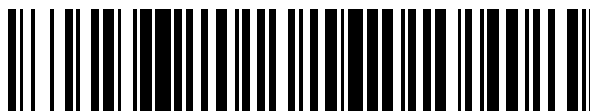


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 531 149**

51 Int. Cl.:

A01N 43/56 (2006.01)

A01N 43/78 (2006.01)

A01N 43/40 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

C07D 409/12 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **01.03.2005 E 05716432 (9)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **31.12.2014 EP 1720865**

54 Título: **Derivados de 2-piridinileticarboxamida y su uso como fungicidas**

30 Prioridad:

03.03.2004 EP 04356029

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

11.03.2015

73 Titular/es:

**BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH
(100.0%)
Alfred-Nobel-Strasse 10
40789 Monheim am Rhein, DE**

72 Inventor/es:

**MANSFIELD, DARREN JAMES;
RIECK, HEIKO;
COQUERON, PIERRE-YVES;
DESBORDES, PHILIPPE;
GROSJEAN-COURNOYER, MARIE-CLAIRE;
GENIX, PIERRE y
VILLIER, ALAIN**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 531 149 T3

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

DESCRIPCIÓN

Derivados de 2-piridiniletancarboxamida y su uso como fungicidas

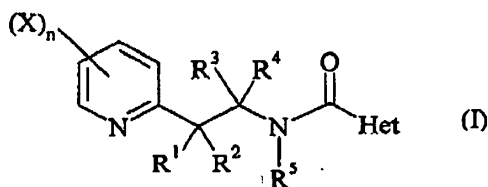
La presente invención se refiere a nuevos derivados de *N*-[2-(2-piridinil)etil]carboxamidas, a su procedimiento de preparación, a su uso como fungicidas, particularmente en forma de composiciones fungicidas, y a procedimientos para el control de hongos fitopatógenos de plantas usando estos compuestos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

La solicitud de patente internacional WO 01/11965 desvela una amplia familia de compuestos fungicidas en los que el grupo 2-piridilo está sustituido con al menos un grupo halogenoalquilo.

En el campo de la agricultura, el uso de nuevos compuestos plaguicidas para evitar o combatir el desarrollo de cepas resistentes a los principios activos usados por los agricultores siempre suscita un gran interés.

Los inventores han encontrado ahora una nueva familia de compuestos que poseen las características anteriormente mencionadas.

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



en la que:

- n es 1, 2, 3 o 4;
- X es igual o diferente, y es un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₆, un alcoxiimino C₁-C₆, un (alcoxiimino C₁-C₆)-alquilo C₁-C₆ o un alcoxi C₁-C₆-alquilcarbonilo-C₁-C₆, un alquilo C₁-C₆;
- R¹ y R² son iguales o diferentes, y son seleccionados, de manera independiente entre sí, entre un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un alquilo C₁-C₆, un halogenoalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C₂-C₆, un alcoxi C₁-C₆, un alquilsulfanilo C₁-C₆, un alquilsulfenilo C₁-C₆, un alquilsulfinilo C₁-C₆, un alcocarbonilo C₁-C₆, un alquilcarbonilamino C₁-C₆, un alcocarboniloxi C₁-C₆, un alcocarbonilamino C₁-C₆ o un grupo fenilo; o R¹ y R² pueden formar juntos un ciclopropilo, un ciclobutilo, un ciclopentilo o un ciclohexilo;
- R³ y R⁴ son iguales o diferentes, y son seleccionados, de manera independiente entre sí, entre un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₆, un halogenoalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilcarbonilamino C₁-C₆ o un grupo fenilo; con la condición de que cuando tres de los cuatro sustituyentes R¹, R², R³ y R⁴ sean un átomo de hidrógeno, entonces el cuarto sustituyente no sea un átomo de hidrógeno;
- R⁵ es un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo hidroxilo, un alquilo C₁-C₆, un halogenoalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₆, un halogenoalcoxi C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₆, un halogenocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C₂-C₆, un alquinilo C₂-C₆, un alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, un cianoalquilo C₁-C₆, un aminoalquilo C₁-C₆, un alquilamino C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, un di-alquilamino-C₁-C₆-alquilo C₁-C₁, un alquilcarbonilo C₁-C₆, un halogenalquilcarbonilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiloxicarbonilo C₁-C₆, un benciloxicarbonilo C₁-C₆, un alcoxi C₁-C₆-alquilcarbonilo C₁-C₆, un alquilsulfonilo C₁-C₆ o un halogenoalquilsulfonilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- Het representa, como se define más adelante, un heterociclo de 5, 6 o 7 miembros con uno, dos o tres heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes; estando Het ligado a través de un átomo de carbono y estando al menos sustituido en la posición *orto*;

así como sus sales, *N*-óxidos, y complejos metálicos y metaloides.

En el contexto de la presente invención:

- halógeno significa flúor, bromo, cloro o yodo;
- heteroátomo significa N, O o S;
- carboxi significa -C(=O)OH;
- carbonilo significa -C(=O)-;
- carbamoilo significa -C(=O)NH₂;
- N-hidroxycarbamoilo significa -C(=O)NHOH;
- un grupo alquilo, un grupo alquenilo y un grupo alquinilo, así como los restos que contienen estos términos, pueden ser lineales o ramificados.

En el contexto de la presente invención, también se ha de entender que en el caso de radicales amino di-sustituídos y carbamoilo di-sustituídos, los dos sustituyentes pueden formar, junto con el átomo de nitrógeno que los porta, un anillo heterocíclico saturado que contiene de 3 a 7 átomos.

De acuerdo con la presente invención, el 2-piridilo puede estar sustituido en cualquier posición con (X)_n, en la que X y n son como se han definido anteriormente. Preferentemente, la presente invención se refiere a derivado de N-[2-(2-piridinil)etil]carboxamida de fórmula general (I), en la que las características diferentes se pueden seleccionar solas o en combinación entre:

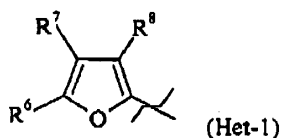
- con respecto a n, n es 1, 2 o 3. Más preferentemente, n es 2 o 3;
- con respecto a las posiciones en las que el 2-piridilo está sustituido, el 2-piridilo está sustituido en la posición 3, 5 y/o 6. Más preferentemente, el 2-piridilo está sustituido en la posición 3 y/o 5.

De acuerdo con la presente invención, los dos átomos de carbono y el átomo de nitrógeno de la "parte etilamida" del compuesto de fórmula (I) están sustituidos respectivamente con R¹ y R², R³ y R⁴, y R⁵, siendo al menos uno de los sustituyentes R¹, R², R³ y R⁴ diferente de hidrógeno. Preferentemente, la presente invención también se refiere a derivado de N-[2-(2-piridinil)etil]carboxamida de fórmula general (I) en la que las siguientes características se pueden seleccionar solas o en combinación entre:

- con respecto a R¹ y R², más preferentemente, R¹ y R² se pueden seleccionar, de manera independiente entre sí, entre un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₆, un halogenoalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un alquilcarbonilamino C₁-C₆.
- con respecto a R³ y R⁴, más preferentemente, R³ y R⁴ se pueden seleccionar, de manera independiente entre sí, entre un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₆, un halogenoalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un grupo fenilo.
- con respecto a R⁵, R⁵ se puede seleccionar entre un átomo de hidrógeno de un C₃-C₇-cicloalquilo.

De acuerdo con la presente invención, "Het" del compuesto de fórmula general (I) puede ser un heterociclo anular de cinco miembros. Los ejemplos específicos de los compuestos de la presente invención donde Het es un heterociclo de cinco miembros incluyen:

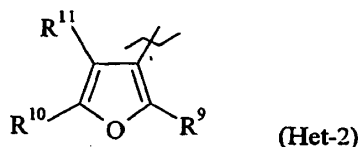
* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-1):



en la que:

- R⁶ y R⁷ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R⁸ puede ser un átomo de halógeno, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

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

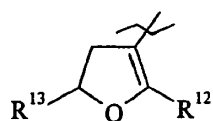


en la que:

- R⁹ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R¹⁰ y R¹¹ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

con la condición de que R⁹ y R¹¹ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

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

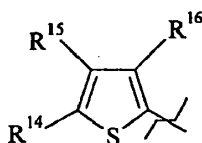


(Het-3)

en la que:

- R¹² puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R¹³ puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

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

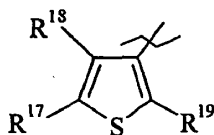


(Het-4)

en la que:

- R¹⁴ y R¹⁵ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiltio C₁-C₄, un alquilsulfonilo C₁-C₄, un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄, o un piridilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄; y
- R¹⁶ puede ser un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

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



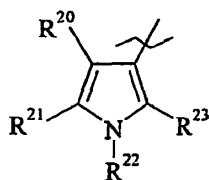
(Het-5)

en la que:

- R¹⁷ y R¹⁸ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄, un alquiloxi C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R¹⁹ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

con la condición de que R¹⁸ y R¹⁹ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

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



(Het-6)

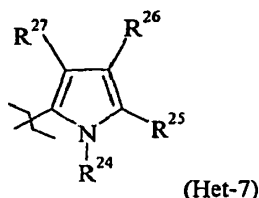
en la que:

- R²⁰ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- R²¹ y R²³ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R²² puede ser un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un hidroxialquilo C₁-C₄, un alquilsulfonilo C₁-C₄, un di(alquilo C₁-C₄)aminosulfonilo, un alquilcarbonilo C₁-C₆, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido con un

átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄, o un benzoílo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄;

con la condición de que R²⁰ y R²³ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

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



5

en la que:

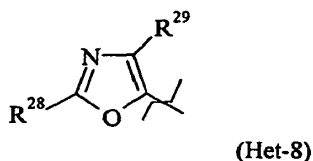
- R²⁴ puede ser un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un hidroxialquilo C₁-C₄, un alquilsulfonilo C₁-C₄, un di(alquil C₁-C₄)aminosulfonilo, un alquilcarbonilo C₁-C₆, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄, o un benzoílo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄; y
- R²⁵, R²⁶ y R²⁷ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un alquilcarbonilo C₁-C₄;

10

15

con la condición de que R²⁴ y R²⁷ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

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

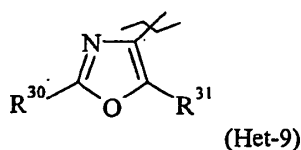


en la que:

- R²⁸ puede ser un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₄; y
- R²⁹ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

20

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

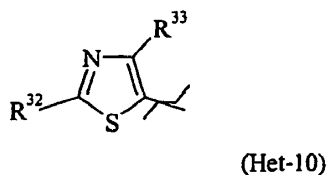


en la que:

- R³⁰ puede ser un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₄; y
- R³¹ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄.

25

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

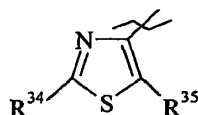


30

en la que:

- R³² puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo ciano, un alquilamino C₁-C₄, un di-(alquil C₁-C₄)amino, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄; y
- R³³ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

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

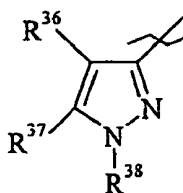


(Het-11)

en la que:

- R³⁴ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo ciano, un alquilamino C₁-C₄, un di-(alquil C₁-C₄)amino, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R³⁵ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

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

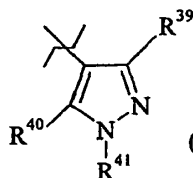


(Het-12)

en la que:

- R³⁶ puede ser un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₆, un alcoxi C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiltio C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un grupo aminocarbonilo o un aminocarbonil-alquilo C₁-C₄;
- R³⁷ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un alcoxi C₁-C₄ o un alquiltio C₁-C₄; y
- R³⁸ puede ser un átomo de hidrógeno, un fenilo, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo C₁-C₄, un alquenilo C₂-C₆, un cicloalquilo C₃-C₆, un alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ o un halogenoalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

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



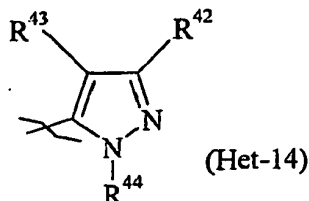
(Het-13)

en la que:

- R³⁹ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₆, un alcoxi C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiltio C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un aminocarbonilo o un aminocarbonil-alquilo C₁-C₄;
- R⁴⁰ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un alcoxi C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un alquiltio C₁-C₄; y
- R⁴¹ puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo C₁-C₄, un alquenilo C₂-C₆, un cicloalquilo C₃-C₆, un alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo

opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄, un alcoxilquilo C₁-C₄ o un grupo nitro; con la condición de que R³⁹ y R⁴⁰ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

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



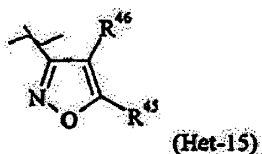
5 en la que:

- R⁴² puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₆, un alcoxi C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiltio C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un aminocarbonilo o un aminocarbonilalquilo C₁-C₄;
- 10 - R⁴³ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un alcoxi C₁-C₄, un alquiltio C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- R⁴⁴ puede ser un átomo de hidrógeno, un fenilo, un bencilo, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo C₁-C₄, un alquenilo C₂-C₆, un cicloalquilo C₃-C₆, un alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

15

con la condición de que R⁴³ y R⁴⁴ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

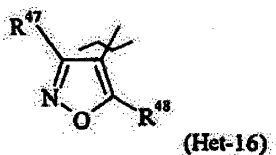
* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-15):



en la que:

- 20 - R⁴⁵ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo que tiene hasta cuatro átomos de carbono o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R⁴⁶ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo que tiene hasta cuatro átomos de carbono o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

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

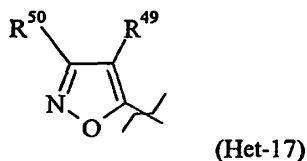


25

en la que R⁴⁷ y R⁴⁸ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄, o un heterociclilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄;

30 con la condición de que R⁴⁷ y R⁴⁸ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

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

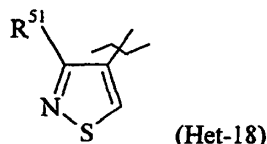


en la que:

- R⁴⁹ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno. y
- R⁵⁰ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

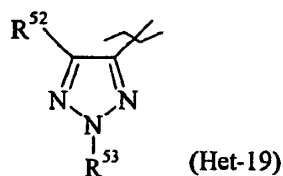
5

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



en la que R⁵¹ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

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

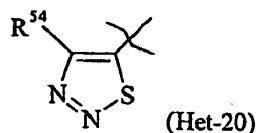


en la que:

- R⁵² puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R⁵³ puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄.

15

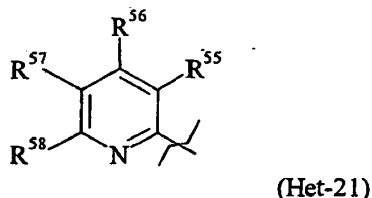
* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-20):



20 en la que R⁵⁴ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

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

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



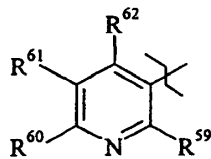
25

en la que:

- R⁵⁵ puede ser un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄, un alquiltio C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- R⁵⁶, R⁵⁷ y R⁵⁸, que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄, un alquiltio C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C₁-C₄ o un alquilsulfonilo C₁-C₄.

30

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



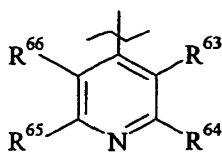
(Het-22)

en la que:

- 5
- R⁵⁹ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxí, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄, un alquiltio C₁-C₅, un alqueniltio C₂-C₅, un halogenoalquiltio C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un feniloxi opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄, o un feniltio opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄;
- 10
- R⁶⁰, R⁶¹ y R⁶², que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄, un alquiltio C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C₁-C₄, un alquilsulfonilo C₁-C₄ o una *N*-morfolina opcionalmente sustituida con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄, o un tienilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄;

15 con la condición de que R⁵⁹ y R⁶² no sean ambos un átomo de hidrógeno.

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

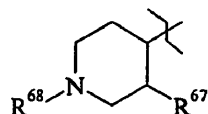


(Het-23)

- 20
- en la que R⁶³, R⁶⁴, R⁶⁵ y R⁶⁶, que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxí, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄, un alquiltio C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C₁-C₄ o un alquilsulfonilo C₁-C₄;

con la condición de que R⁶³ y R⁶⁶ no sean ambos un átomo de hidrógeno.

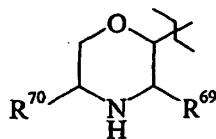
* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-24):



(Het-24)

- 25
- en la que:
- R⁶⁷ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- 30
- R⁶⁸ puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxycarbonilo C₁-C₆, un bencilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 átomos de halógeno, un benciloxycarbonilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 átomos de halógeno o un heterocícilo.

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

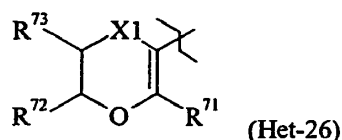


(Het-25)

en la que:

- 5
- R⁶⁹ puede ser un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄, un alquiltio C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
 - R⁷⁰ puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un bencilo.

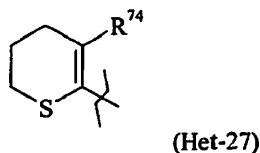
* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-26):



en la que:

- 10
- X¹ puede ser un átomo de azufre, -SO-, -SO₂- o -CH₂-;
 - R⁷¹ puede ser un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
 - R⁷² y R⁷³ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₄.

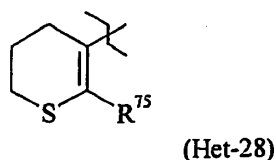
* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-27):



15 en la que:

- R⁷⁴ puede ser un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

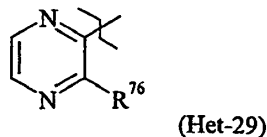
* Het puede representar un heterociclo de fórmula general (Het-28):



en la que:

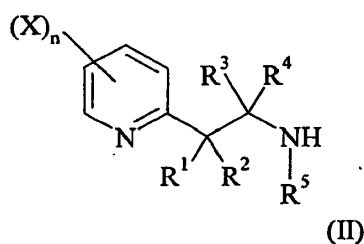
- 20
- R⁷⁵ pueden ser un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

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

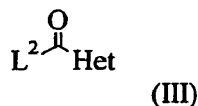


en la que R⁷⁶ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

- 25 La presente invención también se refiere a un procedimiento de preparación del compuesto de fórmula general (I). Por lo tanto, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento de preparación de un compuesto de fórmula general (I) como se ha definido anteriormente, que comprende hacer reaccionar un derivado de 2-piridina de fórmula general (II) o una de sus sales:

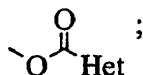


en la que X, n, R¹, R², R³, R⁴ y R⁵ son como se han definido anteriormente; con un derivado de ácido carboxílico de fórmula general (III):



5 en la que:

- Het es como se ha definido anteriormente; y
- L² es un grupo saliente seleccionado entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, -OR⁷⁷, -OCOR⁷⁷, siendo R⁷⁷ un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula:



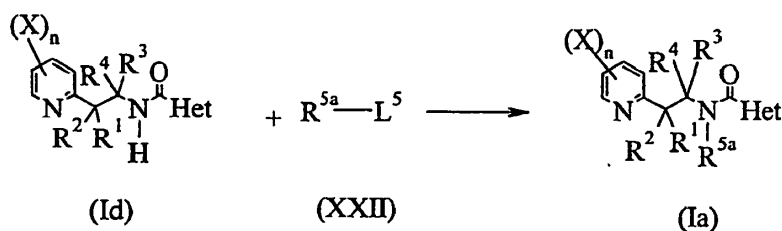
10 en presencia de un catalizador y, si L² es un grupo hidroxilo, en presencia de un agente de condensación.

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

15 En caso de que L² sea un grupo hidroxilo, el procedimiento de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de un agente de condensación. El agente de condensación adecuado se puede seleccionar entre formador de haluro de ácido, tal como fosgeno, tribromuro de fósforo, tricloruro de fósforo, pentacloruro de fósforo, óxido de tricloruro de fósforo o cloruro de tionilo; formador de anhídrido, tal como cloroformiato de etilo, cloroformiato de metilo, cloroformiato de isopropilo, cloroformiato de isobutilo o cloruro de metanosulfonilo; carbodiimidias, tales como N,N'-diciclohexilcarbodiimida (DCC) u otros agentes de condensación habituales, tales como pentóxido de fósforo, ácido polifosfórico, N,N'-carbonil-diimidazol, 2-etoxi-N-etoxi-carbonil-1,2-dihidroquinolina (EEDQ),

20 trifenilfosfina/tetraclorometano, cloruro de 4-(4,6-dimetoxi[1.3.5]triazin-2-il)-4-metilmorfolinio hidratado o bromo-tripirrolidino-fosfonio-hexafluorofosfato.

Cuando R⁵ es un átomo de hidrógeno, el procedimiento anteriormente mencionado de preparación del compuesto de fórmula general (I) se puede completar opcionalmente mediante una etapa adicional de acuerdo con el siguiente esquema de reacción



25 en el que:

- R¹, R², R³, R⁴, X, n y Het son como se han definido anteriormente;
 - R^{5a} es un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo hidroxilo, un alquilo C₁-C₆, un halogenoalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₆, un halogenoalcoxi C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₆, un halogenocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueno C₂-C₆, un alquino C₂-C₆, un alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, un cianoalquilo C₁-C₆, un aminoalquilo C₁-C₆, un alquilamino C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, un di-alquilamino C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, un alquilcarbonilo C₁-C₆, un halogenalquilcarbonilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiloxicarbonilo C₁-C₆, un benciloxicarbonilo C₁-C₆, un alcoxi C₁-C₆-alquilcarbonilo C₁-C₆, un alquilsulfonilo C₁-C₆ o un halogenoalquilsulfonilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
 - L⁵ es un grupo saliente seleccionado entre un átomo de halógeno, un 4-metil-fenilsulfonilo o un metilsulfonilo;
- 30
- 35

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Id) con un compuesto de fórmula general (XXII) para proporcionar un compuesto de fórmula general (Ia).

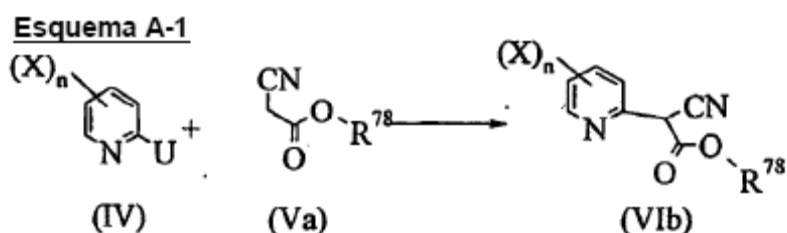
Dependiendo de la definición de R^1 , R^2 , R^3 , R^4 o R^5 , los derivados de amina de fórmula general (II) se pueden preparar mediante diferentes procedimientos. Un ejemplo (A) de dicho procedimiento puede ser cuando:

- 5
- X , n son como se han definido anteriormente;
 - R^1 es un alquilo C_1 - C_6 ;
 - R^2 es un átomo de hidrógeno o un alquilo C_1 - C_6 ; y
 - R^3 , R^4 , R^5 son átomos de hidrógeno;

entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar de acuerdo con un procedimiento que comprende:

10

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



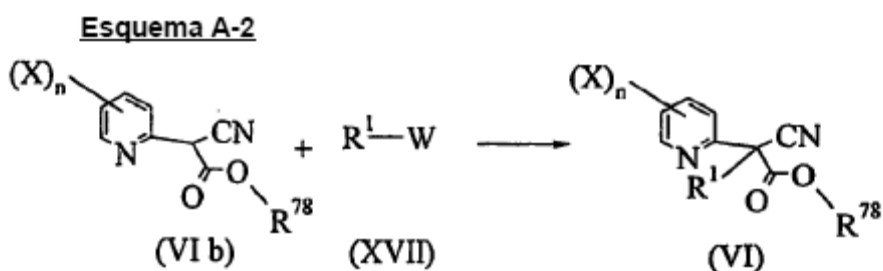
en el que:

- 15
- X y n son como se han definido anteriormente;
 - R^{78} es un alquilo C_1 - C_6 , un haloalquilo C_1 - C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
 - U es un grupo saliente seleccionado entre un halógeno, un alquilsulfonato C_1 - C_6 o un haloalquilsulfonato C_1 - C_6 ;

que comprende la arilación de un derivado de cianoacetato de fórmula general (Va) mediante un derivado de piridina de fórmula general (IV), para proporcionar un derivado de 2-(piridil)cianoacetato de fórmula general (VIb), en presencia de una base, a una temperatura de 0 °C a 200 °C;

20

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



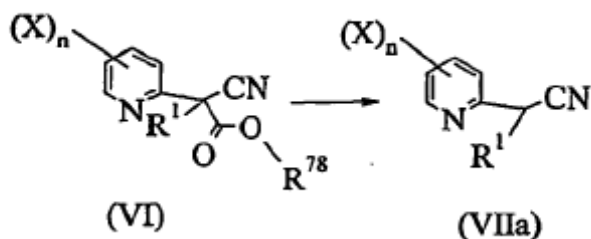
25 en el que:

- X , n son como se han definido anteriormente;
- R^1 es un alquilo C_1 - C_6 ;
- R^{78} es un alquilo C_1 - C_6 , un haloalquilo C_1 - C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
- W es un átomo de halógeno, un alquilsulfonato C_1 - C_6 , un haloalquilsulfonato C_1 - C_6 o un 4-metil-fenilsulfonato;

30 que comprende la alquilación de un compuesto de fórmula general (VI b) mediante un reactivo de fórmula general (XVII), para dar un compuesto de fórmula general (VI);

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

Esquema A-3



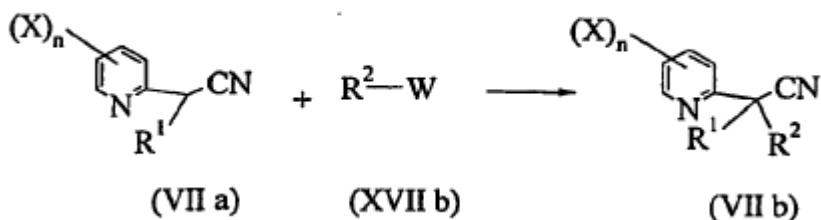
en el que:

- X_n son como se han definido anteriormente;
- R^1 es un alquilo C_1-C_6 ;
- R^{78} es un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende una hidrólisis básica, una hidrólisis ácida o un desplazamiento por un haluro de un compuesto de fórmula general (VI) en el mismo recipiente o un recipiente distinto, para dar, tras calentar a una temperatura desde 40 °C hasta la temperatura de reflujo, un derivado de 2-piridilacetoniitrilo de fórmula general (VIIa);

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

Esquema A-4



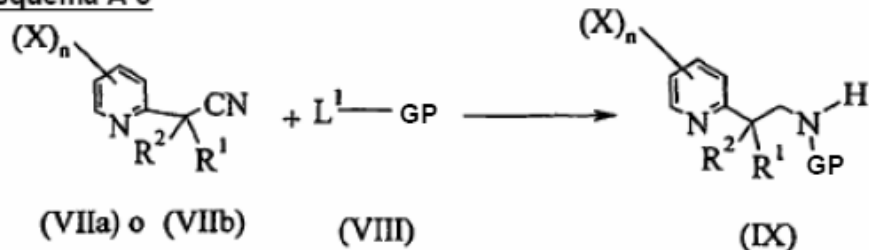
en el que:

- X_n son como se han definido anteriormente;
- R^1 es un alquilo C_1-C_6 ;
- R^2 es un alquilo C_1-C_6 ;
- W es un átomo de halógeno, un alquilsulfonato C_1-C_6 , un haloalquilsulfonato C_1-C_6 o un 4-metil-fenilsulfonato;

que comprende la alquilación de un compuesto de fórmula general (VII a) mediante un reactivo de fórmula general (XVII b), para dar un compuesto de fórmula general (VII b);

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

Esquema A-5



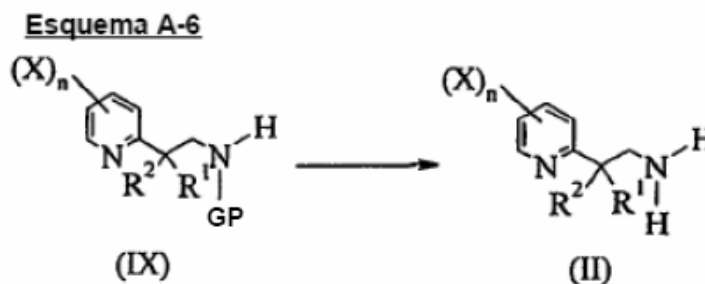
en el que:

- X_n son como se han definido anteriormente;
- R^1 es un alquilo C_1-C_6 ;
- R^2 es un átomo de hidrógeno o un alquilo C_1-C_6 ;
- L^1 es un grupo saliente seleccionado entre un grupo $-OR^{77}$ o un grupo $-OCOR^{77}$, siendo R^{77} un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
- GP representa un grupo protector que puede ser un grupo $-COOR^{77}$ o grupo $-COR^{77}$, siendo R^{77} un alquilo

C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende la reducción, por hidrogenación o por un donante de hidruro, de un compuesto de fórmula general (VIIa) o (VIIb), en presencia de un catalizador y en presencia de un compuesto de fórmula general (VIII), produciendo un compuesto de fórmula general (IX), a una temperatura de 0 °C a 150 °C y a una presión de 100 kPa y 10.000 kPa;

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



en el que:

- 10 - X, n son como se han definido anteriormente;
- R¹ es un alquilo C₁-C₆;
- R² es un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₆;
- GP representa un grupo protector que puede ser un grupo -COOR⁷⁷ o grupo -COR⁷⁷, siendo R⁷⁷ un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

- 15 que comprende una reacción de desprotección, en un medio ácido o un medio básico, de un compuesto de fórmula general (IX), para dar un derivado de amina de fórmula general (II) o una de sus sales.

La primera etapa (etapa A-1) se realiza en presencia de una base. Preferentemente, la base se seleccionará para que sea una base orgánica o una base inorgánica. Los ejemplos adecuados de dichas bases pueden ser, por ejemplo, hidruros de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, hidróxidos, amidas, alcoholatos, carbonatos o carbonatos de hidrógeno, acetatos o aminas terciarias.

- 20 La primera etapa (etapa A-1) de acuerdo con la presente invención se realiza a una temperatura de 0 °C a 200 °C. Preferentemente, la primera etapa (etapa A-1) se realiza a una temperatura de 0 °C a 120 °C, más preferentemente a una temperatura de 0 °C a 80 °C.

- 25 La primera etapa (etapa A-1) de acuerdo con la presente invención se puede realizar en presencia de un disolvente. Preferentemente, el disolvente se selecciona entre agua, un disolvente orgánico o una mezcla de ambos. Los disolventes orgánicos adecuados pueden ser, por ejemplo, un disolvente alifático, alicíclico o aromático.

- 30 La primera etapa (etapa A-1) de acuerdo con la presente invención también se puede realizar en presencia de un catalizador. Preferentemente, el catalizador se selecciona entre sales o complejos de paladio. Más preferentemente, el catalizador se selecciona para que sea un complejo de paladio. El catalizador de complejo de paladio adecuado se puede generar, por ejemplo, directamente en la mezcla de reacción mediante la adición por separado a la mezcla de reacción de una sal de paladio y un ligando complejo. Los ligandos adecuados pueden ser, por ejemplo, ligandos de fosfinas o arsinas voluminosos, tales como (R)-(-)-1-[(S)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etilidiciclohexilfosfina y su correspondiente enantiómero, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etildifenilfosfina y su correspondiente enantiómero, o una mezcla de ambos; (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etilid-*t*-butilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; o (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etilidiciclohexilfosfina y su correspondiente enantiómero, o una mezcla de ambos.

La quinta etapa (etapa A-5) de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de un donante de hidruro. Preferentemente, el donante de hidruro se selecciona entre hidruros metálicos o metaloides tales como LiAlH₄, NaBH₄, KBH₄, B₂H₆.

- 40 La quinta etapa (etapa A-5) de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de un catalizador. Preferentemente, el catalizador se selecciona entre cloruro de Co (II), cloruro de Ni (II), amoníaco o una de sus sales, paladio sobre carbón vegetal, níquel Raney, cobalto Raney o platino.

La quinta etapa (etapa A-5) de acuerdo con la presente invención se realiza a una temperatura de 0 °C a 150 °C. Preferentemente, la temperatura es de 10 °C a 120 °C. Más preferentemente, la temperatura es de 10 °C a 80 °C.

La quinta etapa (etapa A-5) de acuerdo con la presente invención se realiza a una presión de 100 kPa a 10.000 kPa. Preferentemente, la presión es de 100 kPa a 5.000 kPa.

La quinta etapa (etapa A-5) de acuerdo con la presente invención se puede realizar en presencia de un disolvente orgánico, de agua o de una mezcla de los mismos. Preferentemente, el disolvente se selecciona entre éter, alcohol, ácido carboxílico, o una mezcla de los mismos con agua o agua pura.

5

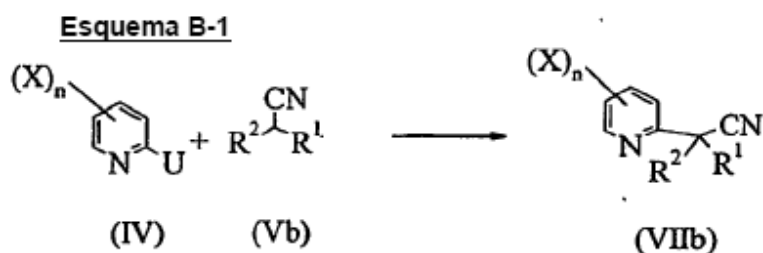
Un segundo ejemplo (B) de dicho procedimiento puede ser cuando:

- R^1, R^2, X, n son como se han definido anteriormente; y
- R^3, R^4, R^5 son átomos de hidrógeno;

entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar de acuerdo con un procedimiento que comprende:

10

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



15

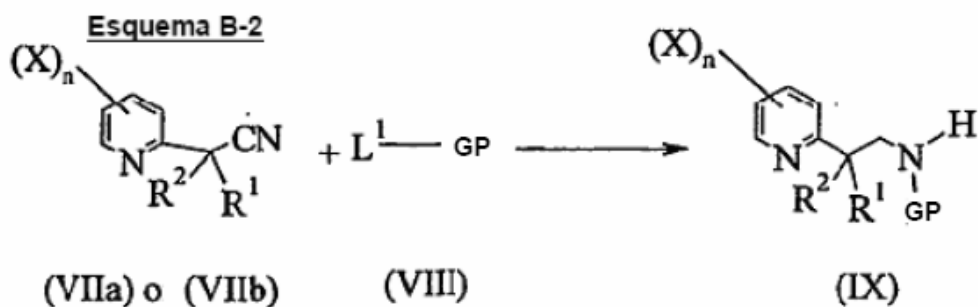
en el que:

- R^1, R^2, X y n son como se han definido anteriormente;
- U es un grupo saliente seleccionado entre un átomo de halógeno, un alquilsulfonato C_1-C_6 o un haloalquilsulfonato C_1-C_6 ;

que comprende la arilación de un compuesto de fórmula general (Vb) mediante un derivado de piridina de fórmula general (IV), para dar un derivado de 2-piridilacetoniitrilo de fórmula general (VIIb), en presencia de una base y a una temperatura de $-100\text{ }^\circ\text{C}$ a $200\text{ }^\circ\text{C}$;

20

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



25

en el que:

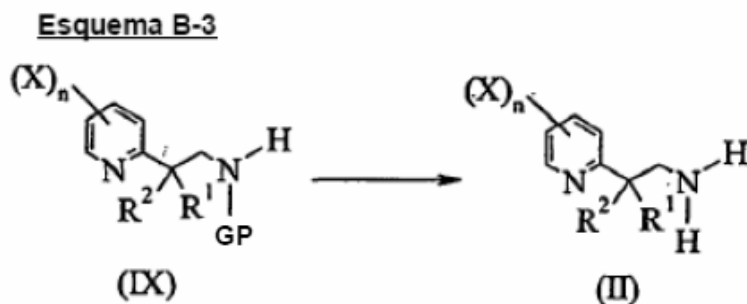
- R^1, R^2, X y n son como se han definido anteriormente;
- L^1 es un grupo saliente seleccionado entre un grupo $-OR^{79}$ o un grupo $-OCOR^{79}$, siendo R^{79} un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
- GP representa un grupo protector que puede ser un grupo $-COOR^{79}$ o grupo $-COR^{79}$, siendo R^{79} un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

30

que comprende la reducción, por hidrogenación o por un donante de hidruro, de un compuesto de fórmula general (VIIa) o (VIIb), en presencia de un compuesto de fórmula general (VIII), produciendo un compuesto de fórmula general (IX);

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

35



en el que:

- R^1 , R^2 , X y n son como se han definido anteriormente;
- GP representa un grupo protector que puede ser un grupo $-\text{COOR}^{79}$ o grupo $-\text{COR}^{79}$, siendo R^{79} un alquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, un haloalquilo $\text{C}_1\text{-C}_6$, un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende una reacción de desprotección, en un medio ácido o un medio básico, de un compuesto de fórmula general (IX), para dar un derivado de amina de fórmula general (II) o una de sus sales.

La primera etapa (etapa B-1) se realiza a una temperatura de $-100\text{ }^\circ\text{C}$ a $200\text{ }^\circ\text{C}$. Preferentemente, la primera etapa (etapa A-1) se realiza a una temperatura de $-80\text{ }^\circ\text{C}$ a $120\text{ }^\circ\text{C}$, más preferentemente a una temperatura de $-80\text{ }^\circ\text{C}$ a $80\text{ }^\circ\text{C}$.

La primera etapa (etapa B-1) de acuerdo con la presente invención se realiza en presencia de una base. Preferentemente, la base se seleccionará para que sea una base orgánica o una base inorgánica. Los ejemplos adecuados de dichas bases pueden ser, por ejemplo, hidruros de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, hidróxidos, amidas, alcoholatos, carbonatos o carbonatos de hidrógeno, acetatos o aminas terciarias.

La primera etapa (etapa B-1) de acuerdo con la presente invención se puede realizar en presencia de un disolvente. Preferentemente, el disolvente se selecciona entre agua, un disolvente orgánico o una mezcla de ambos. Los disolventes orgánicos adecuados pueden ser, por ejemplo, un disolvente alifático, alicíclico o aromático.

La primera etapa (etapa B-1) de acuerdo con la presente invención también se puede realizar en presencia de un catalizador. Preferentemente, el catalizador se selecciona entre sales o complejos de paladio. Más preferentemente, el catalizador se selecciona para que sea un complejo de paladio. El catalizador de complejo de paladio adecuado se puede generar, por ejemplo, directamente en la mezcla de reacción mediante la adición por separado a la mezcla de reacción de una sal de paladio y un ligando complejo. Los ligandos adecuados pueden ser, por ejemplo, ligandos de fosfinas o arsinas voluminosos, tales como (*R*)-(-)-1-[(*S*)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etilidiciclohexilfosfina y su correspondiente enantiómero, o una mezcla de ambos; (*R*)-(-)-1-[(*S*)-2-(diciclohexilfosfino)ferrocenil]etildifenilfosfina y su correspondiente enantiómero, o una mezcla de ambos; (*R*)-(-)-1-[(*S*)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildi-*t*-butilfosfina y su enantiómero correspondiente, o una mezcla de ambos; o (*R*)-(-)-1-[(*S*)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etildiciclohexilfosfina y su correspondiente enantiómero, o una mezcla de ambos.

Las condiciones preferidas en las que se realiza la etapa B-2 son iguales a las condiciones preferidas en las que se realiza la etapa A-4 del procedimiento A anteriormente mencionado.

Las condiciones preferidas en las que se realiza la etapa B-3 son iguales a las condiciones preferidas en las que se realiza la etapa A-5 del procedimiento A anteriormente mencionado.

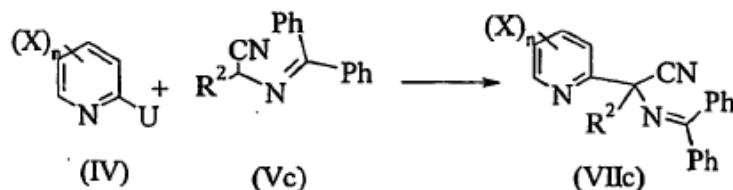
Un tercer ejemplo (C) de dicho procedimiento puede ser cuando:

- R^2 , X, n son como se han definido anteriormente;
- R^1 es un formilamino, un alquilcarbonilamino $\text{C}_1\text{-C}_8$, un halogenoalquilcarbonilamino $\text{C}_1\text{-C}_8$ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilcarbonilamino o un 2,6-diclorofenilcarbonilamino; y
- R^3 , R^4 , R^5 son átomos de hidrógeno;

entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar de acuerdo con un procedimiento que comprende:

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

Esquema C-1



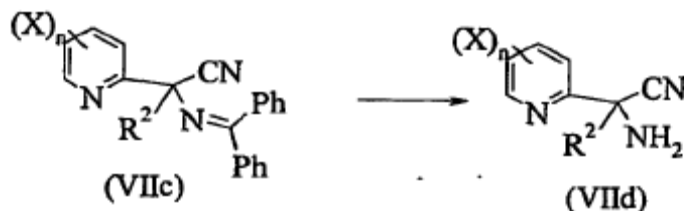
en el que:

- R^2 , X, n son como se han definido anteriormente;
- U es un grupo saliente seleccionado entre un átomo de halógeno, un alquilsulfonato C_1-C_6 o un haloalquilsulfonato C_1-C_6 ;

que comprende la arilación de un compuesto de fórmula general (Vc) mediante un derivado de piridina de fórmula general (IV), para dar un derivado de 2-piridilacetone nitrilo de fórmula general (VIIc), en presencia de una base y a una temperatura de $-100\text{ }^\circ\text{C}$ a $200\text{ }^\circ\text{C}$;

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

Esquema C-2

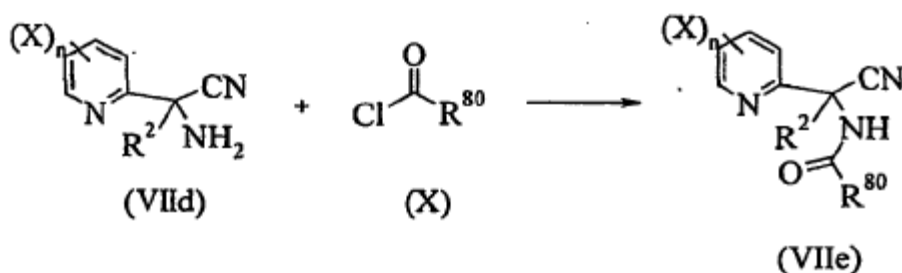


en el que R^2 , X, n son como se han definido anteriormente;

que comprende la desprotección, mediante hidrólisis ácida, de un compuesto de fórmula general (VIIc), produciendo un compuesto de fórmula general (VIIId) o una de sus sales ;

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

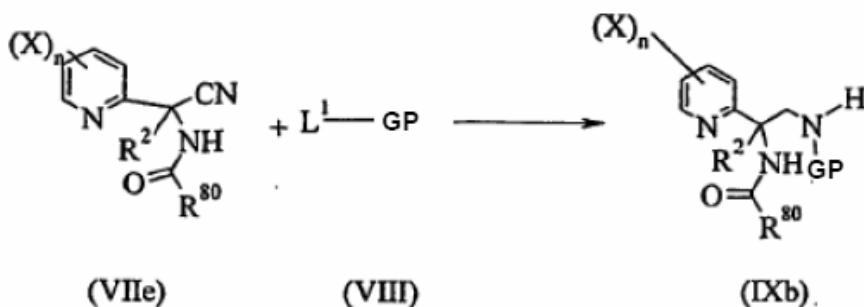
Esquema C-3



en el que:

- R^2 , X, n son como se han definido anteriormente;
- R^{80} es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 , un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo o 2,6-diclorofenil; que comprende el acoplamiento entre un compuesto de fórmula general (VIIId) y cloruro de acilo de fórmula general (X), produciendo un compuesto de fórmula general (VIIe).

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

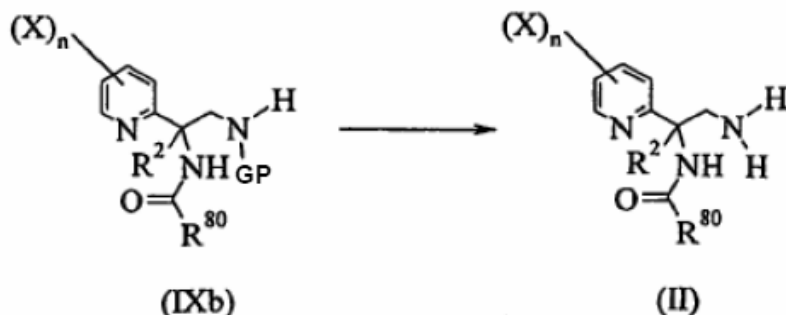
Esquema C-4

en el que:

- R^2 , X, n son como se han definido anteriormente;
- R^{80} es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 , un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo o 2,6-diclorofenilo;
- L^1 es un grupo saliente seleccionado entre un grupo $-OR^{79}$ o un grupo $OCOR^{79}$, siendo R^{79} un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
- GP representa un grupo protector que puede ser un grupo $-COOR^{79}$ o un grupo $-COR^{79}$, siendo R^{79} un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende la reducción, por hidrogenación o por un donante de hidruro, de un compuesto de fórmula general (VIIe), en presencia de un compuesto de fórmula general (VIII), produciendo un compuesto de fórmula general (IXb);

- una quinta etapa de acuerdo con el esquema C-5:

Esquema C-5

en el que:

- R^2 , X, n son como se han definido anteriormente;
- R^{80} es un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo C_1-C_6 , un halogenoalquilo C_1-C_8 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo o 2,6-diclorofenilo;
- L^1 es un grupo saliente seleccionado entre un grupo $-OR^{79}$ o un grupo $OCOR^{79}$, siendo R^{79} un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
- GP representa un grupo protector que puede ser un grupo $-COOR^{79}$ o un grupo $-COR^{79}$, siendo R^{79} un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende la reacción de desprotección, en un medio ácido o un medio básico, de un compuesto de fórmula general (IXb), produciendo un derivado de amina de fórmula general (II) o una de sus sales.

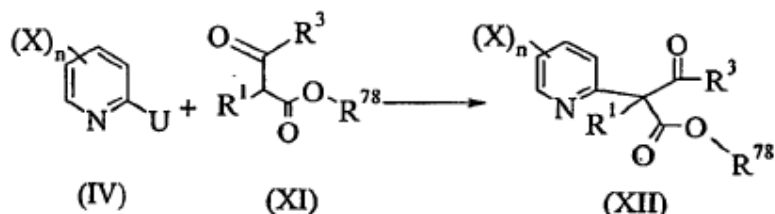
Un cuarto ejemplo (D) de dicho procedimiento puede ser cuando:

- R^1 , X, Y, n y p son como se han definido anteriormente;
- R^2 es un átomo de hidrógeno;
- R^3 es un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo o un fenilo; y
- R^5 es un átomo de hidrógeno, un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un alcoxi C_1-C_6 o un cicloalquilo C_3-C_7 ;

entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar de acuerdo con un procedimiento que comprende:

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

Esquema D-1



5

en el que:

- R¹, X y n son como se han definido anteriormente;
- R³ es un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo o un fenilo;
- R⁷⁸ es un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
- U es un grupo saliente seleccionado entre un halógeno, un alquilsulfonato C₁-C₆ o un haloalquilsulfonato C₁-C₆;

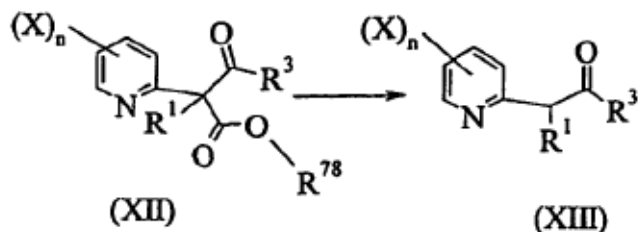
10

que comprende la arilación de un derivado de cetoacetato de fórmula general (XI) mediante un derivado de piridina de fórmula general (IV), para dar un derivado de 2-(piridil)cetoacetato de fórmula general (XII), en presencia de un base, a una temperatura de 0 °C a 200 °C;

15

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

Esquema D-2



en el que:

- R¹, X, n son como se han definido anteriormente;
- R² es un átomo de hidrógeno;
- R³ es un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo o un fenilo;
- R⁷⁸ es un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

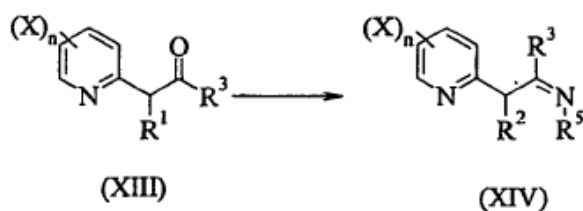
20

que comprende una hidrólisis básica, una hidrólisis ácida o un desplazamiento por un haluro de un compuesto de fórmula general (XII) en el mismo recipiente o un recipiente distinto, para dar, tras calentar a una temperatura desde 40 °C hasta la temperatura de reflujo, un derivado de 2-piridilcetona de fórmula general (XIII);

25

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

Esquema D-3



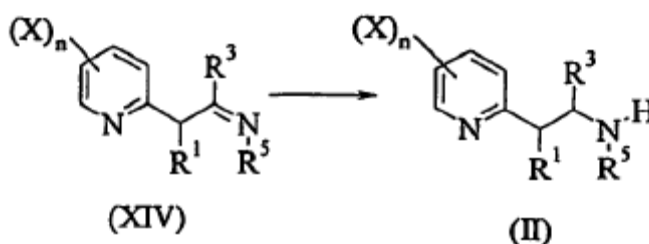
en el que:

- R^1 , X y n son como se han definido anteriormente;
- R^2 es un átomo de hidrógeno;
- R^3 es un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo o un fenilo;
- 5 - R^5 es un átomo de hidrógeno, un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un alcoxi C_1-C_6 o un cicloalquilo C_3-C_7 ;

que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (XIII) con una amina de fórmula R^5-NH_2 , para dar un derivado de imina de fórmula general (XIV);

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

Esquema D-4



10

en el que:

- R^1 , X y n son como se han definido anteriormente;
- R^2 es un átomo de hidrógeno;
- R^3 es un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, un fenilo;
- 15 - R^5 es un átomo de hidrógeno, un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un alcoxi C_1-C_6 o un cicloalquilo C_3-C_7 ;

que comprende la reducción del derivado de imina de fórmula general (XIV) por hidrogenación o por un donante de hidruro, en el mismo recipiente o un recipiente distinto, para dar un derivado de amina de fórmula general (II) o una de sus sales.

Un quinto ejemplo (E) de dicho procedimiento puede ser cuando:

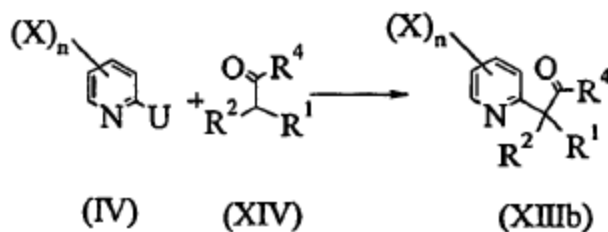
- 20 - R^1 , R^2 , X, Y, n y p son como se han definido anteriormente;
- R^3 es un átomo de hidrógeno
- R^4 es un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, un fenilo; y
- R^5 es un átomo de hidrógeno, un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un alcoxi C_1-C_6 o un cicloalquilo C_3-C_7 ;

entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar de acuerdo con un procedimiento que comprende:

25

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

Esquema E-1



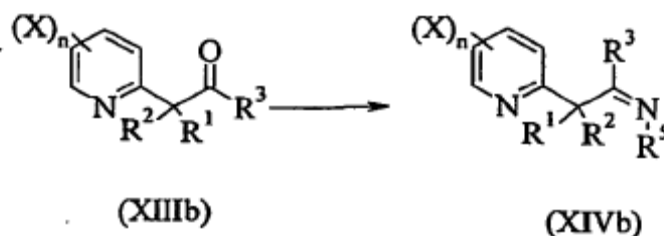
en el que:

- 30 - R^1 , R^2 , X y n son como se han definido anteriormente;
- R^4 es un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo o un fenilo;
- U es un grupo saliente seleccionado entre un halógeno, un alquilsulfonato C_1-C_6 o un haloalquilsulfonato C_1-C_6 ;

que comprende la arilación de un derivado de cetona de fórmula general (XIV) mediante un derivado de piridina de fórmula general (IV), para dar un derivado de 2-(piridil)cetona de fórmula general (XIIIb), en presencia de un

- base, a una temperatura de 0 °C a 200 °C;
- una segunda etapa de acuerdo con el esquema de reacción E-2:

Esquema E-2



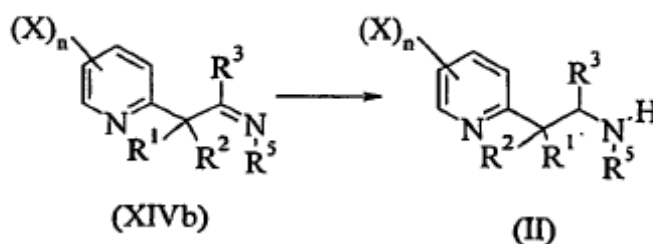
5 en el que:

- R¹, R², X y n son como se han definido anteriormente;
- R⁴ es un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo o un fenilo;
- R⁵ es un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un alcoxi C₁-C₆ o un cicloalquilo C₃-C₇;

10 que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (XIIIb) con una amina de fórmula R⁵-NH₂, para dar derivado de imina de fórmula general (XIVb);

- una tercera etapa de acuerdo con el esquema E-3:

Esquema E-3



en el que:

- 15
- R¹, R², X y n son como se han definido anteriormente;
 - R³ es un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo o un fenilo;
 - R⁴ es un átomo de hidrógeno;
 - R⁵ es un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un alcoxi C₁-C₆ o un cicloalquilo C₃-C₇;

20 que comprende la reducción del derivado de imina de fórmula general (XIVb) por hidrogenación o por un donante de hidruro, en el mismo recipiente o un recipiente distinto, para dar un derivado de amina de fórmula general (II) o una de sus sales.

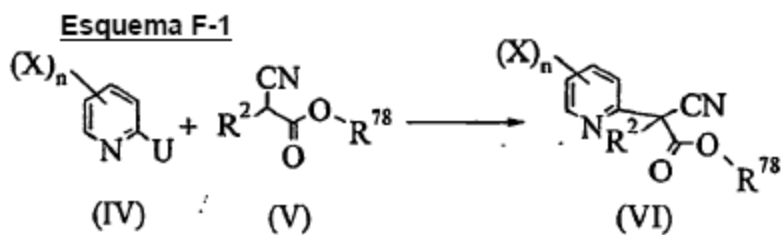
Un sexto ejemplo (F) de dicho procedimiento puede ser cuando:

- 25
- R², X, n son como se han definido anteriormente;
 - R¹ es un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un alquilo C₂-C₆, un alquilamino C₁-C₆, un di-alquilamino C₁-C₆, un alcoxi C₁-C₆, un halogenoalcoxi C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C₁-C₆, un halogenoalquilsulfanilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenoiloxi C₂-C₆, un halogenoalquenoiloxi C₂-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiloiloxi C₃-C₆, un halogenoalquiloiloxi C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un benciloxi, un bencilulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo, un fenilamino o un grupo fenilsulfanilo, un alquilcarboniloxi C₁-C₆, un halogenoalquilcarboniloxi C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y

- 30
- R³ y R⁴ son átomos de hidrógeno;

entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar de acuerdo con un procedimiento que comprende:

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

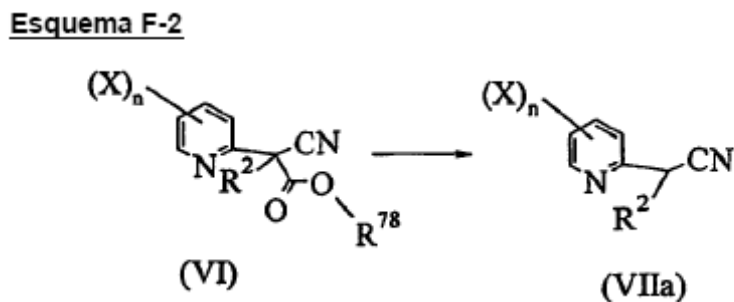


en el que:

- 5
- R^2 , X y n son como se han definido anteriormente;
 - R^{78} es un alquilo C_1 - C_6 , un haloalquilo C_1 - C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
 - U es un grupo saliente seleccionado entre un halógeno, un alquilsulfonato C_1 - C_6 o un haloalquilsulfonato C_1 - C_6 ;

10 que comprende la arilación de un derivado de cianoacetato de fórmula general (V) mediante un derivado de piridina de fórmula general (IV), para dar un derivado de 2-(piridil)cianoacetato de fórmula general (VI), en presencia de un base, a una temperatura de 0 °C a 200 °C;

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

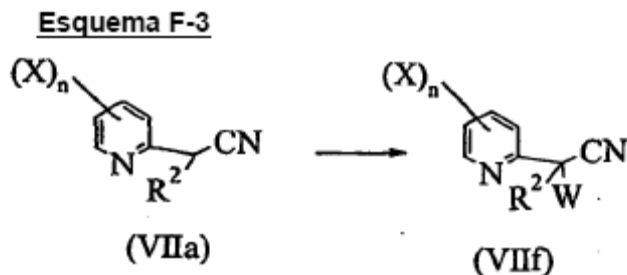


15 en el que:

- R^2 , X, n son como se han definido anteriormente;
- R^1 es un átomo de hidrógeno;
- R^{78} es un alquilo C_1 - C_6 , un haloalquilo C_1 - C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

20 que comprende una hidrólisis básica, una hidrólisis ácida o un desplazamiento por un haluro de un compuesto de fórmula general (VI) en el mismo recipiente o un recipiente distinto, para dar, tras calentar a una temperatura desde 40°C hasta la temperatura de reflujo, un derivado de 2-piridilacetoniitrilo de fórmula general (VIIa);

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

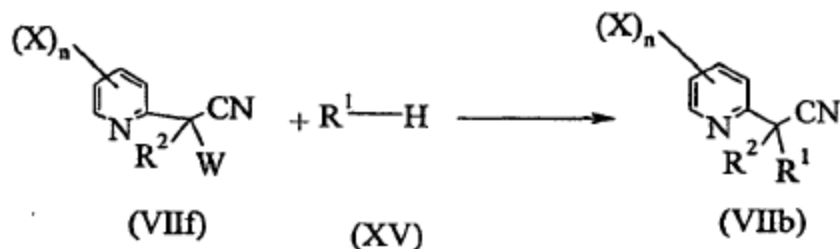


25 en el que:

- R^2 , X, n son como se han definido anteriormente;
- W es un átomo de halógeno;

que comprende la halogenación de un compuesto de fórmula general (VIIa), para dar un compuesto de fórmula general (VIIf);

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

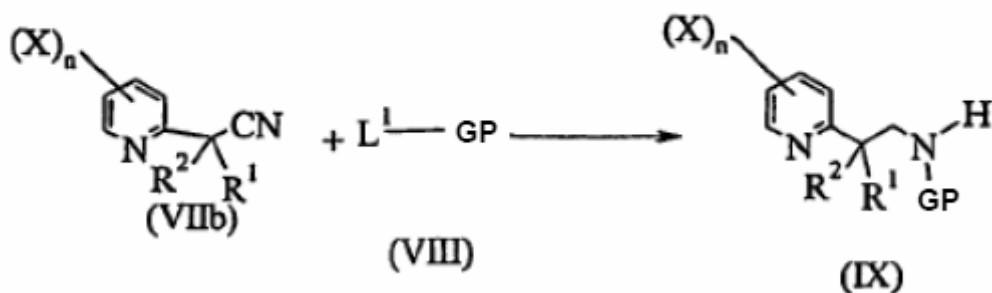
Esquema F-4

en el que:

- R^2 , X, n son como se han definido anteriormente;
- W es un átomo de halógeno;
- R^1 es un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un alquino C_2-C_6 , un alquilamino C_1-C_6 , un di-alquilamino C_1-C_6 , un alcoxi C_1-C_6 , un halogenoalcoxi C_1-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_6 , un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_6 , un halogenoalquenilo C_2-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquinoxilo C_3-C_6 , un halogenoalquinoxilo C_3-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un benciloxi, un bencilulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo, un fenilamino o un grupo fenilsulfanilo, un alquilcarbonilo C_1-C_6 o un halogenoalquilcarbonilo C_1-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

que comprende la sustitución nucleófila, en presencia de una base, de un compuesto de fórmula general (VIIIf) en presencia de un compuesto de fórmula general (XV), produciendo un compuesto de fórmula general (VIIb), a una temperatura de $-78\text{ }^\circ\text{C}$ a $150\text{ }^\circ\text{C}$;

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

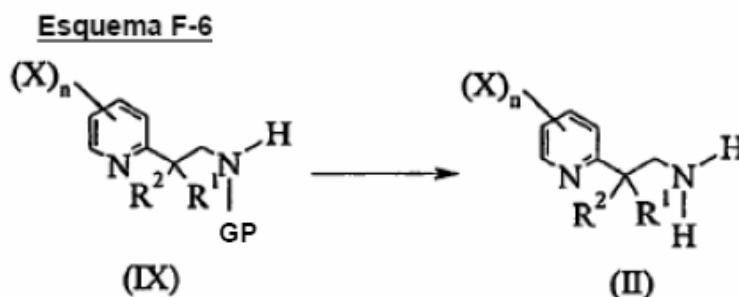
Esquema F-5

en el que:

- R^2 , X, n son como se han definido anteriormente;
- R^1 es un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un alquino C_2-C_6 , un alquilamino C_1-C_6 , un di-alquilamino C_1-C_6 , un alcoxi C_1-C_6 , un halogenoalcoxi C_1-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_6 , un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_6 , un halogenoalquenilo C_2-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquinoxilo C_3-C_6 , un halogenoalquinoxilo C_3-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un benciloxi, un bencilulfanilo, un bencilamino, un fenoxi, un fenilsulfanilo, un fenilamino o un grupo fenilsulfanilo, un alquilcarbonilo C_1-C_6 o un halogenoalquilcarbonilo C_1-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- L^1 es un grupo saliente seleccionado entre un grupo $-OR^{79}$ o un grupo $-OCOR^{79}$, siendo R^{79} siendo un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
- GP representa un grupo protector que puede ser un grupo $-COOR^{79}$ o grupo $-COR^{79}$, siendo R^{79} un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;

que comprende la reducción, por hidrogenación o por un donante de hidruro, de un compuesto de fórmula general (VIIb), en presencia de un catalizador y en presencia de un compuesto de fórmula general (VIII), produciendo un compuesto de fórmula general (IX), a una temperatura de $0\text{ }^\circ\text{C}$ a $150\text{ }^\circ\text{C}$ y a una presión de 100 kPa a 10.000 kPa;

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



en el que:

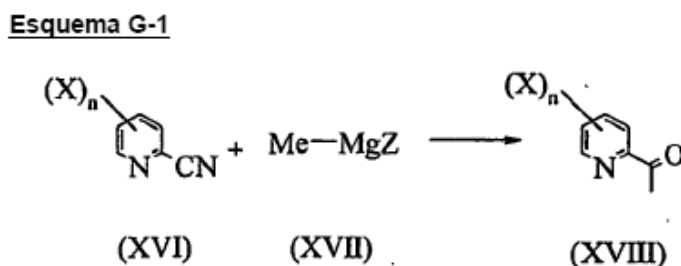
- 5 - R^2 , X, n son como se han definido anteriormente;
 - R^1 es un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un alquilo C_2-C_6 , un alquilamino C_1-C_6 , un di-alquilamino C_1-C_6 , un alcoxi C_1-C_6 , un halogenoalcoxi C_1-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfanilo C_1-C_6 , un halogenoalquilsulfanilo C_1-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C_2-C_6 , un halogenoalquenilo C_2-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiloxi C_3-C_6 , un halogenoalquiloxi C_3-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo, un fenilsulfanilo, un fenilamino, o un grupo fenilsulfanilo, un alquilcarbonilo C_1-C_6 o un halogenoalquilcarbonilo C_1-C_6 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
 - GP representa un grupo protector que puede ser un grupo $-COOR^{79}$ o grupo $-COR^{79}$, siendo R^{79} un alquilo C_1-C_6 , un haloalquilo C_1-C_6 , un bencilo, 4-metoxibencilo o pentafluorofenilo;
- 15 que comprende una reacción de desprotección, en un medio ácido o en un medio básico, de un compuesto de fórmula general (IX), para dar un derivado de amina de fórmula general (II) o una de sus sales.

Un séptimo ejemplo (G) de dicho procedimiento puede ser cuando:

- X, n son como se han definido anteriormente;
- R^1 es un grupo hidroxilo; y
- 20 - R^3 , R^2 , y R^4 son átomos de hidrógeno;

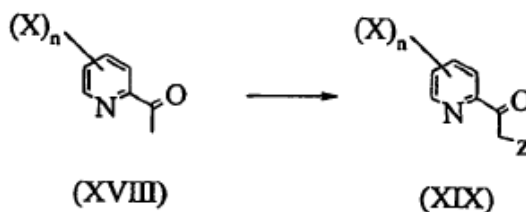
entonces, el derivado de amina de fórmula general (II) se puede preparar de acuerdo con un procedimiento que comprende:

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



- 25 en el que:
- X y n son como se han definido anteriormente;
 - Z es un átomo de halógeno;
- que comprende la adición de un halogenuro de metil-magnesio de fórmula general (XVII) a un derivado de piridina de fórmula general (XVI), para dar un compuesto de fórmula general (XVIII);
- 30 - una segunda etapa de acuerdo con el esquema de reacción G-2:

Esquema G-2



en el que:

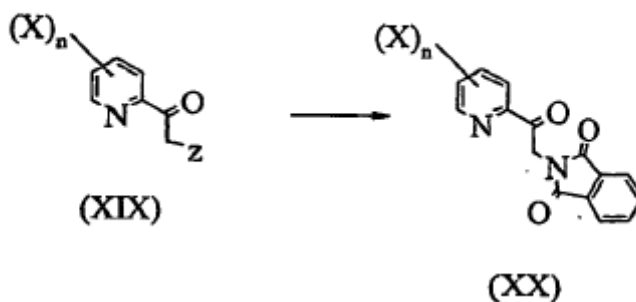
- X y n son como se han definido anteriormente;
- Z es un átomo de halógeno;

5 que comprende la halogenación de un compuesto de fórmula general (XVIII) en un compuesto de fórmula general (XIX) mediante el uso de un agente halogenante tal como cloro, bromo, iones hipoclorito, iones hipobromito, iones tricloruro, iones tribromuro, *N*-cloro-imidas, *N*-cloro-amidas, *N*-cloro-aminas, *N*-bromo-imidas, *N*-bromo-amidas o *N*-bromo-aminas.

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

10

Esquema G-3



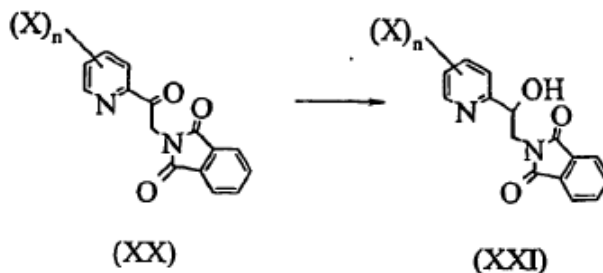
en el que:

- X y n son como se han definido anteriormente;
- Z es un átomo de halógeno;

15 que comprende la sustitución nucleófila de un compuesto de fórmula general (XIX) con una sal ftalimida, produciendo un compuesto de fórmula general (XX);

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

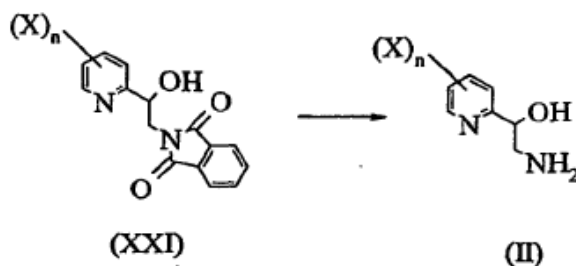
Esquema G-4



20 en el que X y n son como se han definido anteriormente; que comprende la reducción de un compuesto de fórmula general (XX) por un donante de hidruro, produciendo un compuesto de fórmula general (XXI);

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

Esquema G-5



en el que X y n son como se han definido anteriormente

que comprende la desprotección de un compuesto de fórmula general (XXI) haciéndolo reaccionar con hidrato de hidrazina o una sal de hidrazina, para dar un derivado de amina de fórmula general (II) o una de sus sales.

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

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

15 En la presente memoria descriptiva, el término "soporte" se refiere a un material natural o sintético, orgánico o inorgánico, con el que se combina el material activo para facilitar su aplicación, en concreto, a las partes de la planta. Así pues, este soporte, en general, es inerte, y debe ser agrícolamente aceptable. El soporte puede ser un sólido o un líquido. Los ejemplos de soportes adecuados incluyen arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos, agua, alcoholes, en particular, butanol, disolventes orgánicos, aceites minerales y vegetales, y derivados de los mismos. También se pueden mezclas de dichos soportes.

20 La composición también puede comprender componentes adicionales. En particular, la composición puede comprender además un tensioactivo. El tensioactivo puede ser un emulsionante, un agente dispersante o un agente humectante de tipo iónico o no iónico, o una mezcla de dichos tensioactivos. Cabe mencionar, por ejemplo, sales del ácido poliacrílico, sales del ácido lignosulfónico, sales del ácido fenolsulfónico o naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, fenoles sustituidos (en particular, alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres del ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (en particular, tauratos de alquilo), ésteres fosfóricos de alcoholes o fenoles polioxielilados, ésteres de ácido graso de polioles, y derivados de los compuestos anteriores que contienen funciones sulfato, sulfonato y fosfato. En general, la presencia de al menos un tensioactivo es esencial cuando el material activo y/o el soporte inerte son insolubles en agua y cuando el agente vectorial para la aplicación es agua. Preferentemente, el contenido de tensioactivo puede estar comprendido entre el 5 % y el 40 % en peso de la composición.

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

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

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

Estas composiciones no solo incluyen composiciones que están listas para aplicarlas a la planta o la semilla que se vaya a tratar mediante un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo de pulverización o vaporización, sino

también composiciones comerciales concentradas que se deben diluir antes de aplicarse al cultivo.

Los compuestos de la invención también se pueden mezclar con uno o más insecticidas, fungicidas, bactericidas, atractores de acaricidas o feromonas, u otros compuestos con actividad biológica. Las mezclas así obtenidas tienen un espectro de actividad ampliado. Las mezclas con otros fungicidas son particularmente ventajosas.

- 5 Las composiciones fungicidas de la presente invención se pueden usar para controlar, curativa o preventivamente, los hongos fitopatógenos de cultivos. Por lo tanto, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento para controlar, curativa o preventivamente, los hongos fitopatógenos de cultivos, caracterizado porque se aplica una composición fungicida, como se ha definido anteriormente en el presente documento, a la semilla, a la planta y/o al fruto de la planta o al suelo en el que está creciendo la planta o en el que se desea que crezca.

10 Cuando la composición se usa contra hongos fitopatógenos de cultivos comprende una cantidad eficaz y no fitotóxica de un material activo de fórmula general (I).

- 15 La expresión "cantidad eficaz y no fitotóxica" significa una cantidad de composición de acuerdo con la invención que es suficiente para controlar o destruir los hongos presentes o susceptibles de aparecer en los cultivos, y que no implica ningún síntoma apreciable de fitotoxicidad para dichos cultivos. Dicha cantidad puede variar en un amplio intervalo, dependiendo de los hongos que se desee controlar, del tipo de cultivo, de las condiciones climáticas y de los compuestos incluidos en la composición fungicida de acuerdo con la invención.

Esta cantidad se puede determinar mediante ensayos de campo sistémicos, que forman parte de las competencias del experto en la materia.

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

- 25 Entre las plantas que se pueden proteger mediante el procedimiento de acuerdo con la presente invención, cabe mencionar algodón; lino; vid; cultivos de frutas tales como *Rosaceae* sp. (por ejemplo, frutos de pepita tales como manzanas y peras, pero también frutos con hueso tales como albaricoque, almendras y melocotones), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (por ejemplo, plataneros y bananos), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (por ejemplo, limones, naranjas y pomelos); cultivos de leguminosas tales como *Solanaceae* sp. (por ejemplo, tomates), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (por ejemplo, lechugas), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, guisantes), *Rosaceae* sp. (por ejemplo, fresas); grandes cultivos tales como *Graminae* sp. (por ejemplo, maíz, cereales tales como trigo, arroz, cebada y triticale), *Asteraceae* sp. (por ejemplo, girasol), *Cruciferae* sp. (por ejemplo, colza), *Papilionaceae* sp. (por ejemplo, semilla de soja), *Solanaceae* sp. (por ejemplo, patatas), *Chenopodiaceae* sp. (por ejemplo, remolacha); cultivos hortícolas y forestales; así como homólogos modificados genéticamente de estos cultivos.

Entre las plantas y las posibles enfermedades de estas plantas protegidas por el procedimiento de acuerdo con la presente invención, cabe mencionar:

- 40 - trigo, en cuanto al control de las siguientes enfermedades de semillas: fusariosis (*Microdochium nivale* y *Fusarium roseum*), carbón hediondo (*Tilletia caries*, *Tilletia controversa* o *Tilletia indica*), septoriosis (*Septoria nodorum*) y carbón volante;
- 45 - trigo, en cuanto al control de las siguientes enfermedades de partes aéreas de la planta: mal de pie de los cereales (*Tapesia yallundae*, *Tapesia acuiformis*), añublo (*Gaeumannomyces graminis*), pie de tizón (*F. culmorum*, *F. graminearum*), mota negra (*Rhizoctonia cerealis*), oidio (*Erysiphe graminis forma specie tritici*), royas (*Puccinia striiformis* y *Puccinia recondita*) y septoriosis (*Septoria tritici* y *Septoria nodorum*);
- 50 - trigo y cebada, con respecto al control de enfermedades bacterianas y víricas, por ejemplo, el mosaico amarillo de la cebada;
- cebada, en cuanto al control de las siguientes enfermedades de semillas: helmintopirosis (*Pyrenophora graminea*, *Pyrenophora teres* y *Cochliobolus sativus*), carbón volante (*Ustilago nuda*) y fusariosis (*Microdochium nivale* y *Fusarium roseum*);
- 55 - cebada, con respecto al control de las siguientes enfermedades de partes aéreas de la planta: mal de pie de los cereales (*Tapesia yallundae*), helmintopirosis (*Pyrenophora teres* y *Cochliobolus sativus*), oidio (*Erysiphe graminis forma specie hordei*), roya enana (*Puccinia hordei*) y tizón foliar (*Rhynchosporium secalis*);
- patata, con respecto al control de enfermedades del tubérculo (en particular, *Helminthosporium solani*, *Phoma tuberosa*, *Rhizoctonia solani*, *Fusarium solani*), moho (*Phytophthora infestans*) y ciertos virus (virus Y);
- patata, con respecto al control de las siguiente enfermedades del follaje: tizón temprano (*Alternaria solani*), moho (*Phytophthora infestans*);
- algodón, con respecto al control de las siguiente enfermedades de plantas jóvenes desarrolladas a partir de

- semillas: podredumbre de las plántulas y podredumbre basal (*Rhizoctonia solani*, *Fusarium oxisporum*) y podredumbre negra de la raíz (*Thielaviopsis basicola*);
- cultivos productores de proteínas, por ejemplo, guisantes, con respecto al control de las siguientes enfermedades de las semillas: antracnosis (*Ascochyta pisi*, *Mycosphaerella pinodes*), fusariosis (*Fusarium oxisporum*), moho gris (*Botrytis cinerea*) y moho (*Peronospora pisi*);
 - cultivos oleaginosos, por ejemplo, la colza, con respecto al control de las siguientes enfermedades de las semillas: *Phoma lingam*, *Alternaria brassicae* y *Sclerotinia sclerotiorum*;
 - maíz, con respecto al control de enfermedades de las semillas: (*Rhizopus* sp., *Penicillium* sp., *Trichoderma* sp., *Aspergillus* sp., y *Gibberella fujikuroi*);
 - lino, con respecto al control de enfermedades de las semillas: *Alter naria linicola*;
 - árboles forestales, con respecto al control de la podredumbre (*Fusarium oxisporum*, *Rhizoctonia solani*);
 - arroz, con respecto al control de las siguientes enfermedades de partes aéreas: añublo (*Magnaporthe grisea*), mancha en el borde de la vaina (*Rhizoctonia solani*);
 - cultivos de leguminosas, con respecto al control de las siguientes enfermedades de las semillas o de plantas jóvenes desarrolladas a partir de semillas: podredumbre de las plántulas y podredumbre basal (*Fusarium oxisporum*, *Fusarium roseum*, *Rhizoctonia solani*, *Pythium* sp.);
 - cultivos de leguminosas, con respecto al control de las siguientes enfermedades de partes aéreas: moho gris (*Botrytis* sp.), oidios (en particular, *Erysiphe cichoracearum*, *Sphaerotheca fuliginea* y *Leveillula taurica*), fusariosis (*Fusarium oxisporum*, *Fusarium roseum*), necrosis foliar (*Cladosporium* sp.), necrosis foliar por alternaria (*Alternaria* sp.), antracnosis (*Colletotrichum* sp.), necrosis foliar por septoria (*Septoria* sp.), mota negra (*Rhizoctonia solani*), mohos (por ejemplo, *Bremia lactucae*, *Peronospora* sp., *Pseudoperonospora* sp., *Phytophthora* sp.);
 - árboles frutales, con respecto a enfermedades de las parte aéreas: candidosis (*Monilia fructigenae*, *M. laxa*), roña (*Venturia inaequalis*), oidio (*Podosphaera leucotricha*);
 - vid, con respecto a enfermedades del follaje: en particular, moho gris (*Botrytis cinerea*), oidio (*Uncinula necator*), podredumbre negra (*Guignardia biwelli*) y moho (*Plasmopara viticola*);
 - remolacha, con respecto a las siguientes enfermedades de las partes aéreas: cercospora (*Cercospora beticola*), oidio (*Erysiphe beticola*), necrosis foliar (*Ramularia beticola*).

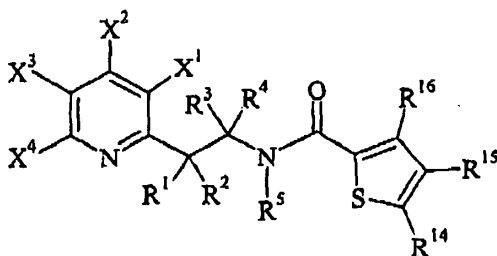
La composición fungicida de acuerdo con la presente invención también se puede usar contra enfermedades fúngicas susceptibles de desarrollarse sobre o dentro de la madera. El término "madera" significa todo tipo de especies de madera, y todo tipo de producto de esta madera, destinado a la construcción, por ejemplo, madera sólida, madera de alta densidad, madera laminada y contrachapado. El procedimiento para tratar la madera de acuerdo con la invención consiste, principalmente, en poner en contacto uno o más compuestos de la presente invención, o una composición de acuerdo con la invención; esto incluye, por ejemplo, la aplicación directa, pulverización, inmersión, inyección o cualquier otro medio adecuado.

La dosis de material activo aplicada normalmente en el tratamiento de acuerdo con la presente invención es, general y ventajosamente, de entre 10 y 800 g/ha, preferentemente de entre 50 y 300 g/ha para aplicaciones en el tratamiento foliar. La dosis de sustancia activa aplicada es, general y ventajosamente, de entre 2 y 200 g por 100 kg de semilla, preferentemente de entre 3 y 150 g por 100 kg de semillas, en el caso del tratamiento de semillas. Como es evidente, se entiende que las dosis indicadas anteriormente se dan como ejemplos ilustrativos de la invención. Cualquier experto en la materia sabrá cómo adaptar las dosis de aplicación de acuerdo con la naturaleza del cultivo que se vaya a tratar.

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

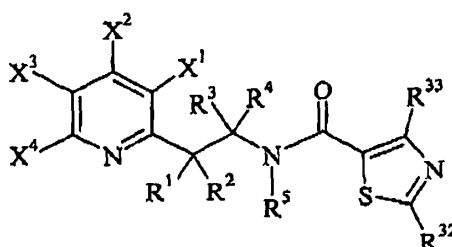
A continuación, se ilustrarán los aspectos de la presente invención con referencia a las siguientes tablas de compuestos y ejemplos. Las siguientes Tablas A a C ilustran, de una manera no limitante, ejemplos de compuestos fungicidas de acuerdo con la presente invención. En los siguientes ejemplos, M+1 (o M-1) significa el pico iónico molecular, más o menos 1 u.m.a. (unidad de masa atómica) respectivamente, como se observa en la espectroscopia de masas, y p.f. significa punto de fusión.

Tabla A



Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	R ¹⁴	R ¹⁵	R ¹⁶	M+1	p.f. (°C)
A-1	H	Me	H	H	H	Cl	H	Cl	H	H	H	I	441 a 1 ³⁵ Cl	-
A-2	H	Me	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H	I	407 a 1 ³⁵ Cl	-

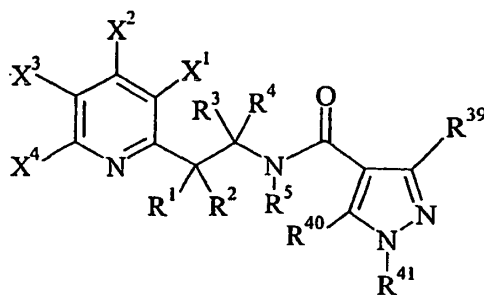
Tabla B



Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	R ³²	R ³³	M+1
B-1	H	Me	H	H	H	Cl	H	Cl	H	Me	CF ₃	398 a 1 ³⁵ Cl
B-2	H	Me	H	H	H	H	H	Cl	H	Me	CF ₃	364 a 1 ³⁵ Cl

5

Tabla C



Compuesto	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X ¹	X ²	X ³	X ⁴	R ³⁹	R ⁴⁰	R ⁴¹	M+1
C-1	H	Me	H	H	H	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	Me	381 a 1 ³⁵ Cl
C-2	H	Me	H	H	H	H	H	Cl	H	CF ₃	H	Me	347 a 1 ³⁵ Cl
C-3	ciclopentilo		H	H	H	H	H	Cl	H	CHF ₂	H	Me	381 a 1 ³⁵ Cl
C-4	H	Et	H	H	H	H	H	Cl	H	CHF ₂	H	Me	347 a 1 ³⁵ Cl

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

Preparación de N-[2-(5-cloro-2-piridinil)propil]-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida*Preparación de 2-ciano-2-(5-cloro-2-piridinil)propanoato terc-butílico*

- 10 A 150 ml de dimetoxietano, se añadieron lentamente en porciones a 0 °C 11,6 g (0,29 mol) de hidruro de sodio (dispersión en aceite mineral al 60 %). A esta suspensión, se añadieron además gota a gota a 5 °C 21,1 g (0,149 mol) de cianoacetato de *terc*-butilo en 50 ml de dimetoxietano. Se agitó la suspensión durante 45 min a temperatura ambiente. A la suspensión, se añadieron sucesivamente 20 g (0,136 mol) de 2,5-dicloropiridina, 0,73 g (1,36 mmol) de (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-*terc*-butilfosfina y 1,56 g (2,7 mmol) de bis(dibencilidenacetona)paladio (0). Se calentó la mezcla de color negro a reflujo durante 4 horas. Después de
- 15 enfriar a temperatura ambiente, se añadieron 12,7 ml (0,2 mol) de yoduro de metilo gota a gota, y se agitó la mezcla adicionalmente a temperatura ambiente durante 17 horas. Se vertió la mezcla de reacción en 100 ml de ácido clorhídrico 1 N y se filtró la fase acuosa en supersel y se extrajo con acetato de etilo (3 x 200 ml).

Se lavó la fase orgánica con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio. Se evaporó el disolvente a presión reducida, dando 44,56 g del producto en bruto en forma de un aceite marrón. Se purificó el producto en bruto por cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 8/2), dando 2-ciano-2-(5-cloro-2-piridinil)propanoato *terc*-butílico: 23,44 g (64 %) en forma de un aceite amarillo.

5 Espectro de masas: $[M + 1] = 267$.

Preparación de 2-(5-cloro-2-piridinil)propanonitrilo

A una solución de 23 g (0,086 mol) de 2-ciano-2-(5-cloro-2-piridinil)propanoato *terc*-butílico en 150 ml de tolueno, se añadieron 7,4 g (0,043 mol) de monohidrato de ácido *p*-toluenosulfónico. Se agitó la mezcla durante 1,5 horas a 110 °C. Tras enfriar, se vertió la mezcla de reacción en agua con hielo, y se llevó el pH a 8 mediante la adición de hidrogenocarbonato de sodio acuoso.

10 Se extrajo la fase acuosa con acetato de etilo (3 x 250 ml), y se lavó la fase orgánica con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio. Se evaporó el disolvente a presión reducida, dando 15,4 g del producto en bruto en forma de un aceite naranja. El producto en bruto se purificó por cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 8/2), dando 2-(5-cloro-2-piridinil)propanonitrilo: 7,8 g (54 %) en forma de un aceite amarillo.

15 Espectro de masas: $[M + 1] = 167$.

Preparación de 2-(5-cloro-2-piridinil)propilcarbamato *terc*-butílico

A una solución de 5,2 g (0,031 mol) de 2-(5-cloro-2-piridinil)propanonitrilo en 60 ml de metanol, se añadieron rápidamente 8 g (0,034 mol) de hexahidrato de cloruro de cobalto (II) y 13,5 g (0,062 mol) de dicarbonato de di-*terc*-butilo. Se enfrió la solución oscura a -5 °C y se añadieron 8,2 g (0,217 mol) de borohidruro de sodio en porciones a 0 °C. Se agitó la mezcla de reacción a temperatura ambiente durante 1 hora. Se neutralizó la mezcla de reacción con 100 ml de ácido clorhídrico 1 N, y se retiró el metanol a presión reducida. Se volvió a extraer la fase acuosa con acetato de etilo (2 x 150 ml), y se lavó la fase orgánica con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio.

20 El disolvente se evaporó a presión reducida, dando 11,7 g del producto en bruto en forma de un aceite negro. El producto en bruto se purificó por cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 9/1), dando 2-(5-cloro-2-piridinil)propil-carbamato *terc*-butílico: 4,8 g (57 %) en forma de un aceite de color amarillo. Espectro de masas: $[M + 1] = 271$.

Preparación de clorhidrato de 2-(5-cloro-2-piridinil)propilamina

A una solución de 4,8 g (0,018 mol) de 2-(5-cloro-2-piridinil)propil-carbamato *terc*-butílico en 30 ml de éter dietílico, se añadieron 44 ml (0,089 mol) de una solución 2 M de cloruro de hidrógeno en éter dietílico. Se agitó la mezcla durante 3 horas a temperatura ambiente.

30 Se filtró el sólido y se secó durante la noche al vacío, dando clorhidrato de 2-(5-cloro-2-piridinil)propilamina: 3,5 g (94 %) en forma de un sólido amarillo. Espectro de masas: $[M + 1] = 169$.

Preparación de *N*-[2-(5-cloro-2-piridinil)propil]-1-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-4-carboxamida

A una suspensión de 100 mg (0,48 mmol) de clorhidrato de 2-(5-cloro-2-piridinil)propilamina en 3 ml de diclorometano, se añadieron sucesivamente 240 μ l (1,68 mmol) de trietilamina y 113 mg (0,58 mmol) de cloruro de 1-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-4-carbonilo. Se agitó la mezcla durante 4 horas a temperatura ambiente. Se vertió la mezcla de reacción en agua, y se llevó el pH a 4.

40 Se evaporó el disolvente, y el residuo se purificó por cromatografía ultrarrápida sobre gel de sílice (eluyente: heptano/acetato de etilo: 8/2), dando *N*-[2-(5-cloro-2-piridinil)propil]-1-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-4-carboxamida en forma de un aceite amarillo: 40 mg (24 %) en forma de un aceite amarillo. Espectro de masas: $[M + 1] = 347$.

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

Ejemplo A: ensayo *in vivo* sobre *Alternaria brassicae* (necrosis foliar de crucíferas)

45 Se prepara el principio activo sometido a ensayo por homogenización en una formulación de tipo suspensión concentrada a 100 g/l. A continuación, se diluye esta suspensión con agua, obteniéndose la concentración deseada de material activo.

50 Se tratan plantas de rábano (variedad Pernot) en cubetas de inicio, sembradas en un sustrato de suelo de turba-puzolana 50/50 y cultivadas a 18-20 °C, en la fase cotiledón mediante pulverización con la suspensión acuosa descrita anteriormente.

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

Tras 24 horas, se contaminan las plantas pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria brassicae* (40.000 esporas por cm³). Se recogen las esporas de un cultivo de 12-13 días de duración.

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

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

- 5 En estas condiciones, se observa una buena protección (de al menos el 50 %) o una protección total a una dosis de 330 ppm con los siguientes compuestos: A1.

En estas condiciones, se observa una buena protección (de al menos el 50 %) o una protección total a una dosis de 125 ppm con los siguientes compuestos: C4.

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

- 10 Se prepara el principio activo sometido a ensayo por homogenización en una formulación de tipo suspensión concentrada a 100 g/l. A continuación, se diluye esta suspensión con agua, obteniéndose la concentración deseada de material activo.

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

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

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

En estas condiciones, se observa una buena protección (de al menos el 50 %) o una protección total a una dosis de 330 ppm con los siguientes compuestos: A1, B1, C1, C2 y D1.

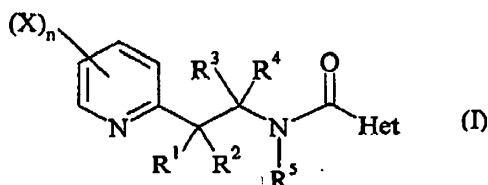
- 25 En estas condiciones, se observa una buena protección (de al menos el 50 %) o una protección total a una dosis de 125 ppm con los siguientes compuestos: C4.

- 30 La *N*-{1-metilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]-etil}-4-fenilbenzamida desvelada por la solicitud de patente WO 01/11965 (véase el compuesto 316 de la Tabla D) demostró una baja eficacia sobre *Alternaria brassicae*, y una eficacia nula sobre *Botrytis cinerea* a 330 ppm; la *N*-{1-etilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]etil}-3-nitrobenzamida también desvelada por la solicitud de patente WO 01/11965 (véase el compuesto 307 de la Tabla D) demostró una baja eficacia sobre *Alternaria brassicae*, y una eficacia nula sobre *Botrytis cinerea* a 330 ppm; la *N*-{1-etilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]-etil}-benzamida y la *N*-{1-metilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]etil}-benzamida también desveladas por la solicitud de patente WO 01/11965 (véanse los compuestos 304 y 314 de la Tabla D) demostraron eficacias nulas sobre *Botrytis cinerea* a 330 ppm; y la *N*-{1-etilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]-etil}-4-clorobenzamida, la *N*-{1-etilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]etil}-2-bromobenzamida y la *N*-{1-metilcarbamoil-2-[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]etil}-4-metoxibenzamida también desveladas por la solicitud de patente WO 01/11965 (véanse los compuestos 306, 310 y 315 de la Tabla D) demostraron una eficacia nula sobre *Botrytis cinerea* a 330 ppm.

- 40 La *N*-{[3-cloro-5-(trifluorometil)-2-piridinil]metil}-5-tienilacetamida desvelada por la solicitud de patente WO 01/11965 (véase el compuesto 101 de la Tabla B) demostró una baja eficacia sobre *Alternaria brassicae* y una eficacia nula sobre *Botrytis cinerea* y *Peronospora parasitica* a 330 ppm.

REIVINDICACIONES

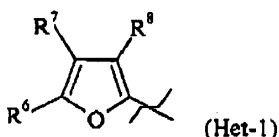
1. Un compuesto de fórmula general (I)



en la que:

- 5 - n es 1, 2, 3 o 4;
 - X es igual o diferente, y es un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₈, un alcoxiimino C₁-C₆, un (alcoxiimino C₁-C₆)-alquilo C₁-C₆ o un alcoxi C₁-C₆-alquilcarbonilo-C₁-C₆;
 - R¹ y R² son iguales o diferentes, y son seleccionados, de manera independiente entre sí, entre un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un alquilo C₁-C₆, un halogenoalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueno C₂-C₆, un alcoxi C₁-C₆, un alquilsulfanilo C₁-C₆, un alquilsulfenilo C₁-C₆, un alquilsulfinilo C₁-C₆, un alcocarbonilamino C₁-C₆ o un grupo fenilo;
 o R¹ y R² pueden formar juntos un ciclopropilo, un ciclobutilo, un ciclopentilo o un ciclohexilo;
 - R³ y R⁴ son iguales o diferentes, y son seleccionados, de manera independiente entre sí, entre un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₆, un halogenoalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un grupo fenilo;
 con la condición de que cuando tres de los cuatro sustituyentes R¹, R², R³ y R⁴ sean un átomo de hidrógeno, entonces el cuarto sustituyente no sea un átomo de hidrógeno;
 - R⁵ es un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo hidroxilo, un alquilo C₁-C₆, un halogenoalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₆, un halogenoalcoxi C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₆, un halogenocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueno C₂-C₆, un alquino C₂-C₆, un alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, un cianoalquilo C₁-C₆, un aminoalquilo C₁-C₆, un alquilamino C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, un di-alquilamino-C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, un alquilcarbonilo C₁-C₆, un halogenalquilcarbonilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiloxicarbonilo C₁-C₆, un benciloxicarbonilo C₁-C₆, un alcoxi C₁-C₆-alquilcarbonilo C₁-C₆, un alquilsulfonilo C₁-C₆ o un halogenoalquilsulfonilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
 - Het representa:

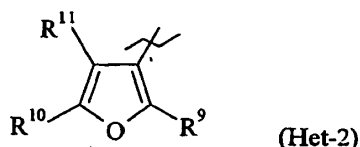
*(Het-1):



en la que:

- 35 - R⁶ y R⁷ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
 - R⁸ puede ser un átomo de halógeno, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

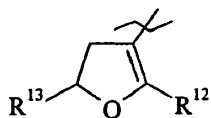
*(Het-2):



en la que:

- 40 - R⁹ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
 - R¹⁰ y R¹¹ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

con la condición de que el R⁹ y R¹¹ no sean ambos un átomo de hidrógeno;
*(Het-3):

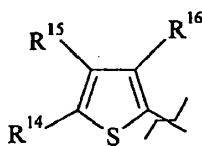


(Het-3)

en la que:

- 5
- R¹² puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
 - R¹³ puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

*(Het-4):

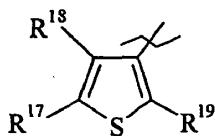


(Het-4)

en la que:

- 10
- R¹⁴ y R¹⁵ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiltio C₁-C₄, un alquilsulfonilo C₁-C₄, un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄, o un piridilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄; y
 - R¹⁶ puede ser un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- 15

*(Het-5):

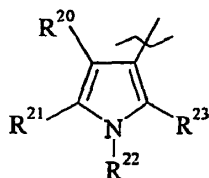


(Het-5)

en la que:

- 20
- R¹⁷ y R¹⁸ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄, un alquiloxi C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
 - R¹⁹ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

25 con la condición de que R¹⁸ y R¹⁹ no sean ambos un átomo de hidrógeno;
*(Het-6):



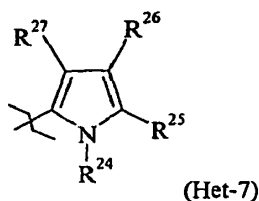
(Het-6)

en la que:

- 30
- R²⁰ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
 - R²¹ y R²³ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
 - R²² puede ser un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que

tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un hidroxialquilo C₁-C₄, un alquilsulfonilo C₁-C₄, un di(alquil C₁-C₄)aminosulfonilo, un alquilcarbonilo C₁-C₆, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄, o un benzoílo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄;

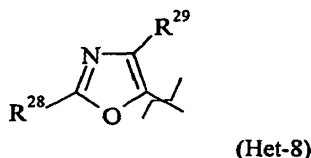
5 con la condición de que R²⁰ y R²³ no sean ambos un átomo de hidrógeno;
*(Het-7):



en la que:

10 - R²⁴ puede ser un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un hidroxialquilo C₁-C₄, un alquilsulfonilo C₁-C₄, un di(alquil C₁-C₄)aminosulfonilo, un alquilcarbonilo C₁-C₆, un fenilsulfonilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄, o un benzoílo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄; y
15 - R²⁵, R²⁶ y R²⁷ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un alquilcarbonilo C₁-C₄;

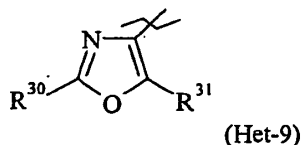
con la condición de que R²⁴ y R²⁷ no sean ambos un átomo de hidrógeno;
*(Het-8):



20 en la que:

- R²⁸ puede ser un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₄; y
- R²⁹ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

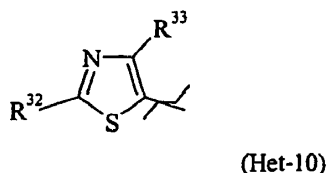
*(Het-9):



25 en la que:

- R³⁰ puede ser un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₄; y
- R³¹ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄;

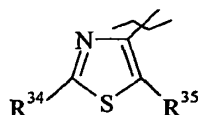
30 *(Het-10):



en la que:

- R³² puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo ciano, un alquilamino C₁-C₄, un di-(alquil C₁-C₄)amino, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄; y
- R³³ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

*(Het-11):

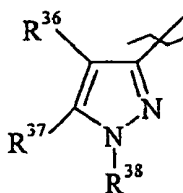


(Het-11)

en la que:

- R³⁴ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo amino, un grupo ciano, un alquilamino C₁-C₄, un di-(alquil C₁-C₄)amino, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R³⁵ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

*(Het-12):

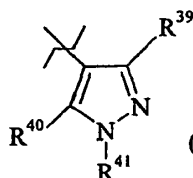


(Het-12)

en la que:

- R³⁶ puede ser un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₆, un alcoxi C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiltio C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un grupo aminocarbonilo o un aminocarbonil-alquilo C₁-C₄;
- R³⁷ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un alcoxi C₁-C₄ o un alquiltio C₁-C₄; y
- R³⁸ puede ser un átomo de hidrógeno, un fenilo, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo C₁-C₄, un alquenilo C₂-C₆, un cicloalquilo C₃-C₆, un alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ o un halogenoalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno.

*(Het-13):



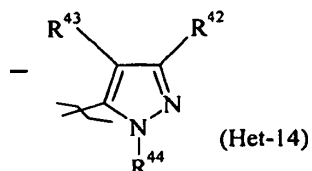
(Het-13)

en la que:

- R³⁹ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₆, un alcoxi C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiltio C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un aminocarbonilo o un aminocarbonil-alquilo C₁-C₄;
- R⁴⁰ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un alcoxi C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un alquiltio C₁-C₄; y
- R⁴¹ puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo C₁-C₄, un alquenilo C₂-C₆, un cicloalquilo C₃-C₆, un alquiltio C₁-C₄-

alquilo C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄, un alcoxialquilo C₁-C₄ o un grupo nitro;

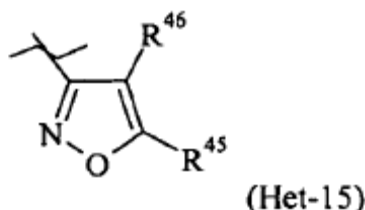
5 con la condición de que R³⁹ y R⁴⁰ no sean ambos un átomo de hidrógeno;
*(Het-14):



en la que:

- 10 - R⁴² puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo nitro, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un cicloalquilo C₃-C₆, un alcoxi C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiltio C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un aminocarbonilo o un aminocarbonilalquilo C₁-C₄;
- 15 - R⁴³ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un alcoxi C₁-C₄, un alquiltio C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
- 20 - R⁴⁴ puede ser un átomo de hidrógeno, un fenilo, un bencilo, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un hidroxialquilo C₁-C₄, un alquenilo C₂-C₆, un cicloalquilo C₃-C₆, un alquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, un halogenoalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

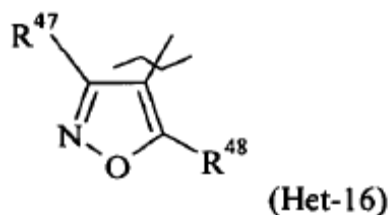
con la condición de que R⁴³ y R⁴⁴ no sean ambos un átomo de hidrógeno;
*(Het-15):



en la que:

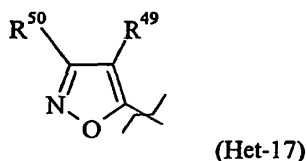
- 25 - R⁴⁵ puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo que tiene hasta cuatro átomos de carbono o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R⁴⁶ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo que tiene hasta cuatro átomos de carbono o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

*(Het-16):



- 30 en la que R⁴⁷ y R⁴⁸ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄, o un heterociclilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄;

con la condición de que R⁴⁷ y R⁴⁸ no sean ambos un átomo de hidrógeno;
*(Het-17):



en la que:

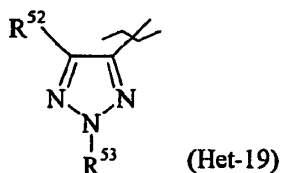
- 5
- R⁴⁹ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno. y
 - R⁵⁰ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

*(Het-18):



10 en la que R⁵¹ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

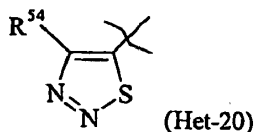
*(Het-19):



15 en la que:

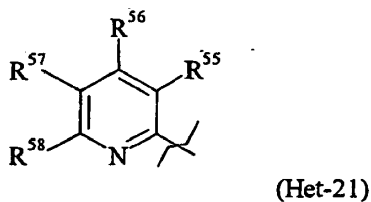
- R⁵² puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- R⁵³ puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, o un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C₁-C₄;

20 *(Het-20):



en la que R⁵⁴ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

*(Het-21):

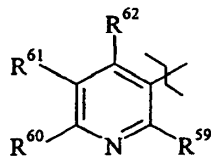


25 en la que:

- 30
- R⁵⁵ puede ser un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄, un alquiltio C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

- R^{16} , R^{57} y R^{58} , que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C_1-C_4 , un halogenoalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C_1-C_4 , un alquiltio C_1-C_4 , un halogenoalcoxi C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C_1-C_4 o un alquilsulfonilo C_1-C_4 ;

5 *(Het-22):



(Het-22)

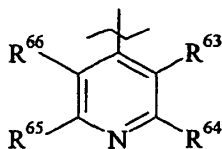
en la que:

10 - R^{59} puede ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo C_1-C_4 , un halogenoalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C_1-C_4 , un alquiltio C_1-C_5 , un alqueniltio C_2-C_5 , un halogenoalquiltio C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un fenilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C_1-C_4 , o un feniltio opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C_1-C_4 ;

15 - R^{60} , R^{61} y R^{62} , que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un alquilo C_1-C_4 , un halogenoalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C_1-C_4 , un alquiltio C_1-C_4 , un halogenoalcoxi C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C_1-C_4 , un alquilsulfonilo C_1-C_4 o una *N*-morfolina opcionalmente sustituida con un átomo de halógeno o un alquilo C_1-C_4 , o un tienilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno o un alquilo C_1-C_4 ;

20 con la condición de que R^{59} y R^{62} no sean ambos un átomo de hidrógeno;

*(Het-23):

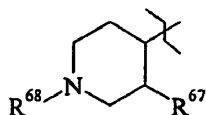


(Het-23)

25 en la que R^{63} , R^{64} , R^{65} y R^{66} , que pueden ser iguales o diferentes, pueden ser un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo C_1-C_4 , un halogenoalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C_1-C_4 , un alquiltio C_1-C_4 , un halogenoalquiltio C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalcoxi C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilsulfinilo C_1-C_4 o un alquilsulfonilo C_1-C_4 ;

con la condición de que R^{63} y R^{66} no sean ambos un átomo de hidrógeno;

*(Het-24):



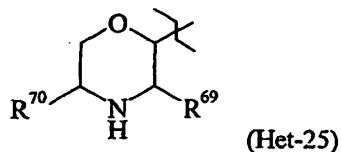
(Het-24)

30 en la que:

35 - R^{67} puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C_1-C_4 o un halogenoalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

- R^{68} puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C_1-C_4 , un halogenoalquilo C_1-C_4 que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcóxycarbonilo C_1-C_6 , un bencilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 átomos de halógeno, un benciloxycarbonilo opcionalmente sustituido con de 1 a 3 átomos de halógeno o un heterociclilo;

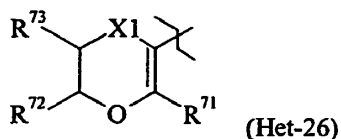
*(Het-25):



en la que:

- 5
- R⁶⁹ puede ser un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₄, un alquiltio C₁-C₄, un halogenoalquiltio C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un halogenoalcoxi C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;
 - R⁷⁰ puede ser un átomo de hidrógeno, un alquilo C₁-C₄, un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un bencilo;

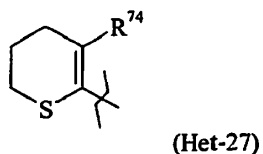
10 *(Het-26):



en la que:

- 15
- X¹ puede ser un átomo de azufre, -SO-, -SO₂- o -CH₂-;
 - R⁷¹ puede ser un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
 - R⁷² y R⁷³ pueden ser iguales o diferentes, y pueden ser un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₄;

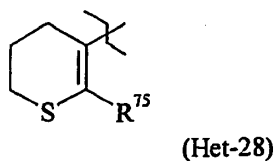
*(Het-27):



en la que:

- 20
- R⁷⁴ puede ser un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

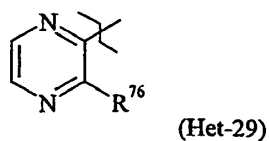
*(Het-28):



en la que:

- R⁷⁵ pueden ser un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

*(Het-29):



- 25
- en la que R⁷⁶ puede ser un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₄ o un halogenoalquilo C₁-C₄ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno;

estando Het al menos sustituido en la posición *orto*;

así como sus sales, *N*-óxidos, y complejos metálicos y metaloides.

2. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1, **caracterizado porque** *n* es 1, 2 o 3.

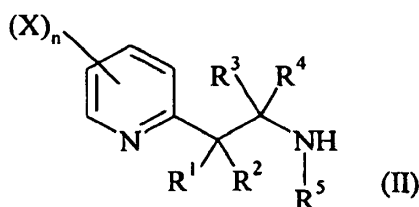
3. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 2, **caracterizado porque** el 2-piridilo está sustituido en la posición 3, 5 y/o 6.

5 4. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, **caracterizado porque** *R*¹ y *R*² son seleccionados, de manera independiente entre sí, entre un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₆, un halogenoalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un alquilcarbonilamino C₁-C₆.

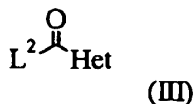
10 5. Un compuesto de acuerdo con la reivindicación 4, **caracterizado porque** *R*³ y *R*⁴ son seleccionados, de manera independiente entre sí, entre un átomo de halógeno, un alquilo C₁-C₆, un halogenoalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno o un grupo fenilo.

6. Un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, **caracterizado porque** *R*⁵ es un átomo de hidrógeno o un cicloalquilo C₃-C₇.

15 7. Un procedimiento de preparación de un compuesto de fórmula general (I) según lo definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6, que comprende hacer reaccionar un derivado de 2-piridina de fórmula general (II) o una de sus sales:



en la que *X*, *n*, *R*¹, *R*², *R*³, *R*⁴ y *R*⁵ son como en cualquiera de las reivindicaciones anteriores; con un derivado de ácido carboxílico de fórmula general (III):



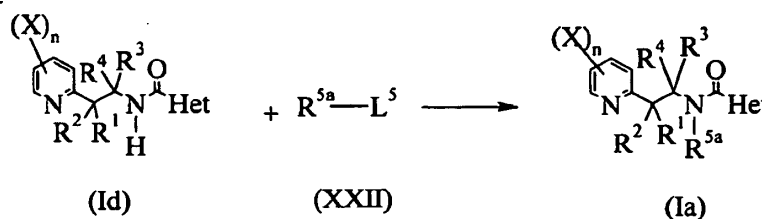
20 en la que:

- *Het* es como se ha definido en cualquiera de las reivindicaciones anteriores; y
- *L*² es un grupo saliente seleccionado entre un átomo de halógeno, un grupo hidroxilo, -OR⁶, -OCOR⁶, siendo *R*⁶ un alquilo C₁-C₆, un haloalquilo C₁-C₆, un bencilo, 4-metoxibencilo, pentafluorofenilo o un grupo de fórmula:



en presencia de un catalizador y, si *L*² es un grupo hidroxilo, en presencia de un agente de condensación.

8. Un procedimiento de acuerdo con la reivindicación 7, **caracterizado porque** *R*⁵ es un átomo de hidrógeno y porque el procedimiento se completa mediante una etapa adicional de acuerdo con el siguiente esquema de reacción:



30 en el que:

- *R*¹, *R*², *R*³, *R*⁴, *X*, *n* y *Het* son como se han definido en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8;
- *R*^{5a} es un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo hidroxilo, un alquilo C₁-C₆, un halogenoalquilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alcoxi C₁-C₆, un halogenoalcoxi C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno,

- 5 un cicloalquilo C₃-C₆, un halogenocicloalquilo C₃-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueno C₂-C₆, un alquino C₂-C₆, un alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, un cianoalquilo C₁-C₆, un aminoalquilo C₁-C₆, un alquilamino C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, un di-alquilamino C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, un alquilcarbonilo C₁-C₆, un halogenalquilcarbonilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno, un alquiloxicarbonilo C₁-C₆, un benciloxicarbonilo C₁-C₆, un alcoxi C₁-C₆-alquilcarbonilo C₁-C₆, un alquilsulfonilo C₁-C₆ o un halogenoalquilsulfonilo C₁-C₆ que tiene de 1 a 5 átomos de halógeno; y
- L⁵ es a grupo saliente seleccionado entre un átomo de halógeno, un 4-metil-fenilsulfonilo o un metilsulfonilo;
- que comprende la reacción de un compuesto de fórmula general (Id) con un compuesto de fórmula general (XXII), para dar un compuesto de fórmula general (Ia).
- 10 9. Una composición fungicida que comprende una cantidad eficaz de un compuesto de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 y un soporte agrícolamente aceptable.
- 15 10. Un procedimiento para combatir, preventiva o curativamente, los hongos fitopatógenos de cultivos, **caracterizado porque** se aplica una cantidad eficaz y no fitotóxica de una composición de acuerdo con la reivindicación 9 a las semillas de las plantas o a las hojas de las plantas y/o a los frutos de las plantas o al suelo en el que las plantas están creciendo o en el que se desea que crezcan.