

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 417 355**

51 Int. Cl.:

C07D 239/30 (2006.01)

A01N 43/54 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **03.05.2010 E 10720212 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **26.06.2013 EP 2432767**

54 Título: **Compuestos y métodos para el control de hongos**

30 Prioridad:

19.05.2009 US 179402 P

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

07.08.2013

73 Titular/es:

**DOW AGROSCIENCES LLC (100.0%)
9330 Zionsville Road
Indianapolis IN 46268-1054, US**

72 Inventor/es:

**DAVIS, GEORGE;
LO, WILLIAM;
RENGA, JAMES;
TISDELL, FRANCIS;
YAP, MAURICE y
YOUNG, DAVID**

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 417 355 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

Compuestos y métodos para el control de hongos.

Campo de la invención

5 Esta invención se refiere a la síntesis de aminopirimidinas sustituidas con arilo y métodos de usar estos compuestos para controlar varios hongos que incluyen algunos patógenos de plantas.

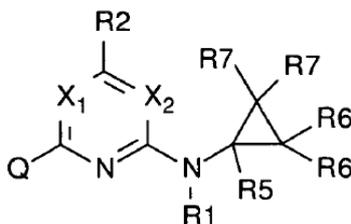
Antecedentes

10 Los hongos comprenden uno de los más grandes y quizás más diversos reinos de la vida eucariótica. Los taxonomistas han caracterizado ya unas 70.000 especies diferentes y estiman que el reino completo puede abarcar algo así como un millón y medio de especies diferentes. Varios de estos organismos son una fuente de alimento tal como los champiñones y algunos son la fuente de útiles productos químicos tales como algunos antibióticos. El papel principal de la mayor parte de los hongos en el ecosistema es reciclar la materia orgánica y muchos hongos están involucrados en el proceso de descomposición de la materia vegetal. Desafortunadamente, se conocen un gran número de hongos que crecen a expensas de materiales útiles y quizás, de forma comercialmente importante, plantas más importantes que las que son esenciales para la supervivencia humana.

15 Considerando su diversidad e impacto sobre industrias tales como la agricultura, los compuestos y métodos para controlar los hongos reciben una gran atención. Actualmente, se han identificado y sintetizado varios fungicidas y se usan actualmente para proteger de los hongos patógenos tanto las plantas ornamentales como los cultivos de alimentos. Y mientras muchos fungicidas seguros y eficaces están actualmente en uso, la evolución de los hongos patógenos y las presiones siempre crecientes para usar bajos niveles de fungicidas en parte para reducir costes continúa creando la necesidad de nuevos fungicidas y/o medios eficaces de usar los fungicidas existentes. Un objeto de esta presente descripción se dirige al cumplimiento de esta necesidad.

Sumario

Una realización es una aminopirimidina sustituida con arilo según la Fórmula 1:



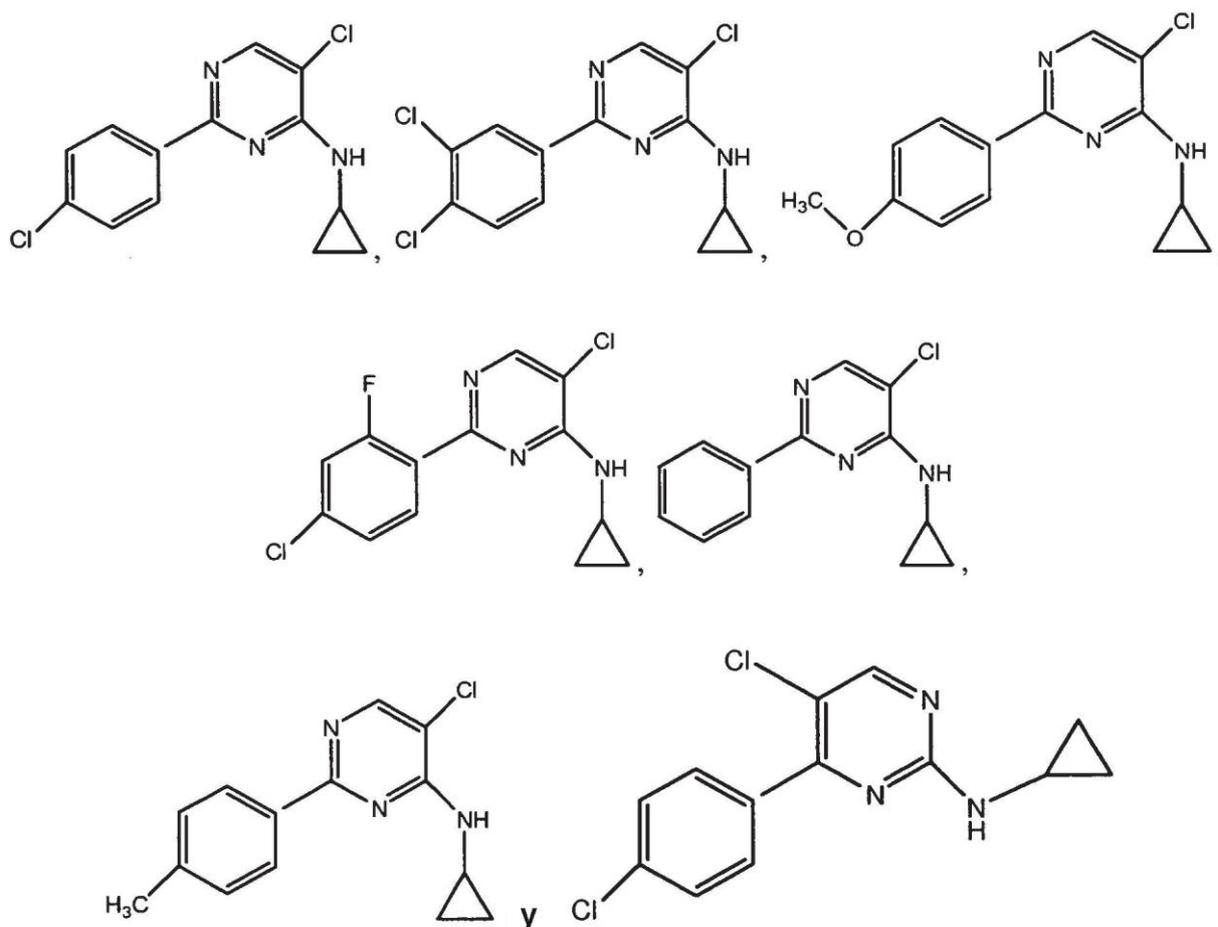
25 en donde X₁ es N o C-R₃; X₂ es N o C-R₄ con tal de que X₁ y X₂ no sean ambos N; R₁-R₇ son H, CN, CHO, -SCN, NO₂, F, Cl, Br, I, alquilo C₁-C₄ sustituido o no sustituido, halo-alquilo C₁-C₄ sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-C₄ sustituido o no sustituido, halo-alcoxi C₁-C₄ sustituido o no sustituido, tio-alquilo C₁-C₄ sustituido o no sustituido, halo-tioalquilo C₁-C₄ sustituido o no sustituido, cicloalquilo C₃-C₇ sustituido o no sustituido, alqueno C₂-C₄ sustituido o no sustituido, alquino C₂-C₄ sustituido o no sustituido, acilalquilo C₁-C₄ sustituido o no sustituido, aciloxi C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-amino, alquil(C₁-C₄)-S(O)=NH, arilo sustituido o no sustituido, heterociclo sustituido o no sustituido, en donde los sustituyentes son uno o más de los siguientes F, Cl, OH, CN, NO₂, CHO, -SCN, alquilo(C₁-C₄)-S(O)_n (en donde n=0,2), alquilo C₁-C₄, halo-alquilo C₁-C₄, alquilamina C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, halo-alcoxi C₁-C₄, tioalquilo C₁-C₄, halo-tioalquilo C₁-C₄, acilalquilo C₁-C₄, aciloxi C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-imino, hidroximino; alquilo (C₁-C₄)-S(O)=NH; y Q es un arilo, sustituido o no sustituido, en donde los sustituyentes de Q se toman a partir de R₁-R₇.

35 Otra realización es una composición fungicida que comprende al menos un compuesto según la Fórmula 1 y un soporte fitológicamente aceptable.

Todavía en otra realización la formulación antifúngica incluye además al menos un compuesto adicional seleccionado del grupo constituido por insecticidas y herbicidas.

40 Otra realización es un método para controlar una infestación fúngica que comprende las etapas de proporcionar al menos un compuesto según la reivindicación 1; y que aplica el compuesto a una superficie adyacente a una infestación fúngica.

Todavía en otra realización es un compuesto seleccionado del grupo de aminopirimidinas sustituidas con arilo que consiste en:



Todavía en otra realización es una composición anti-fúngica, que comprende al menos un compuesto según las anteriores aminopirimidinas sustituidas con arilo y un vehículo fitológicamente aceptable.

5 Todavía en otra realización, la composición incluye al menos un compuesto adicional seleccionado del grupo constituido por: insecticidas, fungicidas y herbicidas.

Otra realización es un método de controlar una infestación fúngica que comprende las etapas de: proporcionar al menos un compuesto según el grupo de aminopirimidinas sustituidas con arilo ilustradas en la presente memoria; y aplicar el compuesto a una superficie adyacente a una infestación fúngica.

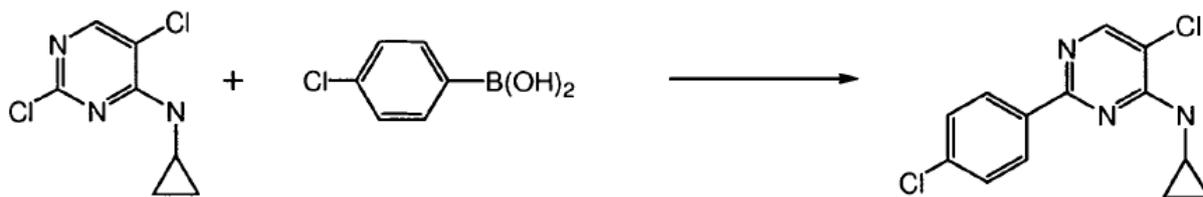
10 Otra realización es un método de controlar una infestación fúngica, que comprende las etapas de proporcionar al menos un compuesto de acuerdo con la Fórmula 1; y aplicar el compuesto a una superficie adyacente a una infestación fúngica.

Descripción

15 Con el propósito de fomentar la comprensión de los principios de la nueva tecnología, se hará referencia ahora a las diversas realizaciones ejemplares de la misma, y el lenguaje específico se usará para describir la misma. Deberá entenderse, sin embargo, que no se pretende limitar, por tanto, el alcance de la nueva tecnología, tales como alteraciones, modificaciones y aplicaciones adicionales de los principios de la nueva tecnología que se contempla como le pasaría normalmente a un experto en la técnica a la que se refiere la nueva tecnología.

Ejemplo 1

Esquema 1, una síntesis del compuesto 1:



En resumen, 2,5-dicloro-4-ciclopropilaminopirimidina (1 mmol, 204 mg) se disolvió en dimetoxietano (8 ml) y ácido 4-clorofenil-bórico (1,5 mmol, 234 mg), carbonato sódico (2 mmol, 2 ml de una solución acuosa 1 molar), y se añadió tetraquis(trifenilfosfin)paladio (0,05 mmol, 60 mg). La reacción se calentó a reflujo durante 4 horas y se agitó durante la noche a 25°C. A continuación, la mezcla de reacción se filtró a través de gel de sílice usando acetato de etilo; después se concentró y se cromatografió usando acetato de etilo al 15% en hexano para dar el producto en forma de un sólido de color blanco, de 138 mg de peso, rendimiento del 49%, Tf. 103-105°C. CG (cromatografía de gases)/EM (espectrometría de masas) 279; RMN ¹H (CDCl₃) ppm 8,36 (d, 2 H, J = 0,03 Hz); 8,26 (s, 1 H); 7,42 (d, 2 H, J = 0,03 Hz); 5,55 (sb, 1 H); 2,98 (m, 1 H); 0,98 (m, 1 H); 0,68 (m, 1 H).

10 Método de ensayo de la actividad fungicida de varios compuestos descritos en la presente memoria

Se ha encontrado que los compuestos de la presente invención tienen un significativo efecto fungicida, particularmente para su uso en la agricultura. Muchos de los compuestos son particularmente eficaces para uso en cultivos agrícolas y plantas de horticultura. En particular, los compuestos tienen el potencial de controlar de forma eficaz diversos hongos indeseables que infestan útiles cultivos de plantas como se ilustra mediante los ejemplos de la presente memoria. Se ha demostrado la actividad en hongos, incluidos, por ejemplo, las siguientes especies de hongos representativos: la roya parda del trigo (*Puccinia recondita tritici* - PUCCRT) y la rojez del trigo por *Septoria tritici* - SEPTTR).

Con relación ahora a la Tabla 1, algunos de los compuestos ejemplares se ensayaron para medir su capacidad para impedir o curar infecciones fúngicas. Las propiedades preventivas de un compuesto dado se determinaron tratando una planta de ensayo susceptible con el compuesto ejemplar y exponiendo después la planta a esporas fúngicas. Las propiedades curativas de un compuesto dado se determinaron exponiendo primero una planta susceptible a un hongo infeccioso y aplicando después los compuestos fungicidas ejemplares.

Los expertos en la técnica comprenderán que la eficacia de los compuestos frente a los hongos anteriores determina la utilidad general de los compuestos como fungicidas. La actividad de los compuestos como fungicidas eficaces se determinó aplicando los compuestos a las plantas y observando el control de la enfermedad fúngica. Los compuestos fueron formulados a relaciones de 50 ppm y 200 ppm en 10% en volumen de acetona más 90% en volumen de agua con Triton X (agua desionizada 99,99% en peso + 0,01% en peso de Triton X100), dando un "compuesto de ensayo formulado". Los compuestos de ensayo formulados fueron aplicados a las plantas usando un pulverizador giratorio equipado con dos toberas opuestas de atomización de aire que distribuían aproximadamente 1500 l/h de volumen de pulverización.

Con relación, de nuevo, a la Tabla 1, los ensayos se llevaron a cabo para determinar la capacidad de un compuesto ejemplar determinado para impedir o al menos limitar una infección fúngica de la forma siguiente. Todas las plantas del estudio fueron inoculadas con esporas de los hongos en este caso PUCCRT o SEPTTR) el día después del tratamiento con el supuesto fungicida. A continuación, las plantas fueron incubadas en un medioambiente favorable para el desarrollo de la enfermedad. La gravedad de la enfermedad se evaluó 7 a 25 días después, dependiendo de la velocidad del desarrollo de la enfermedad. Los experimentos siguientes fueron realizados en laboratorio para determinar la eficacia fungicida de los compuestos de la invención.

Medida del efecto protector de varios compuestos frente a la roya de la hoja del trigo (agente causal de Bayer, código PUCCRT).

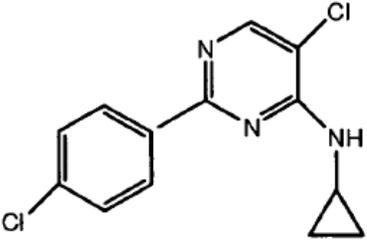
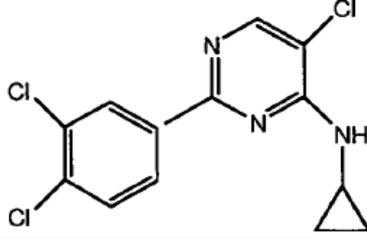
40 Las plantas de trigo (variedad "Yuma") se desarrollaron a partir de semilla en una mezcla de plantación extraída de turba sin tierra (Metromix) hasta que las plántulas tenían una primera hoja completamente expandida. Cada recipiente contenía 3-8 plántulas. Estas plantas fueron pulverizadas hasta humedecerse con los compuestos de ensayo formulados. Al día siguiente, las hojas fueron inoculadas con una suspensión acuosa de esporas de *Puccinia recondita tritici* y las plantas se mantuvieron en un ambiente con gran humedad durante la noche para permitir que las esporas germinaran e infestaran la hoja. Las plantas fueron transferidas después a un invernadero hasta que la enfermedad se desarrollaba sobre las plantas de control sin tratar. Estos ensayos se llevaron a cabo usando dos niveles diferentes del compuesto, 50 ppm y 200 ppm, véase la Tabla 1.

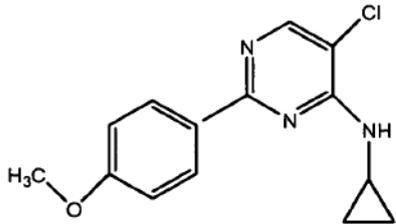
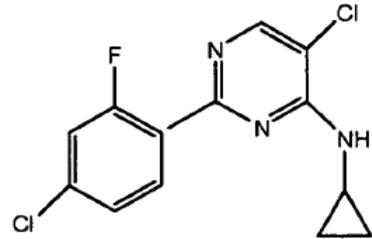
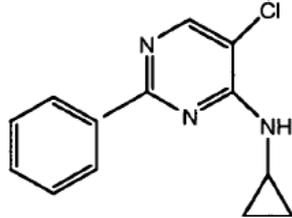
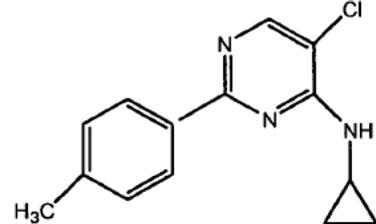
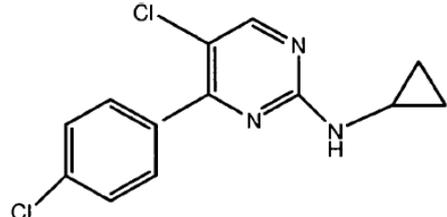
Medida del efecto preventivo de varios compuestos frente a la rojez del trigo por *Septoria* (agente causal de Bayer, código SEPTTR).

50 Las plantas de trigo (variedad "Yuma") se desarrollaron a partir de semilla en una mezcla de aproximadamente 50% de tierra pasteurizada/50% de una mezcla sin tierra hasta que las plántulas tenían una primera hoja completamente

- 5 expandida. Cada recipiente contenía 3-10 plántulas. Estas plantas fueron pulverizadas hasta humedecerse con el compuesto de ensayo formulado. Al día siguiente, las hojas fueron inoculadas con una suspensión acuosa de esporas de *Septoria tritici* y las plantas se mantuvieron en un ambiente de gran humedad (un día en una cámara de condensación a oscuras seguido de tres días en una cámara de condensación iluminada) para permitir que las esporas germinaran e infectaran la hoja. Las plantas fueron transferidas después a un invernadero hasta que la enfermedad se desarrollaba en plantas de control sin tratar. Estos ensayos se llevaron a cabo usando dos niveles diferentes del compuesto, 50 ppm y 200 ppm, véase la Tabla 1.
- Medida del efecto curativo de varios compuestos frente a la rojez del trigo por septoriasis (agente causal de Bayer, código SEPTTR).
- 10 Las plantas de trigo (variedad "Yuma") se desarrollaron a partir de semilla en una mezcla de aproximadamente 50% de tierra pasteurizada/50% de una mezcla sin tierra hasta que las plántulas tenían una primera hoja completamente expandida. Cada recipiente contenía 3-10 plántulas. Estas plantas fueron inoculadas con una suspensión acuosa de esporas de *Septoria tritici* y las plantas se mantuvieron en un ambiente de gran humedad (un día en una cámara de condensación a oscuras seguido de dos días en una cámara de condensación iluminada) para permitir que las esporas germinaran e infectaran la hoja. Las plantas fueron después retiradas de la cámara de condensación y se dejaron secar. Después de secar, las plantas inoculadas fueron pulverizadas hasta humedecerse con el compuesto de ensayo formulado. Al día siguiente, las plantas fueron transferidas a un invernadero hasta que la enfermedad se desarrollaba en las plantas de control sin tratar. Estos ensayos se llevaron a cabo usando dos niveles diferentes del compuesto, 50 ppm y 200 ppm, véase la Tabla 1.
- 15
- 20 El control de la enfermedad se determinó estimando visualmente el porcentaje de gravedad de la enfermedad en recipientes tratados y sin tratar 7 a 24 días después de la inoculación, dependiendo de la velocidad de desarrollo de la enfermedad. Las evaluaciones se hicieron típicamente 7 u 8 días después de la inoculación para PUCCRT y 18 a 22 días después de la inoculación para SEPTTR. El porcentaje de control de la enfermedad (% CE) se calculó mediante: % CE = (1 - % de gravedad de la enfermedad tratada/% de gravedad de la enfermedad sin tratar)*100.
- 25 Los compuestos de esta invención pueden aplicarse preferiblemente en la forma de una composición que comprende uno o más de los compuestos de Fórmula 1 con un vehículo fitológicamente aceptable. Las composiciones incluyen, por ejemplo, formulaciones concentradas que están dispersadas en agua u otro líquido para su aplicación, o son polvo o formulaciones granuladas que son aplicadas sin tratamiento adicional. Las composiciones pueden ser preparadas según procedimientos que son convencionales en la técnica química en agricultura, pero que son nuevas e importantes debido a la presencia en ellas de los compuestos descritos en la presente memoria.
- 30

Tabla 1. Aminopirimidinas sustituidas con arilo representativas y su actividad curativa y protectora medida a 50 y 200 ppm frente a los hongos patológicos *Septoria tritici* (SEPTTR) y *Puccinia recondita* (PUCCRT)

Estructura molecular	Número de referencia	Porcentaje de control de la enfermedad					
		Un día de protección				Tres días de curación	
		[ppm]		[ppm]		[ppm]	
		50	200	50	200	50	200
		SEPTTR		PUCCRT		SEPTTR	
	1	90	97	93	97	0	0
	2	0	35	0	0	62	72

	[ppm]	Porcentaje de control de la enfermedad					
		Un día de protección				Tres días de curación	
		50	200	50	200	50	200
Estructura molecular	Número de referencia	SEPTTR		PUCCRT		SEPTTR	
	3	74	85	99	97	0	0
	4	38	86	50	99	0	18
	5	38	90	99	99	0	0
	6	65	95	97	99	0	27
	7	91	61	53	0	50	50

Las dispersiones en las que se aplican los compuestos, lo más frecuentemente, son suspensiones o emulsiones acuosas preparadas a partir de formulaciones concentradas de los compuestos. Tales formulaciones solubles en agua, suspendibles en agua o emulsionables son bien sólidas, normalmente conocidas como polvos humectables, o líquidas, normalmente conocidas como concentrados emulsionables, o suspensiones acuosas. La presente invención contempla todos los vehículos por los que los compuestos de esta invención pueden ser formulados para distribuir para su uso como fungicida. Como se comprenderá fácilmente, puede usarse cualquier material al que puedan añadirse estos compuestos, con tal de que produzcan la utilidad deseada sin interferir significativamente con la actividad fungicida de los compuestos de esta invención.

5

Los polvos humectables, que pueden ser compactados para formar gránulos dispersables en agua, comprenden una mezcla íntima del compuesto activo, un soporte inerte y tensioactivos. La concentración del compuesto activo es

10

normalmente de aproximadamente 10 por ciento peso/peso (% en peso) hasta aproximadamente 90% en peso, y lo más preferiblemente aproximadamente 25% a aproximadamente 75% en peso. En la preparación de composiciones en polvo humectables, los ingredientes activos pueden ser compuestos con cualquiera de los sólidos finamente divididos, tales como profilita, talco, tiza, yeso, tierra de Fuhler, bentonita, atapulgita, almidón, caseína, gluten, arcillas montmorilloníticas, tierras de diatomeas, silicatos purificados o similares. En tales operaciones, el soporte finamente dividido es triturado o mezclado con el agente tóxico en un disolvente orgánico volátil. Los tensioactivos eficaces, que comprenden de aproximadamente 0,5% a aproximadamente 10% de polvo humectable, que pueden ser usados en combinación con los compuestos de la invención incluyen ligninas sulfonadas, naftalensulfonatos, alquilbencensulfonatos, alquilsulfatos, y tensioactivos no iónicos tales como aductos de óxido de etileno de alquilfenoles.

Los concentrados emulsionables de los compuestos de esta invención comprenden una concentración conveniente tal como a partir de 10% a aproximadamente 50% peso/peso en un líquido adecuado. En resumen, un método para crear estas emulsiones incluye la etapa de disolver el compuesto en un vehículo inerte (un disolvente miscible en agua o una mezcla de disolventes y emulsionantes orgánicos inmiscibles en agua). Los concentrados pueden ser diluidos con agua y aceite para formar mezclas pulverizables en forma de emulsiones de aceite en agua. Los disolventes orgánicos útiles que pueden usarse en la práctica de esta invención incluyen aromáticos, especialmente las fracciones del petróleo naftalénicas y olefínicas de alta temperatura de ebullición tal como nafta aromático pesado y similares. También pueden usarse otros disolventes orgánicos como, por ejemplo, disolventes terpénicos incluidos los derivados de colofonia, cetonas alifáticas, como ciclohexanona, y alcoholes complejos tales como 1-etoxietanol.

Los emulsionantes que pueden emplearse de forma ventajosa en la presente memoria pueden ser fácilmente determinados por los expertos en la técnica e incluyen varios emulsionantes no iónicos, aniónicos, catiónicos y anfóteros, o una mezcla de dos o más emulsionantes. Ejemplos de emulsionantes no iónicos útiles en la preparación de concentrados emulsionantes incluyen, por ejemplo, los éteres de polialquilenglicol y los productos de condensación de alquilfenoles y arilfenoles, alcoholes alifáticos, aminas alifáticas, o ácidos grasos con óxido de etileno, óxidos de propileno tales como alquilfenoles etoxilados, y ésteres carboxílicos solubilizados con poliol o polioxialquileño. Los emulsionantes catiónicos incluyen compuestos de amonio cuaternario y sales de aminas grasas. Los emulsionantes aniónicos incluyen sales (por ejemplo, de calcio) de ácidos alquilarilsulfónicos solubles en aceite, sales de poli(éter de glicol) sulfatadas solubles en aceite y sales de poli(éteres de glicol) fosfatadas apropiadas.

Líquidos orgánicos representativos que pueden emplearse en preparar los concentrados emulsionables de la presente invención incluyen líquidos aromáticos tales como xileno, fracciones de propilbenceno o fracciones mixtas de naftaleno, aceites minerales, líquidos orgánicos aromáticos sustituidos tales como ftalato de dioctilo, queroseno y dialquilamidas de varios ácidos grasos; particularmente las dimetilamidas de glicoles grasos y derivados de glicol tales como éter n-butílico, éter etílico o éter metílico de trietilenglicol. Mezclas de dos o más líquidos orgánicos son también a menudo empleadas de forma adecuada en la preparación del concentrado emulsionable. Los líquidos orgánicos preferidos son xileno y fracciones de propilbenceno, siendo xileno el más preferido. Los agentes dispersantes tensioactivos se emplean normalmente en composiciones líquidas y en la cantidad de aproximadamente 0,1 % en peso a aproximadamente 20 % en peso del peso combinado de agente dispersante y compuesto activo. Las composiciones activas pueden también contener otros aditivos compatibles, por ejemplo, reguladores del crecimiento de las plantas y otros compuestos biológicamente activos usados en agricultura.

Las suspensiones acuosas pueden comprender suspensiones de los compuestos insolubles en agua de esta invención, dispersados en un vehículo acuoso a una concentración en el intervalo de aproximadamente 5% a aproximadamente 50% peso/peso. En una realización, las suspensiones se preparan triturando finamente el compuesto y mezclándolo enérgicamente en un vehículo comprendido de agua y tensioactivos escogidos del tipo de tensioactivos de los que se ha comentado anteriormente. Ingredientes inertes, tales como sales inorgánicas y gomas sintéticas o naturales, pueden añadirse también para incrementar la densidad y la viscosidad del vehículo acuoso. A menudo es más eficaz triturar y mezclar el compuesto al mismo tiempo para preparar la mezcla acuosa y homogeneizarla en un instrumento tal como un molino de arena, un molino de bolas o un homogeneizador de tipo pistón.

Los compuestos se pueden aplicar también como composiciones granuladas que son particularmente útiles cuando se aplican la composición a la tierra. Las composiciones granuladas pueden incluir de aproximadamente 0,5% peso/peso a aproximadamente 10% peso/peso del compuesto dispersado en un soporte inerte que comprende completamente o en gran parte de atapulgita, bentonita, diatomita, arcilla o una sustancia barata similar, divididas de forma grosera. Tales composiciones se preparan normalmente disolviendo el compuesto en un disolvente adecuado y aplicándolo a un soporte granulado que se ha preformado en el tamaño de partícula apropiado, en el intervalo de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 3 mm. Tales composiciones pueden también formularse elaborando una masa o pasta de soporte y compuesto, y triturando, y secando hasta obtener la partícula granulada deseada.

Los polvos que incluyen los compuestos pueden ser preparados mezclando íntimamente el compuesto en forma pulverizada con un soporte árido adecuado en agricultura tal como, por ejemplo, arcilla caolínica, roca de origen volcánico triturada y similares. Muchos de tales polvos pueden incluir adecuadamente desde aproximadamente 1% en peso a aproximadamente 10% en peso del compuesto.

Las composiciones activas pueden contener tensioactivos auxiliares para realzar propiedades como la deposición, la humectación y la penetración de las composiciones en el cultivo y organismo diana. Estos tensioactivos auxiliares pueden emplearse opcionalmente como un componente de la formulación o como una parte de una mezcla de cubeta. La cantidad de tensioactivo auxiliar puede variar desde aproximadamente un porcentaje volumen/volumen de 0,01 (% v/v) a 1,0 % v/v basado en un volumen de pulverización del agua, preferiblemente 0,05 a 0,5 por ciento. Los tensioactivos auxiliares incluyen nonilfenoles etoxilados, alcoholes etoxilados sintéticos o naturales, sales de ésteres de ácidos sulfosuccínicos, organosiliconas etoxiladas, aminas grasas etoxiladas y mezclas de tensioactivos con aceites minerales o vegetales.

Las composiciones pueden incluir opcionalmente combinaciones que comprenden al menos 1% de uno o más de los compuestos de esta invención con otro ingrediente activo en agricultura (IA). Tal IA adicional puede incluir, por ejemplo, fungicidas, insecticidas, nematocidas, mitocidas, artropodicidas, bactericidas, herbicidas o combinaciones de los mismos que son compatibles con los compuestos de la presente invención en el medio seleccionado para su aplicación, y no antagonista de la actividad de los presentes compuestos. Por consiguiente, en las realizaciones de este tipo, el otro IA se emplea como un IA suplementario para lo mismo o para un uso diferente con plantas que los compuestos de la invención. Los compuestos en combinación pueden estar presentes generalmente en una relación de aproximadamente 1:10 a aproximadamente 100:1.

La presente invención incluye dentro de su alcance métodos para el control o prevención de ataque fúngico. Estos métodos comprenden aplicar los compuestos activos al locus del hongo, o a un locus en el que la infestación debe ser impedida (por ejemplo, aplicándolo a una planta de un cereal o de la uva. Los compuestos son adecuados para el tratamiento de varias plantas a niveles fungicidas mientras muestren baja fitotoxicidad. Los compuestos son útiles en una manera protectora o erradicante. Los compuestos de esta invención son aplicados por cualquiera de una diversidad de técnicas conocidas, bien como compuestos o bien como composiciones que incluyen los compuestos. Por ejemplo, los compuestos pueden ser aplicados a las raíces, a las semillas o al follaje de las plantas para el control de varios hongos sin dañar el valor comercial de las plantas. Los materiales se aplican en la forma de cualquiera de los tipos de formulación generalmente usados, por ejemplo, como soluciones, polvos, polvos humectables, concentrados fluidos, o concentrados emulsionables. Estos materiales se aplican de forma conveniente en varias formas conocidas.

Se ha encontrado que los compuestos de esta invención tienen un efecto fungicida significativo, particularmente para su uso en agricultura. Muchos de los compuestos son particularmente eficaces para su uso en cultivos en agricultura y en plantas en horticultura, o con el refuerzo de madera, pintura, cuero o moqueta.

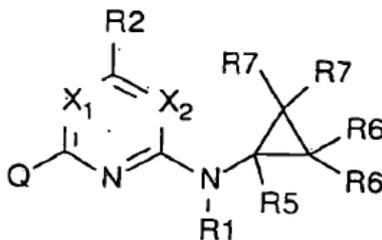
En particular, los compuestos controlan eficazmente una variedad de hongos indeseables que infestan cultivos de plantas útiles. Además de los hongos ensayados, estos compuestos tendrán probablemente actividad frente a diversos hongos, incluidos, por ejemplo, las siguientes especies de hongos representativas: mildíu lanoso de la uva (*Plasmopara viticola* - PLASVI), tizón tardío del tomate (*Phytophthora infestans* - PHYTIN), sarna del manzano (*Venturia inaequalis* - VENTIN), roya parda del trigo (*Puccinia recondita* - PUCCRT), la roya listada del trigo (*Puccinia striiformis* - PUCST), añublo del arroz (*Pyricularia oryzae* - PYRIOR), mancha de la hoja de remolacha ocasionada por *Cercospora* (*Cercospora beticola* - CERCB), mildíu polvoroso del trigo (*Erysiphe graminis* - ERYSGT), la rojez de la hoja del trigo (*Septoria tritici* - SEPTTR), mancha de la vaina del arroz (*Rhizoctonia solani* - RHIZO), cercosporiosis del trigo (*Pseudocercospora herpotrichoides* - PSDCHE), podredumbre parda del melocotón (*Monilinia fructicola* - MONIFC) y la gluma del trigo (*Leptosphaeria nodorum* - LEPTNO). Los expertos en la técnica comprenderán que la eficacia de los compuestos de esta invención contra los anteriores hongos determina la utilidad general de los compuestos como fungicidas.

Los compuestos de esta invención tienen amplios intervalos de eficacia como fungicidas. La cantidad exacta de material activo que ha de aplicarse depende no sólo del específico material activo que ha de aplicarse, sino también de la particular acción deseada. Las especies fúngicas que han de controlarse y la etapa de crecimiento de las mismas, así como la parte de la planta u otro producto que ha de ponerse en contacto con el ingrediente tóxico activo. Así, todos los ingredientes activos de los compuestos de esta invención, y las composiciones que contienen el mismo, pueden no ser igualmente eficaces a concentraciones similares o contra las mismas especies fúngicas. Los compuestos de esta invención y las composiciones son eficaces en su uso con plantas en la inhibición de una enfermedad y en las cantidades fitológicamente aceptables.

Aunque la nueva tecnología se ha ilustrado y descrito en detalle en las figuras y en la descripción anterior, la misma debe considerarse como ilustrativa y no tiene carácter restrictivo, comprendiéndose que sólo las realizaciones preferidas se han mostrado y descrito y que se desea proteger todos los cambios y modificaciones que caen dentro del espíritu de la nueva tecnología. También, aunque la nueva tecnología se ilustró usando ejemplos específicos, argumentos teóricos, cantidades e ilustraciones específicas, estas ilustraciones y los comentarios que se acompañan de ninguna manera debería interpretarse de que limiten la tecnología. Todas las patentes, las solicitudes de patentes y las referencias a textos, tratados científicos, publicaciones y otros similares referenciados en esta solicitud se incorporan en la presente memoria como referencia en su totalidad.

REIVINDICACIONES

1. Una aminopirimidina sustituida con arilo de fórmula



en donde:

- 5 X₁ es N o C-R₃;

X₂ es N o C-R₄ con tal de que X₁ y X₂ no sean ambos N; R₁-R₇ son H, CN, CHO, SCN, NO₂, F, Cl, Br, I, alquilo C₁-C₄ sustituido o no sustituido, halo-alquilo C₁-C₄ sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-C₄ sustituido o no sustituido, halo-alcoxi C₁-C₄ sustituido o no sustituido, tio-alquilo C₁-C₄ sustituido o no sustituido, halo-tioalquilo C₁-C₄ sustituido o no sustituido, cicloalquilo C₃-C₇ sustituido o no sustituido, alqueno C₂-C₄ sustituido o no sustituido, alquino C₂-C₄, acilalquilo C₁-C₄ sustituido o no sustituido, aciloxi C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-amino, alquil(C₁-C₄)-S(O)=NH, arilo sustituido o no sustituido, heterociclo sustituido o no sustituido, en donde los sustituyentes son uno o más de los siguientes F, Cl, OH, CN, NO₂, CHO, SCN, alquilo(C₁-C₄)-S(O)_n (en donde n=0,2), alquilo C₁-C₄, halo-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-amina, alcoxi C₁-C₄, halo-alcoxi C₁-C₄, tioalquilo C₁-C₄, halo-tioalquilo C₁-C₄, acilalquilo C₁-C₄, aciloxi C₁-C₄, alcoxycarbonilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-imino, hidroxí-imino; alquilo (C₁-C₄)-S(O)=NH; y

- 15 Q es arilo, sustituido o no sustituido, en donde los sustituyentes de Q se toman a partir de las R₁-R₇,

con la condición de que la aminopirimidina sustituida con arilo no sean 1-[[6-cloro-2-(4-clorofenil)pirimidin-4-il]amino]ciclopropanocarboxilato de etilo o 1-[[2-(4-clorofenil)-6-(2-fluoro-5-metoxifenil)pirimidin-4-il]amino]-ciclopropanocarboxilato de etilo.

- 20 2. Una composición fungicida, que comprende al menos un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 y un soporte fitológicamente aceptable.

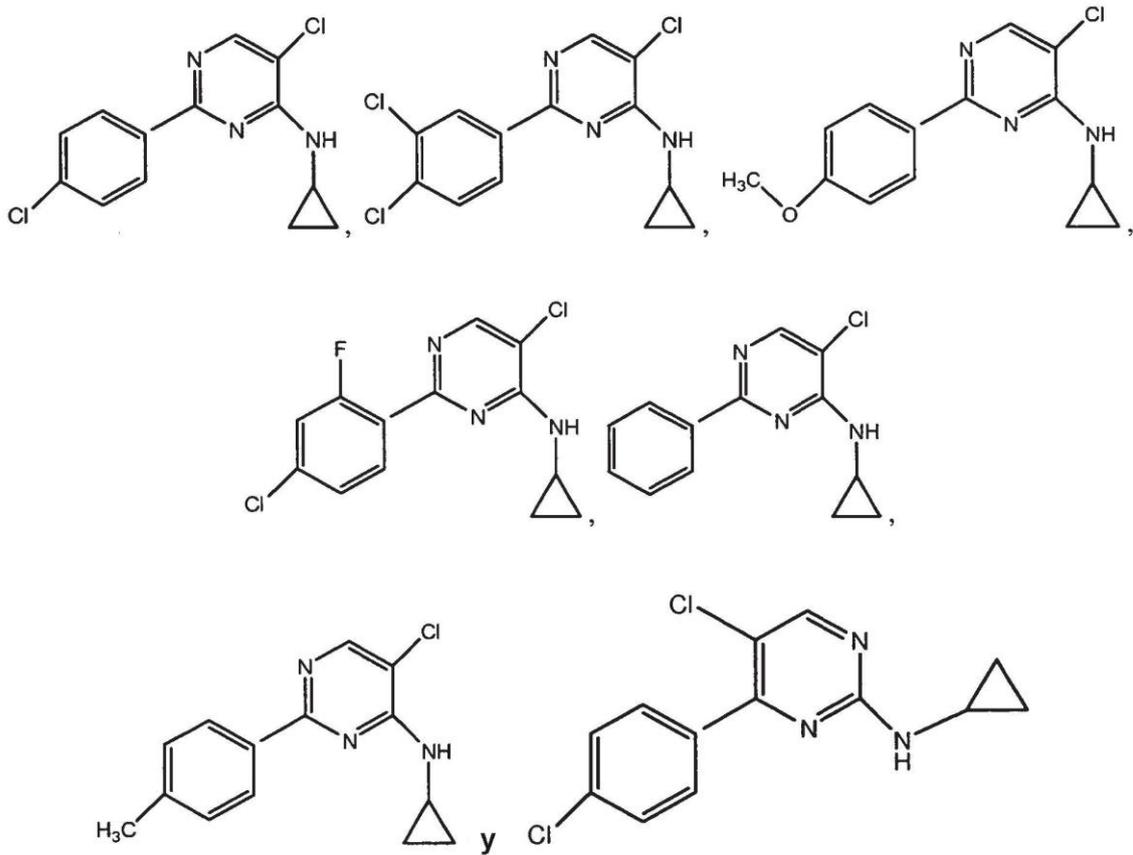
3. La composición según la reivindicación 2, que incluye además al menos un compuesto adicional seleccionado del grupo constituido por: insecticidas, fungicidas y herbicidas.

4. Un método para controlar una infestación fúngica, que comprende las etapas de:

proporcionar al menos un compuesto según la reivindicación 1; y

- 25 aplicar el compuesto a una superficie adyacente a una infestación fúngica.

5. Un compuesto según la reivindicación 1, seleccionado del grupo constituido por:



6. Una composición fungicida, que comprende al menos un compuesto según la reivindicación 5, y un soporte fitológicamente aceptable.
7. La composición según la reivindicación 6, que incluye además al menos un compuesto adicional seleccionado del grupo constituido por: insecticidas, fungicidas y herbicidas.
8. Un método para controlar una infestación fúngica, que comprende las etapas de:
- proporcionar al menos un compuesto según la reivindicación 5; y
- aplicar el compuesto a una superficie adyacente a una infestación fúngica.