)  
**C07D 401/14** (2006.01)  
**C07D 409/04** (2006.01)  
**C07D 409/14** (2006.01)  
**A01N 43/50** (2006.01)  
**A61K 31/4439** (2006.01)  
**A61P 35/00** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **08842112 .8**  
96 Fecha de presentación: **24.10.2008**  
97 Número de publicación de la solicitud: **2201001**  
97 Fecha de publicación de la solicitud: **30.06.2010**

54 Título: **DERIVADOS NOVEDOSOS DE IMIDAZOL.**

30 Prioridad:  
**26.10.2007 EP 07020978**  
**17.12.2007 EP 07024448**  
**10.04.2008 EP 08007093**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**27.12.2011**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**27.12.2011**

73 Titular/es:  
**SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**  
**SCHWARZWALDALLEE 215**  
**4058 BASEL, CH**

72 Inventor/es:  
**DUMEUNIER, Raphael;**  
**LAMBERTH, Clemens;**  
**TRAH, Stephan y**  
**WENDEBORN, Sebastian, Volker**

74 Agente: **Carpintero López, Mario**

ES 2 371 136 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 novedosos de imidazol

La presente invención se refiere a derivados novedosos de imidazol como ingredientes activos que tienen actividad microbicida, en particular actividad fungicida. La invención también se refiere a la preparación de estos ingredientes activos, a derivados heterocíclicos novedosos utilizados como intermedios en la preparación de estos ingredientes activos, a la preparación de estos intermedios novedosos, a composiciones agroquímicas que comprenden al menos uno de los ingredientes activos novedosos, a la preparación de estas composiciones y al uso de los ingredientes activos o composiciones en el campo de la agricultura u horticultura para controlar o prevenir la infestación de plantas, cultivos alimenticios cosechados, semillas o materiales no vivientes por microorganismos fitopatógenos, preferentemente hongos.

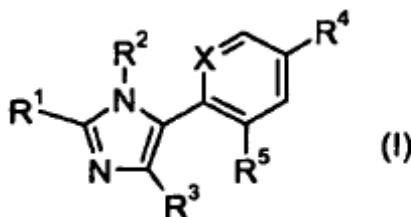
El documento US2002022728 se refiere a nitrofenil-sulfonil-imidazoles para controlar plagas vegetales y animales. WO2004052280 se refiere a compuestos que inhiben la angiogénesis y que son útiles en el tratamiento de enfermedades angiogénico-dependientes como el cáncer.

Además, la presente invención también se refiere al uso de estos derivados novedosos de imidazol como reguladores del crecimiento de las plantas (PGR).

Además, la presente invención también se refiere a composiciones que comprenden los derivados novedosos de imidazol que mejoran las plantas, un proceso que comúnmente y en adelante se denomina "salud de plantas".

La presente invención además se refiere a composiciones fungicidas que comprenden al menos uno de estos compuestos como componente activo.

Estos objetivos se logran por el siguiente compuesto de la fórmula I:



en la que

R<sup>1</sup> es halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sup>2</sup> es un arilo o heteroarilo opcionalmente sustituido;

25 R<sup>3</sup> es halógeno;

R<sup>4</sup> es hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, hidroxilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, OR<sup>6</sup>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o ciano;

R<sup>5</sup> es halógeno;

R<sup>6</sup> es hidrógeno, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, alquilcicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquiloxialquilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

30 X es N o C(R); y

R es hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o ciano; o una de sus formas de sal agroquímicamente utilizable;

a condición de que

cuando X sea C(R), R<sup>2</sup> no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido.

35 En la definición anterior arilo incluye anillos hidrocarburos aromáticos como fenilo, naftilo, antraceno, fenantreno y bifenilo, prefiriéndose fenilo.

40 Heteroarilo significa sistemas anulares aromáticos que comprenden sistemas mono, bi o tricíclicos donde al menos un átomo de oxígeno, nitrógeno o azufre está presente como un miembro anular. Los ejemplos son furilo, tienilo, pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, triazolilo, tetrazolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo, indolilo, benzotiofenilo, benzofuranilo, bencimidazolilo, indazolilo,

benzotriazolilo, benzotiazolilo, benzoxazolilo, quinolilo, isoquinolilo, ftalazinilo, quinoxalinilo, quinazolinilo, cinolinilo y naftiridinilo.

5 El anillo fundido, anillo carbocíclico, anillo heterocíclico, grupo arilo y grupo heteroarilo mencionado con anterioridad o a continuación, puede estar opcionalmente sustituido. Esto significa que pueden portar uno o más sustituyentes idénticos o diferentes. Normalmente, no están presentes más que tres sustituyentes al mismo tiempo. Son ejemplos de sustituyentes: halógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquenilo, haloalquenilo, cicloalquenilo, alquinilo, haloalquinilo, alquiloxi, haloalquiloxi, cicloalcoxi, alqueniloxi, haloalqueniloxi, alquiniloxi, haloalqueniloxi, alquiltio, haloalquiltio, cicloalquiltio, alqueniltio, alquiniltio, alquilcarbonilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, alquencilcarbonilo, alquinilcarbonilo, alcoxialquilo, ciano, nitro, hidroxilo, mercapto, amino, alquilamino, dialquilamino. Los ejemplos típicos para arilo opcionalmente sustituido incluyen 2-fluorofenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 2-clorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 3-bromofenilo, 4-bromofenilo, m-tolilo, p-tolilo, 3-trifluorometilfenilo, 4-trifluorometilfenilo, 3-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 3-trifluorometoxifenilo, 4-trifluorometoxifenilo, 3-cianofenilo, 4-cianofenilo, 2,4-difluorofenilo, 2,5-difluorofenilo, 2,6-difluorofenilo, 3,4-difluorofenilo, 2,4-diclorofenilo, 2,5-diclorofenilo, 2,6-diclorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 3,4-dimetilfenilo, 3,4-dimetoxifenilo, 2-cloro-4-fluorofenilo, 2-cloro-5-fluorofenilo, 2-cloro-6-fluorofenilo, 3-cloro-4-fluorofenilo, 3-cloro-6-fluorofenilo, 3-cloro-4-metilfenilo, 3-cloro-4-metoxifenilo, 4-cloro-2-fluorofenilo, 4-cloro-3-fluorofenilo, 4-cloro-3-metilfenilo, 4-cloro-3-metoxifenilo, 3-fluoro-4-metoxifenilo, 3-fluoro-4-metilfenilo, 4-fluoro-3-metoxifenilo, 4-fluoro-3-metilfenilo, 3-metoxi-4-metilfenilo, 4-metoxi-3-metilfenilo, 2,6-difluoro-4-metilfenilo, 2,6-difluoro-4-trifluorometilfenilo, 2,6-difluoro-4-metoxifenilo, 2,6-difluoro-4-trifluorometoxifenilo, 2,6-difluoro-4-cianofenilo, 2,4,6-trifluorofenilo, 2,5,6-trifluorofenilo. Los ejemplos típicos para heteroarilo opcionalmente sustituido incluyen 6-cloropiridin-2-ilo, 6-fluoropiridin-2-ilo, 6-metoxipiridin-2-ilo, 6-metilpiridin-2-ilo, 6-cloropiridin-3-ilo, 6-fluoropiridin-3-ilo, 6-metoxipiridin-3-ilo, 6-metilpiridin-3-ilo, 2-cloropiridin-4-ilo, 2-fluoropiridin-4-ilo, 2-metoxipiridin-4-ilo, 2-metilpiridin-4-ilo, 3,5-dicloropiridin-2-ilo, 3,5-difluoropiridin-2-ilo, 3-cloro-5-fluoropiridin-2-ilo, 3-cloro-5-metilpiridin-2-ilo, 3-cloro-5-trifluorometilpiridin-2-ilo, 3-cloro-5-metoxipiridin-2-ilo, 3-cloro-5-trifluorometoxipiridin-2-ilo, 3-cloro-5-cianopiridin-2-ilo, 5-cloro-3-fluoropiridin-2-ilo, 3-fluoro-5-metilpiridin-2-ilo, 3-fluoro-5-trifluorometilpiridin-2-ilo, 3-fluoro-5-metoxipiridin-2-ilo, 3-fluoro-5-trifluorometoxipiridin-2-ilo, 3-fluoro-5-cianopiridin-2-ilo, 5-clorotiofen-2-ilo, 5-bromotiofen-2-ilo, 5-metoxitiofen-2-ilo, 4-metoxiquinolin-2-ilo, 4-metilquinolin-2-ilo.

En la definición anterior halógeno es fluoro, cloro, bromo o yodo.

Los radicales alquilo, alquenilo o alquinilo pueden ser de cadena lineal o ramificada.

30 Alquilo en sí mismo o como parte de otro sustituyente es, dependiendo del número de átomos de carbono mencionados, por ejemplo, metilo, etilo, propilo, butilo, pentilo, hexilo y sus isómeros, por ejemplo, isopropilo, isobutilo, sec-butilo, terc-butilo, isopentilo o terc-pentilo.

Un grupo haloalquilo puede contener uno o más átomos de halógeno idénticos o diferentes y, por ejemplo, puede significar  $\text{CH}_2\text{Cl}$ ,  $\text{CHCl}_2$ ,  $\text{CCl}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{F}$ ,  $\text{CHF}_2$ ,  $\text{CF}_3$ ,  $\text{CF}_3\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_3\text{CF}_2$ ,  $\text{CF}_3\text{CF}_2$  o  $\text{CCl}_3\text{CCL}_2$ .

35 Cicloalquilo en sí mismo o como parte de otro sustituyente es, dependiendo del número de átomos de carbono mencionados, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

Alquenilo en sí mismo o como parte de otro sustituyente es, dependiendo del número de átomos de carbono mencionados, por ejemplo, etenilo, alilo, 1-propenilo, buten-2-ilo, buten-3-ilo, penten-1-ilo, penten-3-ilo, hexen-1-ilo o 4-metil-3-pentenilo.

40 Alquinilo en sí mismo o como parte de otro sustituyente es, dependiendo del número de átomos de carbono mencionados, por ejemplo, etinilo, propin-1-ilo, propin-2-ilo, butin-1-ilo, butin-2-ilo, 1-metilo-2-butinilo, hexin-1-ilo o 1-etil-2-butinilo.

45 La presencia de uno o más átomos de carbono asimétricos posibles en un compuesto de la fórmula I significa que los compuestos pueden aparecer en formas ópticamente isoméricas, es decir, formas enantioméricas o diastereoméricas. Como un resultado de la presencia de un posible enlace doble  $\text{C}=\text{C}$  alifático, también puede ocurrir isomerismo geométrico, es decir, cis-trans o isomerismo (E)-(Z). Asimismo, pueden aparecer atropisómeros como un resultado de la rotación restringida alrededor de un enlace simple. Se pretende que la fórmula I incluya todas aquellas formas isoméricas posibles y sus mezclas. Con la presente invención pretende incluir todas aquellas formas isoméricas posibles y sus mezclas para un compuesto de la fórmula I.

50 En cada caso, los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención están en forma libre o en un forma de sal agroquímicamente utilizable.

En una primera realización, los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención tienen  $\text{R}^1$  que es halógeno, alquilo  $\text{C}_1\text{-C}_3$  o haloalquilo  $\text{C}_1\text{-C}_3$ .

En una segunda realización, los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención tienen  $\text{R}^2$  que es un fenilo, naftilo, tienilo, piridilo, quinolilo o isoquinolilo opcionalmente sustituido.

En una tercera realización, los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención tienen R<sup>3</sup> que es fluoro, cloro, bromo o yodo.

En una cuarta realización, los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención tienen R<sup>4</sup> que es hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, OR<sup>6</sup>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o ciano.

5 En una quinta realización, los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención tienen R<sup>5</sup> que es fluoro, cloro, bromo o yodo.

En una sexta realización, los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención tienen R<sup>6</sup> que es hidrógeno, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, alquilcicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalqueno C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, o alquinoxialquilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>.

10 En una séptima realización, los compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención tienen X que es N, C(H), C (halógeno), C(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), C(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), C(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o C(haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>).

Los subgrupos preferidos de compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención son aquellos en los que

R<sup>1</sup> es fluoro, cloro, bromo, yodo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

R<sup>2</sup> es un fenilo, naftilo, tienilo, piridilo o quinolilo opcionalmente sustituido; R<sup>3</sup> es fluoro, cloro o bromo;

15 R<sup>4</sup> es hidrógeno, fluoro, cloro, bromo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> o ciano;

R<sup>5</sup> es fluoro, cloro o bromo; y

X es N, C(H), C(Cl), C(F), C(Br), C(I), C(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), C(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), C(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) o C(haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>).

Los subgrupos más preferidos de compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención son aquellos en los que

R<sup>1</sup> es fluoro, cloro, bromo, metilo o etilo;

20 R<sup>2</sup> es fenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 3-bromofenilo, 4-bromofenilo, m-tolilo, p-tolilo, 3-trifluorometilfenilo, 4-trifluorometilfenilo, 3-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 3-trifluorometoxifenilo, 4-trifluorometoxifenilo, 3-cianofenilo, 4-cianofenilo, 3,4-difluorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 3,4-dimetilfenilo, 3,4-dimetoxifenilo, 3-cloro-4-fluorofenilo, 3-cloro-4-metilfenilo, 3-cloro-4-metoxifenilo, 4-cloro-3-fluorofenilo, 4-cloro-3-metilfenilo, 4-cloro-3-metoxifenilo, naft-2-ilo, 3-fluoro-4-metoxifenilo, 3-fluoro-4-metilfenilo, 4-fluoro-3-metoxifenilo, 4-fluoro-3-metilfenilo, 3-metoxi-4-metilfenilo, 4-metoxi-3-metilfenilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, 6-cloropiridin-2-ilo, 6-fluoropiridin-2-ilo, 6-metoxipiridin-2-ilo, 6-metilpiridin-2-ilo, 6-cloropiridin-3-ilo, 6-fluoropiridin-3-ilo, 6-metoxipiridin-3-ilo, 6-metilpiridin-3-ilo, 2-cloropiridin-4-ilo, 2-fluoropiridin-4-ilo, 2-metoxipiridin-4-ilo, 2-metilpiridin-4-ilo, 5-clorotiofen-2-ilo, 5-bromotiofen-2-ilo, 5-metoxitiofen-2-ilo, quinolin-2-ilo, quinolin-3-ilo, 4-metoxiquinolin-2-ilo o 4-metilquinolin-2-ilo;

R<sup>3</sup> es fluoro o cloro;

30 R<sup>4</sup> es hidrógeno, fluoro, cloro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o ciano;

R<sup>5</sup> es fluoro o cloro; y

X es N, C(H), C(Cl), C(F), C(Br), C(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>), C(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>), C(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>) o C(haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>).

Los subgrupos de máxima preferencia de compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención son aquellos en los que

35 R<sup>1</sup> es fluoro, cloro, metilo o etilo;

R<sup>2</sup> es 4-fluorofenilo, 4-clorofenilo, 4-bromofenilo, p-tolilo, 6-cloropiridin-3-ilo, 6-fluoropiridin-3-ilo, 6-metoxipiridin-3-ilo, 6-metilpiridin-3-ilo, 2-cloropiridin-4-ilo, 2-fluoropiridin-4-ilo, 2-metoxipiridin-4-ilo, 2-metilpiridin-4-ilo, quinolin-2-ilo, quinolin-3-ilo, 4-metoxiquinolin-2-ilo o 4-metilquinolin-2-ilo;

R<sup>3</sup> es fluoro o cloro;

40 R<sup>4</sup> es hidrógeno, fluoro, cloro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

R<sup>5</sup> es fluoro o cloro; y

X es N, C(H), C(Cl) o C(F).

Los subgrupos especialmente preferidos de compuestos de la fórmula I de acuerdo con la invención son aquellos en los que

45 R<sup>1</sup> es cloro o metilo;

R<sup>2</sup> es 6-cloropiridin-3-ilo, 6-metilpiridin-3-ilo, 6-metoxipiridin-3-ilo o quinolin-3-ilo;

R<sup>3</sup> es cloro;

R<sup>4</sup> es fluoro o metoxi;

R<sup>5</sup> es fluoro; y

5 X es C(F).

Son compuestos individuales preferidos:

2-cloro-5-[2,4-dicloro-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina;

2-cloro-5-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina;

5-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-2-metoxi-piridina;

10 2-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-quinolina;

2-[4cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-4-metoxi-quinolina;

3-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-quinolina;

3-[2,4-dicloro-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-quinolina;

3-[2,4-dicloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-imidazol-1-il]-quinolina;

15 2-[4-cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazol-1-il]-4-metoxi-quinolina;

3-[4-cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazol-1-il]-quinolina;

2-cloro-5-[4-cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazol-1-il]piridina;

2-cloro-5-[2,4-dicloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-imidazol-1-il]-piridina;

5-[4-cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazo1-il]-2-metoxi-piridina;

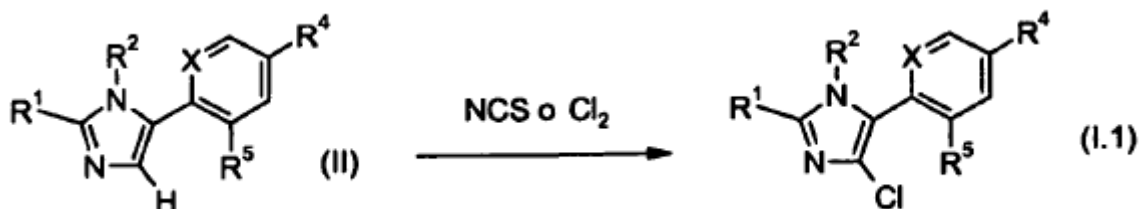
20 5-[4-cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazol-1-il]-2-metil-piridina;

3,5-dicloro-2-[5-cloro-3-(6-cloro-piridin-3-il)-2-metil-3H-imidazol-4-il]-piridina; y

2-[4-cloro-5-(3,5-dicloro-piridin-2-il)-2-metil-imidazol-1-il]-quinolina.

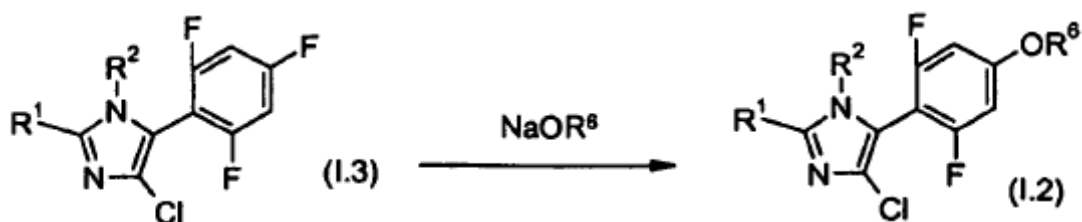
Los compuestos de la fórmula I.1, en los que R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup> y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R), R<sup>2</sup> no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, y R<sup>1</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, pueden obtenerse por la reacción de un compuesto de la fórmula II, en el que R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R), R<sup>2</sup> no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, y R<sup>1</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, con N-clorosuccinimida o cloro molecular.

25



Los compuestos de la fórmula 1.2, en los que R<sup>2</sup> y R<sup>6</sup> son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que R<sup>2</sup> no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, y R<sup>1</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, pueden obtenerse por la reacción de un compuesto de la fórmula I.3, en el que R<sup>2</sup> es lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que R<sup>2</sup> no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, y R<sup>1</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, con un reactivo de la fórmula NaOR<sup>6</sup>, en el que R<sup>6</sup> es lo definido para el compuesto de la fórmula I.

30

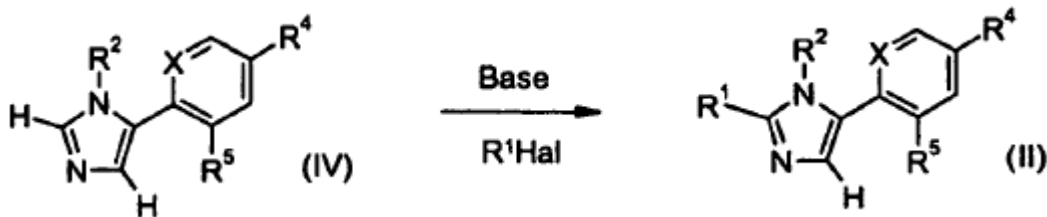


5 Los compuestos de la fórmula II, en los que  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R),  $R^2$  no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, y  $R^1$  es alquilo  $C_1$ - $C_4$ , puede obtenerse por la transformación de un compuesto de la fórmula III, en el que  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R),  $R^2$  no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, con un reactivo de la fórmula  $(R^1)_3Al$ , en el que  $R^1$  es alquilo  $C_1$ - $C_4$ , preferentemente metilo, en presencia de un catalizador de metal de transición.



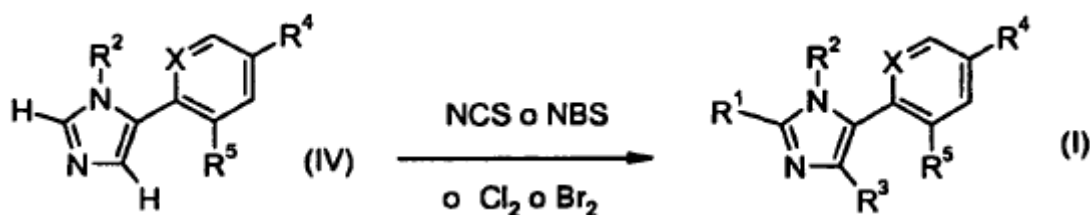
10

15 Los compuestos de la fórmula II, en los que  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R),  $R^2$  no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, y  $R^1$  es alquilo  $C_1$ - $C_4$  o haloalquilo  $C_1$ - $C_4$ , pueden alternativamente obtenerse por la transformación de un compuesto de la fórmula IV, en el que  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R),  $R^2$  no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, con una base fuerte, por ej., diisopropilamido de litio, seguido por un reactivo de la fórmula  $R^1Hal$ , en el que  $R^1$  es alquilo  $C_1$ - $C_4$  o haloalquilo  $C_1$ - $C_4$ , y Hal es halógeno, preferentemente bromo o yodo.



20

Los compuestos de la fórmula I, en los que  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R),  $R^2$  no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, y  $R^1$  es halógeno, preferentemente cloro o bromo, pueden obtenerse por la reacción de un compuesto de la fórmula IV, en el que  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R),  $R^2$  no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, con al menos 2 equivalentes de N-clorosuccinimida, N-bromosuccinimida, cloro o bromo molecular.



25

Los compuestos de la fórmula III, en los que  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R),  $R^2$  no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, puede obtenerse por la transformación

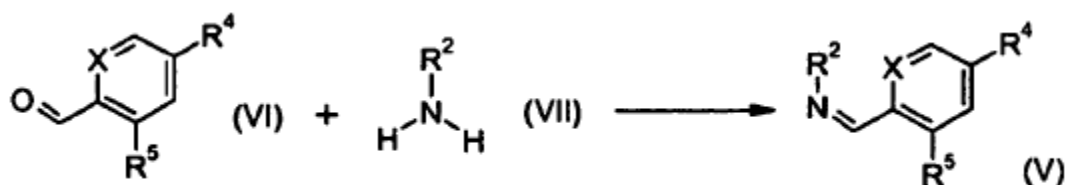
de un compuesto de la fórmula IV, en el que  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R),  $R^2$  no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, con N-bromosuccinimida.



5 Los compuestos de la fórmula IV, en los que  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R),  $R^2$  no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, pueden obtenerse por la reacción de un compuesto de la fórmula V, en el que  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R),  $R^2$  no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, con isocianuro de toluensulfonilmetilo en presencia de una base, por ej., carbonato de potasio anhidro, de acuerdo con lo ya descrito en Journal of Medicinal Chemistry 2003,46,3463.



15 Los compuestos de la fórmula V, en los que  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$  y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R),  $R^2$  no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido, pueden obtenerse por la reacción de un aldehído de la fórmula VI, en el que  $R^4$ ,  $R^5$  y X son lo definido para el compuesto de la fórmula I, con una amina de la fórmula VII, en la que  $R^2$  es lo definido para el compuesto de la fórmula I, a condición de que cuando X sea C(R) en el compuesto de la fórmula VI,  $R^2$  no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido en el compuesto de la fórmula VII, de acuerdo con lo ya descrito en Journal of Medicinal Chemistry 2003, 46, 3463.



20 Sorprendentemente, ahora se ha descubierto que los compuestos novedosos de la fórmula I tienen, por propósitos prácticos, un nivel muy ventajoso de actividad biológica para proteger plantas contra enfermedades que son causadas por hongos así como por bacterias y virus.

25 Los compuestos de la fórmula I pueden utilizarse en el sector agrícola y campos de uso relacionados como ingredientes activos para controlar plagas de plantas o sobre materiales no vivientes para el control de microorganismos descomponedores u organismos potencialmente perjudiciales para el hombre. Los compuestos novedosos se distinguen por su excelente actividad a tasas bajas de aplicación, por ser bien tolerados por plantas y por ser ambientalmente seguros. Tienen propiedades curativas, preventivas y sistémicas muy útiles y se utilizan para proteger numerosas plantas cultivadas. Los compuestos de la fórmula I pueden utilizarse para inhibir o destruir las plagas que tienen por blanco plantas o partes de plantas (frutos, flores, hojas, tallos, tubérculos, raíces) de diferentes cultivos de plantas útiles, y al mismo tiempo para proteger también aquellas partes de las plantas que crecen después, por ej., de microorganismos fitopatógenos.

35 También es posible utilizar compuestos de la fórmula I como agentes de recubrimiento para el tratamiento de materiales de propagación de plantas, por ej., semillas, tales como frutos, tubérculos o granos, o esquejes de plantas (por ejemplo, arroz), para la protección contra infecciones fúngicas así como contra hongos fitopatógenos que aparecen en el suelo. El material de propagación puede tratarse con una composición que comprende un compuesto de la fórmula I antes de la plantación: una semilla, por ejemplo, puede recubrirse antes de ser plantada. Los ingredientes activos de acuerdo con la invención también pueden aplicarse a granos (revestimiento), ya sea por la impregnación de las semillas en una formulación líquida o por revestimiento con una formulación sólida. La composición también puede aplicarse al sitio de

5 plantación cuando el material de propagación está siendo plantado, por ejemplo, al surco de siembra durante la siembra. La invención también se refiere a tales procedimientos para tratar material de propagación y al material de propagación así tratado. Además, los compuestos de acuerdo con la presente invención pueden utilizarse para controlar hongos en áreas relacionadas, por ejemplo en la protección de materiales técnicos, que incluyen productos técnicos de madera y productos técnicos relacionados con madera, en el almacenamiento de alimentos, en el manejo de la higiene.

Además, la invención podría utilizarse para proteger materiales no vivientes de ataques fúngicos, por ej., maderas, paneles de yeso y pinturas.

10 Los compuestos de la fórmula I son, por ejemplo, efectivos contra los hongos fitopatogénos de las siguientes clases: Fungi imperfecti (por ej., *Alternaria* spp.), Basidiomicetos (por ej., *Corticium* spp., *Ceratobasidium* spp., *Waitea* spp., *Thanatephorus* spp., *Rhizoctonia* spp., *Hemileia* spp., *Puccinia* spp., *Phakopsora* spp., *Ustilago* spp., *Tilletia* spp.), Ascomicetos (por ej., *Venturia* spp., *Blumeria* spp., *Erysiphe* spp., *Podosphaera* spp., *Uncinula* spp., *Monilinia* spp., *Sclerotinia* spp., *Colletotrichum* spp., *Glomerella* spp., *Fusarium* spp., *Gibberella* spp., *Monographella* spp., *Phaeosphaeria* spp., *Mycosphaerella* spp., *Cercospora* spp., *Pyrenophora* spp., *Rhynchosporium* spp., *Magnaporthe* spp., *Gaeumannomyces* spp., *Oculimacula* spp., *Ramularia* spp., *Botryotinia* spp.) y Oomicetos (por ej., *Phytophthora* spp., *Pythium* spp., *Plasmopara* spp., *Peronospora* spp., *Pseudoperonospora* spp. *Bremia* spp). Se ha observado una actividad excepcional contra mildiús vellosos (por ej., *Uncinula necator*), royas (por ej., *Puccinia* spp.) y septoriosis (por ej., *Mycosphaerella* spp.). Además, los compuestos novedosos de la fórmula I son efectivos contra bacterias fitopatogénicas Gram negativas y Gram positivas (por ej., *Xanthomonas* spp, *Pseudomonas* spp, *Erwinia amylovora*, *Ralstonia* spp.) y virus (por ej., virus mosaico del tabaco).

20 Dentro del ámbito de la presente invención, las plantas útiles y/o cultivos objetivo a proteger típicamente comprenden las siguientes especies de plantas: cereales (trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz, sorgo y especies relacionadas); remolachas (remolacha azucarera y remolacha forrajera); pomáceas, drupas y frutos suaves (manzanas, peras, ciruelas, duraznos, almendras, cerezas, frutillas, frambuesa y moras); plantas leguminosas (habas, lentejas, guisantes, habas de soja); plantas oleosas (colza, mostaza, amapola, olivas, girasoles, coco, plantas de aceite de ricino, habas de cacao, cacahuates); plantas de pepino (calabazas, pepinos, melones); plantas de fibra (algodón, lino, cáñamo, yute);  
25 frutos cítricos (naranjas, limones, pomelos, mandarinas); vegetales (espinaca, lechuga, espárragos, coles, zanahorias, cebollas, tomates, patatas, paprika); lauraceas (aguacate, cinnamomum, alcanfor) o plantas tales como tabaco, nueces, cafe, berenjenas, cana de azucar, te, pimienta, vid, lupulo, bananas y plantas de caucho natural, ası como cesped y ornamentales.

30 Las plantas ıtiles y/o cultivos objetivo de acuerdo con la invención incluyen variedades convencionales ası como variedades geneticamente mejoradas o manipuladas tales como, por ejemplo, resistentes a insectos (por ej., variedades Bt. y VIP) ası como resistentes a enfermedades, tolerantes a herbicidas (por ej., variedades de maız resistentes a glifosato y glufosinato comercialmente disponibles bajo los nombres comerciales RoundupReady y LibertyLink) y variedades tolerantes a nematodos. A modo de ejemplo, las variedades de cultivos geneticamente mejorados o manipulados adecuados incluyen las variedades de algodon Stoneville 5599BR y las variedades de algodon Stoneville 4892BR.

40 Los terminos "plantas ıtiles" y/o "cultivos objetivo" deben comprenderse con la inclusion de, tambien, plantas ıtiles que se han tornado tolerantes a herbicidas como bromoxinilo o clases de herbicidas (tales como, por ejemplo, inhibidores de HPPD, inhibidores de ALS, por ejemplo primisulfuron, prosulfuron y trifloxisulfuron, inhibidores de EPSPS (5-enol-pirovilshikimato-3-fosfato-sintasa), inhibidores de GS (glutamina sintetasa) o inhibidores de PPO (protoporfirinogeno-oxidasa) como un resultado de procedimientos convencionales de cultivo o manipulacion genetica. Un ejemplo de un cultivo que se ha tornado tolerante a imidazolinonas, por ej., imazamox, por procedimientos convencionales de cultivo (mutagenesis) es la colza de verano Cleanfield (Canola). Los ejemplos de cultivos que se han tornado tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas por procedimientos de manipulacion genetica incluyen variedades de maız resistentes a glifosato y glufosinato comercialmente disponibles bajo los nombres comerciales RoundupReady, Herculex I y LibertyLink.

45 Los terminos "plantas ıtiles" y/o "cultivos objetivo" deben comprenderse con la inclusion de, tambien, plantas ıtiles que se han transformado por el uso de tecnicas de ADN recombinante de modo de ser capaces de sintetizar una o mas toxinas de accion selectiva, tales como son conocidas, por ejemplo, bacterias productoras de toxinas, especialmente aquellas del genero Bacillus.

50 Los terminos "plantas ıtiles" y/o "cultivos objetivo" deben comprenderse con la inclusion de, tambien, plantas ıtiles que se han transformado por el uso de tecnicas de ADN recombinante de modo de ser capaces de sintetizar sustancias antipatogenas que tienen un cation selectivo, tales como, por ejemplo, las denominadas "proteinas relacionadas con la patogenesis" (PRP, vease, por ej., el documento EP-A-0 392 225). Los ejemplos de tales sustancias antipatogenas y plantas transgenicas capaces de sintetizar tales sustancias antipatogenas son conocidas, por ejemplo, a partir de los documentos EP-A-0 392 225, WO 95/33818, y EP-A-0 353 191. Los procedimientos para producir tales plantas transgenicas son generalmente conocidos por aquellos con experiencia en la tecnica y se describen, por ejemplo, en las publicaciones mencionadas con anterioridad.



El término "locus" de una planta útil como se utiliza en la presente memoria pretende abarcar el lugar en el que se cultivan las plantas, en el que los materiales de propagación de plantas de las plantas útiles se siembran o en el que los materiales de propagación de plantas de las plantas útiles se colocarán en el suelo. Un ejemplo de un locus tal es un campo, en el que las plantas de cultivo se cultivan.

5 Se comprende que la expresión "material de propagación de plantas" denota partes generativas de la planta, tales como semillas, que pueden utilizarse para la multiplicación de las plantas, y material vegetativo, tal como esquejes o tubérculos, por ejemplo patatas. Pueden mencionarse, por ejemplo, semillas (en sentido estricto), raíces, frutos, tubérculos, bulbos, rizomas y partes de plantas. También pueden mencionarse plantas germinadas y plantas jóvenes que han de trasplantarse tras la germinación o tras la emergencia del suelo. Estas plantas jóvenes pueden protegerse antes de la trasplantación por un tratamiento total o parcial por inmersión. Preferentemente, se comprende que el "material de propagación de plantas" denota semillas.

10 Los compuestos de la fórmula I se utilizan en forma no modificada o, preferentemente, junto con los adyuvantes convencionalmente empleados en la técnica de formulación. Con este objetivo, los compuestos se formulan convenientemente en forma conocida en concentrados emulsionables, pastas revestibles, soluciones o suspensiones diluibles o directamente pulverizables, emulsiones diluidas, polvos humectables, polvos solubles, polvos, granulados, y también encapsulaciones, por ej., en sustancias poliméricas. Como en el caso del tipo de las composiciones, los procedimientos de aplicación, tales como pulverización, atomización, espolvoreo, dispersión, revestimiento o vertido, se seleccionan de acuerdo con los objetivos pretendidos y las circunstancias prevalentes. Las composiciones también pueden contener adyuvantes adicionales tales como estabilizadores, antiespumantes, reguladores de la viscosidad, aglutinantes o ligantes o adherentes así como fertilizantes, donantes de micronutrientes u otras formulaciones para obtener efectos especiales.

Los vehículos y adyuvantes útiles pueden ser sólidos o líquidos y son sustancias útiles en tecnologías de formulación, por ej., sustancias minerales naturales o regeneradas, disolventes, dispersantes, agentes humectantes, adherentes, espesantes, ligantes o fertilizantes. Tales vehículos se describen, por ejemplo, en el documento WO 97/33890.

25 Los compuestos de la fórmula I normalmente se utilizan en la forma de composiciones y pueden aplicarse al área de cultivo o a la planta a tratar, simultáneamente o en sucesión con compuestos adicionales. Estos compuestos adicionales pueden ser, por ej., fertilizantes o donantes de micronutrientes u otras preparaciones, que influyen el crecimiento de las plantas. También pueden ser herbicidas selectivos o herbicidas no selectivos así como insecticidas, fungicidas, bactericidas, nematocidas, moluscocidas o mezclas de varias de estas preparaciones, si se desea, en conjunto con vehículos, tensioactivos o adyuvantes promotores de la aplicación adicionales usualmente empleados en la técnica de formulación.

30 Los compuestos de la fórmula I normalmente se utilizan en la forma de composiciones fungicidas para controlar o proteger contra microorganismos fitopatógenos, que comprenden como ingrediente activo al menos un compuesto de la fórmula I o de al menos un compuesto individual preferido como los definidos con anterioridad, en forma libre o en una forma de sal agroquímicamente utilizable, y al menos uno de los adyuvantes mencionados con anterioridad.

35 Dichas composiciones fungicidas para controlar o proteger contra microorganismos fitopatógenos, que comprenden como ingrediente activo al menos un compuesto de la fórmula I o al menos un compuesto individual preferido como los definidos con anterioridad, en forma libre o en una forma de sal agroquímicamente utilizable, y al menos uno de los adyuvantes mencionados con anterioridad pueden mezclarse con otros fungicidas, para dar lugar en algunos casos a actividades sinérgicas inesperadas. Los componentes de mezclas particularmente preferidos son:

45 Azoles, tales como azaconazol, BAY 14120, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, difenoconazol, diniconazol, epoxiconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, hexaconazol, imazalilo, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, pefurazoato, penconazol, protioconazol, pirifenox, procloraz, propiconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, triflumizol, triticonazol;

Pirimidinil carbinoles, tales como ancimidol, fenarimol, nuarimol;

2-amino-pirimidinas, tales como bupirimato, dimetirimol, etirimol;

Morfolinas, tales como dodemorf, fenpropidina, fenpropimorf, espiroxamina, tridemorf;

Anilino-pirimidinas, tales como ciprodinilo, mepanipirim, pirimetanilo;

50 Pirroles, tales como fenciclonilo, fludioxonilo;

Fenilamidas, tales como benalaxilo, furalaxilo, metalaxilo, R-metalaxilo, ofurace, oxadixil;

Bencimidazoles, tales como benomilo, carbendazim, debacarb, fuberidazol, tiabendazol;

Dicarboximidazoles, tales como clozolinato, diclozolina, iprodiona, miclozolina, procimidona, vinclozolina;

Carboxamidas, tales como boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanilo, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tifulzamida;

Guanidinas, tales como guazatina, dodina, iminoctadina;

5

Estrobilurinas, tales como azoxistrobina, dimoxistrobina, enestroburina, fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominostrobin, trifloxistrobina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina;

Ditiocarbamatos, tales como ferbam, mancozeb, maneb, metiram, propineb, tiram, zineb, ziram;

N-halometiltiotetrahidroftalimidias, tales como captafol, captan, diclofluanida, fluoromidas, folpet, tolfluanida;

10

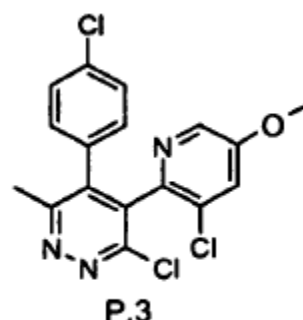
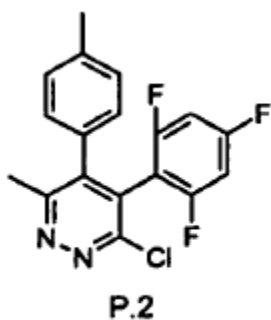
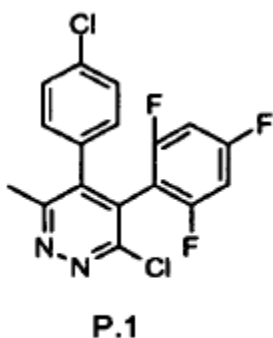
Compuestos de cobre, tales como mezcla Bordeaux, hidróxido de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido cuproso, mancozeb, oxina-cobre;

Derivados de nitrofenol, tales como dinocap, nitrotal-isopropilo;

Derivados de organofosforosos, tales como edifenfos, iprobenfos, isoprotilano, fosdifen, pirazofos, tolclofos-metilo;

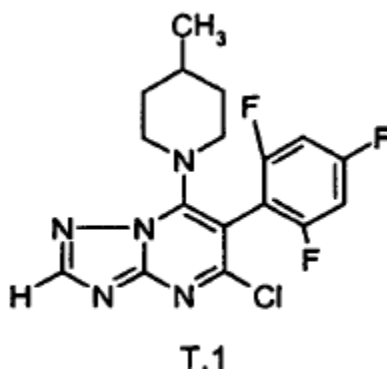
15

Derivados de piridazina que son conocidos y pueden prepararse por procedimientos como los descritos en WO 05/121104, WO 061001175 y WO 07/066601, tales como 3-cloro-5-(4-cloro-fenil)-6-metil-4-(2,4,6-trifluoro-fenil)-piridazina (fórmula P.1), 3-cloro-6-metil-5-p-tolil-4-(2,4,6-trifluoro-fenil)-piridazina (fórmula P.2) y 3-cloro-4-(3-cloro-5-metoxi-piridin-2-il)-5-(4-cloro-fenil)-6-metil-piridazina (fórmula P.3);



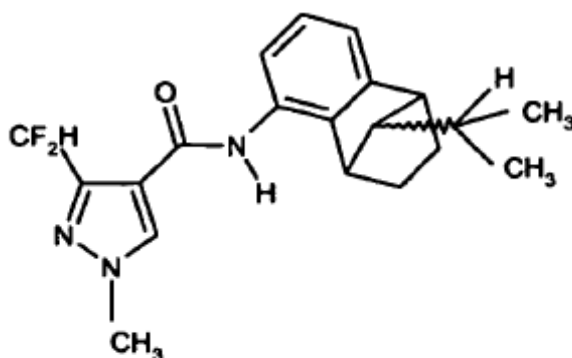
20

Derivados de triazolopirimidina que son conocidos y pueden prepararse por procedimientos como los descritos en WO98/46607, tales como 5-cloro-7-(4-metil-piperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina (fórmula T.1);



25

Derivados de carboxamida que son conocidos y pueden prepararse por procedimientos como los descritos en WO04/035589 y en WO06/37632, tales como ácido 3-difluorometil-1-metil-1H-pirazol-4-carboxílico (9-isopropil-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metano-naftalen-5-il)-amida (fórmula U.1); o

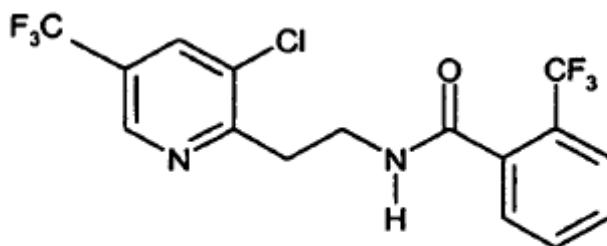


U.1

N-(3',4'-dicloro-5-fluoro-1,1'-bifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida (compuesto F-13).

Derivados de benzamida que son conocidos y pueden prepararse por procedimientos como los descritos en WO 20041016088, tales como N-{2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]etil}-2-trifluorometilbenzamida, que también es conocida bajo el nombre fluopiram (fórmula V.1);

5



V.1

y

10 varios otros, tales como acibenzolar-S-metilo, anilazina, bentiavalicarb, blastocidín-S, cinometionato, cloroneb, clorotalonilo, ciflufenamida, cimoxanilo, diclona, diclocimet, diclomezina, dicloran, dietofencarb, dimetomorf, flumorf, ditianon, etaboxam, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenoxanilo, fentina, ferimzona, fluazinam, fluopicolida, flusulfamida, fenhexamida, fosetil-aluminio, himexazol, iprovalicarb, ciazofamida, kasugamicina, mandipropamida, metasulfocarb, metrafenona, nicobifen, pencicuron, ftalida, polioxinas, probenazol, propamocarb, proquinazida, piroquilón, quinoxifeno, quintoceno, azufre, tiadinilo, triazoxida, triciclazol, triforina, validamicina, zoxamida y glifosato.

15 Otro aspecto de la invención se refiere al uso de un compuesto de la fórmula I o de un compuesto individual preferido como los definidos con anterioridad, de una composición que comprende al menos un compuesto de la fórmula I o al menos un compuesto individual preferido como los definidos con anterioridad, o de una mezcla fungicida que comprende al menos un compuesto de la fórmula I o al menos un compuesto individual preferido como los definidos con anterioridad, mezclado con otros fungicidas, como los descritos con anterioridad, para controlar o prevenir la infestación de plantas, cultivos alimenticios cosechados, semillas o materiales no vivos por microorganismos fitopatógenos, preferentemente organismos fúngicos.

20

Un aspecto adicional de la invención se refiere a un procedimiento para controlar o prevenir una infestación de plantas de cultivo, cultivos alimenticios cosechados o de materiales no vivos por microorganismos fitopatógenos o descomponedores u organismos potencialmente perjudiciales para el hombre, especialmente organismos fúngicos, que comprende la aplicación de un compuesto de la fórmula I o de un compuesto individual preferido como los definidos con anterioridad, como ingrediente activo a las plantas, a partes de las plantas o a sus locus, a semillas o a cualquier otra parte de los materiales no vivos.

25

Controlar o prevenir significa reducir la infestación de plantas de cultivo o de materiales no vivientes por microorganismos fitopatogénos o descomponedores u organismos potencialmente perjudiciales para el hombre, especialmente organismos fúngicos, a un nivel tal que se demuestre una mejora.

5 Un procedimiento preferido para controlar o prevenir una infestación de plantas de cultivo por microorganismos fitopatogénos, especialmente organismos fúngicos, que comprende la aplicación de un compuesto de la fórmula I, o una composición agroquímica que contiene al menos uno de dichos compuestos, es la aplicación foliar. La frecuencia de aplicación y la tasa de aplicación dependerán del riesgo de infestación por el patógeno correspondiente. Sin embargo, los compuestos de la fórmula I también pueden penetrar la planta a través de las raíces vía el suelo (acción sistémica) por el empapamiento del locus de la planta con una formulación líquida, o por la aplicación de los compuestos en forma  
10 sólida al suelo, por ej., en forma granular (aplicación al suelo). En cultivos de arroz acuático tales granulados pueden aplicarse al campo de arroz inundado. Los compuestos de la fórmula I también pueden aplicarse a semillas (revestimiento) por la impregnación de las semillas o tubérculos, ya sea con una formulación líquida del fungicida o por revestimiento con una formulación sólida.

15 Una formulación [es decir, una composición que contiene el compuesto de la fórmula I] y, si se desea, un adyuvante sólido o líquido o monómeros para encapsular el compuesto de la fórmula I, se prepara en una forma conocida, típicamente por la mezcla profunda y/o molienda del compuestos con extensores, por ejemplo, disolventes, vehículos sólidos y, opcionalmente, compuestos de superficie activa (tensioactivos).

20 Las formulaciones agroquímicas normalmente contendrán de 0,1 a 99% en peso, preferentemente de 0,1 a 95% en peso, del compuesto de la fórmula I, 99,9 a 1% en peso, preferentemente 99,8 a 5% en peso, de un adyuvante sólido o líquido, y de 0 a 25% en peso, preferentemente de 0,1 a 25% en peso, de un tensioactivo.

Las tasas ventajosas de aplicación normalmente son de 5 g a 2 kg de ingrediente activo (a.i.) por hectárea (ha), preferentemente de 10 g a 1 kg a.i./ha, con máxima preferencia de 20 g a 600 g a.i./ha. Cuando se utiliza como un agente de empapamiento de semillas, las dosificaciones convenientes son de 10 mg a 1g de sustancia activa por kg de semillas.

25 Aunque se prefiere formular productos comerciales como concentrados, el usuario final normalmente utilizará formulaciones diluidas.

30 Sorprendentemente, los compuestos de imidazol de la fórmula I de acuerdo con la invención, prefiriéndose en particular los compuestos de imidazol individuales descritos en la descripción anterior, también presentan una actividad reguladora del crecimiento de plantas (PGR). Por lo tanto, la presente invención también se refiere al uso de estos derivados novedosos de imidazol como reguladores del crecimiento de las plantas (PGR).

Los reguladores del crecimiento de las plantas (PGR) son generalmente cualesquiera sustancias o mezclas de sustancias pretendida para acelerar o retrasar la velocidad de crecimiento o desarrollo, o de otra manera alterar el desarrollo de plantas o sus productos.

Los reguladores del crecimiento de las plantas (PGR) afectan el crecimiento y la diferenciación de las plantas.

35 Más específicamente, varios reguladores del crecimiento de las plantas (PGR) pueden, por ejemplo, reducir la altura de una planta, estimular la germinación de semillas, inducir la floración, oscurecer el color de las hojas, cambiar la velocidad del crecimiento de una planta y modificar el tiempo y eficiencia de la frutación.

40 Además, la presente invención también se refiere a composiciones que comprenden los derivados novedosos de imidazol de la presente invención que mejoran las plantas, un proceso que comúnmente y en adelante se denomina "salud de plantas".

45 Por ejemplo, las propiedades ventajosas que pueden mencionarse son características de cultivos mejorados que incluyen: emergencia, rendimientos de cultivo, contenido de proteína, vigor aumentado, desarrollo más rápido, velocidad aumentada de la emergencia de las semillas, eficiencia mejorada de la utilización de nitrógeno, eficiencia mejorada del uso del agua, contenido oleoso mejorado, calidad mejorada, digestibilidad mejorada, maduración más rápida, sabor mejorado, contenido de almidón mejorado, sistema radicular más desarrollado (crecimiento de raíz mejorado), tolerancia al estrés mejorada (por ej., contra sequía, alta temperatura, sal, luz, rayos UV, agua, baja temperatura), etileno reducido (producción reducida y/o inhibición de la recepción), aumento del ahijamiento, aumento de la altura de plantas, aumento del tamaño de la vaina, menor cantidad de hojas basales marchitas, vástagos más fuertes, color de hojas de un verde más intenso, contenido de pigmento, actividad fotosintética, menos requerimiento de insumos (tales como fertilizantes o  
50 agua), menos requerimiento de semillas, vástagos más productivos, floración más temprana, madurez de granos más temprana, menos caída de plantas (acame), crecimiento aumentado de brotes, vigor aumentado de plantas, sostenimiento aumentado de plantas y mejor y más temprana germinación.

Son propiedades ventajosas, obtenidas especialmente a partir de semillas tratadas, por ej., germinación mejorada, establecimiento en el campo mejorado, mejor vigor, establecimiento en el campo más homogéneo.

- Son propiedades ventajosas, obtenidas especialmente a partir de aplicación foliar y/o en surco, por ej., crecimiento y desarrollado mejorados de plantas, mejor crecimiento, más vástagos, hojas más verdes, hojas más grandes, más biomasa, mejores raíces, tolerancia mejorada al estrés de las plantas, más rendimiento de granos, más biomasa cosechada, calidad mejorada de la cosecha (contenido de ácidos grasos, metabolitos, aceite, etc.), más productos comercializables (por ej., tamaño aumentado), proceso aumentado (por ej., vida media más extensa, mejor extracción de compuestos), calidad aumentada de semillas (para ser sembradas en las siguientes estaciones para producción de semillas); o cualquier otra ventaja familiar para aquellos con experiencia en la técnica.
- Por lo tanto, es un objetivo de la presente invención proporcionar un procedimiento que resuelva los problemas esbozados con anterioridad.
- La presente invención se refiere a ingredientes activos de protección de plantas que son compuestos de imidazol de la fórmula I de acuerdo con la invención, prefiriéndose en particular los compuestos de imidazol individuales descritos en la descripción anterior, y mezclas con eficacia aumentada, y a un procedimiento para aumentar la salud de las plantas por la aplicación de dichos compuestos y mezclas a las plantas o sus locus.
- La acción de los compuestos de la fórmula I va más allá de la acción fungicida conocida. Los compuestos de imidazol de la fórmula I de acuerdo con la invención, siendo compuestos en particular preferidos los compuestos de imidazol individuales descritos en la descripción anterior, exhiben salud de plantas
- El término salud de plantas comprende varias clases de mejoras de plantas que no están vinculadas al control de los hongos perjudiciales.
- Los siguientes ejemplos no limitantes ilustran en mayor detalle la invención descrita con anterioridad.
- Ejemplo 1:** Este ejemplo ilustra la preparación de 2-Cloro-5-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina (Compuesto Núm.1.j.210)
- a) Preparación de (6-Cloro-piridin-3-il)-[1-(2,4,6-trifluoro-fenil)-met-(E)-iliden]-amina
- 6-Cloro-piridin-3-ilamina (5 g) y 2,4,6-trifluoro-benzaldehído (6,226 g) se disuelven en tolueno (190 ml). Después, la mezcla se agita durante 16,0 h a reflujo en un aparato Dean-Stark. La mezcla de reacción se evapora a presión reducida, para obtener 9,92 g de (6-cloro-piridin-3-il)[1-(2,4,6-trifluoro-fenil)-met-(E)-iliden]-amina. <sup>1</sup>H RMN (300Mhz, CDCl<sub>3</sub>) 8,58 ppm, 1H, s; 8,25 ppm, 1H, d, J=2,16Hz; 7,51 ppm, 1H, dd, J=2,47 y 8,36Hz; 7,36 ppm, 1H, d, J=8,39Hz; 6,79 ppm, 2H, t, J=8,69Hz.
- b) Preparación de 2-Cloro-5-[5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina
- Se disuelven 9,92 g de (6-Cloro-piridin-3-il)-[1-(2,4,6-trifluoro-fenil)-met-(E)-iliden]-amina en 120 ml de N,N-dimetil-formamida y 100 ml de 1,2-dimetoxi-etano. Se añaden 10,73 g de isocianuro de toluensulfonilmetilo y 10,13 g de carbonato de potasio anhídrido, y la mezcla de reacción resultante se calienta a 100°C durante 90 minutos. Tras el enfriamiento, la mezcla se filtra, los disolventes se evaporan, el sólido resultante se adsorbe sobre Isolute® HM-N y se purifica por cromatografía en columna sobre gel de sílice, por el uso de una mezcla de heptano / acetato de etilo 3:1 - 7:3 - 2:1 y 1:1 como eluyentes sucesivos para obtener 9,320 g de un intermedio de peso molecular igual a 465,88 g/mol. Este intermedio se disuelve en 80 ml de N,N-dimetil-formamida y 70 ml de 1,2-dimetoxi-etano, y a esta solución se añaden 6,645 g de carbonato de potasio anhídrido. La mezcla de reacción resultante se calienta a 100°C durante 24 h. Tras el enfriamiento, la mezcla se filtra, los disolventes se evaporan, el sólido resultante se adsorbe sobre Isolute® HM-N y se purifica por cromatografía en columna sobre gel de sílice, por el uso de una mezcla de heptano / acetato de etilo 2:1 y 1:1 como eluyentes sucesivos para obtener 4,782 g de 2-Cloro-5-[5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina. <sup>1</sup>H RMN (300Mhz, CDCl<sub>3</sub>) 8,26 ppm, 1H, d, J=2,57Hz; 7,81 ppm, 1H, s; 7,48 ppm, 1H, dd, J=2,7 y 8,44Hz; 7,38 ppm, 1H, d, J=8,41 Hz; 7,35 ppm, 1H, s; 6,69 ppm, 2H, t, J=8Hz.
- c) Preparación de 5-[2-Bromo-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-2-cloro-piridina
- Una mezcla de 3,290 g de 2-Cloro-5-[5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina, 2,203 g de N-bromosuccinimida y 30 ml de cloroformo se calienta durante 4 h a 80°C. Después, la mezcla se enfría a temperatura ambiente, se añade Isolute® HM-N a la mezcla de reacción y el cloroformo se evapora. La mezcla bruta se purifica por cromatografía en columna sobre gel de sílice, por el uso de una mezcla de heptano / acetato de etilo 4:1 como eluyente para obtener 1,520 g de 5-[2-Bromo-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-2-cloro-piridina como un sólido amarillo pálido-anaranjado. <sup>1</sup>H RMN (300Mhz, CDCl<sub>3</sub>) 8,23 ppm, 1H, d, J=2,58Hz; 7,54 ppm, 1H, dd, J=2,71 y 8,43Hz; 7,40 ppm, 1H, d, J=8,41 Hz; 7,27 ppm, 1H, s; 6,66 ppm, 2H, t, J=7,85Hz.
- d) Preparación de 2-Cloro-5-[2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina
- 5-[2-Bromo-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-2-cloro-piridina (0,959 g) se disuelve en 50 ml de tetrahidrofurano. A esta solución, se añaden 0,040 g de tetrakis(trifenilfosfina)Paladio, antes de calentar la mezcla resultante a reflujo durante 10 minutos. Después, se retira el baño de aceite e, inmediatamente después, se añaden lentamente 3,7 ml de (trimetil) aluminio. La mezcla de reacción se calienta a reflujo durante exactamente 95 minutos antes de enfriarse a 0°C.

- Se añaden 2 ml de metanol gota a gota (evolución de gases) y tras cinco minutos, se añade Isolute® HM-N y los disolventes se eliminan a presión reducida. El residuo se purifica por cromatografía sobre gel de sílice, por el uso de una mezcla de heptano / acetato de etilo 1 : 4 como eluyente, para administrar 0,218 g de 2-Cloro-5-[2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina como un sólido blanco. <sup>1</sup>H RMN (300Mhz, CDCl<sub>3</sub>) 8,23 ppm, 1H, d, J=2,53 Hz; 7,47 ppm, 1H, dd, J=2,62 y 8,53Hz; 7,39 ppm, 1H, d, J=8,4Hz; 7,20 ppm, 1H, s; 6,64 ppm, 2H, t, J=7,46Hz; 2,38 ppm, 3H, s. Se obtienen 0,312 g de 2-Metil-5-[2-metil-5-(2,4,6-trifluorofenil)-imidazol-1-il]-piridina como un sub-producto. <sup>1</sup>H RMN (300Mhz, CDCl<sub>3</sub>) 8,23 ppm, 1H, d, J=2,22Hz; 7,30 ppm, 1H, dd, J=2,4 y 8,22Hz; 7,12 ppm, 1H, d, J=8,24Hz; 7,09 ppm, 1H, s; 6,53 ppm, 2H, t, J=7,38Hz; 2,51 ppm, 3H, s; 2,27 ppm, 3H, s.
- e) Preparación de 2-Cloro-5-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina (Compuesto Núm.I.j.210)
- 10 Una mezcla de 0,310 g de 2-Cloro-5-[2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina, 0,134 g de N-clorosuccinimida y 3 ml de cloroforma se calienta durante 3 h a 80°C. Después, la mezcla se enfría a temperatura ambiente, se añade Isolute® HM-N a la mezcla de reacción y el cloroformo se evapora. La mezcla bruta se purifica por cromatografía en columna sobre gel de sílice, por el uso de una mezcla de heptano / acetato de etilo 2:1 como eluyente para obtener 2-cloro-5-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina. Este sólido blanco se disuelve en éter de dietilo (10 ml), se extrae dos veces con 5 ml de una solución 1N de hidróxido de sodio, la fase orgánica se seca sobre sulfato de sodio, se filtra y evapora a presión reducida para obtener 0,195 g de 2-Cloro-5-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluorofenil)-imidazol-1-il]-piridina (Compuesto Núm.I.j.210) como un sólido blanco. <sup>1</sup>H RMN (300Mhz, CDCl<sub>3</sub>) 8,23 ppm, 1H, d, J=2,49Hz; 7,47 ppm, 1H, dd, J=2,63 y 8,43Hz; 7,40 ppm, 1H, d, J=8,41Hz; 6,68 ppm, 2H, t, J=7,45Hz; 2,34 ppm, 3H, s.
- 15
- 20 **Ejemplo 2:** Este ejemplo ilustra la preparación de 2-Cloro-5-[2,4-dicloro-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina (Compuesto Núm.I.j.209)
- Una mezcla de 0,15 g de 2-Cloro-5-[5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina, 0,164 g de N-clorosuccinimida y 1,56 ml de cloroformo se calienta durante 16 h a 80°C. Después, la mezcla se calienta a temperatura ambiente, se añade Isolute® HM-N a la mezcla de reacción y el cloroformo se evapora. La mezcla bruta se purifica por cromatografía en columna sobre gel de sílice, por el uso de una mezcla de heptano / acetato de etilo 6 : 1 como eluyente para obtener 0,136 g de 2-Cloro-5-[2,4-dicloro-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina (Compuesto Núm.I.j.209). <sup>1</sup>H RMN (300 Mhz, CDCl<sub>3</sub>) 8,23 ppm, 1H, d, J=2,7Hz; 7,54 ppm, 1H, dd, J=2,7 y 8,5Hz; 7,43 ppm, 1H, d, J=8,36Hz; 6,71 ppm, 2H, t, J=7,97Hz.
- 25
- 30 **Ejemplo 3:** Este ejemplo ilustra la preparación de 5-[4-Cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazol-1-il]-2-metil-piridina (Compuesto Núm.I.m.225)
- a) Preparación de 5-[4-Cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-2-metil-piridina (Compuesto Núm.I.j.225)
- Una mezcla de 0,448 g de 2-metil-5-[2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina, 0,217 g de N-clorosuccinimida y 5 ml de cloroformo se calienta durante 1,5 h a 80°C. Después, la mezcla se enfría a temperatura ambiente, se añade Isolute® HM-N a la mezcla de reacción y el cloroformo se evapora. La mezcla bruta se purifica por cromatografía en columna sobre gel de sílice, por el uso de una mezcla de heptano / acetato de etilo 1:1 como eluyente para obtener 5-[4-Cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-2-metil-piridina (Compuesto Núm.I.j.225) contaminado por succinimida. Este sólido blanco se disuelve en éter de dietilo (10 ml), se extrae dos veces con 5 ml de una solución 1N de hidróxido de sodio, la fase orgánica se seca sobre sulfato de sodio, se filtra y evapora a presión reducida para obtener 0,265 g de 5-[4-Cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-2-metil-piridina pura (Compuesto Núm.I.j.225) como un sólido blanco. <sup>1</sup>H RMN (300Mhz, CDCl<sub>3</sub>) 8,32 ppm, 1H, d, J=2,26Hz; 7,39 ppm, 1H, dd, J=2,41 y 8,21 Hz; 7,21 ppm, 1H, d, J=8,21 Hz; 6,65 ppm, 2H, t, J=7,51 Hz; 2,60 ppm, 3H, s; 2,32 ppm, 3H, s.
- 35
- 40
- b) Preparación de 5-[4-Cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazol-1-il]-2-metil-piridina (Compuesto Núm.I.m.225)
- 0,280 g de 5-[4-Cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-2-metil-piridina (Compuesto Núm.I.j. 225) se disuelven en 5 ml de tetrahidrofurano y la mezcla se enfría a 0°C. Se añaden 305 µl de una solución de metilato de sodio (30%) en metanol, y la reacción se agita durante 16 h a temperatura ambiente. Se añaden 5 ml de acetato de etilo, seguido por 5 ml de agua, y se separan las capas. La fase acuosa se extrae dos veces con acetato de etilo, y las fases orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de sodio, se filtran y evaporan a presión reducida para obtener 0,260 g de 5-[4-Cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazol-1-il]-2-metil-piridina (Compuesto Núm.I.m.225). <sup>1</sup>H RMN (300Mhz, CDCl<sub>3</sub>) 8,22 ppm, 1H, d, J=2,26Hz; 7,31 ppm, 1H, dd, J=2,39 y 8,21 Hz; 7,10 ppm, 1H, d, J=8,21Hz; 6,32 ppm, 2H, d, J=9,1Hz; 3,69 ppm, 3H, s; 2,50 ppm, 3H, s; 2,22 ppm, 3H, s.
- 45
- 50
- Ejemplo 4:** Este ejemplo ilustra la preparación de 5-[4-Cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazol-1-il]-2-metoxi-piridina (Compuesto Núm.I.220)
- Se disuelven 0,102 g de 2-Cloro-5-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina (Compuesto Núm.I.j.210) en 1,75 ml de tetrahidrofurano y la mezcla se enfría a 0°C. Se añaden 132 µl de una solución de metilato de sodio (30%) en metanol, y la reacción se agita durante 16 h a temperatura ambiente. Se añaden 2 ml de acetato de etilo, seguido por 3 ml de agua, y se separan las capas. La fase acuosa se extrae dos veces con acetato de etilo, y las fases
- 55

orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de sodio, se filtran y evaporan a presión reducida para obtener 0,099 g de 5-[4-Cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metilimidazol-1-il]-2-metoxi-piridina (Compuesto Núm.I.m.220). <sup>1</sup>H RMN (300Mhz, CDCl<sub>3</sub>) 7,90 ppm, 1H, d, J=2,6Hz; 7,28 ppm, 1H, dd, J=2,72 y 8,72Hz; 6,67 ppm, 1H, d, J=8,78Hz; 6,33 ppm, 2H, d, J=9,1Hz; 3,86 ppm, 3H, s; 3,69 ppm, 3H, s; 2,21 ppm, 3H, s.

5 **Ejemplo 5:** Este ejemplo ilustra la preparación de 2-Cloro-5-[4-cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metilimidazol-1-il]-piridina (Compuesto Núm.I.m.210)

10 Se disuelven 0,089 g de 5-[4-Cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metilimidazol-1-il]-2-metoxi-piridina (Compuesto Núm.I.m.220) en 1 ml de fosforocloruro y se calientan a reflujo durante 24 horas. La solución se vierte sobre agua helada y se agita durante 30 minutos, después, se añade una solución 1 M de hidróxido de sodio para alcanzar la neutralidad. La solución acuosa se extrae tres veces con diclorometano, las fracciones orgánicas combinadas se secan sobre sulfato de sodio y el disolvente se elimina bajo presión reducida. La mezcla bruta se purifica por cromatografía en columna sobre gel de sílice, por el uso de una mezcla de heptano / acetato de etilo 3 : 1 como eluyente para obtener 0,041 g de 2-Cloro-5-[4-cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metilimidazol-1-il]-piridina (Compuesto Núm.I.m.210). <sup>1</sup>H RMN (300Mhz, CDCl<sub>3</sub>) 8,15 ppm, 1H, d, J=2,7Hz; 7,39 ppm, 1H, dd, J=2,7 y 8,4Hz; 7,31 ppm, 1H, d, J=8,4Hz; 6,34 ppm, 2H, d, J=9,25Hz; 3,71 ppm, 3H, s; 2,25 ppm, 3H, s.

La Tabla 1 a continuación ilustra los ejemplos de compuestos individuales de la fórmula I de acuerdo con la invención.

Tabla 1: Compuestos individuales de la fórmula I de acuerdo con la invención

Núm. de Compuesto	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
001	F	fenilo	F
002	CH <sub>3</sub>	fenilo	F
003	F	fenilo	Cl
004	Cl	fenilo	Cl
005	CH <sub>3</sub>	fenilo	Cl
006	F	3-fluorofenilo	F
007	CH <sub>3</sub>	3-fluorofenilo	F
008	F	3-fluorofenilo	Cl
009	Cl	3-fluorofenilo	Cl
010	CH <sub>3</sub>	3-fluorofenilo	Cl
011	F	4-fluorofenilo	F
012	CH <sub>3</sub>	4-fluorofenilo	F
013	F	4-fluorofenilo	F
014	Cl	4-fluorofenilo	Cl
015	CH <sub>3</sub>	4-fluorofenilo	Cl
016	F	3-clorofenilo	F
017	CH <sub>3</sub>	3-clorofenilo	F
018	F	3-clorofenilo	Cl
019	Cl	3-clorofenilo	Cl
020	CH <sub>3</sub>	3-clorofenilo	Cl
021	F	4-clorofenilo	F
022	CH <sub>3</sub>	4-clorofenilo	F
023	F	4-clorofenilo	F
024	Cl	4-clorofenilo	Cl
025	CH <sub>3</sub>	4-clorofenilo	Cl
026	F	3-bromofenilo	F
027	CH <sub>3</sub>	3-bromofenilo	F
028	F	3-bromofenilo	Cl
029	Cl	3-bromofenilo	Cl
030	CH <sub>3</sub>	3-bromofenilo	Cl
031	F	4-bromofenilo	F
032	CH <sub>3</sub>	4-bromofenilo	F
033	F	4-bromofenilo	Cl
034	Cl	4-bromofenilo	Cl
035	CH <sub>3</sub>	4-bromofenilo	Cl
036	F	m-tolilo	F
037	CH <sub>3</sub>	m-tolilo	F
038	F	m-tolilo	Cl
039	Cl	m-tolilo	Cl
040	CH <sub>3</sub>	m-tolilo	Cl
041	F	p-tolilo	F
042	CH <sub>3</sub>	p-tolilo	F

(cont.)

Núm. de Compuesto	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
043	F	p-tolilo	Cl
044	Cl	p-tolilo	Cl
045	CH <sub>3</sub>	p-tolilo	Cl
046	F	3-trifluorometilfenilo	F
047	CH <sub>3</sub>	3-trifluorometilfenilo	F
048	F	3-trifluorometilfenilo	Cl
049	Cl	3-trifluorometilfenilo	Cl
050	CH <sub>3</sub>	3-trifluorometilfenilo	Cl
051	F	4-trifluorometilfenilo	F
052	CH <sub>3</sub>	4-trifluorometilfenilo	F
053	F	4-trifluorometilfenilo	Cl
054	Cl	4-trifluorometilfenilo	Cl
055	CH <sub>3</sub>	4-trifluorometilfenilo	Cl
056	F	3-metoxifenilo	F
057	CH <sub>3</sub>	3-metoxifenilo	F
058	F	3-metoxifenilo	Cl
059	Cl	3-metoxifenilo	Cl
060	CH <sub>3</sub>	3-metoxifenilo	Cl
061	F	4-metoxifenilo	F
062	CH <sub>3</sub>	4-metoxifenilo	F
063	F	4-metoxifenilo	Cl
064	Cl	4-metoxifenilo	Cl
065	CH <sub>3</sub>	4-metoxifenilo	Cl
066	F	3-trifluorometoxifenilo	F
067	CH <sub>3</sub>	3-trifluorometoxifenilo	F
068	F	3-trifluorometoxifenilo	Cl
069	Cl	3-trifluorometoxifenilo	Cl
070	CH <sub>3</sub>	3-trifluorometoxifenilo	Cl
071	F	4-trifluorometoxifenilo	F
072	CH <sub>3</sub>	4-trifluorometoxifenilo	F
073	F	4-trifluorometoxifenilo	Cl
074	Cl	4-trifluorometoxifenilo	Cl
075	CH <sub>3</sub>	4-trifluorometoxifenilo	Cl
076	F	3-cianofenilo	F
077	CH <sub>3</sub>	3-cianofenilo	F
078	F	3-cianofenilo	Cl
079	Cl	3-cianofenilo	Cl
080	CH <sub>3</sub>	3-cianofenilo	Cl
081	F	4-cianofenilo	F
082	CH <sub>3</sub>	4-cianofenilo	F
083	F	4-cianofenilo	Cl
084	Cl	4-cianofenilo	Cl
085	CH <sub>3</sub>	4-cianofenilo	Cl
086	F	3,4-difluorofenilo	F
087	CH <sub>3</sub>	3,4-difluorofenilo	F
088	F	3,4-difluorofenilo	Cl
089	Cl	3,4-difluorofenilo	Cl
090	CH <sub>3</sub>	3,4-difluorofenilo	Cl
091	F	3,4-diclorofenilo	F
092	CH <sub>3</sub>	3,4-diclorofenilo	F
093	F	3,4-diclorofenilo	Cl
094	Cl	3,4-diclorofenilo	Cl
095	CH <sub>3</sub>	3,4-diclorofenilo	Cl
096	F	3,4-dimetilfenilo	F
097	CH <sub>3</sub>	3,4-dimetilfenilo	F
098	F	3,4-dimetilfenilo	Cl
099	Cl	3,4-dimetilfenilo	Cl
100	CH <sub>3</sub>	3,4-dimetilfenilo	Cl
101	F	3,4-dimetoxifenilo	F
102	CH <sub>3</sub>	3,4-dimetoxifenilo	F



## ES 2 371 136 T3

(cont.)

Núm. de Compuesto	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
103	F	3,4-dimetoxifenilo	Cl
104	Cl	3,4-dimetoxifenilo	Cl
105	CH <sub>3</sub>	3,4-dimetoxifenilo	Cl
106	F	3-cloro-4-fluorofenilo	F
107	CH <sub>3</sub>	3-cloro-4-fluorofenilo	F
108	F	3-cloro-4-fluorofenilo	Cl
109	Cl	3-cloro-4-fluorofenilo	Cl
110	CH <sub>3</sub>	3-cloro-4-fluorofenilo	Cl
111	F	3-cloro-4-metilfenilo	F
112	CH <sub>3</sub>	3-cloro-4-metilfenilo	F
113	F	3-cloro-4-metilfenilo	Cl
114	Cl	3-cloro-4-metilfenilo	Cl
115	CH <sub>3</sub>	3-cloro-4-metilfenilo	Cl
116	F	3-cloro-4-metoxifenilo	F
117	CH <sub>3</sub>	3-cloro-4-metoxifenilo	F
118	F	3-cloro-4-metoxifenilo	Cl
119	Cl	3-cloro-4-metoxifenilo	Cl
120	CH <sub>3</sub>	3-cloro-4-metoxifenilo	Cl
121	F	4-cloro-3-fluorofenilo	F
122	CH <sub>3</sub>	4-cloro-3-fluorofenilo	F
123	F	4-cloro-3-fluorofenilo	Cl
124	Cl	4-cloro-3-fluorofenilo	Cl
125	CH <sub>3</sub>	4-cloro-3-fluorofenilo	Cl
126	F	4-cloro-3-metilfenilo	F
127	CH <sub>3</sub>	4-cloro-3-metilfenilo	F
128	F	4-cloro-3-metilfenilo	Cl
129	Cl	4-cloro-3-metilfenilo	Cl
130	CH <sub>3</sub>	4-cloro-3-metilfenilo	Cl
131	F	4-cloro-3-metoxifenilo	F
132	CH <sub>3</sub>	4-cloro-3-metoxifenilo	F
133	F	4-cloro-3-metoxifenilo	Cl
134	Cl	4-cloro-3-metoxifenilo	Cl
135	CH <sub>3</sub>	4-cloro-3-metoxifenilo	Cl
136	F	3-fluoro-4-metoxifenilo	F
137	CH <sub>3</sub>	3-fluoro-4-metoxifenilo	F
138	F	3-fluoro-4-metoxifenilo	Cl
139	Cl	3-fluoro-4-metoxifenilo	Cl
140	CH <sub>3</sub>	3-fluoro-4-metoxifenilo	Cl
141	F	3-fluoro-4-metilfenilo	F
142	CH <sub>3</sub>	3-fluoro-4-metilfenilo	F
143	F	3-fluoro-4-metilfenilo	Cl
144	Cl	3-fluoro-4-metilfenilo	Cl
145	CH <sub>3</sub>	3-fluoro-4-metilfenilo	Cl
146	F	4-fluoro-3-metoxifenilo	F
147	CH <sub>3</sub>	4-fluoro-3-metoxifenilo	F
148	F	4-fluoro-3-metoxifenilo	Cl
149	Cl	4-fluoro-3-metoxifenilo	Cl
150	CH <sub>3</sub>	4-fluoro-3-metoxifenilo	Cl
151	F	4-fluoro-3-metilfenilo	F
152	CH <sub>3</sub>	4-fluoro-3-metilfenilo	F
153	F	4-fluoro-3-metilfenilo	Cl
154	Cl	4-fluoro-3-metilfenilo	Cl
155	CH <sub>3</sub>	4-fluoro-3-metilfenilo	Cl
156	F	3-metoxi-4-metilfenilo	F
157	CH <sub>3</sub>	3-metoxi-4-metilfenilo	F
158	F	3-metoxi-4-metilfenilo	Cl
159	Cl	3-metoxi-4-metilfenilo	Cl
160	CH <sub>3</sub>	3-metoxi-4-metilfenilo	Cl
161	F	4-metoxi-3-metilfenilo	F
162	CH <sub>3</sub>	4-metoxi-3-metilfenilo	F

(cont.)

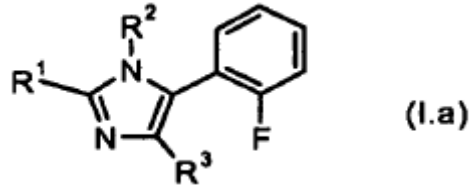
Núm. de Compuesto	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
163	F	4-metoxi-3-metilfenilo	Cl
164	Cl	4-metoxi-3-metilfenilo	Cl
165	CH <sub>3</sub>	4-metoxi-3-metilfenilo	Cl
166	F	naft-2-ilo	F
167	CH <sub>3</sub>	naft-2-ilo	F
168	F	naft-2-ilo	Cl
169	Cl	naft-2-ilo	Cl
170	CH <sub>3</sub>	naft-2-ilo	Cl
171	F	piridin-2-ilo	F
172	CH <sub>3</sub>	piridin-2-ilo	F
173	F	piridin-2-ilo	Cl
174	Cl	piridin-2-ilo	Cl
175	CH <sub>3</sub>	piridin-2-ilo	Cl
176	F	piridin-3-ilo	F
177	CH <sub>3</sub>	piridin-3-ilo	F
178	F	piridin-3-ilo	Cl
179	Cl	piridin-3-ilo	Cl
180	CH <sub>3</sub>	piridin-3-ilo	Cl
181	F	piridin-4-ilo	F
182	CH <sub>3</sub>	piridin-4-ilo	F
183	F	piridin-4-ilo	Cl
184	Cl	piridin-4-ilo	Cl
185	CH <sub>3</sub>	piridin-4-ilo	Cl
186	F	6-cloropiridin-2-ilo	F
187	CH <sub>3</sub>	6-cloropiridin-2-ilo	F
188	F	6-cloropiridin-2-ilo	Cl
189	Cl	6-cloropiridin-2-ilo	Cl
190	CH <sub>3</sub>	6-cloropiridin-2-ilo	Cl
191	F	6-fluoropiridin-2-ilo	F
192	CH <sub>3</sub>	6-fluoropiridin-2-ilo	F
193	F	6-fluoropiridin-2-ilo	Cl
194	Cl	6-fluoropiridin-2-ilo	Cl
195	CH <sub>3</sub>	6-fluoropiridin-2-ilo	Cl
196	F	6-metoxipiridin-2-ilo	F
197	CH <sub>3</sub>	6-metoxipiridin-2-ilo	F
198	F	6-metoxipiridin-2-ilo	Cl
199	Cl	6-metoxipiridin-2-ilo	Cl
200	CH <sub>3</sub>	6-metoxipiridin-2-ilo	Cl
201	F	6-metilpiridin-2-ilo	F
202	CH <sub>3</sub>	6-metilpiridin-2-ilo	F
203	F	6-metilpiridin-2-ilo	Cl
204	Cl	6-metilpiridin-2-ilo	Cl
205	CH <sub>3</sub>	6-metilpiridin-2-ilo	Cl
206	F	6-cloropiridin-3-ilo	F
207	CH <sub>3</sub>	6-cloropiridin-3-ilo	F
208	F	6-cloropiridin-3-ilo	Cl
209	Cl	6-cloropiridin-3-ilo	Cl
210	CH <sub>3</sub>	6-cloropiridin-3-ilo	Cl
211	F	6-fluoropiridin-3-ilo	F
212	CH <sub>3</sub>	6-fluoropiridin-3-ilo	F
213	F	6-fluoropiridin-3-ilo	Cl
214	Cl	6-fluoropiridin-3-ilo	Cl
215	CH <sub>3</sub>	6-fluoropiridin-3-ilo	Cl
216	F	6-metoxipiridin-3-ilo	F
217	CH <sub>3</sub>	6-metoxipiridin-3-ilo	F
218	F	6-metoxipiridin-3-ilo	Cl
219	Cl	6-metoxipiridin-3-ilo	Cl
220	CH <sub>3</sub>	6-metoxipiridin-3-ilo	Cl
221	F	6-metilpiridin-3-ilo	F
222	CH <sub>3</sub>	6-metilpiridin-3-ilo	F

(cont.)

Núm. de Compuesto	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
223	F	6-metilpiridin-3-ilo	Cl
224	Cl	6-metilpiridin-3-ilo	Cl
225	CH <sub>3</sub>	6-metilpiridin-3-ilo	Cl
226	F	2-cloropiridin-4-ilo	F
227	CH <sub>3</sub>	2-cloropiridin-4-ilo	F
228	F	2-cloropiridin-4-ilo	Cl
229	Cl	2-cloropiridin-4-ilo	Cl
230	CH <sub>3</sub>	2-cloropiridin-4-ilo	Cl
231	F	2-fluoropiridin-4-ilo	F
232	CH <sub>3</sub>	2-fluoropiridin-4-ilo	F
233	F	2-fluoropiridin-4-ilo	Cl
234	Cl	2-fluoropiridin-4-ilo	Cl
235	CH <sub>3</sub>	2-fluoropiridin-4-ilo	Cl
236	F	2-metoxipiridin-4-ilo	F
237	CH <sub>3</sub>	2-metoxipiridin-4-ilo	F
238	F	2-metoxipiridin-4-ilo	Cl
239	Cl	2-metoxipiridin-4-ilo	Cl
240	CH <sub>3</sub>	2-metoxipiridin-4-ilo	Cl
241	F	2-metilpiridin-4-ilo	F
242	CH <sub>3</sub>	2-metilpiridin-4-ilo	F
243	F	2-metilpiridin-4-ilo	Cl
244	Cl	2-metilpiridin-4-ilo	Cl
245	CH <sub>3</sub>	2-metilpiridin-4-ilo	Cl
246	F	5-clorotiofen-2-ilo	F
247	CH <sub>3</sub>	5-clorotiofen-2-ilo	F
248	F	5-clorotiofen-2-ilo	Cl
249	Cl	5-clorotiofen-2-ilo	Cl
250	CH <sub>3</sub>	5-clorotiofen-2-ilo	Cl
251	F	5-bromotiofen-2-ilo	F
252	CH <sub>3</sub>	5-bromotiofen-2-ilo	F
253	F	5-bromotiofen-2-ilo	Cl
254	Cl	5-bromotiofen-2-ilo	Cl
255	CH <sub>3</sub>	5-bromotiofen-2-ilo	Cl
256	F	5-metoxitiofen-2-ilo	F
257	CH <sub>3</sub>	5-metoxitiofen-2-ilo	F
258	F	5-metoxitiofen-2-ilo	Cl
259	Cl	5-metoxitiofen-2-ilo	Cl
260	CH <sub>3</sub>	5-metoxitiofen-2-ilo	Cl
261	F	quinolin-2-ilo	F
262	CH <sub>3</sub>	quinolin-2-ilo	F
263	F	quinolin-2-ilo	Cl
264	Cl	quinolin-2-ilo	Cl
265	CH <sub>3</sub>	quinolin-2-ilo	Cl
266	F	quinolin-3-ilo	F
267	CH <sub>3</sub>	quinolin-3-ilo	F
268	F	quinolin-3-ilo	Cl
269	Cl	quinolin-3-ilo	Cl
270	CH <sub>3</sub>	quinolin-3-ilo	Cl
271	F	4-metoxiquinolin-2-ilo	F
272	CH <sub>3</sub>	4-metoxiquinolin-2-ilo	F
273	F	4-metoxiquinolin-2-ilo	Cl
274	Cl	4-metoxiquinolin-2-ilo	Cl
275	CH <sub>3</sub>	4-metoxiquinolin-2-ilo	Cl
276	F	4-metilquinolin-2-ilo	F
277	CH <sub>3</sub>	4-metilquinolin-2-ilo	F
278	F	4-metilquinolin-2-ilo	Cl
279	Cl	4-metilquinolin-2-ilo	Cl
280	CH <sub>3</sub>	4-metilquinolin-2-ilo	Cl

en los que

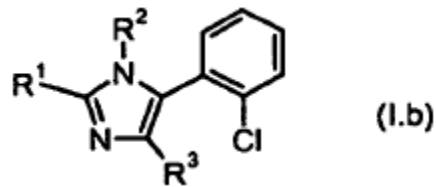
a) 110 compuestos de la fórmula (I.a):



5

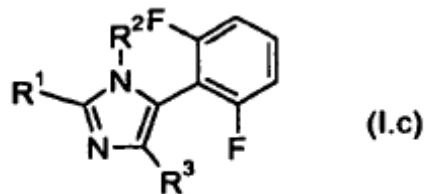
en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

b) 110 compuestos de la fórmula (I.b):



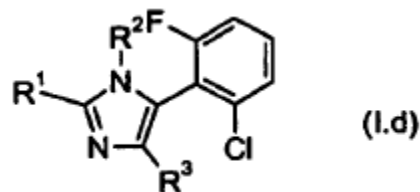
10 en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

c) 110 compuestos de la fórmula (I.c):



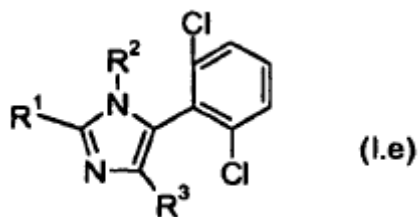
en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

15 d) 110 compuestos de la fórmula (I.d):



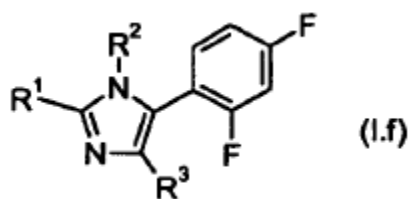
en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

e) 110 compuestos de la fórmula (I.e):



en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280..

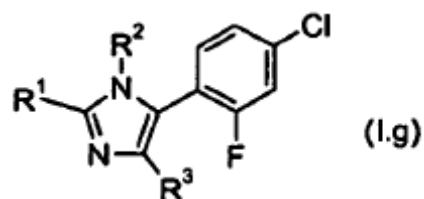
f) 110 compuestos de la fórmula (I.f):



5

en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

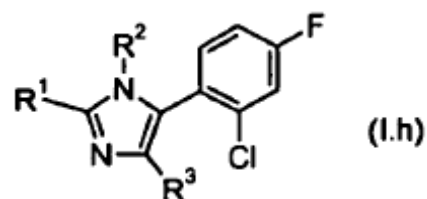
g) 110 compuestos de la fórmula (I.g):



10

en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

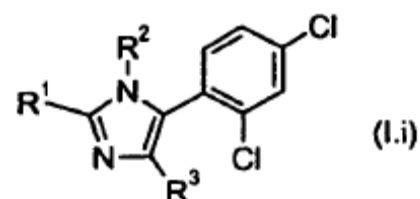
h) 110 compuestos de la fórmula (I.h):



15

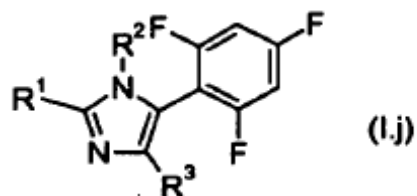
en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

i) 110 compuestos de la fórmula (I.i):



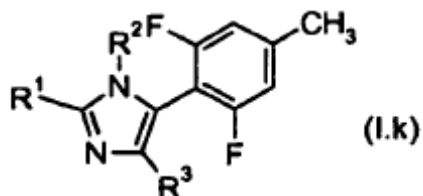
en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

j) 110 compuestos de la fórmula (I.j):



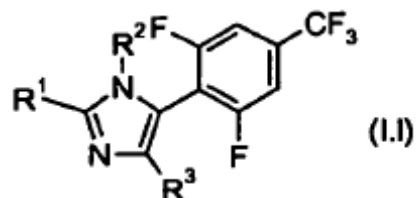
5 en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

k) 110 compuestos de la fórmula (I.k):



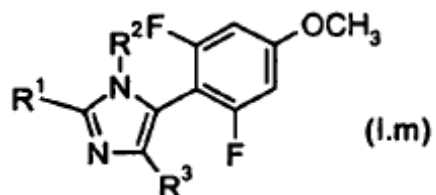
en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

10 l) 110 compuestos de la fórmula (I.l):



en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

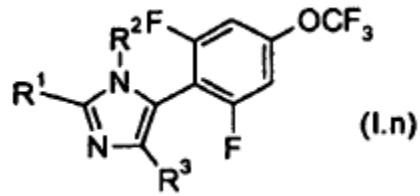
m) 110 compuestos de la fórmula (I.m):



15

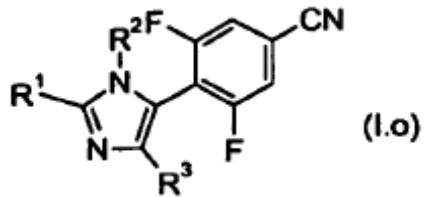
en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

n) 110 compuestos de la fórmula (I.n):



en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

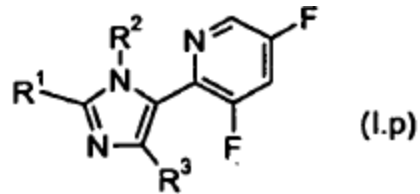
o) 110 compuestos de la fórmula (I.o):



5

en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son lo definido en la Tabla 1 como compuestos 171 a 280.

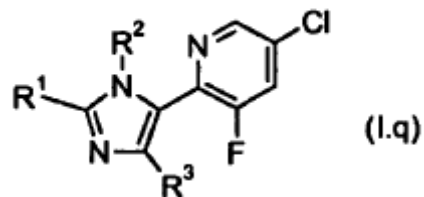
p) 280 compuestos de la fórmula (I.p):



10

en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son lo definido en la Tabla 1.

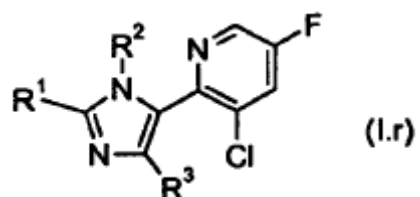
q) 280 compuestos de la fórmula (I.q):



15

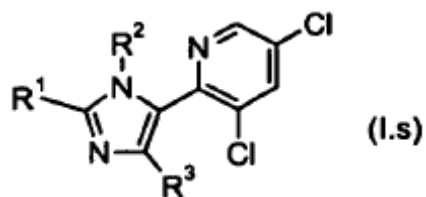
en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son lo definido en la Tabla 1.

r) 280 compuestos de la fórmula (I.r):



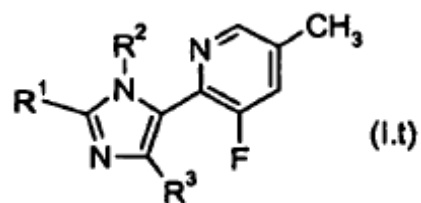
en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1.

s) 280 compuestos de la fórmula (I.s):



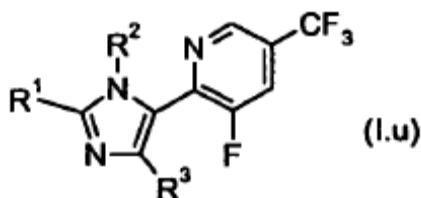
5 en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1.

t) 280 compuestos de la fórmula (I.t):



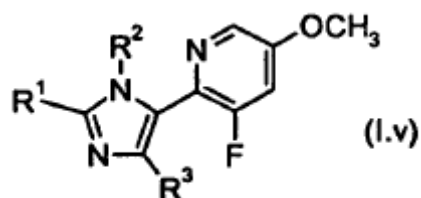
en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1.

10 u) 280 compuestos de la fórmula (I.u):



en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1.

v) 280 compuestos de la fórmula (I.v):

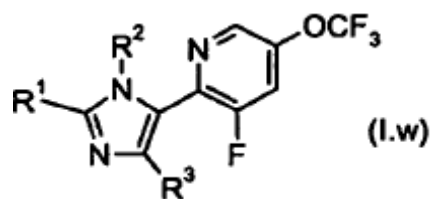


15

en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1.

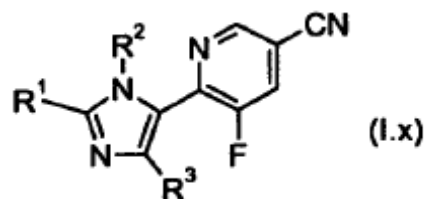
w) 280 compuestos de la fórmula (I.w):





en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1.

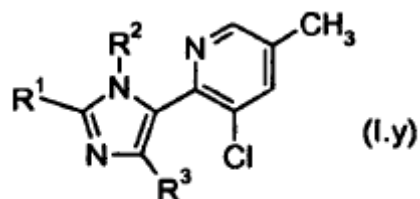
x) 280 compuestos de la fórmula (I.x):



5

en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1.

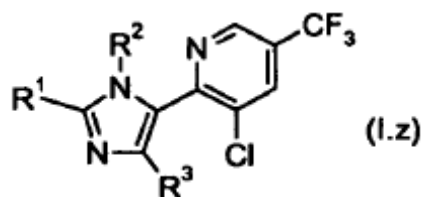
y) 280 compuestos de la fórmula (I.y):



10

en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1.

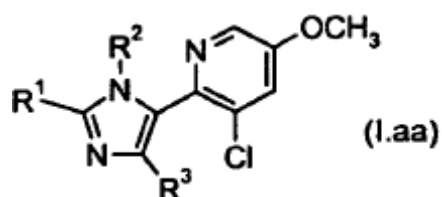
z) 280 compuestos de la fórmula (I.z):



15

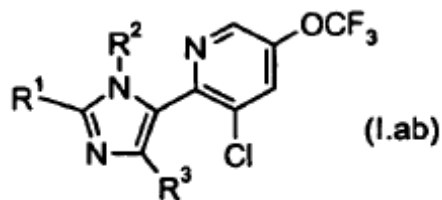
en la que  $R^1$ ,  $R^2$  y  $R^3$  son lo definido en la Tabla 1.

aa) 280 compuestos de la fórmula (I.aa):



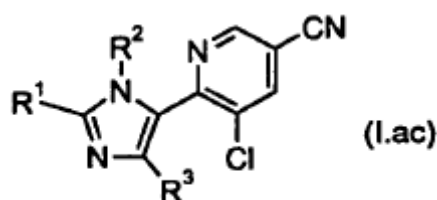
en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son lo definido en la Tabla 1.

ab) 280 compuestos de la fórmula (I.ab):



5 en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son lo definido en la Tabla 1.

ac) 280 compuestos de la fórmula (I.ac):



en la que R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> son lo definido en la Tabla 1.

10 A lo largo de esta descripción, las temperaturas se expresan en grados Celsius, "p.f." significa punto de fusión, "RMN" significa espectro de resonancia magnética nuclear; y "%" es porcentaje en peso, a menos que las concentraciones correspondientes se indiquen en otras unidades.

Las siguientes abreviaturas se utilizan a lo largo de esta descripción:

- 15
- |                        |                           |
|------------------------|---------------------------|
| p.f. = punto de fusión | br = ancho                |
| s = singulete          | dd = doblete de dobletes  |
| d = doblete            | dt = doblete de tripletes |
| t = triplete           | q = cuartete              |
| m = multiplete         | ppm = partes por millón   |

20 La Tabla 2 muestra datos de RMN seleccionados, en los que CDCl<sub>3</sub> es el disolvente de todos (a menos que se indique lo contrario, no se hace intento alguno por enumerar todos los datos caracterizantes en todos los casos) para los compuestos de la Tabla.

Tabla 2: Datos de RMN seleccionados para los compuestos de la Tabla 1

Núm. de Compuesto	Datos de <sup>1</sup> H RMN (ppm/número de H/multiplicidad)
I.j.209	8,23 ppm, 1H, d, J=2,70Hz; 7,54 ppm, 1H, dd, J=2,70 y 8,50Hz; 7,43 ppm, 1H, d, J=8,36Hz; 6,71 ppm, 2H, t, J=7,97Hz
I.j.210	8,23 ppm, 1H, d, J=2,49Hz; 7,47 ppm, 1H, dd, J=2,63 y 8,43Hz; 7,40 ppm, 1H, d, J=8,41Hz; 6,68 ppm, 2H, t, J=7,45Hz; 2,34 ppm, 3H, s
I.j.225	8,32 ppm, 1H, d, J=2,26Hz; 7,39 ppm, 1H, dd, J=2,41 y 8,21Hz; 7,21 ppm, 1H, d, J=8,21Hz; 6,65 ppm, 2H, t, J=7,51Hz; 2,60 ppm, 3H, s; 2,32 ppm, 3H, s
I.j.269	8,70 ppm, 1H, d, J=2,27Hz; 8,17 ppm, 1H, d, J=8,37Hz; 8,06 ppm, 1H, s; 7,86 ppm, 2H, m; 7,67 ppm, 1H, t, J=7,34Hz; 6,64 ppm, 2H, t, J=7,82Hz

(cont.)

Núm. de Compuesto	Datos de <sup>1</sup> H RMN (ppm/número de H/multiplicidad)
I.j.270	8,61 ppm, 1H, d, J=2,24Hz; 8,08 ppm, 1H, d, J=8,40Hz; 7,92 ppm, 1H, d, J=2,13Hz; 7,77 ppm, 1H, d, J=7,54Hz; 7,76 ppm, 1H, t, J=8,25Hz; 7,58 ppm, 1H, t, J=7,57Hz; 6,52 ppm, 2H, t, J=7,79Hz; 2,29 ppm, 3H, s
I.m.210	<sup>1</sup> H RMN (300Mhz, CDCl <sub>3</sub> ) 8,15 ppm, 1H, d, J=2,7Hz; 7,39 ppm, 1H, dd, J=2,7 y 8,4Hz; 7,31 ppm, 1H, d, J=8,4Hz; 6,34 ppm, 2H, d, J=9,25Hz; 3,71 ppm, 3H, s; 2,25 ppm, 3H, s,
I.m.220	<sup>1</sup> H RMN (300Mhz, CDCl <sub>3</sub> ) 7,90 ppm, 1H, d, J=2,6Hz; 7,28 ppm, 1H, dd, J=2,72 y 8,72Hz; 6,67 ppm, 1H, d, J=8,78Hz; 6,33 ppm, 2H, d, J=9,1 Hz; 3,86 ppm, 3H, s; 3,69 ppm, 3H, s; 2,21 ppm, 3H, s.
I.m.225	8,22 ppm, 1H, d, J=2,26Hz; 7,31 ppm, 1H, dd, J=2,39 y 8,21Hz; 7,10 ppm, 1H, d, J=8,21Hz; 6,32 ppm, 2H, d, J=9,1Hz; 3,69 ppm, 3H, s; 2,50 ppm, 3H, s; 2,22 ppm, 3H, s.

5 Los compuestos de acuerdo con la presente invención pueden prepararse de acuerdo con los esquemas de reacción mencionados con anterioridad, en los que, a menos que se indique lo contrario, la definición de cada variable es lo definido con anterioridad para un compuesto de la fórmula (I).

#### Ejemplos biológicos

##### Alternaria solani / tomate / preventiva (Acción contra Alternaria en tomate)

10 Plantas de tomate de 4 semanas de edad cv. Roter Gnom se tratan con el compuesto de ensayo formulado en una cámara de pulverización. Dos días después de la aplicación, se inoculan plantas de tomate por pulverización de una suspensión de espora sobre las plantas de ensayo. Tras un período de incubación de 4 días a 22 °C /18 °C y h.r. 95% en un invernadero, se evaluó la incidencia de la enfermedad.

Los compuestos I.j.209, I.j.210, I.j.225, I.j.269, I.j.270, I.m.210, I.m.220 y I.m.225 de acuerdo con la invención a 200 ppm inhiben la infestación fúngica en este ensayo a al menos un 80%, mientras que bajo las mismas condiciones, las plantas de control no tratadas son infectadas por los hongos fitopatógenos a más de un 80%.

##### 15 Botrytis cinerea / tomate / preventiva (Acción contra Botrytis en tomate)

Plantas de tomate de 4 semanas de edad cv. Roter Gnom se tratan con el compuesto de ensayo formulado en una cámara de pulverización. Dos días después de la aplicación, se inoculan plantas de tomate por pulverización de una suspensión de espora sobre las plantas de ensayo. Tras un período de incubación de 3 días a 20°C y h.r. 95% en un invernadero, se evaluó la incidencia de la enfermedad.

20 Los compuestos I.j.209, I.j.210, I.j.270, I.m.210, I.m.220 y I.m.225 de acuerdo con la invención a 200 ppm inhiben la infestación fúngica en este ensayo a al menos un 80 %, mientras que bajo las mismas condiciones, las plantas de control no tratadas son infectadas por los hongos fitopatógenos a más de un 80%.

##### Puccinia recondita / trigo / preventiva (Acción contra la roya parda en trigo)

25 Plantas de trigo de 1 semana de edad cv. Arina se tratan con el compuesto de ensayo formulado en una cámara de pulverización. Un día después de la aplicación, se inoculan plantas de trigo por pulverización de una suspensión de espora (1 x 10<sup>5</sup> uredosporas/ml) sobre las plantas de ensayo. Tras un período de incubación de 1 día a 20°C y h.r. 95%, las plantas se mantienen durante 10 días a 20°C / 18°C (día/noche) y r.h. 60 % en un invernadero. Se evaluó la incidencia de la enfermedad 11 días después de la inoculación.

30 Los compuestos I.j.210, I.j.270, I.m.210, I.m.220 y I.m.225 de acuerdo con la invención a 200 ppm inhiben la infestación fúngica en este ensayo a al menos un 80 %, mientras que bajo las mismas condiciones, las plantas de control no tratadas son infectadas por los hongos fitopatógenos a más de un 80%.

Magnaporthe grisea (Pyricularia oryzae) / arroz / preventiva (Acción contra el añublo del arroz)

Plantas de arroz 3 semanas de edad cv. Koshihikari se tratan con el compuesto de ensayo formulado en una cámara de pulverización. Dos días después de la aplicación se inoculan plantas de arroz por pulverización de una suspensión de espora (1 x 10<sup>5</sup> conidia/ml) sobre las plantas de ensayo. Tras un período de incubación de 6 días a 25°C y h.r. 95%, se evaluó la incidencia de la enfermedad.

- 5 Los compuestos I.j.209, I.j.210, I.j.225, I.j.270, I.m.210, I.m.220 y I.m.225 de acuerdo con la invención a 200 ppm inhiben la infestación fúngica en este ensayo a al menos un 80 %, mientras que bajo las mismas condiciones, las plantas de control no tratadas son infectadas por los hongos fitopatógenos a más de un 80%.

Pyrenophora teres (Helminthosporium teres) / cebada / preventiva (Acción contra la mancha reticulada en cebada)

- 10 Plantas de cebada de 1 semana de edad cv. Regina se tratan con el compuesto de ensayo formulado en una cámara de pulverización. Dos días después de la aplicación, se inoculan plantas de cebada por pulverización de una suspensión de espora (2,6 x 10<sup>4</sup> conidia/ml) sobre las plantas de ensayo. Tras un período de incubación de 4 días a 20°C y h.r. 95%, se evaluó la incidencia de la enfermedad.

- 15 Los compuestos I.j.209, I.j.210, I.j.269, I.j.270, I.m.210, I.m.220 y I.m.225 de acuerdo con la invención a 200 ppm inhiben la infestación fúngica en este ensayo a al menos un 80 %, mientras que bajo las mismas condiciones, las plantas de control no tratadas son infectadas por los hongos fitopatógenos a más de un 80%.

Septoria tritici/ trigo / preventiva (Acción contra septoriosis Septoria en trigo)

- 20 Plantas de trigo de 2 semanas de edad cv. Riband se tratan con el compuesto de ensayo formulado en una cámara de pulverización. Un día después de la aplicación, se inoculan plantas de trigo por pulverización de una suspensión de espora (106 conidia/ml) sobre las plantas de ensayo. Tras un período de incubación de 1 día a 22°C / 21°C y h.r. 95%, las plantas se mantienen a 22°C / 21°C y h.r. 70% en un invernadero. Se evaluó la incidencia de la enfermedad 16 - 18 días después de la inoculación.

Los compuestos I.j.209, I.j.210, I.j.225, I.j.269, I.j.270, I.m.210, I.m.220 y I.m.225 de acuerdo con la invención a 200 ppm inhiben la infestación fúngica en este ensayo a al menos un 80 %, mientras que bajo las mismas condiciones, las plantas de control no tratadas son infectadas por los hongos fitopatógenos a más de un 80 %.

- 25 Uncinula necator / vid / preventiva (Acción contra mildiú velloso en vid)

Plántulas de vid de 5 semanas de edad cv. Gutedel se tratan con el compuesto de ensayo formulado en una cámara de pulverización. Un día después de la aplicación, se inoculan plantas de vid por la agitación de plantas infectadas con mildiú velloso de vid sobre las plantas de ensayo. Tras un período de incubación de 7 días a 24°C / 22°C y h.r. 70% bajo un régimen de luz de 14/10 h (luz/oscuridad), se evaluó la incidencia de la enfermedad.

- 30 Los compuestos I.j.210, I.j.225, I.j.269, I.j.270, I.m.210, I.m.220 y I.m.225 de acuerdo con la invención a 200 ppm inhiben la infestación fúngica en este ensayo a al menos un 80 %, mientras que bajo las mismas condiciones, las plantas de control no tratadas son infectadas por los hongos fitopatógenos a más de un 80%.

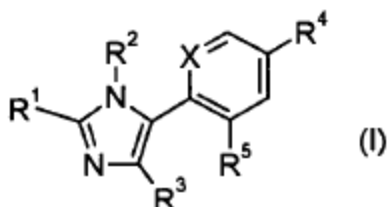
35

40

45

## REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula I:



5 en la que

R<sup>1</sup> es halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

R<sup>2</sup> es un arilo o heteroarilo opcionalmente sustituido;

R<sup>3</sup> es halógeno;

R<sup>4</sup> es hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, hidroxilo, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, OR<sup>6</sup>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o ciano;

10 R<sup>5</sup> es halógeno;

R<sup>6</sup> es hidrógeno, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, alquilcicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquiloxialquilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>; X es N o C(R); y

R es hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o ciano; o una forma de sal agroquímicamente utilizable;

15 a condición de que

cuando X sea C(R), R<sup>2</sup> no pueda ser un arilo opcionalmente sustituido.

2. El compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 en el que R<sup>1</sup> es halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>.

3. El compuesto de acuerdo con cualquier reivindicación 1 o 2 en el que R<sup>2</sup> es un fenilo, naftilo, tienilo, piridilo, quinolilo o isoquinolilo opcionalmente sustituido.

20 4. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 en el que R<sup>3</sup> es fluoro, cloro, bromo o yodo.

5. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 en el que R<sup>4</sup> es hidrógeno, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, OR<sup>6</sup>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o ciano.

25 6. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en el que R<sup>5</sup> es fluoro, cloro, bromo o yodo.

7. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 en el que R<sup>6</sup> es hidrógeno, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, alquilcicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquenilo C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxialquilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>.

30 8. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 en el que X es N, C(H), C(halógeno), C(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), C(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>), C(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) o C(haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>).

9. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 en el que

R<sup>1</sup> es fluoro, cloro, bromo, yodo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

R<sup>2</sup> es un fenilo, naftilo, tienilo, piridilo o quinolilo opcionalmente sustituido;

R<sup>3</sup> es fluoro, cloro o bromo;

35 R<sup>4</sup> es hidrógeno, fluoro, cloro, bromo, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> o ciano;

R<sup>5</sup> es fluoro, cloro o bromo; y

X es N, C(H), C(Cl), C(F), C(Br), C(I), C(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), C(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), C(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) o C(haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>).

**10.** El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 en el que

R<sup>1</sup> es fluoro, cloro, bromo, metilo o etilo;

5 R<sup>2</sup> es fenilo, 3-fluorofenilo, 4-fluorofenilo, 3-clorofenilo, 4-clorofenilo, 3-bromofenilo, 4-bromofenilo, m-tolilo, p-tolilo, 3-trifluorometilfenilo, 4-trifluorometilfenilo, 3-metoxifenilo, 4-metoxifenilo, 3-trifluorometoxifenilo, 4-trifluorometoxifenilo, 3-cianofenilo, 4-cianofenilo, 3,4-difluorofenilo, 3,4-diclorofenilo, 3,4-dimetilfenilo, 3,4-dimetoxifenilo, 3-cloro-4-fluorofenilo, 3-cloro-4-metilfenilo, 3-cloro-4-metoxifenilo, 4-cloro-3-fluorofenilo, 4-cloro-3-metilfenilo, 4-cloro-3-metoxifenilo, naft-2-ilo, 3-fluoro-4-metoxifenilo, 3-fluoro-4-metilfenilo, 4-fluoro-3-metoxifenilo, 4-fluoro-3-metilfenilo, 3-metoxi-4-metilfenilo, 4-metoxi-3-metilfenilo, piridin-2-ilo, piridin-3-ilo, piridin-4-ilo, 6-cloropiridin-2-ilo, 6-fluoropiridin-2-ilo, 6-metoxipiridin-2-ilo, 6-metilpiridin-2-ilo, 6-cloropiridin-3-ilo, 6-fluoropiridin-3-ilo, 6-metoxipiridin-3-ilo, 6-metilpiridin-3-ilo, 2-cloropiridin-4-ilo, 2-fluoropiridin-4-ilo, 2-metoxipiridin-4-ilo, 2-metilpiridin-4-ilo, 5-clorotiofen-2-ilo, 5-bromotiofen-2-ilo, 5-metoxitiofen-2-ilo, quinolin-2-ilo, quinolin-3-ilo, 4-metoxiquinolin-2-ilo o 4-metilquinolin-2-ilo;

R<sup>3</sup> es fluoro o cloro;

R<sup>4</sup> es hidrógeno, fluoro, cloro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o ciano;

15 R<sup>5</sup> es fluoro o cloro; y

X es N, C(H), C(Cl), C(F), C(Br), C(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>), C(haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>), C(alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>) o C(haloalcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>).

**11.** El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 en el que

R<sup>1</sup> es fluoro, cloro, metilo o etilo;

20 R<sup>2</sup> es 4-fluorofenilo, 4-clorofenilo, 4-bromofenilo, p-tolilo, 6-cloropiridin-3-ilo, 6-fluoropiridin-3-ilo, 6-metoxipiridin-3-ilo, 6-metilpiridin-3-ilo, 2-cloropiridin-4-ilo, 2-fluoropiridin-4-ilo, 2-metoxipiridin-4-ilo, 2-metilpiridin-4-ilo, quinolin-2-ilo, quinolin-3-ilo, 4-metoxiquinolin-2-ilo o 4-metilquinolin-2-ilo;

R<sup>3</sup> es fluoro o cloro;

R<sup>4</sup> es hidrógeno, fluoro, cloro, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o alcoxi C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

R<sup>5</sup> es fluoro o cloro; y

25 X es N, C(H), C(Cl) o C(F).

**12.** El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11 en el que

R<sup>1</sup> es cloro o metilo;

R<sup>2</sup> es 6-cloropiridin-3-ilo, 6-metilpiridin-3-ilo, 6-metoxipiridin-3-ilo o quinolin-3-ilo;

R<sup>3</sup> es cloro;

30 R<sup>4</sup> es fluoro o metoxi;

R<sup>5</sup> es fluoro; y

X es C(F).

**13.** Un compuesto seleccionado de

2-cloro-5-[2,4-dicloro-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina;

35 2-cloro-5-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-piridina;

5-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-2-metoxi-piridina;

2-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-quinolina;

2-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-4-metoxi-quinolina;

3-[4-cloro-2-metil-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-quinolina;

40 3-[2,4-dicloro-5-(2,4,6-trifluoro-fenil)-imidazol-1-il]-quinolina;

3-[2,4-dicloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-imidazol-1-il]-quinolina;

- 2-[4-cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazol-1-il]-4-metoxi-quinolina;
- 3-[4-cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazol-1-il]-quinolina;
- 2-cloro-5-[4-cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazol-1-il]-piridina;
- 2-cloro-5-[2,4-dicloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-imidazol-1-il]-piridina;
- 5 5-[4-cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazol-1-il]-2-metoxi-piridina;
- 5-[4-cloro-5-(2,6-difluoro-4-metoxi-fenil)-2-metil-imidazol-1-il]-2-metil-piridina;
- 3,5-dicloro-2-[5-cloro-3-(6-cloro-piridin-3-il)-2-metil-3H-imidazol-4-il]-piridina; y
- 2-[4-cloro-5-(3,5-dicloro-piridin-2-il)-2-metil-imidazol-1-il]-quinolina.
- 10 **14.** Una composición fungicida para controlar o proteger contra microorganismos fitopatógenos, que comprende como ingrediente activo al menos un compuesto como el definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, en forma libre o en forma de sal agroquímicamente utilizable, y al menos un adyuvante.
- 15 **15.** La composición de acuerdo con la reivindicación 20, que comprende al menos un compuesto fungicidamente activo adicional, preferentemente seleccionado del grupo que consiste en azoles, pirimidinil carbinoles, 2-amino-pirimidinas, morfolinas, anilino-pirimidinas, pirrolos, fenilamidas, bencimidazoles, dicarboximidas, carboxamidas, estrobilurinas, ditiocarbamatos, N-halometiltiotetrahidroftalimidias, compuestos de cobre, nitrofenoles, derivados organofosforosos, piridazinas, triazolopirimidinas, carboxamidas o benzamidas.
- 16.** El uso de un compuesto como el definido en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13 para controlar o prevenir la infestación de plantas, cultivos alimenticios cosechados, semillas o materiales no vivientes por microorganismos fitopatógenos.
- 20 **17.** Un procedimiento para controlar o prevenir una infestación de plantas de cultivo, cultivos alimenticios cosechados o materiales no vivientes por microorganismos fitopatógenos o descomponedores u organismos potencialmente perjudiciales para el hombre, que comprende la aplicación de un compuesto como el definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, como ingrediente activo a las plantas, a partes de las plantas o a sus locus, a semillas o a cualquier otra parte de los materiales no vivientes.
- 25 **18.** El procedimiento de acuerdo con la reivindicación 17, en el que los microorganismos fitopatógenos son organismos fúngicos.