

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 546 538**

51 Int. Cl.:

C07D 401/12	(2006.01)	C07D 471/04	(2006.01)
A01N 43/52	(2006.01)	A01P 3/00	(2006.01)
A01N 43/56	(2006.01)	A01N 43/80	(2006.01)
A01N 43/653	(2006.01)	A01N 43/50	(2006.01)
A01N 43/78	(2006.01)	A01N 43/82	(2006.01)
A01N 43/824	(2006.01)	C07D 213/82	(2006.01)
A01N 43/836	(2006.01)	C07D 221/04	(2006.01)
A01N 43/90	(2006.01)		
C07D 413/12	(2006.01)		
C07D 417/12	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **18.04.2006 E 06745581 (6)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **26.08.2015 EP 1887002**

54 Título: **Compuesto de carboxamida y uso del mismo**

30 Prioridad:

31.05.2005 JP 2005158568
28.11.2005 JP 2005341610

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
24.09.2015

73 Titular/es:

SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED
(100.0%)
27-1, Shinkawa 2-chome, Chuo-ku
Tokyo 104-8260, JP

72 Inventor/es:

ARIMORI, SADAYUKI y
KINOSHITA, YOSHIHARU

74 Agente/Representante:

UNGRÍA LÓPEZ, Javier

ES 2 546 538 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

Compuesto de carboxamida y uso del mismo

5 **Campo técnico**

La presente invención se refiere a un compuesto de carboxamida y el uso del mismo.

10 **Antecedentes de la invención**

Se ha progresado en el desarrollo de un agente de control de enfermedades vegetales y se han encontrado muchos compuestos que tienen actividad de control frente a las enfermedades vegetales. Sin embargo, la actividad de control de las enfermedades vegetales de estos compuestos no es suficiente en algunos casos.

15 Se han investigado intensamente compuestos nuevos que tienen actividad de control de enfermedades vegetales.

El documento JP2003528806 desvela compuestos heterocíclicos como fungicidas.

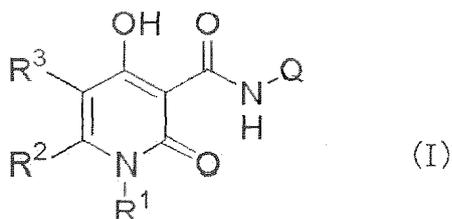
20 **Divulgación de la invención**

Un objeto de la presente invención es proporcionar un compuesto que tenga una excelente actividad de control de enfermedades vegetales.

La presente invención es como sigue:

25

[1] Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I):



30 [donde Q representa un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3, R¹ representa un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilquilo C2-C5, R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 o R¹ y R² se unen entre sí en un extremo para representar un grupo alquilenos C3-C4 y R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3.] (en lo sucesivo, denominado presente compuesto).

35

[2] El compuesto de carboxamida de acuerdo con [1], donde Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3 y un átomo de carbono adyacente a un átomo de nitrógeno entre los átomos constitucionales del anillo y un átomo de nitrógeno del NH en la fórmula (I) se unen entre sí.

40

[3] El compuesto de carboxamida de acuerdo con [1], donde Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno, el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3 y el grupo heterocíclico tiene como un átomo constitucional del anillo un átomo de nitrógeno y al menos un heteroátomo seleccionado de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno.

45

[4] El compuesto de carboxamida de acuerdo con [1], donde Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno no fusionado con otro anillo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

50

[5] El compuesto de carboxamida de acuerdo con [1], donde Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno fusionado con un anillo de benceno y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

55

- 5 [6] El compuesto de carboxamida de acuerdo con [1], donde Q es un grupo heterocíclico que es un grupo tiazolilo, un grupo benzotiazolilo, un grupo imidazolilo, un grupo benzimidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazolilo, un grupo 1,2,4-tiadiazolilo, un grupo 1,2,4-triazolilo, un grupo 1,3,4-oxadiazolilo o un grupo 1,3,4-tiadiazolilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.
- 10 [7] El compuesto de carboxamida de acuerdo con [1], donde Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-benzotiazolilo, un grupo 2-imidazolilo, un grupo 2-benzimidazolilo, un grupo 3-pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo, un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo o un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.
- 15 [8] El compuesto de carboxamida de acuerdo con [1], donde Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-imidazolilo, un grupo 3-pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo, un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo o un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.
- 20 [9] El compuesto de carboxamida de acuerdo con [1], donde Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-benzotiazolilo o un grupo 2-benzimidazolilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.
- 25 [10] El compuesto de carboxamida de acuerdo con [1], donde Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-benzimidazolilo opcionalmente sustituido con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.
- 30 [11] El compuesto de carboxamida de acuerdo con uno cualquiera de [1] a [10], donde R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.
- [12] El compuesto de carboxamida de acuerdo con uno cualquiera de [1] a [10], donde R³ es un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno.
- 35 [13] Un agente de control de enfermedades vegetales que comprende el compuesto de carboxamida como se define en uno cualquiera de [1] a [12] como un principio activo y un vehículo inerte.
- [14] Un método para controlar una enfermedad vegetal, que comprende la etapa de tratar una planta o un suelo donde crece una planta con una cantidad eficaz del compuesto de carboxamida como se define en uno cualquiera de [1] a [12].
- 40 [15] Uso del compuesto de carboxamida como se define en uno cualquiera de [1] a [12] para controlar una enfermedad vegetal.
- 45 En la presente invención, como grupos representados por Q, R¹, R² y R³, se mencionan los siguientes ejemplos específicos.
- El grupo alquilo C1-C3 representado por R¹ incluye un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo y un grupo isopropilo y los ejemplos del grupo alcoxilalquilo C2-C5 incluyen un grupo metoximetilo, un grupo etoximetilo y un grupo propoximetilo.
- 50 El grupo alquilo C1-C3 representado por R² incluye un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo y un grupo isopropilo.
- 55 Los ejemplos del grupo alquileo C3-C4 en el que R¹ y R² se unen entre sí en un extremo incluyen un grupo trimetileno y un grupo tetrametileno.
- El átomo de halógeno representado por R³ incluye un átomo de flúor, un átomo de cloro, un átomo de bromo y un átomo de yodo.
- 60 El grupo alquilo C1-C3 representado por R³ incluye un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo propilo y un grupo isopropilo.
- 65 Q representa un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno. El grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno

(por ejemplo, un átomo de flúor o un átomo de cloro), un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 (por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo propilo) y un grupo haloalquilo C1-C3 (por ejemplo, un grupo trifluorometilo), en la parte del anillo de 5 miembros y/o en la parte del anillo de benceno. Los ejemplos del grupo heterocíclico representado por Q incluyen los siguientes grupos.

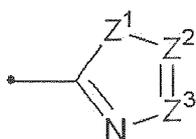
5 Un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno en el que el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3 y un átomo de carbono adyacente a un átomo de nitrógeno entre los átomos constitucionales del anillo y un átomo de nitrógeno del NH en la fórmula (I) se unen entre sí.

15 Un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno en el que el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3 y el grupo heterocíclico tiene un átomo de nitrógeno y al menos un heteroátomo seleccionado de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno un como átomo constitucional del anillo.

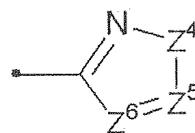
20 Un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno no fusionado con otro anillo en el que el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

25 Un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno fusionado con un anillo de benceno en el que el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3 en el anillo de 5 miembros y/o en el anillo de benceno.

Un grupo heterocíclico representado por la fórmula (a-1) o la fórmula (a-2):



(a-1)



(a-2)

30 [donde, Z¹ representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o NA¹, Z² representa un átomo de nitrógeno o un grupo CA² y Z³ representa un átomo de nitrógeno o un grupo CA³,
 A¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 (por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo propilo), A² representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno (por ejemplo, un átomo de flúor o un átomo de cloro), un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 (por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo propilo) o un grupo haloalquilo C1-C3 (por ejemplo, un grupo trifluorometilo), A³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno (por ejemplo, un átomo de flúor o un átomo de cloro), un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 (por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo propilo) o un grupo haloalquilo C1-C3 (por ejemplo, un grupo trifluorometilo), o A² y A³ se unen entre sí en un extremo para representar un grupo 1,3-butadien-1,4-diilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 o un grupo haloalquilo C1-C3 (por ejemplo, un grupo 1,3-butadien-1,4-diilo, un grupo 2-fluoro-1,3-butadien-1,4-diilo, un grupo 2-cloro-1,3-butadien-1,4-diilo, un grupo 2-ciano-1,3-butadien-1,4-diilo, un grupo 2-metil-1,3-butadien-1,4-diilo, un grupo 2-trifluorometil-1,3-butadien-1,4-diilo, un grupo 1-fluoro-1,3-butadien-1,4-diilo, un grupo 1-cloro-1,3-butadien-1,4-diilo y un grupo 1-metil-1,3-butadien-1,4-diilo). Aquí, si Z¹ es NA¹ y A¹ es un átomo de hidrógeno, entonces, Z² es un grupo CA² y Z³ es un grupo CA³.
 40 Z⁴ representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o NA⁴, Z⁵ representa un átomo de nitrógeno o CA⁵ y Z⁶ representa un átomo de nitrógeno o CA⁶,
 A⁴ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 (por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo propilo), A⁵ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 (por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo propilo) y A⁶ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 (por ejemplo, un grupo metilo, un grupo etilo o un grupo propilo).].

55 Un grupo heterocíclico que es un grupo tiazolilo, un grupo benzotiazolilo, un grupo imidazolilo, un grupo benzimidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazolilo, un grupo 1,2,4-tiadiazolilo, un grupo 1,2,4-triazolilo, un grupo 1,3,4-oxadiazolilo o un grupo 1,3,4-tiadiazolilo en el que el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

60 Un grupo heterocíclico que es un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-benzotiazolilo, un grupo 2-imidazolilo, un grupo 2-benzimidazolilo, un grupo 3-pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo, un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo o un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo en el que el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un

grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3. Los ejemplos específicos del grupo heterocíclico representado por Q incluyen un grupo 2-imidazolilo, un grupo 4-metil-2-imidazolilo, un grupo 4,5-dimetil-2-imidazolilo, un grupo 4-cloro-2-imidazolilo, un grupo 4-bromo-2-imidazolilo, un grupo 4,5-diciano-2-imidazolilo, un grupo 4-fluoro-2-imidazolilo, un grupo 4-ciano-2-imidazolilo, un grupo 2-benzimidazolilo, un grupo 4-fluoro-2-benzimidazolilo, un grupo 5-fluoro-2-benzimidazolilo, un grupo 4-cloro-2-benzimidazolilo, un grupo 5-cloro-2-benzimidazolilo, un grupo 4-ciano-2-benzimidazolilo, un grupo 5-ciano-2-benzimidazolilo, un grupo 4-metil-2-benzimidazolilo, un grupo 5-metil-2-benzimidazolilo, un grupo 4-trifluorometil-2-benzimidazolilo, un grupo 5-trifluorometil-2-benzimidazolilo, un grupo 5,6-dimetil-2-benzimidazolilo, un grupo 5,6-difluoro-2-benzimidazolilo, un grupo 5,6-dicloro-2-benzimidazolilo, un grupo 5-trifluorometil-2-benzimidazolilo, un grupo 5-ciano-2-benzimidazolilo, un grupo 2-tiazolilo, un grupo 4-metil-2-tiazolilo, un grupo 4,5-dimetil-2-tiazolilo, un grupo 4-cloro-2-tiazolilo, un grupo 4-bromo-2-tiazolilo, un grupo 4,5-diciano-2-tiazolilo, un grupo 4-fluoro-2-tiazolilo, un grupo 4-ciano-2-tiazolilo, un grupo 2-benzotiazolilo, un grupo 4-fluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 5-fluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 6-fluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 7-fluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 4-cloro-2-benzotiazolilo, un grupo 5-cloro-2-benzotiazolilo, un grupo 6-cloro-2-benzotiazolilo, un grupo 7-cloro-2-benzotiazolilo, un grupo 4-metil-2-benzotiazolilo, un grupo 5-metil-2-benzotiazolilo, un grupo 6-metil-2-benzotiazolilo, un grupo 7-metil-2-benzotiazolilo, un grupo 5,6-dimetil-2-benzotiazolilo, un grupo 5,6-difluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 5,6-dicloro-2-benzotiazolilo, un grupo 5-trifluorometil-2-benzotiazolilo, un grupo 5-ciano-2-benzotiazolilo, un grupo 1-metil-3-pirazolilo, un grupo 1,5-dimetil-3-pirazolilo, un grupo 4-cloro-1-metil-3-pirazolilo, un grupo 1-etil-3-pirazolilo, un grupo 1-(2,2,2-trifluoroetil)-3-pirazolilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 3-metil-1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 3-trifluorometil-1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 3-ciano-1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, un grupo 5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo, un grupo 5-trifluorometil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo y 5-ciano-1,3,4-tiadiazol-2-ilo.

Las realizaciones del presente compuesto incluyen, por ejemplo, los siguientes compuestos entre los presentes compuestos.

Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno, el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3 y el grupo heterocíclico tiene un átomo de nitrógeno y al menos un heteroátomo seleccionado de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno un como átomo constitucional del anillo.

Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno, el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3 y un átomo de carbono adyacente a un átomo de nitrógeno entre los átomos constitucionales del anillo y un átomo de nitrógeno del NH en la fórmula (I) se unen entre sí.

Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno no fusionado con otro anillo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno fusionado con un anillo de benceno y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo heterocíclico representado por la fórmula (a-1) o la fórmula (a-2):



[donde, Z^1 representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o NA^1 , Z^2 representa un átomo de nitrógeno o un grupo CA^2 , Z^3 representa un átomo de nitrógeno o un grupo CA^3 , A^1 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, A^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3, A^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 o un grupo haloalquilo C1-C3 o A^2 y A^3 se unen entre sí en un extremo para representar un grupo 1,3-butadien-1,4-diilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 o un grupo haloalquilo C1-C3. Aquí, si Z^1 es NA^1 y A^1 es un átomo de hidrógeno, entonces, Z^2 es un grupo CA^2 y Z^3 es un grupo CA^3 .

Z⁴ representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o NA⁴, Z⁵ representa un átomo de nitrógeno o CA⁵ y Z⁶ representa un átomo de nitrógeno o CA⁶, A⁴ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, A⁵ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y A⁶ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.]

5 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo heterocíclico que es un grupo tiazolilo, un grupo benzotiazolilo, un grupo imidazolilo, un grupo benzimidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazolilo, un grupo 1,2,4-tiadiazolilo, un grupo 1,2,4-triazolilo, un grupo 1,3,4-oxadiazolilo o un grupo 1,3,4-tiadiazolilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

15 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-benzotiazolilo, un grupo 2-imidazolilo, un grupo 2-benzimidazolilo, un grupo 3-pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo, un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo o un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

20 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-imidazolilo, un grupo 3-pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo, un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo o un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

25 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-benzotiazolilo o un grupo 2-benzimidazolilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

30 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo 2-benzimidazolilo opcionalmente sustituido con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

35 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo 2-imidazolilo, un grupo 4-metil-2-imidazolilo, un grupo 4,5-dimetil-2-imidazolilo, un grupo 4-cloro-2-imidazolilo, un grupo 4-bromo-2-imidazolilo, un grupo 4,5-diciano-2-imidazolilo, un grupo 4-fluoro-2-imidazolilo o un grupo 4-ciano-2-imidazolilo.

40 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo 2-benzimidazolilo, un grupo 4-fluoro-2-benzimidazolilo, un grupo 5-fluoro-2-benzimidazolilo, un grupo 4-cloro-2-benzimidazolilo, un grupo 5-cloro-2-benzimidazolilo, un grupo 4-metil-2-benzimidazolilo, un grupo 5-metil-2-benzimidazolilo, un grupo 5,6-dimetil-2-benzimidazolilo, un grupo 5,6-difluoro-2-benzimidazolilo, un grupo 5,6-dicloro-2-benzimidazolilo, un grupo 5-trifluorometil-2-benzimidazolilo o un grupo 5-ciano-2-benzimidazolilo.

45 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo 2-tiazolilo, un grupo 4-metil-2-tiazolilo, un grupo 4,5-dimetil-2-tiazolilo, un grupo 4-cloro-2-tiazolilo, un grupo 4-bromo-2-tiazolilo, un grupo 4,5-diciano-2-tiazolilo, un grupo 4-fluoro-2-tiazolilo o un grupo 4-ciano-2-tiazolilo.

50 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo 2-benzotiazolilo, un grupo 4-fluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 5-fluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 6-fluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 7-fluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 4-cloro-2-benzotiazolilo, un grupo 5-cloro-2-benzotiazolilo, un grupo 6-cloro-2-benzotiazolilo, un grupo 7-cloro-2-benzotiazolilo, un grupo 4-metil-2-benzotiazolilo, un grupo 5-metil-2-benzotiazolilo, un grupo 6-metil-2-benzotiazolilo, un grupo 7-metil-2-benzotiazolilo, un grupo 5,6-dimetil-2-benzotiazolilo, un grupo 5,6-difluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 5,6-dicloro-2-benzotiazolilo, un grupo 5-trifluorometil-2-benzotiazolilo o un grupo 5-ciano-2-benzotiazolilo.

55 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 3-metil-1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 3-trifluorometil-1,2,4-tiadiazol-5-ilo o un grupo 3-ciano-1,2,4-tiadiazol-5-ilo.

60 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que Q es un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, un grupo 5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo, un grupo 5-trifluorometil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo o un grupo 5-ciano-1,3,4-tiadiazol-2-ilo.

Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R² es un átomo de hidrógeno y R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.

65 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R² es un grupo metilo y R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.

Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.

5 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^1 es un grupo metilo, R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.

Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^1 es un grupo metilo, R^2 es un grupo metilo y R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.

10 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^1 es un grupo metilo, R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.

15 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^1 y R^2 se unen entre sí en un extremo para formar un grupo trimetileno y R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.

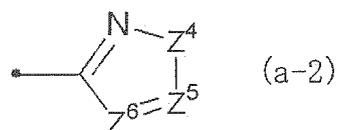
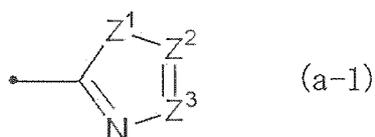
20 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno, el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3 y el grupo heterocíclico tiene un átomo de nitrógeno y al menos un heteroátomo seleccionado de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno como un átomo constitucional del anillo.

25 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno, el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3; y un átomo de carbono adyacente a un átomo de nitrógeno entre los átomos constitucionales del anillo y un átomo de nitrógeno del NH en la fórmula (I) se unen entre sí.

30 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

35 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno, el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

40 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y Q es un grupo heterocíclico representado por la fórmula (a-1) o la fórmula (a-2):



45 [donde, Z^1 representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o NA^1 , Z^2 representa un átomo de nitrógeno o un grupo CA^2 , Z^3 representa un átomo de nitrógeno o un grupo CA^3 , A^1 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, A^2 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3, A^3 representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 o un grupo haloalquilo C1-C3 o A^2 y A^3 se unen entre sí en un extremo para representar un grupo 1,3-butadien-1,4-diilo opcionalmente sustituido con un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 o un grupo haloalquilo C1-C3. Aquí, si Z^1 es NA^1 y A^1 es un átomo de hidrógeno, entonces, Z^2 es un grupo CA^2 y Z^3 es un grupo CA^3 .

50 Z^4 representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o NA^4 , Z^5 representa un átomo de nitrógeno o CA^5 y Z^6 representa un átomo de nitrógeno o CA^6 , A^4 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, A^5 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y A^6 representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.].

60 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, Q es un grupo heterocíclico que es un grupo tiazolilo, un grupo benzotiazolilo, un grupo imidazolilo, un grupo benzimidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazolilo, un grupo 1,2,4-tiadiazolilo, un grupo 1,3,4-oxadiazolilo o un grupo 1,3,4-tiadiazolilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo

C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

5 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-benzotiazolilo, un grupo 2-imidazolilo, un grupo 2-benzimidazolilo, un grupo 3-pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo, un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo o un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

10 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-imidazolilo, un grupo 3-pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo, un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo o un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

15 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-benzotiazolilo o un grupo 2-benzimidazolilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

20 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y Q es un grupo 2-benzimidazolilo opcionalmente sustituido con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

25 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y Q es un grupo 2-imidazolilo, un grupo 4-metil-2-imidazolilo, un grupo 4,5-dimetil-2-imidazolilo, un grupo 4-cloro-2-imidazolilo, un grupo 4-bromo-2-imidazolilo, un grupo 4,5-diciano-2-imidazolilo, un grupo 4-fluoro-2-imidazolilo o un grupo 4-ciano-2-imidazolilo.

30 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y Q es un grupo 2-benzimidazolilo, un grupo 4-fluoro-2-benzimidazolilo, un grupo 5-fluoro-2-benzimidazolilo, un grupo 4-cloro-2-benzimidazolilo, un grupo 5-cloro-2-benzimidazolilo, un grupo 4-metil-2-benzimidazolilo, un grupo 5-metil-2-benzimidazolilo, un grupo 5,6-dimetil-2-benzimidazolilo, un grupo 5,6-difluoro-2-benzimidazolilo, un grupo 5,6-dicloro-2-benzimidazolilo, un grupo 5-trifluorometil-2-benzimidazolilo o un grupo 5-ciano-2-benzimidazolilo.

40 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y Q es un grupo 2-tiazolilo, un grupo 4-metil-2-tiazolilo, un grupo 4,5-dimetil-2-tiazolilo, un grupo 4-cloro-2-tiazolilo, un grupo 4-bromo-2-tiazolilo, un grupo 4,5-diciano-2-tiazolilo, un grupo 4-fluoro-2-tiazolilo o un grupo 4-ciano-2-tiazolilo.

45 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, Q es un grupo 2-benzotiazolilo, un grupo 4-fluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 5-fluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 6-fluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 7-fluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 4-cloro-2-benzotiazolilo, un grupo 5-cloro-2-benzotiazolilo, un grupo 6-cloro-2-benzotiazolilo, un grupo 7-cloro-2-benzotiazolilo, un grupo 4-metil-2-benzotiazolilo, un grupo 5-metil-2-benzotiazolilo, un grupo 6-metil-2-benzotiazolilo, un grupo 7-metil-2-benzotiazolilo, un grupo 5,6-dimetil-2-benzotiazolilo, un grupo 5,6-difluoro-2-benzotiazolilo, un grupo 5,6-dicloro-2-benzotiazolilo, un grupo 5-trifluorometil-2-benzotiazolilo o un grupo 5-ciano-2-benzotiazolilo.

50 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y Q es un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 3-metil-1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 3-trifluorometil-1,2,4-tiadiazol-5-ilo o un grupo 3-ciano-1,2,4-tiadiazol-5-ilo.

55 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^3 es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y Q es un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, un grupo 5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo, un grupo 5-trifluorometil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo o un grupo 5-ciano-1,3,4-tiadiazol-2-ilo.

60 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es un átomo de hidrógeno.

60 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^2 es grupo metilo y R^3 es un átomo de hidrógeno.

65 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R^2 es un átomo de hidrógeno y R^3 es un grupo metilo.

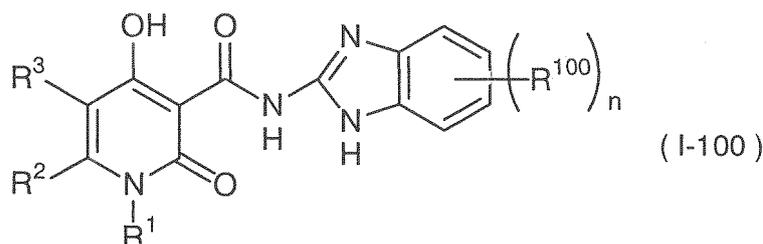
Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R¹ es un grupo metilo, R² es un átomo de hidrógeno y R³ es un átomo de hidrógeno.

5 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R¹ es un grupo metilo, R² es un grupo metilo y R³ es un átomo de hidrógeno.

Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R¹ es un grupo metilo, R² es un átomo de hidrógeno y R³ es un grupo metilo.

10 Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I) en el que R¹ y R² se unen entre sí en un extremo para formar un grupo trimetileno y R³ es un átomo de hidrógeno.

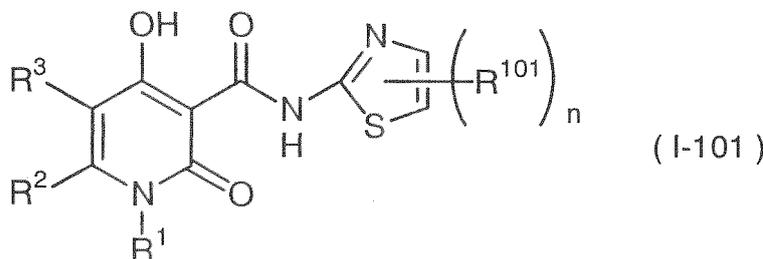
Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I-100):



15 (donde, R¹ representa un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilquilo C2-C5, R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 o R¹ y R² se unen entre sí en un extremo para representar un grupo alquileno C3-C4, R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3, R¹⁰⁰ representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 o un grupo haloalquilo C1-C3 y n representa un entero de 0 a 4).

20

Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I-101):



25 (donde, R¹ representa un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilquilo C2-C5, R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 o R¹ y R² se unen entre sí en un extremo para representar un grupo alquileno C3-C4, R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3, R¹⁰¹ representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 o un grupo haloalquilo C1-C3 y n representa un entero de 0 a 2).

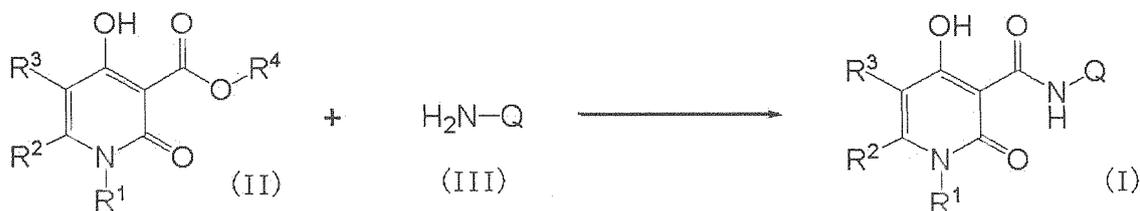
30

A continuación, se explicará un procedimiento para preparar el presente compuesto. El presente compuesto puede prepararse, por ejemplo, de acuerdo con el siguiente (Procedimiento A), (Procedimiento B) y (Procedimiento C).

35 En los siguientes (Procedimiento A), (Procedimiento B), (Procedimiento C) y Procedimiento de Referencia, si es necesario, puede usarse un grupo de protección para proteger un grupo funcional particular y el grupo de protección puede desprotegerse bajo la condición adecuada.

(Procedimiento A)

40 El presente compuesto puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (II) y un compuesto representado por la fórmula (III).

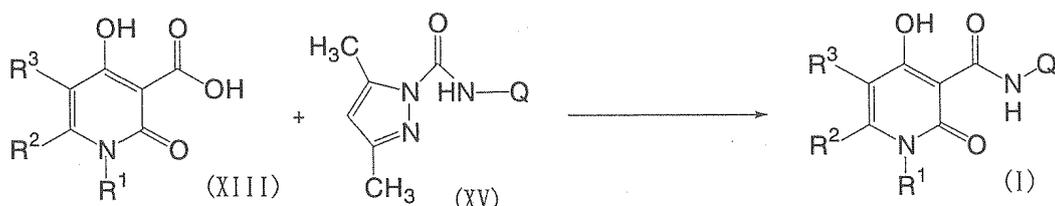


el sólido con un disolvente orgánico, secándolo etcétera. El presente compuesto aislado representado por la fórmula (I) puede también purificarse adicionalmente por un procedimiento tal como cromatografía, recristalización y similares.

5 (Procedimiento C)

El presente compuesto puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XIII) y un compuesto representado por la fórmula (XV) en presencia de un triflato de un metal alcalinotérreo tal como triflato de magnesio, triflato de calcio y similares.

10



[donde R¹, R², R³ y Q son como se define anteriormente.]

15 La reacción se realiza normalmente en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente usado en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y similares.

En la reacción, el compuesto representado por la fórmula (XV) se usa normalmente en una relación de 1 mol por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XIII) y el triflato del metal alcalinotérreo se usa normalmente en una relación de 0,01 a 0,1 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XIII).

20

Una temperatura de reacción en la reacción está normalmente en un intervalo de 100 a 150 °C y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

25 Después de que se complete la reacción, el presente compuesto representado por la fórmula (I) puede aislarse realizando un procedimiento posterior al tratamiento tal como enfriándose la mezcla de reacción, recogiendo el sólido resultante por filtración, lavando el sólido con un disolvente orgánico, secándolo etcétera. El compuesto aislado representado por la fórmula (I) puede también purificarse adicionalmente por un procedimiento tal como cromatografía, recristalización y similares.

30

El compuesto representado por la fórmula (XVI) puede prepararse a partir de un compuesto representado por la fórmula (XVI);



35

y 3,5-dimetilimidazol.

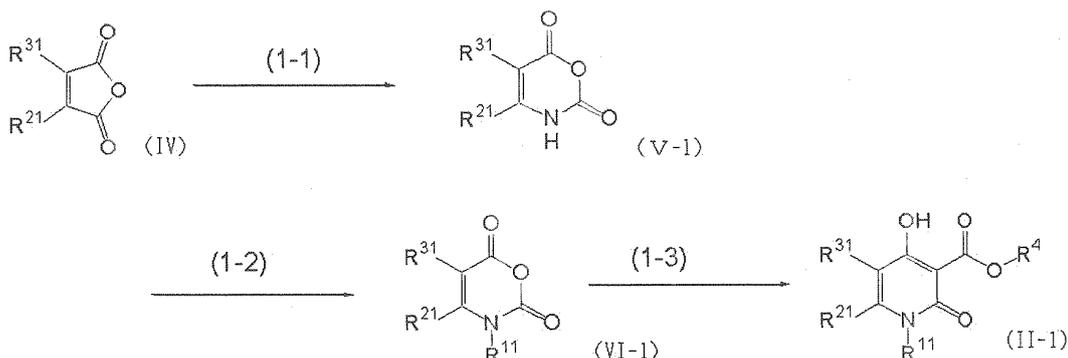
A continuación, se explicará un procedimiento para preparar un intermedio para preparar el presente compuesto como Procedimiento de Referencia.

40

(Procedimiento de Referencia 1)

Puede prepararse un compuesto representado por la fórmula (II-1) entre los compuestos representados por la fórmula (II) a partir de un compuesto representado por la fórmula (IV) de acuerdo con el siguiente esquema.

45



[donde Q es como se define anteriormente, R¹¹ representa un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilalquilo C2-C5, R²¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, R³¹ representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R⁴ representa un grupo alquilo C1-C10]

5 Etapa (1-1)

Un compuesto representado por la fórmula (V-1) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (IV) con un compuesto azida (por ejemplo azida sódica y azida de trimetilsililo) y haciendo reaccionar además el producto resultante con un compuesto alcohólico (por ejemplo metanol y etanol).

10 La reacción se realiza normalmente en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente usado en la reacción incluyen hidrocarburos halogenados tales como cloroformo, tetracloruro de carbono y similares, hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y similares, amidas ácidas tales como N,N-dimetilformamida y similares y una mezcla de los mismos.

15 En la reacción, el compuesto azida se usa normalmente en una relación de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (IV) y el compuesto alcohólico se usa normalmente en una relación de 1 mol por 1 mol del compuesto azida.

20 Cuando el compuesto representado por la fórmula (IV) se hace reaccionar con el compuesto azida, una temperatura de reacción está normalmente en un intervalo de -20 a 100 °C y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas. Cuando el producto resultante se hace reaccionar con el compuesto alcohólico, una temperatura de reacción está normalmente en un intervalo de -20 a 10 °C y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

25 Después de que se complete la reacción, el compuesto representado por la fórmula (V-1) puede aislarse realizando un procedimiento posterior al tratamiento tal como recogiendo un sólido producido en la mezcla de reacción por filtración, lavando el sólido con un disolvente orgánico, secándolo etcétera. El compuesto aislado representado por la fórmula (V-1) puede purificarse adicionalmente por un procedimiento tal como cromatografía, recristalización y similares.

30 De manera alternativa, el compuesto representado por la fórmula (V-1) puede prepararse también por el método mostrado en Tetrahedron Letters nº 4, pág. 243-246, 1976.

35 Etapa (1-2)

Un compuesto representado por la fórmula (VI-1) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (V-1) con un compuesto representado por la fórmula (X):



[donde R¹¹ es como se define anteriormente y X representa un grupo saliente tal como un átomo de halógeno (por ejemplo átomo de cloro, átomo de bromo y átomo de yodo), un grupo sulfoniloxi (por ejemplo grupo metansulfoniloxi, grupo metoxisulfoniloxi y grupo p-toluensulfoniloxi) y similares]

45 en presencia de una base.

50 La reacción se realiza normalmente en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente usado en la reacción incluyen cetonas tales como acetona, cetona de etil metilo y similares, hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y similares, amidas ácidas tales como N,N-dimetilformamida y similares, éteres tales como tetrahidrofurano, 1,4-dioxano y similares, nitrilos tales como acetonitrilo y similares y una mezcla de los mismos.

55 Los ejemplos del compuesto representado por la fórmula (X) que se usa en la reacción incluyen yoduro de metilo, bromuro de metilo, sulfato de dimetilo, yoduro de etilo, yoduro de propilo y éter de clorometil etilo.

Los ejemplos de la base usada en la reacción incluyen carbonatos tales como carbonato potásico, carbonato de cesio y similares e hidruros de metales alcalinos tales como hidruro sódico, hidruro potásico y similares.

60 En la reacción, el compuesto representado por la fórmula (X) se usa normalmente en una relación de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (VI-1) y la base se usa normalmente en una relación de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (VI-1).

Una temperatura de reacción en la reacción está normalmente en un intervalo de -20 a 150 °C y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

65

Después de que se complete la reacción, el compuesto representado por la fórmula (VI-1) puede aislarse realizando el siguiente procedimiento posterior al tratamiento.

5 La mezcla de reacción se enfría a temperatura ambiente y se filtra, el filtrado se concentra a presión reducida y el sólido resultante se lava con un disolvente orgánico y se seca; se añade agua a la mezcla de reacción, esta se extrae con un disolvente orgánico y se concentra la capa orgánica.

10 El compuesto aislado representado por la fórmula (VI-1) puede también purificarse adicionalmente por un procedimiento tal como cromatografía, recristalización y similares.

Etapa (1-3)

15 Un compuesto representado por la fórmula (II-1) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (VI-1) con malonato de dialquilo representado por la fórmula:



(donde R^4 es como se define anteriormente) en presencia de una base.

20 La reacción se realiza normalmente en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente usado en la reacción incluyen éteres tales como tetrahidrofurano, 1,4-dioxano y similares, hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y similares, amidas ácidas tales como N,N-dimetilformamida y similares y una mezcla de los mismos.

25 Los ejemplos del malonato de dialquilo representado por la fórmula $\text{CH}_2 (\text{COOR}^4)_2$ usado en la reacción incluyen malonato de dimetilo y malonato de dietilo.

Los ejemplos de la base usada en la reacción incluyen:

30 alcóxidos metálicos representados por la fórmula:



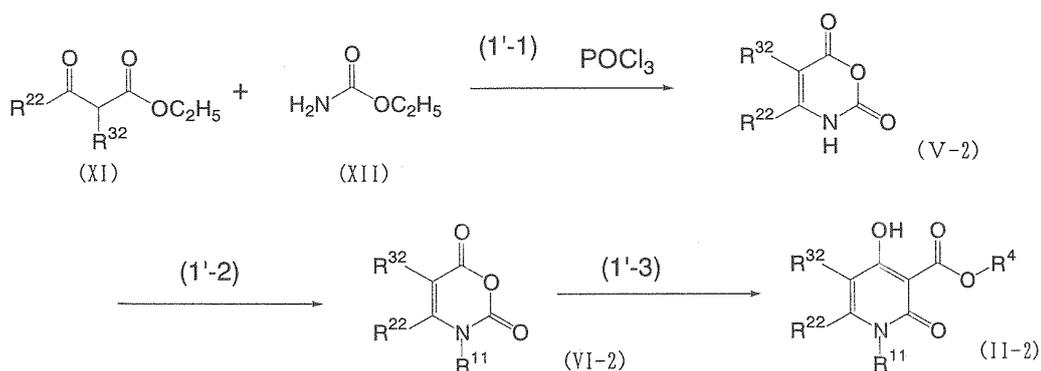
35 (donde R^4 es como se define anteriormente) e hidruros de metales alcalinos tales como hidruro sódico, hidruro potásico y similares.

40 En la reacción, el malonato de dialquilo se usa normalmente en una relación de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (VI-1) y la base se usa normalmente en una relación de 1 a 5 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (VI-1).

Una temperatura de reacción en la reacción está normalmente en un intervalo de -10 a 150 °C y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

45 Después de que se complete la reacción, el compuesto representado por la fórmula (II-1) puede aislarse realizando un procedimiento posterior al tratamiento tal como enfriándose la mezcla de reacción a temperatura ambiente, añadiendo agua ácida tal como ácido clorhídrico diluido y similares a la mezcla de reacción para hacer la capa acuosa ácida, extraer esta con un disolvente orgánico, secándola y concentrando la capa orgánica etcétera. El compuesto aislado representado por la fórmula (II-1) puede purificarse adicionalmente por un procedimiento tal como cromatografía, recristalización y similares.

50 Además, un compuesto representado por la fórmula (II-2) entre el compuesto representado por la fórmula (II) puede prepararse, por ejemplo, de acuerdo con el siguiente esquema:



[donde Q, R¹¹ y R⁴ son como se define anteriormente, R²² representa un grupo alquilo C1-C3, R³² representa un átomo de halógeno y R⁴ representa un grupo alquilo C1-C10.]

5

Etapa (1'-1)

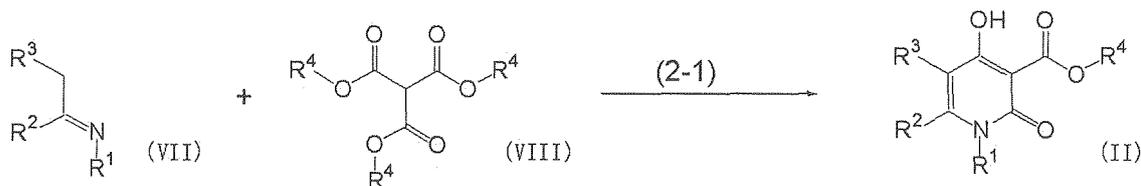
Un compuesto representado por la fórmula (V-2) puede prepararse de acuerdo con el método descrito en Tetrahedron Letters n° 4, pág. 243-246, 1976.

10

Una etapa (1'-2) y una etapa (1'-3) se realizan como en la etapa (1-2) y la etapa (1-3).

(Procedimiento de Referencia 2)

15 El compuesto representado por la fórmula (II) también puede prepararse de acuerdo con el siguiente esquema:



[donde R¹, R², R³, R⁴ y Q son como se define anteriormente.]

20

Etapa (2-1)

El compuesto representado por la fórmula (II) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (VII) con un compuesto representado por la fórmula (VIII).

25

La reacción puede realizarse normalmente en ausencia de un disolvente. De manera alternativa, la reacción puede realizarse en presencia de un disolvente mientras se retira azeotrópicamente o similares un compuesto alcohólico producido acompañando a una reacción. Los ejemplos del disolvente usado en la reacción incluyen hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y similares, amidas ácidas tales como N,N-dimetilformamida y similares y una mezcla de los mismos.

30

En la reacción, el compuesto representado por la fórmula (VIII) se usa normalmente en una relación de 1 a 50 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (VII).

35

Una temperatura de reacción en la reacción está normalmente en un intervalo de 100 a 250 °C y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

Después de que se complete la reacción, el compuesto representado por la fórmula (II) puede aislarse, por ejemplo, realizando el siguiente procedimiento posterior al tratamiento.

40

La mezcla de reacción se enfría a temperatura ambiente, el sólido resultante se filtra y el sólido se lava con un disolvente orgánico y se seca;

después de que la mezcla de reacción se enfría a temperatura ambiente, se añade agua a la mezcla de reacción, esta se extrae con un disolvente orgánico y se concentra la capa orgánica.

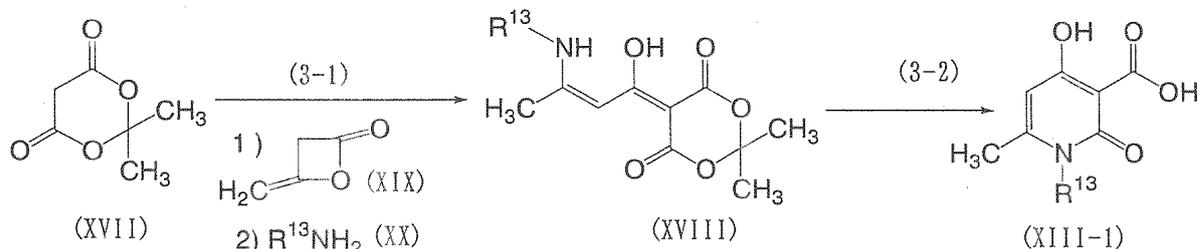
45

El compuesto aislado representado por la fórmula (II) puede también purificarse adicionalmente por un procedimiento tal como cromatografía, recristalización y similares.

(Procedimiento de Referencia 3)

Entre el compuesto representado por la fórmula (XIII), un compuesto representado por la fórmula (XIII-1) puede prepararse a partir de un compuesto representado por la fórmula (XVII) de acuerdo con el siguiente esquema:

5



[donde R^{13} representa un grupo alquilo C1-C3.]

10 (Etapa 3-1)

Un compuesto representado por la fórmula (XVIII) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XVII) con dicetena representado por la fórmula (XIX) en presencia de amina terciaria o piridinas (primera fase) y haciendo reaccionar el producto resultante con un compuesto representado por la fórmula (XX) (segunda fase).

15

Cada reacción se realiza normalmente en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente usado en la reacción incluyen nitrilos tales como acetonitrilo, propionitrilo y similares, éteres tales como éter de dietilo, éter de t-butilo metilo, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano y similares, hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y similares y una mezcla de los mismos.

20

En la reacción en la primera fase, el dicetena representado por la fórmula (XIX) se usa normalmente en una relación de 1 mol por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XVII).

25

En la reacción en la primera fase, los ejemplos de la amina terciaria usada incluyen trimetilamina y tri-n-propilamina; los ejemplos de piridinas incluyen piridina y 4-dimetilaminopiridina. En la reacción en la primera fase, la amina terciaria o las piridinas se usan normalmente en una relación de 1 mol por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XVII).

30

Una temperatura de reacción en la primera fase está normalmente en un intervalo de 0 a 40 °C y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

35

La mezcla de reacción obtenida por la reacción en la primera fase se usa normalmente como está en la reacción en la segunda fase.

La reacción en la segunda fase se realiza normalmente mezclando la mezcla de reacción obtenida en la primera fase y un compuesto representado por la fórmula (XX).

40

En la reacción en la segunda fase, el compuesto representado por la fórmula (XX) se usa normalmente en una relación de 2 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XVII).

Una temperatura de reacción en la reacción en la segunda fase está normalmente en un intervalo de 0 a 40 °C y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 24 horas.

45

Después de que se complete la reacción en la segunda fase, el compuesto representado por la fórmula (XVIII) puede aislarse realizando un procedimiento posterior al tratamiento tal añadiendo ácido (por ejemplo ácido clorhídrico diluido, ácido sulfúrico diluido) a la mezcla de reacción, recogiendo el cristal resultante por filtración, secándolo etcétera. El compuesto aislado representado por la fórmula (XVIII) puede purificarse adicionalmente por un procedimiento tal como cromatografía, recristalización y similares.

50

(Etapa 3-2)

Un compuesto representado por la fórmula (XIII-1) puede prepararse reteniendo un compuesto representado por la fórmula (XVIII) a de 40 a 120 °C durante 0,1 a 24 horas.

55

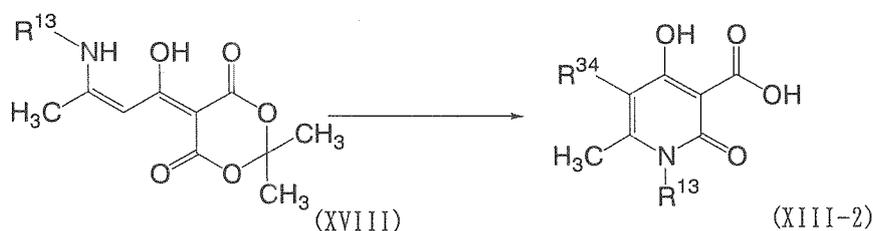
El procedimiento se realiza normalmente en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente usado en el procedimiento incluyen nitrilos tales como acetonitrilo, propionitrilo y similares, éteres tales como éter de t-butilo

metilo, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano y similares, hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y similares y una mezcla de los mismos.

- 5 Después de que se confirme la desaparición del compuesto representado por la fórmula (XVIII) por medio de un análisis tal como una cromatografía en capa fina y similares, el compuesto representado por la fórmula (XIII-1) puede aislarse realizando un procedimiento posterior al tratamiento tal como la adición de la mezcla resultante en agua, la extracción con un disolvente orgánico, la concentración de una capa orgánica y similares. El compuesto aislado representado por la fórmula (XIII-1) puede también purificarse adicionalmente por un procedimiento tal como
10 cromatografía, recristalización y similares.

(Procedimiento de Referencia 4)

- 15 Entre el compuesto representado por la fórmula (XIII), un compuesto representado por la fórmula (XIII-2) puede prepararse haciendo reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XVIII) con un agente halogenizante a de -10 a 30 °C (primera fase) y reteniendo el producto resultante a de 40 a 120 °C durante 0,1 a 24 horas (segunda fase):



- 20 [donde R³⁴ representa un átomo de halógeno y R¹³ es como se define anteriormente.]

- 25 La reacción en la primera fase se realiza normalmente en presencia de un disolvente. Los ejemplos del disolvente usado en la reacción incluyen nitrilos tales como acetonitrilo, propionitrilo y similares, éteres tales como éter de dietilo, éter de t-butil metilo, tetrahidrofurano, 1,4-dioxano y similares, hidrocarburos aromáticos halogenados tales como clorobenceno, bromobenceno y similares, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno y similares y una mezcla de los mismos.

- 30 Los ejemplos del agente halogenizante usado en la reacción en la primera fase incluyen sal de N-fluoropiridinio tales como bis(tetrafluoroborato) de N,N'-difluoro-2,2'-bipiridinio y similares y N-halogenosuccinimidas tales como N-clorosuccinimida, N-bromosuccinimida, N-yodosuccinimida y similares.

- 35 En la reacción, el agente halogenizante se usa normalmente en una relación de 0,5 a 2 moles por 1 mol del compuesto representado por la fórmula (XVIII).

- Una temperatura de reacción en la primera fase está normalmente en un intervalo de -10 a 30 °C y un tiempo de reacción está normalmente en un intervalo de 0,1 a 5 horas.

- 40 La mezcla de reacción obtenida en la reacción en la primera fase puede usarse normalmente como está en un procedimiento en la segunda fase.

El procedimiento en la segunda fase se realiza normalmente reteniendo la mezcla de reacción obtenida en la primera fase a de 40 a 120 °C.

- 45 A partir de entonces, el compuesto representado por la fórmula (XIII-2) puede aislarse realizando un procedimiento posterior al tratamiento, tal como la adición de la mezcla resultante en agua, la extracción con un disolvente orgánico, la concentración de la capa orgánica y similares. El compuesto aislado representado por la fórmula (XIII-2) puede también purificarse adicionalmente por un procedimiento tal como cromatografía, recristalización y similares.

- 50 Un compuesto representado por la fórmula (III) puede obtenerse comercialmente o prepararse de acuerdo con el método descrito en, por ejemplo, Indian Journal of Chemistry, Sección B: Organic Chemistry Including Medicinal Chemistry (1998), 37B(1), p. 84, Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters (2002), 12(16), p. 2221-2224, documento JP-B n° 52-009736, Journal of Organic Chemistry (1994), 59(24), p. 7299-7305, Phosphorus, Sulfur and Silicon and the Related Elements (2002), 177(11), p. 2651-2659, Bioorganic & Medicinal Chemistry (2001), 9(12), 3231-3241,
55 Chemische Berichte (1960), 93, p. 2190-2097, "The Chemistry of Heterocyclic Compounds" (John Wiley e Hijos, Inc.) etcétera.

Un compuesto representado por la fórmula (IV), un compuesto representado por la fórmula (VII), un compuesto representado por la fórmula (VIII), un compuesto representado por la fórmula (X) y el malonato de dialquilo pueden

obtenerse comercialmente o prepararse de acuerdo con los métodos conocidos.

Los ejemplos de una enfermedad vegetal que puede controlarse por el presente compuesto incluyen las siguientes enfermedades:

- 5 *Pyricularia oryzae* y *Cochliobolus miyabeanus* y *Rhizoctonia solani* del arroz;
Erysiphe graminis, *Gibberella zeae*, *Fusarium graminearum*, *Fusarium culmorum*, *F. avenaceum*, *Microdochium nivale*, *Puccinia striiformis*, *P. graminis*, *P. recondita*, *P. hordei*, *Typhula* sp., *Micronectriella nivalis*, *Ustilago tritici*,
10 *U. nuda*, *Tilletia caries*, *Pseudocercospora herpotrichoides*, *Rhynchosporium secalis*, *Septoria tritici*,
Leptosphaeria nodorum y *Gaeumannomyces graminis*, del trigo y la cebada;
Diaporthe citri, *Elsinoe fawcetti*, *Penicillium digitatum* y *P. italicum* de los cítricos;
Sclerotinia mali, *Valsa mali*, *Podosphaera leucotricha*, *Alternaria mali* y *Venturia inaequalis* del manzano;
Venturia nashicola, *V. pirina*, *Alternaria kikuchiana* y *Gymnosporangium haraeaeum* del peral;
15 *Sclerotinia cinerea*, *Cladosporium carpophilum* y *Phomopsis* sp. del melocotón; *Elsinoe ampelina*, *Glomerella cingulata*, *Uncinula necator*, *Phakopsora ampelopsidis*, *Guignardia bidwellii* y *Plasmopara viticola*, de la vid;
Gloeosporium kaki, *Cercospora kaki* y *Mycosphaerella nawae* del caqui japonés;
Colletotrichum lagenarium, *Sphaerotheca fuliginea*, *Mycosphaerella melonis*, *Fusarium oxysporum*,
Pseudoperonospora cubensis, *Phytophthora* sp. y *Pythium* sp. de la calabaza;
Alternaria solani, *Cladosporium fulvum* y *Phytophthora infestans* del tomate;
20 *Phomopsis vexans* y *Erysiphe cichoracearum*, de la berenjena; *Alternaria japonica* y *Cercospora brassicae* de
vegetales *Cruciferae*;
Puccinia allii del puerro; *Cercospora kikuchii*, *Elsinoe glycines*, *Diaporthe phaseolorum* var. *sojae* y *Phakopsora pachrhizii* de la soja; *Colletotrichum lindemthianum* del frijol rojo; *Cercospora personata* y *Cercospora arachidicola* del cacahuete; *Erysiphe pisi* del guisante; *Alternaria solani* y *Phytophthora infestans* de la patata;
25 *Sphaerotheca humuli* de la fresa; *Exobasidium reticulatum* y *Elsinoe leucospila* del té; *Alternaria longipes*,
Erysiphe cichoracearum, *Colletotrichum tabacum*, *Peronospora tabacina* y *Phytophthora nicotianae* del tabaco;
Cercospora beticola de la remolacha azucarera; *Diplocarpon rosae* y *Sphaerotheca pannosa* del rosal; *Septoria chrysanthemi-indici* y *Puccinia horiana* del crisantemo; *Botrytis cinerea* y *Sclerotinia sclerotiorum* de diversos
cultivos; *Sclerotinia homeocarpa* y *Rhizoctonia solani* del césped.

- 30 El agente de control de enfermedades vegetales de la presente invención puede ser el propio presente compuesto, pero normalmente el agente contiene el presente compuesto y un vehículo inerte tal como un vehículo sólido, un vehículo líquido y similares, y se formula en preparaciones mezclando adicionalmente un tensioactivo y otros adyuvantes para las preparaciones. Los ejemplos de tales preparaciones incluyen concentrados emulsionables,
35 polvos humectables, gránulos dispersables en agua, preparaciones en emulsión, preparaciones fluidizables, polvos y gránulos. Estas preparaciones contienen el presente compuesto como un principio activo normalmente en un 0,1 a un 90 % en términos de relación en peso.

- 40 Los ejemplos del vehículo sólido usado tras la formulación de las preparaciones incluyen polvos finos y partículas de minerales tales como arcilla de caolín, arcilla atapulguita, bentonita, montmorillonita, arcilla ácida, pirofilita, talco, tierra de diatomeas, calcita y similares, orgánicos naturales tales como polvos de mazorca de maíz, harina de cáscara de nuez y similares, orgánicos sintéticos tales como urea y similares, sales tales como carbonato cálcico, sulfato amónico y similares, sustancias inorgánicas sintéticas tales como óxido de silicio hidratado sintético y similares y los ejemplos del vehículo líquido incluyen hidrocarburos aromáticos tales como xileno, alquilbenceno,
45 metilnaftaleno y similares, alcoholes tales como 2-propanol, etilenglicol, propilenglicol, éter de monometilo de etilenglicol y similares, cetonas tales como acetona, ciclohexanona, isoforona y similares, aceites vegetales tales como aceite de semilla de soja, aceite de semilla de algodón y similares, hidrocarburos alifáticos, ésteres, dimetilsulfóxido, acetonitrilo y agua.

- 50 Los ejemplos del tensioactivo incluyen tensioactivos aniónicos tales como sal de éster de alquilsulfato, sal de alquilarisulfonato, sal de dialquilsulfosuccinato, sal de éster de éter fosfato de polioxietilén alquil arilo, sal de ligninsulfonato, policondensado de formaldehído de naftalén sulfonato y similares y tensioactivos no iónicos tales como éter de polioxietilén alquil arilo, copolímero en bloque de polioxipropileno de polioxietilén alquilo, éster de ácido graso de sorbitán y similares.

- 55 Los ejemplos de otros adyuvantes para las preparaciones incluyen polímeros solubles en agua tales como alcohol polivinílico, polivinilpirrolidona y similares, polisacáridos tales como goma arábiga, ácido alginico y una sal del mismo, CMC (carboximetilcelulosa), goma Xantana y similares, sustancias inorgánicas tales como silicato de magnesio y aluminio, alúmina sol y similares, conservantes, agentes colorantes y estabilizantes tales como PAP (fosfato de isopropilo ácido), BTH y similares.

- 60 El agente de control de enfermedades vegetales de la presente invención se usa, por ejemplo, para proteger a una planta frente a una enfermedad vegetal por el tratamiento foliar de la planta o se usa para proteger a una planta que crece en un suelo frente a una enfermedad vegetal tratando el suelo. Cuando el agente de control de enfermedades vegetales de la presente invención se usa tratando foliarmente a una planta o cuando el agente se usa tratando un suelo, la cantidad de tratamiento varía dependiendo de una clase de un cultivo que es una planta a controlarse, de

una clase de una enfermedad a controlarse, de un nivel de infestación de una enfermedad a controlarse, de una forma de preparación, de un término de tratamiento, de una condición climatológica y similares y la cantidad en términos del presente compuesto por 10000 m² es normalmente de 1 a 5000 g, preferentemente de 5 a 1000 g.

- 5 En el caso de los concentrados emulsionables, los polvos humectables, las preparaciones fluidizables y similares, una planta se trata normalmente diluyendo el agente con agua, seguido de la pulverización. Una concentración del presente compuesto está normalmente en un intervalo del 0,0001 al 3 % en peso, preferentemente en un intervalo del 0,0005 al 1 % en peso. En el caso de polvos, gránulos y similares, una planta se trata con el agente sin dilución.
- 10 Alternativamente, el agente de control de enfermedades vegetales de la presente invención puede usarse por un método de tratamiento tal como la desinfección de semillas. Los ejemplos del método para desinfectar una semilla incluyen un método de sumergir una semilla vegetal en un agente de control de enfermedades vegetales de la presente invención que se ha preparado de tal manera que una concentración del presente compuesto se ajuste a de 1 a 1000 ppm, un método de pulverizar o aplicar el agente de control de enfermedades vegetales de la presente invención que tenga una concentración del presente compuesto de 1 a 1000 ppm en las semillas vegetales y un método para recubrir las semillas vegetales con el agente de control de enfermedades vegetales de la presente invención que se haya formulado en polvos.
- 15

20 El método de control de enfermedades vegetales de la presente invención se realiza normalmente tratando a una planta que se espera que desarrolle una enfermedad o a un suelo donde la planta crece y/o tratando a una planta que se confirma que ha desarrollado una enfermedad o a un suelo donde la planta crece con una cantidad eficaz del agente de control de enfermedades vegetales de la presente invención.

25 El agente de control de enfermedades vegetales de la presente invención se usa normalmente como un agente de control de enfermedades vegetales para horticultura, es decir, un agente de control de enfermedades vegetales para controlar una enfermedad vegetal en campo arado, arrozales, huertos, jardines de té, prados, céspedes etcétera.

30 El agente de control de enfermedades vegetales de la presente invención puede usarse (mezclado o combinado) junto con otros fungicidas, insecticidas, acaricidas, nematocidas, herbicidas, agentes de control del crecimiento vegetal y/o fertilizantes.

Los ejemplos de un principio activo de tales otros fungicidas incluyen clorotalonil, fluazinam, diclofluanida, fosetil-Al, derivados imido cíclicos (captan, captafol, folpet, etc.) derivados ditiocarbamato (maneb, mancozeb, tiram, ziram, zineb, propineb etc.), derivados inorgánicos u orgánicos de cobre (sulfato de cobre básico, oxiclورو de cobre, hidróxido de cobre, oxina-cobre etc.), derivados de acilalanina (metalaxilo, furalaxilo, ofurace, ciprofuram, benalaxilo, oxadixilo etc.), compuestos de estrobilurina (cresoxim-metilo, azoxistrobina, trifloxistrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, dimoxistrobina, fluoxastrobina, metominostrobin etc.), derivados de anilino pirimidina (ciprodinilo, pirimetanilo, mepanipirim etc.), derivados de fenilpirrol (fencpiclonilo, fludioxonilo etc.), derivados imida (procimidona, iprodiona, vincrozolina etc.), derivados de benzimidazol (carbendazim, benomilo, tiabendazol, tiofanato-metilo etc.), derivados amina (fenpropimorf, tridemorf, fenpropidina, espiroxamina etc.), derivados azol (propiconazol, triadimenol, procloraz, penconazol, tebuconazol, flusilazol, diniconazol, bromuconazol, epoxiconazol, difenoconazol, ciproconazol, metconazol, triflumizol, tetraconazol, miclobutanilo, fenbuconazol, hexaconazol, fluquinconazol, triticonazol, bitertanol, imazalilo, frutriafol etc.), cimoxanil, dimetomorf, famoxadona, fenamidona, iprovalicarb, bentiavalicarb, ciazofamid, picobenzamid, mandipropamida, zoxamida, etaboxam, boscalid, pirbencarb, fluopicolida, fenhexamida, quinoxifen, proquinazid, dietofencarb, acibenzolar-S-metilo, guazatina y pentiopirad.

35

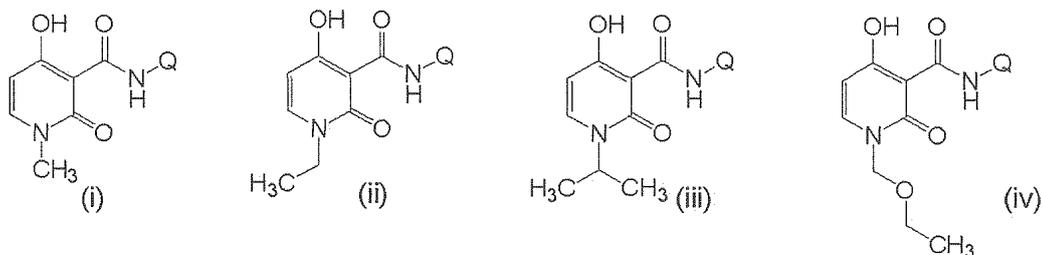
40

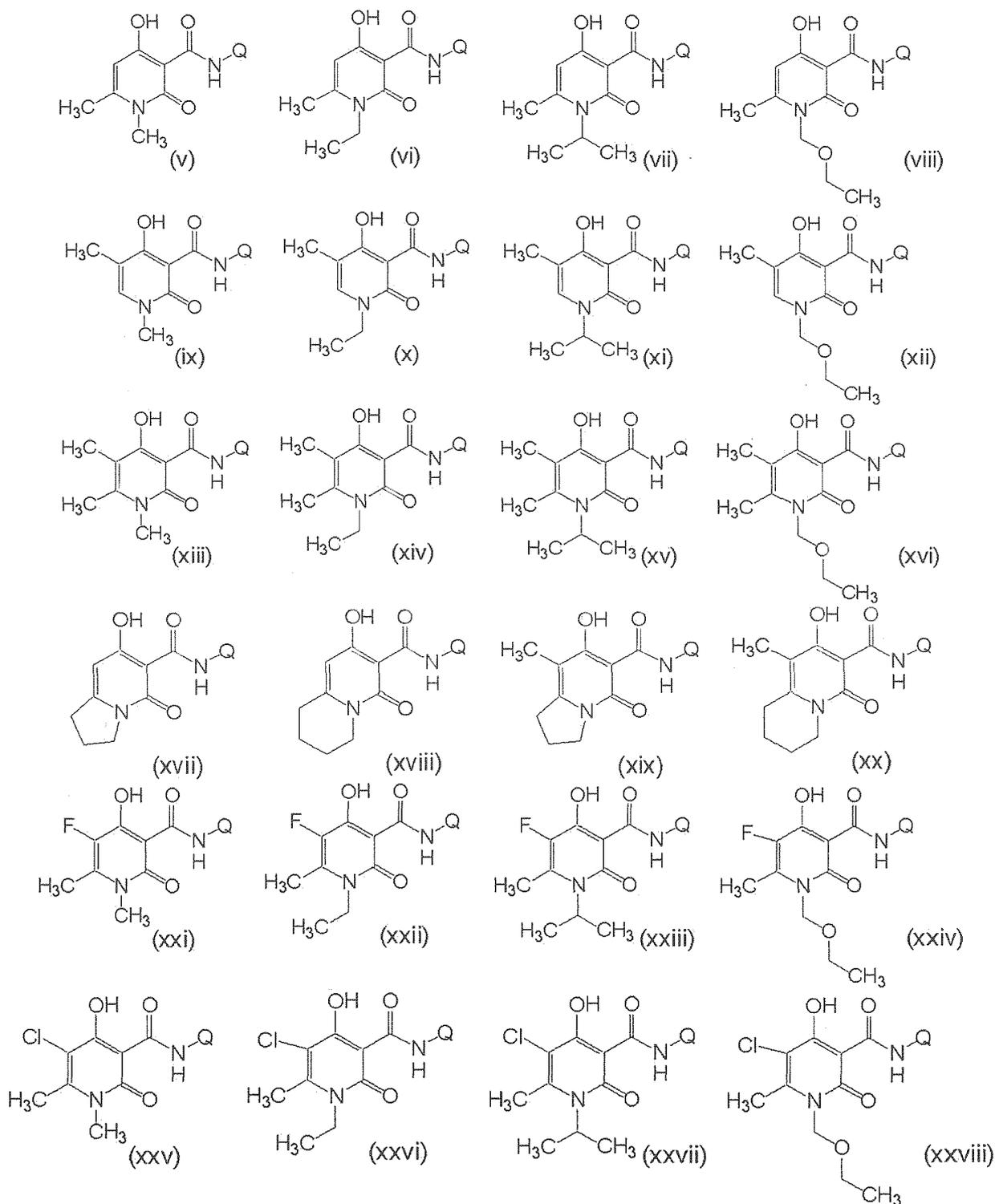
45

Los ejemplos específicos del presente compuesto incluyen los siguientes compuestos.

Compuestos de carboxamida representados por las siguientes fórmulas (i) a (xxviii):

50



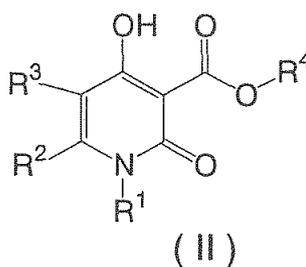


En las fórmulas (i) a (xxviii), Q representa uno cualquiera de los siguientes grupos.

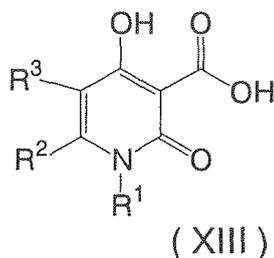
- 10 Grupo 2-imidazolilo, grupo 4-metil-2-imidazolilo, grupo 4,5-dimetil-2-imidazolilo, grupo 4-cloro-2-imidazolilo, grupo 4-bromo-2-imidazolilo, grupo 4,5-diciano-2-imidazolilo, grupo 4-fluoro-2-imidazolilo, grupo 4-ciano-2-imidazolilo, grupo 2-benzimidazolilo, grupo 4-fluoro-2-benzimidazolilo, grupo 5-fluoro-2-benzimidazolilo, grupo 4-cloro-2-benzimidazolilo, grupo 5-cloro-2-benzimidazolilo, grupo 4-ciano-2-benzimidazolilo, grupo 5-ciano-2-benzimidazolilo, grupo 4-metil-2-benzimidazolilo, grupo 5-metil-2-benzimidazolilo, grupo 4-trifluorometil-2-benzimidazolilo, grupo 5-trifluorometil-2-benzimidazolilo, grupo 5,6-dimetil-2-benzimidazolilo, grupo 5,6-difluoro-2-benzimidazolilo, grupo 5,6-dicloro-2-benzimidazolilo, grupo 5-trifluorometil-2-benzimidazolilo, grupo 5-ciano-2-benzimidazolilo, grupo 2-tiazolilo, grupo 4-metil-2-tiazolilo, grupo 4,5-dimetil-2-tiazolilo, grupo 4-cloro-2-tiazolilo, grupo 4-bromo-2-tiazolilo, grupo 4,5-

- 5 diciano-2-tiazolilo, grupo 4-fluoro-2-tiazolilo, grupo 4-ciano-2-tiazolilo, grupo 2-benzotiazolilo, grupo 4-fluoro-2-benzotiazolilo, grupo 7-fluoro-2-benzotiazolilo, grupo 5-fluoro-2-benzotiazolilo, grupo 6-fluoro-2-benzotiazolilo, grupo 4-cloro-2-benzotiazolilo, grupo 5-cloro-2-benzotiazolilo, grupo 6-cloro-2-benzotiazolilo, grupo 7-cloro-2-benzotiazolilo, grupo 4-metil-2-benzotiazolilo, grupo 5-metil-2-benzotiazolilo, grupo 6-metil-2-benzotiazolilo, grupo 7-metil-2-benzotiazolilo, grupo 5,6-dimetil-2-benzotiazolilo, grupo 5,6-difluoro-2-benzotiazolilo, grupo 5,6-dicloro-2-benzotiazolilo, grupo 5-trifluorometil-2-benzotiazolilo, grupo 5-ciano-2-benzotiazolilo, grupo 3-pirazolilo, grupo 1-metil-3-pirazolilo, grupo 1,5-dimetil-3-pirazolilo, grupo 4-cloro-1-metil-3-pirazolilo, grupo 1-etil-3-pirazolilo, grupo 1-(2,2,2-trifluoroetil)-3-pirazolilo, grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, grupo 3-metil-1,2,4-tiadiazol-5-ilo, grupo 3-trifluorometil-1,2,4-tiadiazol-5-ilo, grupo 3-ciano-1,2,4-tiadiazol-5-ilo, grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, grupo 5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo, grupo 5-trifluorometil-1,3,4-tiadiazol-2-ilo y grupo 5-ciano-1,3,4-tiadiazol-2-ilo.

Las realizaciones de los intermedios del presente compuesto incluyen, por ejemplo, los siguientes compuestos.



- 15 Un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilquilo C2-C5, R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R³ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3.
- 20 Un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R¹ y R² se unen entre sí en un extremo para formar un grupo alquileno C3-C4 y R³ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3.
- Un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3, R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.
- 25 Un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3, R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R³ es un átomo de halógeno.
- Un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3, R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R³ es un átomo de flúor.
- 30 Un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3, R² es un grupo alquilo C1-C3 y R³ es un átomo de flúor.
- 35 Un compuesto representado por la fórmula (II) en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3, R² es un grupo metilo y R³ es un átomo de flúor.



- 40 Un compuesto representado por la fórmula (XIII) en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoxilquilo C2-C5, R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R³ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3.
- 45 Un compuesto representado por la fórmula (XIII) en el que R¹ y R² se unen entre sí en un extremo para formar un grupo alquileno C3-C4 y R³ es un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3.
- Un compuesto representado por la fórmula (XIII) en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3, R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.

Un compuesto representado por la fórmula (XIII) en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3, R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R³ es un átomo de halógeno.

5 Un compuesto representado por la fórmula (XIII) en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3, R² es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3 y R³ es un átomo de flúor.

Un compuesto representado por la fórmula (XIII) en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3, R² es un grupo alquilo C1-C3 y R³ es un átomo de flúor.

10 Un compuesto representado por la fórmula (XIII) en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3, R² es un grupo metilo y R³ es un átomo de halógeno.

Un compuesto representado por la fórmula (XIII) en el que R¹ es un grupo alquilo C1-C3, R² es un grupo metilo y R³ es un átomo de flúor.

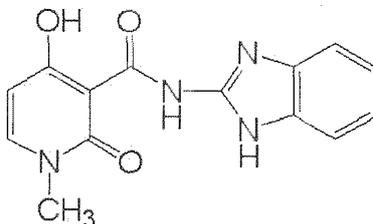
15 Ejemplos

La presente invención se explicará con mayor detalle por los Ejemplos de Preparación, los Ejemplos de Formulación y los Ejemplos de Ensayo, pero la presente invención no se limita a estos Ejemplos.

20 En primer lugar, se describirán los Ejemplos de Preparación del presente compuesto y los Ejemplos de Preparación de Referencia para preparar los intermedios del presente compuesto.

25 Ejemplo de Preparación 1

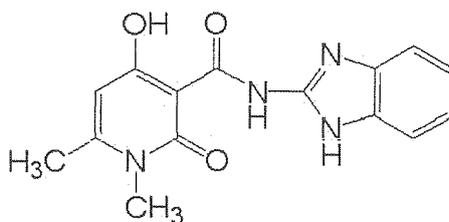
Se añadieron 110 mg de 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo y 83,9 mg de 2-aminobenzimidazol a 15 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 4 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, después, a la mezcla de reacción se añadieron 30 ml de n-hexano. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con n-hexano y se secó para obtener 115 mg de N-(2-benzimidazolil)-4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 1) representada por la fórmula:



35 RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 3,52 (3H, s), 6,28 (1H, d, J = 8 Hz), 7,12 (2H, m), 7,50 (2H, m), 8,04 (1H, d, J = 8 Hz), 12,22 (1H, s), 13,31 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 2

40 Usando 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo en lugar de 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo N-(2-benzimidazolil)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida representada por la fórmula:

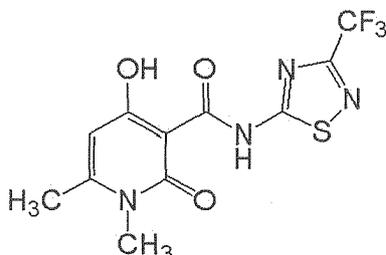


45 (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 2).
RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 2,45 (3H, s), 3,50 (3H, s), 6,26 (1H, s), 7,13 (2H, m), 7,48 (2H, m), 12,19 (1H, s), 13,32 (1H, s), 14,28 (1H, s)

50

Ejemplo de Preparación 3

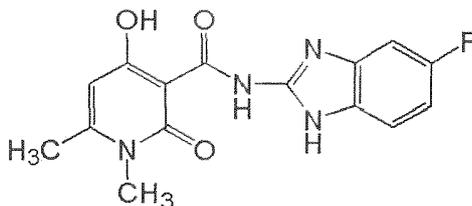
- 5 Usando 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo en lugar de 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo, usando 5-amino-3-fluorometil-1,2,4-tiadiazol en lugar de 2-aminobenzimidazol y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo N-(3-fluorometil-1,2,4-tiadiazol-5-il)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida representada por la fórmula:



- 10 (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 3).
RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,44 (3H, s), 3,58 (3H, s), 6,06 (1H, s), 13,34 (1H, s), 14,07 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 4

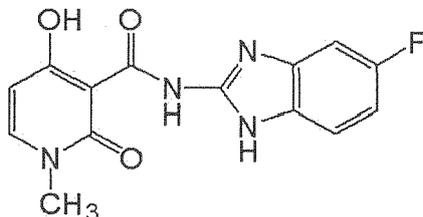
- 15 Usando 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo en lugar de 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo, usando 2-amino-5-fluorobenzimidazol en lugar de 2-aminobenzimidazol y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo N-(5-fluoro-2-benzimidazolil)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida representada por la fórmula:



- 20 (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 4).
RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 2,45 (3H, s), 3,49 (3H, s), 6,26 (1H, s), 6,97 (1H, m), 7,26 (1H, m), 7,47 (1H, m), 12,28 (1H, s), 13,37 (1H, s), 14,20 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 5

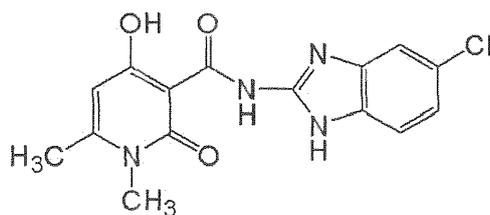
- 30 Usando 2-amino-5-fluorobenzimidazol en lugar de 2-aminobenzimidazol y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo N-(5-fluoro-2-benzimidazolil)-4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida representada por la fórmula:



- 35 (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 5).
RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 3,52 (3H, s), 6,27 (1H, d, J = 7 Hz), 6,98 (1H, m), 7,26 (1H, d, J = 7 Hz), 7,47 (1H, m), 8,04 (1H, d, J = 8 Hz), 12,31 (1H, s), 13,37 (1H, s), 14,32 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 6

- 40 Usando 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo en lugar de 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo, usando 2-amino-5-clorobenzimidazol en lugar de 2-aminobenzimidazol y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo N-(5-cloro-2-benzimidazolil)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida representada por la fórmula:

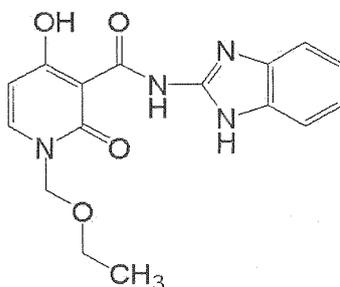


(en lo sucesivo, denominado presente compuesto 6).

5 RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 2,45 (3H, s), 3,49 (3H, s), 6,26 (1H, s), 7,14 (1H, m), 7,43-7,52 (2H, m), 12,33 (1H, s), 13,40 (1H, s), 14,16 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 7

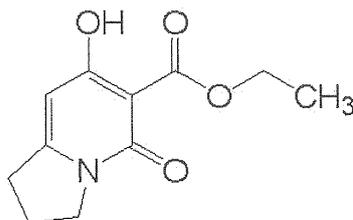
10 Usando 1-etoximetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo en lugar de 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo N-(5-fluoro-2-benzimidazolil)-1-etoximetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida representada por la fórmula:



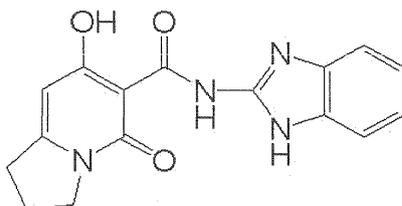
15 (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 7).
RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 1,12 (3H, t, J = 7 Hz), 3,58 (2H, q, J = 7 Hz), 5,35 (2H, s), 6,31 (1H, d, J = 8 Hz), 7,13 (2H, m), 7,47 (2H, m), 8,04 (1H, d, J = 8 Hz), 12,20 (1H, m), 13,17 (1H, m)

20 Ejemplo de Preparación 8

Usando un compuesto de carboxilato representado por la fórmula:



25 en lugar de 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo un compuesto de carboxamida representado por la fórmula:

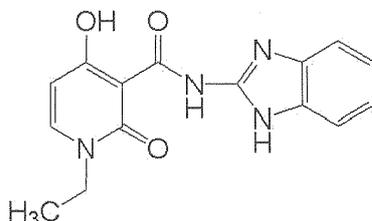


30 (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 8).
RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 2,15 (2H, m), 3,14 (2H, t, J = 8 Hz), 4,07 (2H, t, J = 7 Hz), 6,26 (1H, s), 7,14 (2H, m), 7,48 (2H, m), 12,20 (1H, bs), 13,22 (1H, s)

35

Ejemplo de Preparación 9

Usando 1-etil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo en lugar de 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo N-(2-benzimidazolil)-etil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida representado por la fórmula:

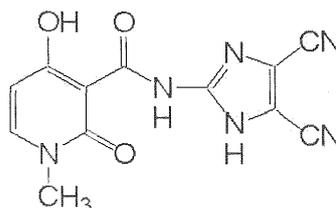


(en lo sucesivo, denominado presente compuesto 9).

10 RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 1,27 (3H, d, J = 7 Hz), 4,00 (2H, q, J = 7 Hz), 6,30 (1H, d, J = 7 Hz), 7,14 (2H, m), 7,49 (2H, m), 8,07 (1H, d, J = 7 Hz), 13,35 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 10

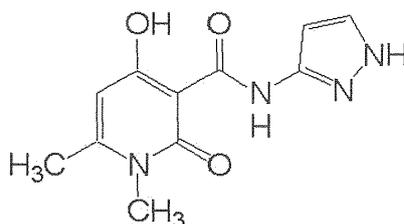
15 Usando 2-amino-4,5-dicianobenzimidazol en lugar de 2-aminobenzimidazol y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo N-(4,5-diciano-2-imidazolil)-4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida representada por la fórmula:



20 (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 10).

Ejemplo de Preparación 11

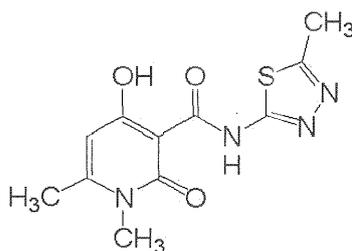
25 Usando 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo en lugar de 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo, usando 3-aminopirazol en lugar de 2-aminobenzimidazol y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo N-(3-pirazolil)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida representada por la fórmula:



30 (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 11).
RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 2,51 (3H, s), 3,52 (3H, s), 6,16 (1H, s), 6,59 (1H, s), 7,69 (1H, s), 12,58 (1H, s), 12,63 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 12

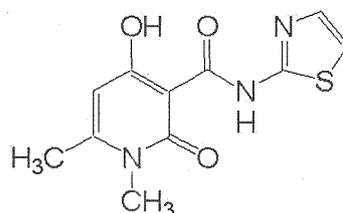
40 Usando 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo en lugar de 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo, usando 2-amino-5-metil-1,3,4-tiadiazol en lugar de 2-aminobenzimidazol y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo N-(5-metil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 12) representada por la fórmula:



RMN-¹H (CCl₃, TMS) δ (ppm): 2,41 (3H, s), 2,72 (3H, s), 6,01 (1H, s), 13,66 (1H, s), 13,80 (1H, s)

5 Ejemplo de Preparación 13

Usando 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo en lugar de 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo, usando 2-aminotiazol en lugar de 2-aminobenzimidazol y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación 1, se obtuvo N-(2-tiazolil)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida representada por la fórmula:

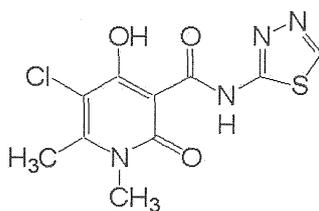


(en lo sucesivo, denominado presente compuesto 13).

15 RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 2,39 (3H, s), 3,53 (3H, s), 5,99 (1H, s), 7,02 (1H, d, J = 3 Hz), 7,52 (1H, d, J = 3 Hz), 13,49 (1H, s), 14,09 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 14

20 Se añadieron 197 mg de 5-cloro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 76 mg de 2-amino-1,3,4-tiadiazol a 2 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, después, a la mezcla de reacción se añadió 30 n-hexano. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con una mezcla de éter de t-butil metilo y n-hexano y se secó para obtener 183 mg de N-(1,3,4-tiadiazol-2-il)-5-cloro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 14) representada por la fórmula:



30 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,64 (3H, s), 3,65 (3H, s), 8,90 (1H, s), 13,85 (1H, s), 14,63 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 15

35 Usando 5-fluoro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo en lugar de 5-cloro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo, usando 2-amino-5-metiltiazol en lugar de 2-amino-1,3,4-tiadiazol y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación 12, se obtuvo N-(5-metil-2-tiazolil)-5-fluoro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida representada por la fórmula:

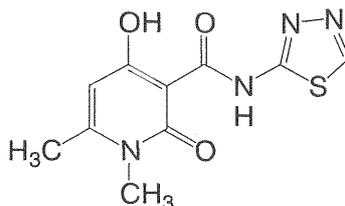


(en lo sucesivo, denominado presente compuesto 15).

RMN-¹H (CDCl₃, TMS, TMS) δ (ppm): 2,42 (3H, s), 2,43 (3H, d, J = 3 Hz), 3,54 (3H, s), 7,17 (1H, d, J = 1 Hz), 13,32 (1H, s), 14,69 (1H, s)

5 Ejemplo de Preparación 16

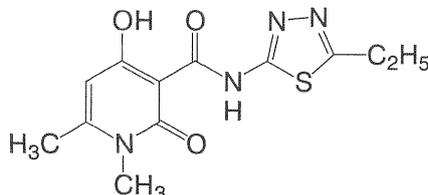
Se añadieron 213 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 94 mg de 2-amino-1,3,4-tiadiazol a 2,5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 6,5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, después, el sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mezclado de éter de t-butil metilo y hexano y se secó para obtener 185 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-N-(1,3,4-tiadiazol-2-il)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 16) representada por la fórmula:



15 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,41 (3H, s), 3,54 (3H, s), 6,01 (1H, s), 8,88 (1H, s), 13,67 (1H, s), 13,84 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 17

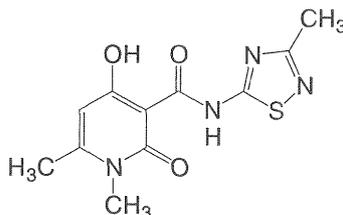
20 Se añadieron 212 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 117 mg de 2-amino-5-etil-1,3,4-tiadiazol a 2,5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mezclado de éter de t-butil metilo y hexano y se secó para obtener 200 mg de N-(5-etil-1,3,4-tiadiazol-2-il)-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 17) representada por la fórmula:



30 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,43 (3H, t, J = 8 Hz), 2,41 (3H, s), 3,05 (2H, q, J = 8 Hz), 3,53 (3H, s), 6,00 (1H, s), 13,65 (1H, s), 13,81 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 18

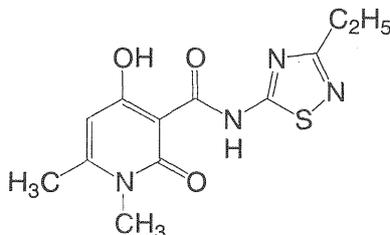
35 Se añadieron 243 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 122 mg de 2-amino-3-metil-1,2,4-tiadiazol a 2,5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mezclado de éter de t-butil metilo y hexano y se secó para obtener 257 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-N-(3-metil-1,2,4-tiadiazol-5-il)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 18) representada por la fórmula:



45 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,42 (3H, s), 2,58 (3H, s), 3,54 (3H, s), 6,04 (1H, s), 13,53 (1H, s), 13,61 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 19

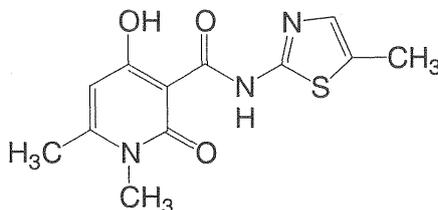
Se añadieron 213 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 120 mg de 5-amino-3-etil-1,2,4-tiadiazol a 2,5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 4 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mezclado de éter de t-butil metilo y hexano y se secó para obtener 231 mg de 1,6-dimetil-N-(3-etil-1,2,4-tiadiazol-5-il)-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 19) representada por la fórmula:



10 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,37 (3H, t, J = 7 Hz), 2,42 (3H, s), 2,91 (2H, q, J = 7 Hz), 3,54 (3H, s), 6,03 (1H, s), 13,55 (1H, s), 13,59 (1H, s)

15 Ejemplo de Preparación 20

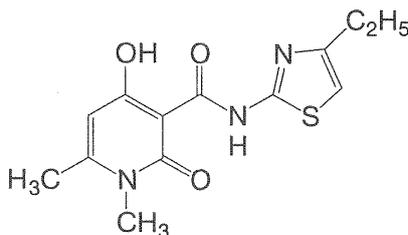
Se añadieron 212 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 105 mg de 2-amino-5-metiltiazol a 2,5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 5,5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mezclado de éter de t-butil metilo y hexano y se secó para obtener 188 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-N-(5-metiltiazol-2-il)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 20) representada por la fórmula:



25 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,39 (3H, s), 2,42 (3H, s), 3,52 (3H, s), 5,99 (1H, s), 7,16 (1H, s), 13,33 (1H, s), 14,17 (1H, s)

30 Ejemplo de Preparación 21

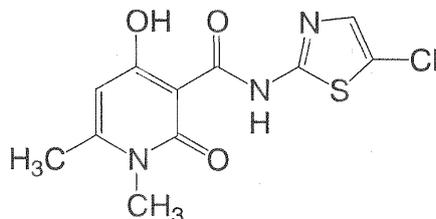
Se añadieron 210 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 117 mg de 2-amino-4-etiltiazol a 2,5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 5,5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mezclado de éter de t-butil metilo y hexano y se secó para obtener 150 mg de 1,6-dimetil-N-(4-etiltiazol-2-il)-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 21) representada por la fórmula:



40 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,28 (3H, t, J = 7 Hz), 2,39 (3H, s), 2,72 (2H, q, J = 7 Hz), 3,52 (3H, s), 5,99 (1H, s), 6,57 (1H, s), 13,41 (1H, s), 14,14 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 22

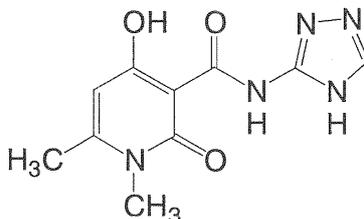
Se añadieron 223 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 129 mg de 2-amino-5-clorotiazol a 2,5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 8,5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mezclado de éter de t-butil metilo y hexano y se secó para obtener 153 mg de N-(5-clorotiazol-2-il)-1,3-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 22) representada por la fórmula:



RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,41 (3H, s), 3,53 (3H, s), 6,01 (1H, s), 7,33 (1H, s), 13,44 (1H, s), 13,84 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 23

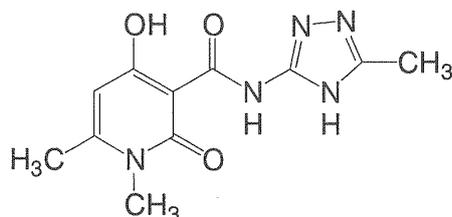
Se añadieron 213 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 78 mg de 3-amino-1,2,4-triazol a 2,5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 7,5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mezclado de éter de t-butil metilo y hexano y se secó para obtener 188 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-N-(1,2,4-triazol-3-il)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 23) representada por la fórmula:



RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,42 (3H, s), 3,53 (3H, s), 6,02 (1H, s), 7,79 (1H, s), 13,29 (1H, s), 13,86 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 24

Se añadieron 211 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 90 mg de 3-amino-5-metil-1,2,4-triazol a 2,5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 7 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mezclado de éter de t-butil metilo y hexano y se secó para obtener 214 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-N-(5-metil-1,2,4-triazol-3-il)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 24) representada por la fórmula:



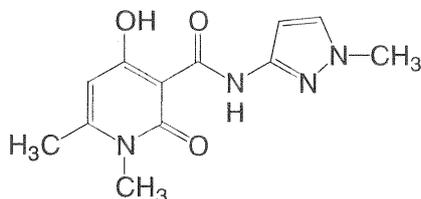
RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,38 (3H, s), 2,40 (3H, s), 3,52 (3H, s), 6,00 (1H, s), 7,79 (1H, s), 13,19 (1H, s), 13,49 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 25

Se añadieron 213 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 79 mg de 3-amino-1-metilpirazol a 2,5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 6,5 horas en condición de reflujo con

calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mezclado de éter de t-butil metilo y hexano y se secó para obtener 134 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-N-(1-metilpirazol-3-il)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 25) representada por la fórmula:

5



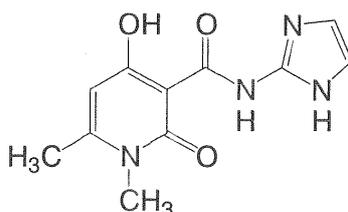
RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,37 (3H, s), 3,50 (3H, s), 3,84 (3H, s), 5,95 (1H, s), 6,59 (1H, s), 6,61 (1H, d, J = 2 Hz), 12,48 (1H, s), 15,25 (1H, s)

10

Ejemplo de Preparación 26

Se añadieron 257 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 260 mg de 2-aminoimidazol a 5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 2 horas en condición de reflujo con calor. Además, a la mezcla se añadieron 151 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y la mezcla resultante se agitó durante 2,5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mezclado de éter de t-butil metilo y hexano y se secó para obtener 580 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-N-(2-imidazolil)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 26) representada por la fórmula:

20



RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,39 (3H, s), 3,52 (3H, s), 5,98 (1H, s), 6,85 (1H, d, J = 1 Hz), 6,90 (1H, d, J = 1 Hz), 10,60 (1H, s), 13,06 (1H, s), 14,29 (1H, s)

25

Ejemplo de Preparación 27

Se añadieron 213 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 79 mg de 3-amino-5-metilisooxazol a 2,5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 6,5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mezclado de éter de t-butil metilo y hexano y se secó para obtener 141 mg de 1,6-dimetil-4-hidroxi-N-(1-metilisooxazol-3-il)-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 27) representada por la fórmula:

30



35

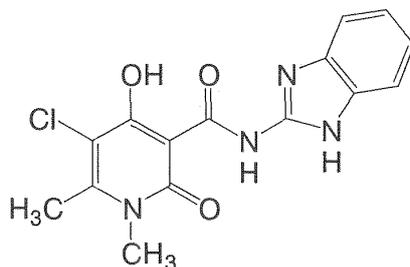
RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 2,42 (3H, s), 2,42 (3H, s), 3,51 (3H, s), 5,98 (1H, s), 6,66 (1H, s), 12,72 (1H, s), 14,65 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 28

Se añadieron 199 mg de 5-cloro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 98 mg de 2-amino-benzimidazol a 2 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 9,5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, después, se añadió hexano a esta y la mezcla resultante se dejó reposar. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con una mezcla de éter de t-butil metilo y n-hexano y se secó para obtener 202 mg de N-(2-benzimidazolil)-5-cloro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-

45

dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 28) representada por la fórmula:

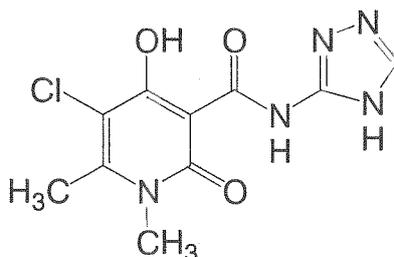


5 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,62 (3H, s), 3,63 (3H, s), 7,18-7,72 (5H, m), 10,76 (1H, s), 13,41 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 29

10 Se añadieron 161 mg de 5-cloro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 51 mg de 3-amino-1,2,4-triazol a 1,5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, después, se añadió hexano a ésta y la mezcla resultante se dejó reposar. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con una mezcla de éter de t-butil metilo y n-hexano y se secó para obtener 153 mg de 5-cloro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-N-(1,2,4-triazol-3-il)-1,2-

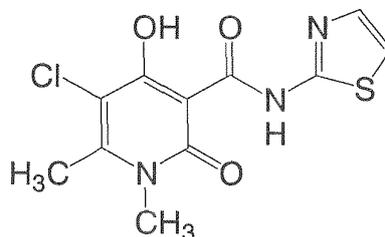
15



RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,64 (3H, s), 3,63 (3H, s), 7,81 (1H, s), 13,30 (1H, s), 14,80 (1H, s)

20 Ejemplo de Preparación 30

25 Se añadieron 160 mg de 5-cloro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo y 60 mg de 2-aminotiazol a 1,5 ml de bromobenceno, después, la mezcla se agitó durante 5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, después, se añadió hexano a ésta y la mezcla resultante se dejó reposar. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con una mezcla de éter de t-butil metilo y n-hexano y se secó para obtener 136 mg de 5-cloro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-N-(2-tiazolil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 30) representada por la fórmula:



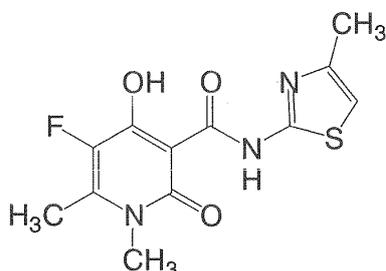
30 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,62 (3H, s), 3,62 (3H, s), 7,05 (1H, d, J = 3 Hz), 7,54 (1H, d, J = 3 Hz), 13,48 (1H, s), 15,07 (1H, s)

Ejemplo de Preparación 31

35 Se disolvieron 200 mg de ácido 5-fluoro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico en 3 ml de acetonitrilo y a éste se añadieron 162 mg de carbonildiimidazol. La mezcla se agitó durante 1 hora en condición de reflujo con calor, después, se añadieron 114 mg de 2-amino-4-metiltiazol y la mezcla resultante se agitó adicionalmente durante 1 hora en condición de reflujo con calor. A partir de entonces, la mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente. Como resultado, se produjo un cristal. El cristal producido se recogió por filtración

40

para obtener 90 mg de 5-fluoro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-N-(4-metil-2-tiazolil)-1,2-dihidropiridin-3-carboxamida (en lo sucesivo, denominado presente compuesto 31) representada por la fórmula:

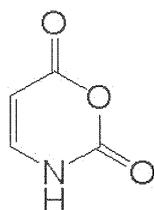


5 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,29 (3H, s), 2,43 (3H, s), 3,50 (3H, s), 6,97 (1H, s), 13,75 (1H, s), 14,37 (1H, s)

Después, se describirán los Ejemplos de Preparación de Referencia para preparar los intermedios del presente compuesto.

10 Ejemplo de Preparación de Referencia 1

15 A temperatura ambiente, se añadieron 7,9 ml de trimetilsililazida a una mezcla de 5,0 g de anhídrido maleico y 20 ml de benceno. La mezcla se agitó a 50-60 °C durante 3 horas. Después de enfriar la mezcla de reacción a temperatura ambiente, se añadieron 4,5 ml de etanol, seguido de agitación durante 3 horas adicionales. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con éter de dietilo para obtener 300 mg de 2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:

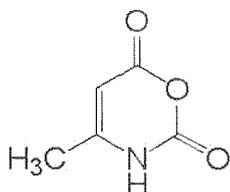


20 RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 5,62 (1H, d, J = 8 Hz), 7,66 (1H, d, J = 8 Hz), 11,55 (1H, s)

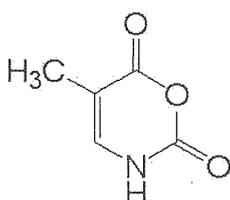
Ejemplo de Preparación de Referencia 2

25 A temperatura ambiente, se añadieron 50,0 g de trimetilsililazida a una mezcla de 44,8 g de anhídrido citracónico y 60 ml de cloroformo. La mezcla se agitó a 50-60 °C durante 5 horas. Después de enfriar la mezcla de reacción con un hielo, se añadieron 25,0 g de etanol, seguido de agitación durante 30 minutos adicionales. El sólido resultante se recogió por filtración y se lavó con un disolvente mezclado de cloroformo y etanol para obtener 4-metil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona bruta representada por la fórmula:

30



35 Además, la solución de lavado se concentró a presión reducida. Se añadió éter de t-butil metilo al residuo, seguido de filtración. El sólido resultante se lavó con éter de t-butil metilo. El filtrado y la solución de lavado se combinaron y se concentraron a presión reducida para obtener 5-metil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona bruta representada por la fórmula:



4-Metil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona

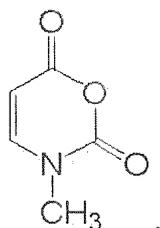
RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 2,06 (3H, s), 5,50 (1H, s), 11,47 (1H, s-br)

5-Metil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona

5 RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 1,78 (3H, s), 7,48 (1H, s), 11,47 (1H, s-br)

Ejemplo de Preparación de Referencia 3

10 A temperatura ambiente, se añadieron secuencialmente 1,50 g de 2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona, 2,19 g de carbonato potásico y 3,77 g de yoduro de metilo a 30 ml de acetona y la mezcla se agitó durante 10 horas en condición de reflujo con calor. La reacción se enfrió a temperatura ambiente y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida y el sólido resultante se secó para obtener 1,46 g de 3-metil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:



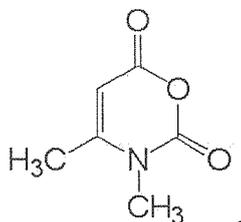
15

RMN-¹H (CD₃SOCD₃, TMS) δ (ppm): 3,26 (3H, s), 5,68 (1H, d, J = 8 Hz), 7,82 (1H, d, J = 8 Hz)

Ejemplo de Preparación de Referencia 4

20

Usando 4-metil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona bruta en lugar de 2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación de Referencia 3, se obtuvo 3,4-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona bruta representada por la fórmula:



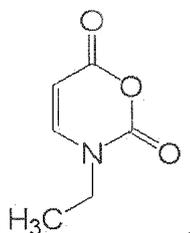
25

RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,27 (3H, d), 3,41 (3H, s), 5,49 (1H, d)

Ejemplo de Preparación de Referencia 5

30

Usando bromuro de etilo en lugar de yoduro de metilo y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación de Referencia 3, se obtuvo 3-etil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:

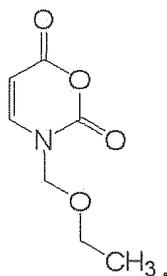


35

Ejemplo de Preparación de Referencia 6

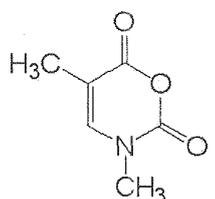
Usando éter de clorometil etilo en lugar de yoduro de metilo y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación de Referencia 3, se obtuvo 3-etoximetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:

40



Ejemplo de Preparación de Referencia 7

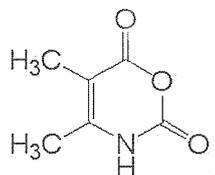
- 5 Usando 5-metil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona bruta en lugar de 2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación de Referencia 3, se obtuvo 3,5-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona bruta representada por la fórmula:



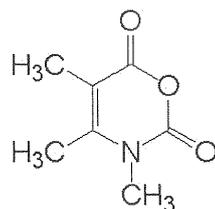
- 10 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,94 (3H, d), 3,37 (3H, s), 6,99 (1H, parecido a q)

Ejemplo de Preparación de Referencia 8

- 15 Usando 4,5-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:



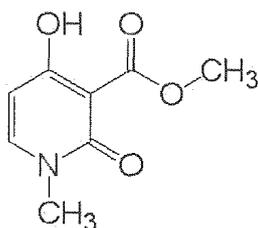
- 20 en lugar de 2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación de Referencia 3, se obtuvo 3,4,5-trimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:



- 25 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,97 (3H, s), 2,26 (3H, s), 3,42 (3H, s)

Ejemplo de Preparación de Referencia 9

- 30 Bajo enfriamiento por hielo, se añadieron 568 mg de hidruro sódico (60 %) a una mezcla de 181 mg de malonato de dimetilo y 70 ml de N,N-dimetilformamida y la mezcla se agitó durante 20 minutos. Después de que la mezcla se calentó a 80 °C, se añadieron 1,50 g de 3-metil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona a la mezcla, seguido de agitación adicional a 127 °C durante 7 horas. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida, se añadieron 2 mol/l de ácido clorhídrico al residuo y la mezcla se agitó a 60 °C durante 15 minutos. La mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución de cloruro sódico saturada acuosa, se secó con sulfato sódico, se filtró y se concentró. El residuo se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: acetato de etilo)
- 35 para obtener 100 mg de 4-hidroxi-1-metil-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo representado por la fórmula:

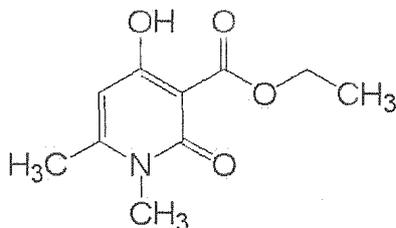


RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 3,44 (3H, s), 3,97 (3H, s), 5,97 (1H, d, J = 8 Hz), 7,37(1H, d, J = 8 Hz), 13,21 (1H, s)

5 Ejemplo de Preparación de Referencia 10

A temperatura ambiente, se añadió 1 ml de una solución de 0,71 g de malonato de dietilo en tetrahidrofurano a una mezcla de 0,19 g de hidruro sódico y 4 ml de tetrahidrofurano y la mezcla se agitó durante 20 minutos. A temperatura ambiente, se añadieron 3 ml de una solución de 0,59 g de 3,4-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona en tetrahidrofurano a la mezcla, seguido de agitación durante 2 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Al residuo, se añadieron 10 ml de agua y 12 ml de ácido clorhídrico 2 mol/l, seguido de extracción con acetato de etilo. La capa orgánica se secó con sulfato magnésico, después se filtró y se concentró para obtener 0,57 g de 1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo representado por la fórmula:

15



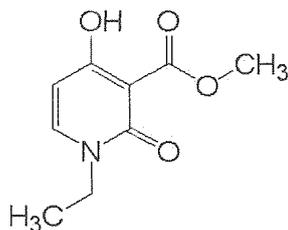
RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,44 (3H, t, J = 7 Hz) 2,34 (3H, s), 3,45 (3H, s), 4,43 (2H, q, J = 7 Hz), 5,86 (1H, s), 13,26 (1H, s)

20

Ejemplo de Preparación de Referencia 11

Usando 3-etil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona en lugar de 3,4-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona y usando malonato de dimetilo en lugar de malonato de dietilo y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación de Referencia 10, se obtuvo 1-etil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo representado por la fórmula:

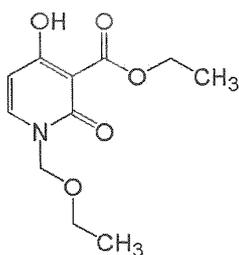
25



30 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,33 (3H, t, J = 7 Hz), 3,94 (2H, q, J = 7 Hz), 3,98 (3H, s), 5,98 (1H, d, J = 8 Hz), 7,37 (1H, d, J = 8 Hz), 13,25 (1H, s)

Ejemplo de Preparación de Referencia 12

35 Usando 3-etoximetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona en lugar de 3,4-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación de Referencia 10, se obtuvo 1-etoximetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo representado por la fórmula:



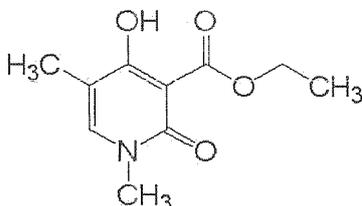
RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,20 (3H, t, J = 7 Hz), 1,44 (3H, t, J = 7 Hz), 3,60 (2H, q, J = 7 Hz), 4,45 (2H, q, J = 7 Hz), 5,30 (2H, s), 6,03 (1H, d, J = 8 Hz), 7,50 (1H, d, J = 8 Hz), 13,55 (1H, s)

5

Ejemplo de Preparación de Referencia 13

Usando 3,5-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona en lugar de 3,4-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación de Referencia 10, se obtuvo 1,5-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo representado por la fórmula:

10



Ejemplo de Preparación de Referencia 14

15

Usando 3,4,5-trimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona en lugar de 3,4-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona, usando malonato de dimetilo en lugar de malonato de dietilo y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación de Referencia 10, se obtuvo 4-hidroxi-2-oxo-1,5,6-trimetil-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de metilo representado por la fórmula:

20



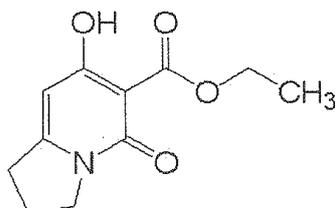
RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,05 (3H, s), 2,36 (3H, s), 3,51 (3H, s), 3,96 (3H, s), 13,83 (1H, s)

Ejemplo de Preparación de Referencia 15

25

Una mezcla de 10,1 ml de 2-metil-1-pirrolina y 2,27 ml de metantricarboxilato de trietilo se agitó a 200 °C durante 20 horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se sometió a cromatografía en gel de sílice para obtener 400 mg de éster carboxílico representado por la fórmula:

30



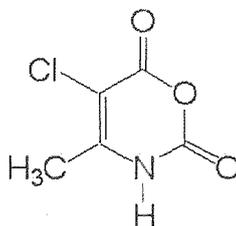
RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,43 (3H, t, J = 7 Hz), 2,14 (2H, m), 3,06 (2H, t, J = 7 Hz), 4,08 (2H, t, J = 7 Hz), 4,41 (2H, q, J = 7 Hz), 5,90 (1H, s), 13,55 (1H, s)

35

Ejemplo de Preparación de Referencia 16

Después de que se añadieran secuencialmente 16,5 g de 2-cloroacetoacetato de etilo y 8,91 g de carbamato de etilo a 83,9 g de oxiclورو fosforoso, esto se agitó a 90 °C durante 5 horas. La mezcla de reacción se concentró a

presión reducida y se añadieron tolueno y agua al residuo, seguido de la separación de las capas. La capa orgánica se extrajo con agua cuatro veces. La capa acuosa se recogió y se extrajo con acetato de etilo cuatro veces. Se recogió la capa orgánica, se lavó con agua, se secó con sulfato magnésico, se filtró y se concentró. El sólido resultante se lavó con una mezcla de éter de t-butil metilo y n-hexano y se secó para obtener 5-cloro-4-metil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:



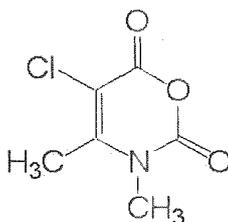
RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,34 (3H, s),

10

Ejemplo de Preparación de Referencia 17

A temperatura ambiente, se añadieron secuencialmente 2,11 g de 5-cloro-4-metil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona, 2,07 g de carbonato potásico y 1,3 ml de yoduro de metilo a 40 ml de acetona, después la mezcla se agitó durante 3 horas en condición de reflujo con calor. A la mezcla de reacción se añadieron 0,5 ml de yoduro de metilo y la mezcla se agitó adicionalmente durante 2 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente y se filtró. El filtrado se concentró a presión reducida. El sólido resultante se secó para obtener 1,74 g de 5-cloro-3,4-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:

15



20

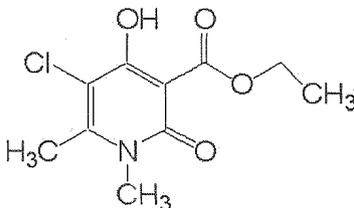
RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,48 (3H, s), 3,48 (3H, s)

Ejemplo de Preparación de Referencia 18

25

A 0,43 g de hidruro sódico (60 %) se añadieron 35 ml de tetrahidrofurano, 2,5 ml de una solución de 1,76 g de malonato de dietilo en tetrahidrofurano se añadieron adicionalmente en enfriamiento por hielo y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. A la mezcla se añadieron 1,74 g de 5-cloro-3,4-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona y ésta se agitó durante 3,5 horas en condición de reflujo con calor. La mezcla de reacción se concentró a presión reducida. Al residuo se añadieron secuencialmente 20 ml de agua y 15 ml de ácido clorhídrico 1 mol/l, seguido de la extracción con 85 ml de cloroformo dos veces. La capa orgánica se secó con sulfato magnésico, se filtró y se concentró. El residuo se lavó con n-hexano para obtener 1,52 g de 5-cloro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo representada por la fórmula:

30



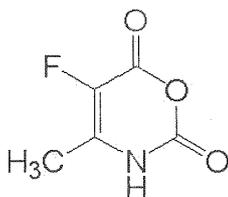
35

RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,45 (3H, t, J = 7 Hz), 2,57 (3H, s), 3,54 (3H, s), 4,46 (2H, q, J = 7 Hz), 14,10 (1H, s)

Ejemplo de Preparación de Referencia 19

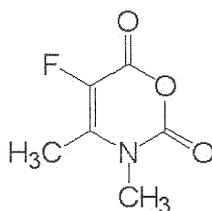
40

Usando 2-fluoroacetoacetato de etilo en lugar de 2-cloroacetoacetato de etilo y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación de Referencia 16, se obtuvo 5-fluoro-4-metil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:



Ejemplo de Preparación de Referencia 20

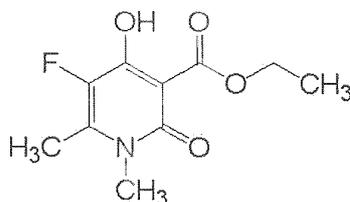
- 5 Usando 5-fluoro-4-metil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona en lugar de 5-cloro-4-metil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación de Referencia 17, se obtuvo 5-fluoro-3,4-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona representada por la fórmula:



10

Ejemplo de Preparación de Referencia 21

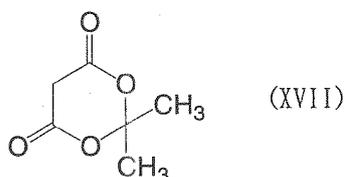
- 15 Usando 5-fluoro-3,4-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona en lugar de 5-cloro-3,4-dimetil-2H-1,3-oxazin-2,6(3H)-diona y de acuerdo con la misma manera como la del Ejemplo de Preparación de Referencia 18, se obtuvo 5-fluoro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxilato de etilo representada por la fórmula:



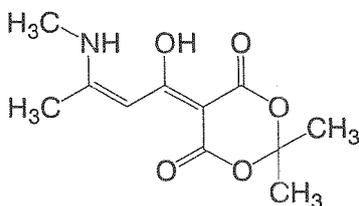
- 20 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,45 (3H, d, J = 7 Hz), 2,38 (3H, s), 3,46 (3H, s), 4,46 (2H, q, J = 7 Hz), 13,67 (1H, s), 13,64 (1H, s)

Ejemplo de Preparación de Referencia 22

- 25 Se disolvieron 14,4 g de un compuesto representado por la fórmula (XVII):



- 30 y 6,8 g de dicetena en 150 ml de acetonitrilo y se añadieron 1,01 g de trietilamina a temperatura ambiente. La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después, se añadieron 15,5 g de una solución de metilamina al 40 % en metanol a la mezcla, después ésta se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. A partir de entonces, la mezcla de reacción se enfrió con un hielo y se añadieron 30 ml de ácido clorhídrico concentrado. El cristal resultante se recogió por filtración y se secó para obtener 17,6 g de 2,2-dimetil-5-(1-hidroxi-3-metilamino-2-butenilidien)-1,3-dioxan-4,6-diona representada por la fórmula:



35

RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 1,70 (6H, s), 2,16 (3H, s), 3,09 (3H, d, J = 4 Hz), 6,45 (1H, s), 8,82 (1H, br)

Ejemplo de Preparación de Referencia 23

- 5 Se suspendió 1,0 g de 2,2-dimetil-5-(1-hidroxi-3-metilamino-2-butenildien)-1,3-dioxan-4,6-diona en 20 ml de acetonitrilo, se añadieron al mismo 806 mg de bis(tetrafluoroborato) de N,N'-difluoro-2,2'-bipiridinio y esto se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora y a 50 °C durante 30 minutos. La mezcla de reacción se añadió a 100 ml de agua helada y se extrajo con 100 ml de cloroformo dos veces. La capa orgánica se secó con sulfato magnesio anhidro y se concentró y el residuo se sometió a cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: acetato de etilo)
- 10 para obtener 480 mg de ácido 5-fluoro-1,6-dimetil-4-hidroxi-2-oxo-1,2-dihidropiridin-3-carboxílico representado por la fórmula:



- 15 RMN-¹H (CDCl₃, TMS) δ (ppm): 2,47 (3H, s), 3,58 (3H, s), 13,89 (1H, br), 15,46 (1H, br)

Después, se mostrarán los Ejemplos de Formulación. Parte representa parte en peso.

Ejemplo de Formulación 1

- 20 Cincuenta partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 13, 3 partes de ligninsulfonato, 2 partes de laurilsulfato sódico y 45 partes de óxido de silicio hidratado sintético se muelen y se mezclan bien para obtener cada polvo humectable.

25 Ejemplo de Formulación 2

- Veinte partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 13 y 1,5 partes de triolato de sorbitán se mezclan con 28,5 partes de una solución acuosa que contiene 2 partes de alcohol polivinílico y se dividen finamente por un método de molienda húmeda, se añaden 40 partes de una solución acuosa que contiene 0,05 partes de goma Xantana y 0,1 partes de silicato de magnesio y aluminio, se añaden 10 partes de propilenglicol y esto se agita y se mezcla para obtener cada preparación fluidizable.
- 30

Ejemplo de Formulación 3

- 35 Dos partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 13, 88 partes de arcilla de caolín y 10 partes de talco se muelen y se mezclan bien para obtener cada polvo.

Ejemplo de Formulación 4

- 40 Cinco partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 13, 14 partes de éter de polioxietileno de estiril fenilo, 6 partes de dodecibencensulfonato cálcico y 75 partes de xileno se mezclan bien para obtener cada concentrado emulsionable.

Ejemplo de Formulación 5

- 45 Dos partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 13, 1 parte de óxido de silicio hidratado sintético, 2 partes de ligninsulfonato cálcico, 30 partes de bentonita y 65 partes de arcilla de caolín se muelen y se mezclan bien, se añade agua y la mezcla se amasa bien, se granula y se seca para obtener cada gránulo.

50 Ejemplo de Formulación 6

- Diez partes de cada uno de los presentes compuestos 1 a 13, 35 partes de carbono blanco que contiene 50 partes de sal de amonio de éter sulfato de alquilo de polioxietileno y 55 partes de agua se mezclan y se dividen finamente por un método de molienda húmeda para obtener cada preparación fluidizable.
- 55

Después, el Ejemplo de Ensayo demuestra que el presente compuesto es útil como un fungicida agrícola y hortícola. El presente compuesto se indica por un número de compuesto.

Ejemplo de Ensayo 1: Ensayo del efecto en el control del moho gris del pepino (efecto preventivo)

5 Un bote de plástico se cargó con una marga arenosa y se sembró pepino (Nombre de la variedad de la planta: Sagamihanpaku) y creció durante 10 días en un invernadero. Cada preparación fluidizable de los presentes compuestos 1 a 9, 12 a 17, 20, 23 a 25, 27 y 31 que se habían obtenido de acuerdo con el Ejemplo de Preparación 6 se diluyeron con agua hasta una concentración predeterminada (500 ppm) para preparar una solución de pulverización. Cada solución de pulverización se pulverizó de forma foliar de tal manera que la solución se adhirió suficientemente a las hojas de pepino. Después de pulverizar, el pepino se secó al aire hasta un punto en que la solución de pulverización en las hojas se secó y un medio PDA que contenía una espora del moho gris del pepino (10 *Botrytis cinerea*) se colocó en las hojas del pepino. Después de la inoculación, el pepino se colocó a 12 °C en alta humedad durante 5 días y se investigó el efecto de control. Como resultado, un área de lesión en una planta tratada con los presentes compuestos 1 a 9, 12 a 17, 20, 23 a 25, 27 y 31 fue el 10 % o menos de un área de una lesión en una planta no tratada.

15 Ejemplo de Ensayo 2: Ensayo del efecto en el control del tizón del trigo (*Fusarium culmorum*) (efecto preventivo)

20 Un bote de plástico se cargó con una marga arenosa y se sembró un trigo (Nombre de la variedad de la planta: Shirogane komugi) y creció durante 8 días en un invernadero. Cada preparación fluidizable de los presentes compuestos 12, 13 y 15 que se habían obtenido de acuerdo con el Ejemplo de Preparación 6 se diluyeron con agua hasta una concentración predeterminada (500 ppm) para preparar una solución de pulverización. Cada solución de pulverización se pulverizó de forma foliar de tal manera que la solución se adhirió suficientemente a las hojas de trigo. Después de pulverizar, el trigo se secó al aire hasta un punto en que la solución de pulverización en las hojas se secó, después una suspensión de esporas del tizón del trigo (*Fusarium culmorum*) (que contenía aproximadamente 2000000 esporas por 1 ml de la suspensión) se inoculó por pulverización (en una relación de aproximadamente 2 ml por una planta). Después de la inoculación, el trigo se colocó a 23 °C en alta humedad durante 4 días, después se colocó en un invernadero durante 3 días. A partir de entonces, se investigó el efecto de control. Como resultado, un área de lesión en una planta tratada con los presentes compuestos 12, 13 y 15 fue el 10 % o menos de un área de una lesión en una planta no tratada.

30

Aplicabilidad industrial

Usando el presente compuesto, puede controlarse una enfermedad vegetal.

35

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de carboxamida representado por la fórmula (I):



5

[donde Q representa un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3, R¹ representa un grupo alquilo C1-C3 o un grupo alcoialquilo C2-C5, R² representa un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3, o R¹ y R² se unen entre sí en un extremo para representar un grupo alquileo C3-C4 y R³ representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo alquilo C1-C3].

10

2. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3 y un átomo de carbono adyacente a un átomo de nitrógeno entre los átomos constitucionales del anillo y un átomo de nitrógeno del NH en la fórmula (I) se unen entre sí.

15

20

3. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno opcionalmente fusionado con un anillo de benceno y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3 y el grupo heterocíclico tiene como un átomo constitucional del anillo un átomo de nitrógeno y al menos un heteroátomo seleccionado de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y un átomo de nitrógeno.

25

4. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno no fusionado con otro anillo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

30

5. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q es un grupo heterocíclico de 5 miembros que contiene nitrógeno fusionado con un anillo de benceno y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

35

6. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q es un grupo heterocíclico que es un grupo tiazolilo, un grupo benzotiazolilo, un grupo imidazolilo, un grupo benzimidazolilo, un grupo pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazolilo, un grupo 1,2,4-tiadiazolilo, un grupo 1,2,4-triazolilo, un grupo 1,3,4-oxadiazolilo o un grupo 1,3,4-tiadiazolilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

40

7. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-benzotiazolilo, un grupo 2-imidazolilo, un grupo 2-benzimidazolilo, un grupo 3-pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo, un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo o un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

45

50

8. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-tiazolilo, un grupo 2-imidazolilo, un grupo 3-pirazolilo, un grupo 1,2,4-oxadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo, un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo o un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo y el grupo heterocíclico puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

55

9. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q es un grupo heterocíclico que es un grupo 2-benzotiazolilo o un grupo 2-benzimidazolilo y el grupo heterocíclico

puede sustituirse con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

5 10. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, donde Q es un grupo 2-benzimidazolilo opcionalmente sustituido con al menos un grupo seleccionado del grupo que consiste en un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo alquilo C1-C3 y un grupo haloalquilo C1-C3.

10 11. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, donde R³ es un átomo de hidrógeno o un grupo alquilo C1-C3.

12. El compuesto de carboxamida de acuerdo con la reivindicación 1, donde R³ es un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno.

15 13. Un agente de control de enfermedades vegetales que comprende el compuesto de carboxamida como se define en la reivindicación 1 como un principio activo y un vehículo inerte.

20 14. Un método para controlar una enfermedad vegetal, que comprende la etapa de tratar una planta o un suelo donde crece una planta con una cantidad eficaz del compuesto de carboxamida como se define en la reivindicación 1.

15. Uso del compuesto de carboxamida como se define en uno la reivindicación 1 para controlar una enfermedad vegetal.