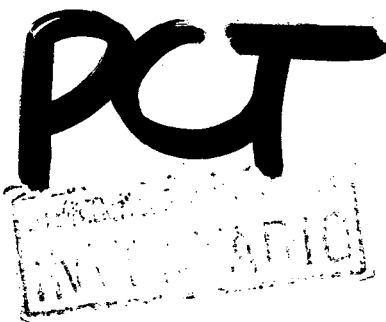




Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones



SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION

10-1461

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO DERIVADOS DE HETEROCICLO-PIRIMIDINIL-AMINO
FUNGICIDAS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE BAYER CROPS SCIENCE SA

DOMICILIO F-69009 LYON, FRANCIA

74. APODERADO ALVARO CORREA ORDOÑEZ

22. BOGOTÁ, D.C., Enero 6, 2010

(FORMA P-10)

08-01-2010

PETITOR

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-001461- -00000-0000

Fecha: 2010-01-07 16:34:08 Dep: 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTEIYII Eve: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 107

Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

SOLICITUD DE :

①

☒

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☒

Capítulo I.

☐

Capítulo II.

②

SOLICITANTE
(71)

Nombre: BAYER CROPSCIENCE SA

Dirección: 16 rue Jean-Marie Leclair, F-69009 Lyon, Francia

Nacionalidad o Domicilio: Francia

Lugar de Constitución: Francia

Teléfono:

Fax:

E-Mail

IDENTIFICACION

C.C.

☐

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

③

REPRESENTANTE
O APODERADO

Nombre: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

Dirección: Avenida 82 No. 10-62 Piso 6

Teléfono: 6341500

Fax: 3762211

E-Mail: office.bogota@bakernet.com

IDENTIFICACION

C.C.

☒

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número

79.143.366 Usaquén TP 28281

④

INVENTOR (ES)

Nombre: BEIER, Christian; COQUERON, Pierre-Yves; DUNKEL, Ralf; GENIX, Pierre; GREUL, Jörg; GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire; HILT, Emmanuelle; RINOLFI, Philippe; VOERSTÉ, Arnd; VORS, Jean-Pierre.

Dirección: 4 allée Jean Lacarelle F-69230 Saint Genis-laval (FR); 56 cours de la Liberté F-69003 Lyon (FR); 11 rue Pierre Dupont F-69001 Lyon (FR); 10 rue Janin F-69004 Lyon (FR); Am Sandberg 30a 42799 Leichlingen (DE); Le Trève Collonge Route d'Albigny F-69250 Curis au Mont d'Or (FR); Hameau de Peyrieu F-38460 Dizimieu (FR); Résidence le Coteau Lieu-dit la Colletière F-69380 Châtillon d'Azergues (FR); Mozartstrasse 3-5 50674 Köln (DE); 6 allée Adanson F-69110 Sainte Foy lès Lyon (FR) (Respectivamente).

Nacionalidad o Domicilio: Francés y Alemán

⑤

PCT (85)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2008/057126

Fecha 06.06.2008

Publicación Internacional No. WO/2008/148889

Fecha 11.12.2008

⑥

Título (54)

DERIVADOS DE HETEROCICLIL-PIDIMIDINIL-AMINO FUNGICAS

⑦

Clasificación Internacional (51)

C07D 401/14; C07D 405/14; A01N 43/54

⑧

Prioridad

SI ☒NO ☐

(33) País de Origen

EP

(32) Fecha

08.06.2007

(31) Número de Solicitud

07356077.3

⑨

Comprobante de pago No. En hoja anexa

Fecha Enero 06. 2009

Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página

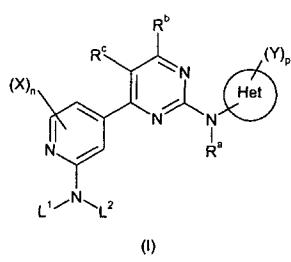
10

ANEXOS

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud
- ☒ Documento que acredite la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica
- ☒ Poderes, si fuere el caso **Ver radicado No.09 009.929 Poder General**
- ☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante
- ☐ Declaraciones
- ☒ Copia de la solicitud internacional. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano. (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)
- ☐ Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen preliminar (IPEA)
- ☐ Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA
- ☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso
- ☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas
- ☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico
- ☒ Arte final 12 x 12
- ☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud
- ☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional.
- ☒ Otros: Extractos

11

FIGURA CARATERISTICA



12

Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE: ALVARO CORREA ORDÓÑEZ

FIRMA: [Signature]

C.C. 79.143.366 de Usaquén T.P. 20.281

5

BAYER CROPSOURCE SA
P2009/000265

RELACIÓN DE RECIBOS A LA SIC.

09-80,484

09-88,668

09-88,629

09-88,794

09-80,447

09-88,856

2009/015

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 80,484

FECHA : OCTUBRE 26 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-001461-00000-0000

Fecha: 2010-01-07 16:34:08 Dep. 2020 DIR NUEVASCR
Tra 11 PATENTELIYI Lve: 378 FASEL NACIONAL
Act. 411 PRESENTACION Folios: 107

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	121953904	26/10/2009	54,221,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01	SOLICITUDES	
83		INVOCACION DE UNA PRIORIDAD EN SI	151,000.00
		TOTAL :	\$ 151,000.00

SON: CIENTO CINCUENTA Y UNO MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 88,668

FECHA : NOVIEMBRE 25 DE 2009



No. 10-001461-00000-0000

Fecha: 2010-01-07 16:34:08 Dep: 2020 DIR NULVASCR
Lra: 11 PATENTEIYII Lve: 378 FASENACIONALI
Act: 411 PRESENTACION Folios: 107

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	53918196	25/11/2009	70,018,300.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	5,000.00
		TOTAL :	\$ 5,000.00

SON: CINCO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

6

2009/016

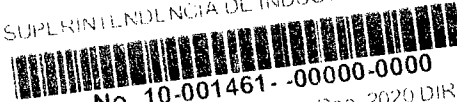
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 88,629

FECHA : NOVIEMBRE 25 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-001461-00000-0000

Fecha 2010-01-07 16:34:08

Dep. 2029 DIR NULVASCOR
Lve 378 FASENACIONALI
Folios 107

Trá. 11 PATENTILYII
Act. 411 PRESENTACION

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	53918196	25/11/2009	70,018,300.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	
		99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS	1,000.00
		TOTAL :	\$ 1,000.00

SON: MIL PESOS

RESPONSABLE : _____

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

2009/11/0

7

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 88,794
FECHA : NOVIEMBRE 25 DE 2009

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	53918196	25/11/2009	70,018,300.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-08	PRORROGA DE TERMINOS	
		31 PRORROGA DE TERMINOS	81,000.00
		TOTAL :	\$ 81,000.00

SON: OCHENTA Y UNO MIL PESOS

RESPONSABLE : 

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

2009/015

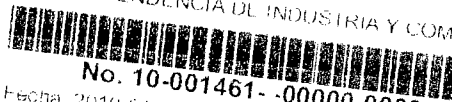
SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

CERTIFICACION DE EXCEDENTE : 09 - 80,447

FECHA : OCTUBRE 26 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-001461-00000-0000

Fecha 2010-01-07 16:34:08 Dep: 2020 DIR NULVASC
tra 11 PATENTE/II Lve 378 FASL NACIONAL
Act 411 PRESENTACION Folios: 107

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	121953904	26/10/2009	84,821,000.00

***** C O N C E P T O *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	99 OTROS SERVICIOS ADMINISTRATIVOS
			TOTAL : \$ 20,000.00

SON: VEINTE MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

ESTA CERTIFICACION DE EXCEDENTE DE PAGO SOLO PODRA SER UTILIZADA
COMO PARTE DE LA CANCELACION DE UNA TARIFA VIGENTE Y NO PODRA SER
SUSTITUIDA POR NINGUN RECIBO.

a

2009/016

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 09 - 88,856
FECHA : NOVIEMBRE 25 DE 2009

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-001461- -00000-0000

Fecha: 2010-01-07 16:34:08 Dep. 2020 DIR NULVASCR
Tra. 11 PATENTE IYII Eje. 378 FASE NACIONAL I
Act. 411 PRESENTACION Folios: 107

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PAGO	Vr. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	53918196	25/11/2009	70,018,300.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-01 SOLICITUDES	85 EXAMEN DE PATENTABILIDAD DE INVEN	452,000.00
TOTAL :			\$ 452,000.00

SON: CUATROCIENTOS CINCUENTA Y DOS MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____



Industria y Comercio

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS

SUPERINTENDENCIA PATENTE DE INVENCION ____ PCT ☒ MODELO DE UTILIDAD ____ DISEÑO INDUSTRIAL ____

(21) N° de solicitud:

(22) Fecha de solicitud:

(51) Clasificación Internacional : C07D 401/14; C07D 405/14; A01N 43/54

(71) Solicitante(s) **BAYER CROPSCIENCE SA**

(72) Inventor(es) BEIER, Christian; COQUERON, Pierre-Yves; DUNKEL, Ralf; GENIX, Pierre; GREUL, Jörg; GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire; HILT Emmanuelle; RINOLFI, Philippe; VOERSTE, Arnd; VORS, Jean-Pierre.

(74) Apoderado: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

(30) Prioridad

(31) **No. Prioridad**

(32)

Fecha

(33) **País**

07356077.3

08.06.2007

EP

(85) Fecha inicio fase nacional: 08-01-2010

(87) Publicación internacional

(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT

Fecha: 11-12-2008

Fecha de presentación de la solicitud: 06-06-2008

N° publicación: WO/2008/148889

No. de solicitud PCT/EP2008/057126

(54) Título: DERIVADOS DE HETEROCICLIL-PIDIMIDINIL-AMINO FUNGICICAS



Industria y Comercio

**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
DIVISION DE NUEVAS CREACIONES**

TARJETA ARCHIVO TEMATICO

SUPERINTENDENCIA PATENTE DE INVENCION _____ PCT X MODELO DE UTILIDAD _____ DISEÑO INDUSTRIAL _____

(21) N° de solicitud: _____ (22) Fecha de solicitud: _____

(51) Clasificación Internacional : C07D 401/14; C07D 405/14; A01N 43/54

(71) Solicitante(s) **BAYER CROPSCIENCE SA**

(72) Inventor(es) BEIER, Christian; COQUERON, Pierre-Yves; DUNKEL, Ralf; GENIX, Pierre; GREUL, Jörg; GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire; HILT Emmanuelle; RINOLFI, Philippe; VOERSTE, Arnd; VORS, Jean-Pierre.

(74) Apoderado: **ALVARO CORREA ORDOÑEZ**

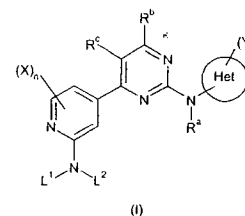
(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	07356077.3	08.06.2007	EP

(85) Fecha límite inicio fase nacional: 08-01-2010

(86) Datos relativos a la presentación de la solíc. PCT
Fecha de presentación de la solicitud: 06-06-2008
No. de solicitud PCT/EP2008/057126

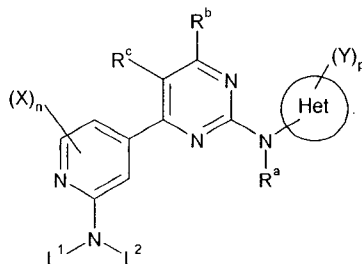
(87) Publicación internacional:

Fecha: 11-12-2008
No. Publicación : WO/2008/148889



(54) Título: **DERIVADOS DE HETEROCICLIL-PIDIMIDINIL-AMINO FUNGICICAS**

(57) Resumen: La presente invención se refiere a derivados de heterocicilil-pirimidil-amino de fórmula (I)



CONTINUA AL RESPALDO ...

(12) INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau



(43) International Publication Date
11 December 2008 (11.12.2008)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2008/148889 A1

(51) International Patent Classification:
C07D 401/14 (2006.01) *A01N 43/54* (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)

Jean-Pierre [FR/FR]; 6 allée Adanson, F-69110 Sainte
Foy lès Lyon (FR).

(21) International Application Number:
PCT/EP2008/057126

(74) Agent: **BALMEFREZOL, Ludovic**; Bayer CropScience
SA, Patents & Licensing Department, 14-20 rue Pierre
Baizet, F-69263 Lyon Cedex 09 (FR).

(22) International Filing Date: 6 June 2008 (06.06.2008)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:
07356077.3 8 June 2007 (08.06.2007) EP

(71) Applicant (for all designated States except US): **BAYER
CROPSCIENCE SA** [FR/FR]; 16 rue Jean-Marie Leclair,
F-69009 Lyon (FR).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): **BEIER, Christian**
[DE/FR]; 4 allée Jean Lacarelle, F-69230 Saint Genis-laval
(FR). **COQUERON, Pierre-Yves** [FR/FR]; 56 cours de la
Liberté, F-69003 Lyon (FR). **DUNKEL, Ralf** [DE/FR]; 11
rue Pierre Dupont, F-69001 Lyon (FR). **GENIX, Pierre**
[FR/FR]; 10 rue Janin, F-69004 Lyon (FR). **GREUL, Jörg**
[DE/DE]; Am Sandberg 30a, 42799 Leichlingen (DE).
GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire [FR/FR];
Le Trêve Collonge, Route d'Albigny, F-69250 Curis au
Mont d'Or (FR). **HILT, Emmanuelle** [FR/FR]; Hameau
de Peyrieu, F-38460 Dizimieu (FR). **RINOLFI, Philippe**
[FR/FR]; Résidence le Coteau, Lieu-dit la Colletière,
F-69380 Châtillon d'Azergues (FR). **VOERSTE, Arnd**
[DE/DE]; Mozartstrasse 3-5, 50674 Köln (DE). **VORS,**

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of national protection available): AE, AG, AL, AM,
AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA,
CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE,
EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID,
IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC,
LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN,
MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH,
PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV,
SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN,
ZA, ZM, ZW.

(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL,
NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

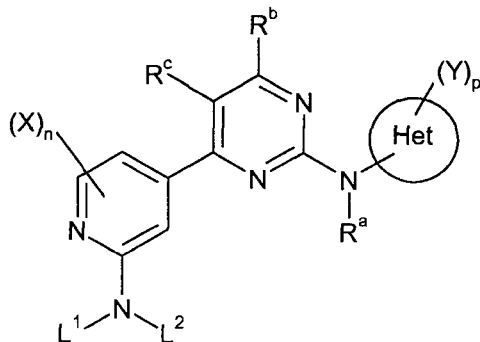
Declarations under Rule 4.17:

- as to applicant's entitlement to apply for and be granted a
patent (Rule 4.17(ii))
- of inventorship (Rule 4.17(iv))

Published:

- with international search report

(54) Title: FUNGICIDE HETEROCYCLYL-PYRIMIDINYL-AMINO DERIVATIVES



(I)

(57) Abstract: The present invention relates to heterocyclyl-pyrimidinyl-amino derivatives of formula (I), heterocyclyl-pyrimidinyl-amino derivatives of formula (I) wherein Het, Y, p, R^a, R^b, R^c, X, n, L¹ and L² represent various substituents, their process of preparation, preparation intermediate compounds, their use as fungicide active agents, particularly in the form of fungicide compositions, and methods for the control of phytopathogenic fungi, notably of plants, using these compounds or compositions.

WO 2008/148889 A1

FUNGICIDE HETEROCYCLYL-PYRIMIDINYL-AMINO DERIVATIVES

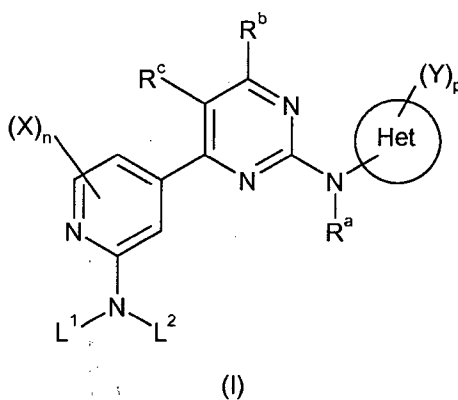
DESCRIPTION

The present invention relates to heterocyclyl-pyrimidinyl-amino derivatives, their process of preparation, preparation intermediate compounds, their use as fungicide active agents, particularly in the form of fungicide compositions, and methods for the control of phytopathogenic fungi, notably of plants, using these compounds or compositions.

In international patent application WO-2005/019211, there are described some compounds having both a biaryl moiety and a heterocyclic moiety that can be used as fungicide agents. Even if some of these compounds may possess structural similarities with the compounds according to the invention, this document does not disclose nor suggest the compounds according to the invention. Apart, 4-[2-(ethylamino)-4-pyridinyl]-N-[5-(1-piperazinyl)-2-pyridinyl]-2-pyrimidinamine has been disclosed in international patent application WO-2004/065378, it may be useful as inhibitor of the cellular proliferation. This compound has been excluded from the scope of the present invention.

It is always of high-interest in agriculture to use novel pesticide compounds in order to avoid or to control the development of resistant strains to the active ingredients. It is also of high-interest to use novel compounds being more active than those already known, with the aim of decreasing the amounts of active compound to be used, whilst at the same time maintaining effectiveness at least equivalent to the already known compounds. We have now found a new family of compounds which possess the above mentioned effects or advantages.

Accordingly, the present invention provides heterocyclyl-pyrimidinyl-amino derivatives of formula (I)



wherein

- Het represents a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different;
- 5 • Y independently represents a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, an oxo group, a cyano group, an amino group, a sulphenyl group, a pentafluoro- λ^6 -sulphenyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a C₁-C₈-alkyl, a tri(C₁-C₈-alkyl)silyl, a substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-cycloalkyl, substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-cycloalkyl, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₂-C₈-alkenyloxy, a C₂-C₈-alkynyloxy, a C₁-C₈-alkylamino, a di-C₁-C₈-alkylamino, a C₁-C₈-alkoxy, a C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyloxy, a C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₈-alkynyloxy, a C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyloxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyl-C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonylamino, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a di-C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a C₁-C₈-alkyloxycarbonyloxy, a C₁-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphinyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylaminosulfamoyl, a di-C₁-C₈-alkylaminosulfamoyl, a (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkenyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkynyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a 2-oxopyrrolidin-1-yl, substituted or non-substituted (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxyalkyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted benzyloxy, substituted or non-substituted benzylsulphenyl, substituted or non-substituted benzylamino, substituted or non-substituted phenoxy,

substituted or non-substituted phenylsulphenyl, or substituted or non-substituted phenylamino ;

- p represents 0, 1, 2, 3, 4, 5 or 6;
- R^a represents a hydrogen atom, a cyano group, a formyl group, a formyloxy group, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkyl, a C₁-C₈-cycloalkyl, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₁-C₈-alkoxyalkyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms;
- R^b and R^c independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano, a C₁-C₈-alkyl, a C₁-C₈-cycloalkyl, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms ;
- X independently represents a C₁-C₁₀-alkyl, a C₁-C₁₀-halogenoalkyl, a halogen atom or a cyano;
- n represents 0, 1, 2 or 3;
- L¹ and L² independently represent a hydrogen atom, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, substituted or non-substituted (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl, tri(C₁-C₈-alkyl)silyl, substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-cycloalkyl, substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-cycloalkyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms a C₂-C₈-alkenyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylamino, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylamino, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkenyloxy, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyloxy, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkenyloxy, substituted or non-substituted C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₃-C₈-alkynyloxy, substituted or non-substituted C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or

- non-substituted C₁-C₈-alkylcarbamoyl, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, substituted or non-substituted N-C₁-C₈-alkyloxycarbamoyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, substituted or non-substituted N-C₁-C₈-alkyl-C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxycarbonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonylamino, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyloxycarbonyloxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylsulphenyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylsulphanyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylsulphanyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylsulphonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylaminosulfamoyl, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylaminosulfamoyl, substituted or non-substituted (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted or non-substituted (C₁-C₆-alkenyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted or non-substituted (C₁-C₆-alkynyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C₁-C₈-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C₁-C₈-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C₁-C₈-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl;
- L¹ and L² can form together a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic, substituted or non-substituted 4-, 5-, 6- or 7-membered, N-including heterocycle comprising up to 4 heteroatoms independently selected in the list consisting of N, O, S ;

as well as salts, N-oxides, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active or geometric isomers thereof; provided that the following compound is excluded: 4-[2-(ethylamino)-4-pyridinyl]-N-[5-(-piperazinyl)-2-pyridinyl]-2-pyrimidinamine.

Any of the compounds according to the present invention may exist in one or more optical or chiral isomeric form depending on the number of asymmetric centres in the compound. The invention thus relates equally to all optical isomers and to any racemic or scalemic mixtures thereof (the term "scalemic" denotes a mixture of enantiomers in different proportions), and to the mixtures of any potential stereoisomers, in any proportion. Diastereoisomers or optical isomers can be separated according to any methods known *per se* by the man ordinary skilled in the art.

Any of the compounds according to the present invention may also exist in one or more geometric isomeric form depending on the number of double bond within the compound. The invention thus equally relates to any geometric isomer and to any possible mixtures thereof, in any proportion. Geometric isomers can be separated according to any method known *per se* by the man ordinary skilled in the art.

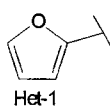
Any compound of formula (I) according to the invention wherein Y represents a hydroxy group, a sulphenyl group or an amino group can exist in a tautomeric form resulting from the shift of the proton of said hydroxy group, sulphenyl group or amino group respectively. Such tautomeric forms are also part of the present invention. Generally, any tautomeric form of a compound of formula (I) according to the invention wherein Y represents a hydroxy group, a sulphenyl group or an amino group, as well as the tautomeric forms of the compounds which can optionally be used as intermediates in the preparation processes according to the invention are also part of the present invention.

According to the invention, the following generic terms are generally used with the following meanings:

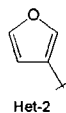
- halogen means fluorine, chlorine, bromine or iodine;
- heteroatom can be nitrogen, oxygen or sulphur;
- unless indicated otherwise, a group or a substituent that is substituted according to the invention can be linear or branched as well as substituted by one or more of the following groups or atoms: a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, a cyano group, an amino group, a sulphenyl group, a pentafluoro- λ^6 -sulphenyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C₁-C₈-alkyl group, a C₁-C₈-alkyl, a tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-alkyl, C₁-C₈-cycloalkyl, tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-cycloalkyl, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₂-C₈-alkenyloxy, a C₂-C₈-alkynyloxy, a C₁-C₈-alkylamino, a di-C₁-C₈-alkylamino, a C₁-C₈-alkoxy, a C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-

alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyloxy, a C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₈-alkynyloxy, a C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyloxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyl-C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonylamino, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a di-C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a C₁-C₈-alkyloxycarbonyloxy, a C₁-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphinyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylaminosulfamoyl, a di-C₁-C₈-alkylaminosulfamoyl, a (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkenyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkynyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a 2-oxopyrrolidin-1-yl, (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, C₁-C₈-alkoxyalkyl, C₁-C₈-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, benzyloxy, benzylsulphenyl, benzylamino, phenoxy, phenylsulphenyl, or phenylamino.

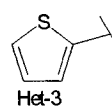
Preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein Het represents a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic heterocycle selected in the list consisting of:



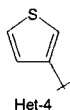
;



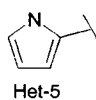
;



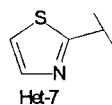
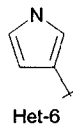
;



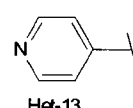
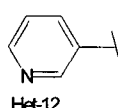
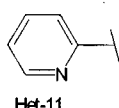
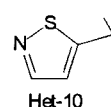
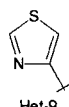
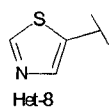
;



;



;



Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein Y represents
 5 a halogen atom, a cyano group, a formylamino group, a carbamoyl group, a substituted or non-substituted (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl, a substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl, a substituted or non-substituted C₁-C₈-cycloalkyl, a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxy, a substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a substituted or non-substituted a C₁-C₈-
 10 halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonylamino. More preferably, Y represents a halogen atom, a cyano group, a formylamino group, a carbamoyl group, a substituted or non-substituted (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl, a substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl, a substituted or non-substituted C₁-C₈-cycloalkyl, a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxy, a
 15 substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a substituted or non-substituted a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein p represents
 20 0, 1 or 2. More preferably, p represents 1.

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^a
 represents a hydrogen atom.

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein R^b and R^c
 25 independently represent a hydrogen atom or a halogen atom. More preferably, R^b and R^c represent a hydrogen atom.

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein n represents 0.

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein L¹ and L² independently represent a hydrogen atom, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, substituted or non-substituted (hydroxyimino)-C₁-C₈-alkyl group, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl, tri(C₁-C₈-alkyl)silyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-cycloalkyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylamino, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylamino, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbamoyl, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, substituted or non-substituted N-C₁-C₈-alkyloxycarbamoyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, substituted or non-substituted N-C₁-C₈-alkyl-C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxycarbonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonylamino, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyloxycarbonyloxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylsulphonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C₁-C₈-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C₁-C₈-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C₁-C₈-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

when L¹ and L² form together a substituted or non-substituted, 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S, L¹ and L² independently represent a substituted or non-substituted 2-oxopyrrolidin-1-yl or a substituted or non-substituted 2-oxo-1,3-oxazolidin-3-yl.

More preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein L^1 and L^2 independently represent a hydrogen atom or a linear or branched, substituted or non-substituted C_1 - C_8 -alkyl, for example a (C_1 - C_8 -alkoxy)- C_1 - C_8 -alkyl.

5

The above mentioned preferences with regard to the substituents of the compounds of formula (I) according to the invention can be combined in various manners, either individually, partially or entirely. These combinations of preferred features thus provide sub-classes of compounds according to the invention. Examples of such sub-classes of preferred compounds according to the

10

invention can combine:

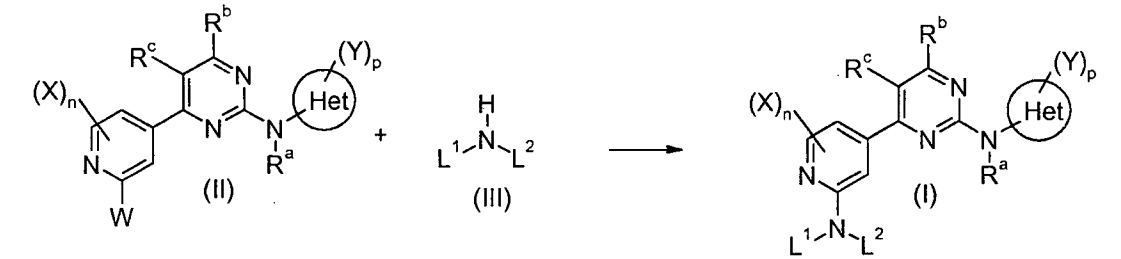
- preferred features of Het with preferred features of one or more of Y, p, R^a , R^b , R^c , X, n, L^1 and L^2 ;
- preferred features of Y with preferred features of one or more of Het, p, R^a , R^b , R^c , X, n, L^1 and L^2 ;
- 15 - preferred features of p with preferred features of one or more of Het, Y, R^a , R^b , R^c , X, n, L^1 and L^2 ;
- preferred features of R^a with preferred features of one or more of Het, Y, p, R^b , R^c , X, n, L^1 and L^2 ;
- preferred features of R^b with preferred features of one or more of Het, Y, p, R^a , R^c , X, n, L^1 and L^2 ;
- 20 - preferred features of R^c with preferred features of one or more of Het, Y, p, R^a , R^b , X, n, L^1 and L^2 ;
- preferred features of X with preferred features of one or more of Het, Y, p, R^a , R^b , R^c , n, L^1 and L^2 ;
- 25 - preferred features of n with preferred features of one or more of Het, Y, p, R^a , R^b , R^c , X, L^1 and L^2 ;
- preferred features of L^1 with preferred features of one or more of Het, Y, p, R^a , R^b , R^c , X, n and L^2 ;
- preferred features of L^2 with preferred features of one or more of Het, Y, p, R^a , R^b , R^c , X, n and L^1 .

30

In these combinations of preferred features of the substituents of the compounds according to the invention, the said preferred features can also be selected among the more preferred features of

each of Het, Y, p, R^a, R^b, R^c, X, n, L¹ and L² so as to form most preferred subclasses of compounds according to the invention.

The present invention also relates to a process for the preparation of compounds of formula (I).
 Thus according to a further aspect of the present invention, there is provided a process P1 for the preparation of a compound of formula (I) as herein-defined, as illustrated by the following reaction scheme:



Process P1

wherein

- W represents a leaving group such as a halogen atom, a C₁-C₆ alkylsulfonate, a C₁-C₆ haloalkylsulfonate ; a substituted or non-substitued phenylsulfonate and
- X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c, L¹, L², Het, being as herein-defined; and that comprises
 - reacting a compound of fomula (II) with an amino derivative of formula (III) in order to yield a compound of formula (I), optionally in the presence of a catalyst, preferably a transition metal catalyst, such as a copper salt, preferably a copper(I) salt for example copper(I) chloride, copper(I) cyanide, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphin)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-

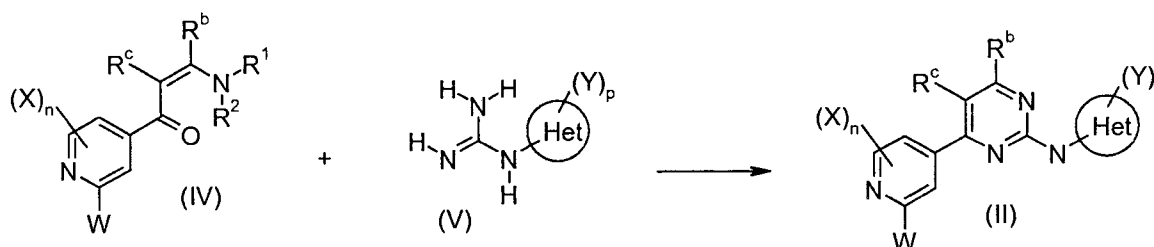
(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyldi-t-butylphosphine, optionally in the presence of a base, such as an inorganic or an organic base; preferably an alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium amide, lithium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU);

Depending on the respective definitions of X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c, Het, amino-pyrimidine derivatives of formula (II) may be prepared by various processes.

Accordingly, there is provided a process A according to the invention for the preparation of a compound of formula (II) wherein

- R^a represents a hydrogen atom;
- X, Y, n, p, R^b, R^c, Het being as herein-defined; and comprising

- a first step according to reaction scheme A-1 :



Scheme A-1

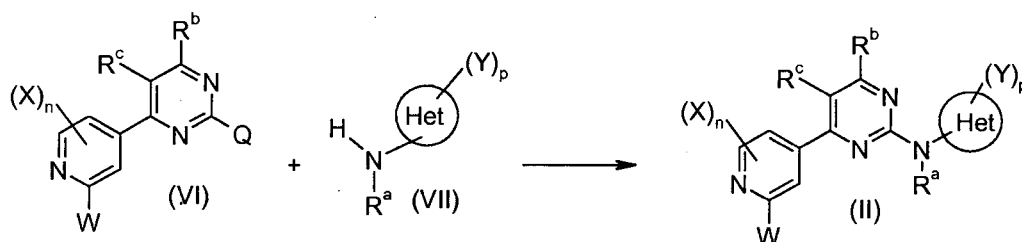
wherein

- W, X, Y, n, p, R^b, R^c, Het, being as herein-defined;
- R¹ and R² are independently a C₁-C₈-alkyl group, R¹ and R² can form together a substituted or non-substituted, 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S;

that comprises the formation of the pyrimidine moiety by condensation, at a temperature of from -50°C to 200°C, of a compound of formula (IV), optionally in the presence of a base such as an inorganic or an organic base, preferably an alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium amide, lithium diisopropylamide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropylethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU); with a guanidine or a guanidine salt derivative of formula (V) to yield a compound of formula (II).

Alternatively, there is provided a process B according to the invention for the preparation of a compound of formula (II) wherein W, X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c, Het being as herein-defined; and comprising

- a first step according to reaction scheme B-1 :



Scheme B-1

wherein

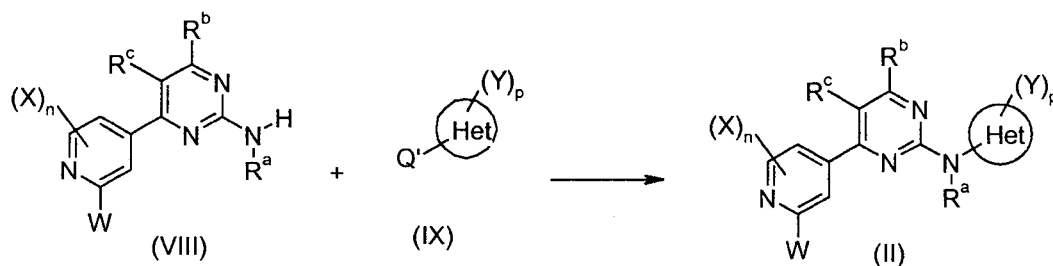
- W, X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c, Het being as herein-defined;
- Q represents a hydrogen atom or a leaving group such as a halogen atom, a C₁-C₆ alkylsulphenyl, a C₁-C₆ haloalkylsulphenyl ; a substituted or non-substituted phenylsulphenyl, a C₁-C₆ alkylsulfonate, a C₁-C₆ haloalkylsulfonate ; a substituted or non-substituted phenylsulfonate and that comprises

reacting a compound of formula (VI) with an amino derivative of formula (VII) in order to yield a compound of formula (II), optionally in the presence of a catalyst, preferably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphino)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-di-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-dicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-dicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-di-t-butylphosphine, optionally in the presence of an organo-metallic reagent such as an organo-lithium reagent, for example *n*-butyl lithium, methyl lithium,

phenyl lithium or an organo-magnesium halide reagent (Grignard reagent) such as isopropyl magnesium halide more preferably such as isopropyl magnesium chloride, optionally in the presence of a base, such as an inorganic or an organic base, preferably an alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium amide, lithium diisopropylamide, 2,2,6,6-tetramethylpiperidylmagnesium chloride, lithium hexamethyldisilazide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate, sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine (TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), optionally in the presence of a metallic salt such as an alkaline earth metal salt, an alkali metal salt, a transition metal salt such as a lithium salt, preferably a lithium halide, more preferably lithium chloride, such as a copper salt, preferably a copper(I) salt such as copper(I) chloride, copper(I) cyanide, in the presence of an oxidative agent such as oxygen, 3,3',5,5'-tetra-tert-butylidiphenylquinone, 2,3-dichloro-5,6-dicyano-1,4-benzoquinone (DDQ), and 2,3,5,6-tetrachloro-1,4-benzoquinone (chloranil).

Alternatively, there is provided a process C according to the invention for the preparation of a compound of formula (II) wherein W, X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c, Het, being as herein-defined; and comprising

- a first step according to reaction scheme C-1 :



Scheme C-1

wherein

- W, X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c, Het, being as herein-defined;

- Q' represents a leaving group such as a halogen atom, a C₁-C₆ alkylsulphenyl, a C₁-C₆ haloalkylsulphenyl ; a substituted or non-substituted phenylsulphenyl a C₁-C₆ alkylsulfonate, a C₁-C₆ haloalkylsulfonate ; a substituted or non-substituted phenylsulfonate, and that comprises
- 5 reacting an amino derivative of formula (VIII) with a compound of formula (IX) in order to yield a compound of formula (II), optionally in the presence of a catalyst, preferably a transition metal catalyst, such as palladium salts or complexes for example palladium (II) chloride, palladium (II) acetate, tetrakis-(triphenylphosphine) palladium(0), bis-(triphenylphosphine) palladium dichloride (II), tris(dibenzylideneacetone) dipalladium(0), bis(dibenzylideneacetone) palladium(0), or 1,1'-
- 10 bis(diphenylphosphino)ferrocene-palladium (II) chloride. As an alternative the palladium complex is directly generated in the reaction mixture by separately adding to the reaction mixture a palladium salt and a complex ligand such as a phosphine, for example triethylphosphine, tri-tert-butylphosphine, tricyclohexylphosphine, 2-(dicyclohexylphosphine)biphenyl, 2-(di-tert-butylphosphino)biphenyl, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl,
- 15 triphenylphosphine, tris-(o-tolyl)phosphine, sodium 3-(diphenylphosphino)benzolsulfonate, tris-2-(methoxyphenyl)phosphine, 2,2'-bis-(diphenylphosphine)-1,1'-binaphthyl, 1,4-bis-(diphenylphosphine)butane, 1,2-bis-(diphenylphosphine)ethane, 1,4-bis-(dicyclohexylphosphine)butane, 1,2-bis-(dicyclohexylphosphine)ethane, 2-(dicyclohexylphosphine)-2'-(N,N-dimethylamino)-biphenyl, bis(diphenylphosphino)ferrocene, tris-(2,4-tert-butylphenyl)-
- 20 phosphite, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-di-tert-butylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-dicyclohexylphosphine, (R)-(-)-1-[(S)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-dicyclohexylphosphine, (S)-(+)-1-[(R)-2-(diphenylphosphino)ferrocenyl]ethyl-di-tert-butylphosphine, optionally in the presence of an organo-metallic reagent such as an organo-lithium reagent for example *n*-butyl lithium, methyl lithium, phenyl lithium or an organo-magnesium halide reagent (Grignard reagent) such as isopropyl
- 25 magnesium halide for example isopropyl magnesium chloride, optionally in the presence of a base, such as an inorganic or an organic base; preferably an alkaline earth metal or alkali metal hydrides, hydroxides, amides, alcoholates, acetates, carbonates or hydrogen carbonates, such as sodium hydride, sodium amide, lithium diisopropylamide, 2,2,6,6-tetramethylpiperidylmagnesium chloride, lithium hexamethyldisilazide, sodium methanolate, sodium ethanolate, potassium tert-butanolate,
- 30 sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate, sodium hydroxide, potassium hydroxide, sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, cesium carbonate or ammonium carbonate; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine

(TEA), tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethyl-benzylamine, N,N-diisopropyl-ethylamine (DIPEA), pyridine, N-methylpiperidine, N-methylmorpholine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU), optionally in the presence of a metallic salt such as an alkaline earth metal salt, an alkali metal salt, a transition metal salt such as a lithium salt, preferably a lithium halide, more preferably lithium chloride, such as a copper salt, preferably a copper(I) salt such as copper(I) chloride, copper(I) cyanide, in the presence of an oxidative agent such as oxygen, 3,3',5,5'-tetra-tert-butylidiphenylquinone, 2,3-dichloro-5,6-dicyano-1,4-benzoquinone (DDQ), and 2,3,5,6-tetrachloro-1,4-benzoquinone (chloranil).

Suitable solvents for carrying out processes P1, A, B and C according to the invention are in each case all customary inert organic solvents. Preference is given to using optionally halogenated aliphatic, alicyclic or aromatic hydrocarbons, such as petroleum ether, hexane, heptane, cyclohexane, methylcyclohexane, benzene, toluene, xylene or decalin; chlorobenzene, dichlorobenzene, dichloromethane, chloroform, carbon tetrachloride, dichloroethane or trichloroethane; ethers, such as diethyl ether, diisopropyl ether, methyl t-butyl ether, methyl t-amyl ether, dioxane, tetrahydrofuran, 1,2-dimethoxyethane, 1,2-diethoxyethane or anisole; nitriles, such as acetonitrile, propionitrile, n- or i-butyronitrile or benzonitrile; amides, such as N,N-dimethylformamide, N,N-dimethylacetamide, N-methylformanilide, N-methylpyrrolidone or hexamethylphosphoric triamide; esters, such as methyl acetate or ethyl acetate, sulphoxides, such as dimethyl sulphoxide, or sulphones, such as sulfolane.

When carrying out processes P1, A, B and C according to the invention, the reaction temperatures can independently be varied within a relatively wide range. Generally, processes according to the invention are carried out at temperatures between -80°C and 250°C.

Processes P1, A, B and C according to the invention are generally independently carried out under atmospheric pressure. However, in each case, it is also possible to operate under elevated or reduced pressure.

Work-up is carried out by customary methods. Generally, the reaction mixture is treated with water and the organic phase is separated off and, after drying, concentrated under reduced pressure. If

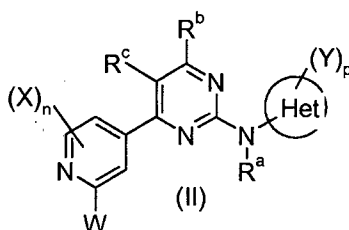
appropriate, the remaining residue can be freed by customary methods, such as chromatography or recrystallization, from any impurities that may still be present.

Compounds according to the invention can be prepared according to the above described process.

5 It will nevertheless be understood that, on the basis of his general knowledge and of available publications, the skilled worker will be able to adapt these processes according to the specifics of each of the compounds according to the invention that is desired to be synthesized.

10 Still in a further aspect, the present invention relates to compounds of formula (II) useful as intermediate compounds or materials for the process of preparation according to the invention.

The present invention thus provides compounds of formula (II)



wherein

- W represents a leaving group such as a halogen atom, a C₁-C₆ alkylsulfonate, a C₁-C₆ haloalkylsulfonate ; a substituted or non-substituted phenylsulfonate and
- X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c, Het, being as herein-defined.

20 In a further aspect, the present invention also relates to a fungicide composition comprising an effective and non-phytotoxic amount of an active compound of formula (I).

The expression "effective and non-phytotoxic amount" means an amount of composition according to the invention which is sufficient to control or destroy the fungi present or liable to appear on the crops, and which does not entail any appreciable symptom of phytotoxicity for the said crops. Such an amount can vary within a wide range depending on the fungus to be controlled, the type of crop, the climatic conditions and the compounds included in the fungicide composition according to the invention. This amount can be determined by systematic field trials, which are within the capabilities of a person skilled in the art.

Thus, according to the invention, there is provided a fungicide composition comprising, as an active ingredient, an effective amount of a compound of formula (I) as herein defined and an agriculturally acceptable support, carrier or filler.

5 According to the invention, the term "support" denotes a natural or synthetic, organic or inorganic compound with which the active compound of formula (I) is combined or associated to make it easier to apply, notably to the parts of the plant. This support is thus generally inert and should be agriculturally acceptable. The support may be a solid or a liquid. Examples of suitable supports include clays, natural or synthetic silicates, silica, resins, waxes, solid fertilisers, water, alcohols, in particular butanol, organic solvents, mineral and plant oils and derivatives thereof. Mixtures of such supports may also be used.

The composition according to the invention may also comprise additional components. In particular, the composition may further comprise a surfactant. The surfactant can be an emulsifier, a dispersing agent or a wetting agent of ionic or non-ionic type or a mixture of such surfactants.

15 Mention may be made, for example, of polyacrylic acid salts, lignosulphonic acid salts, phenolsulphonic or naphthalenesulphonic acid salts, polycondensates of ethylene oxide with fatty alcohols or with fatty acids or with fatty amines, substituted phenols (in particular alkylphenols or arylphenols), salts of sulphosuccinic acid esters, taurine derivatives (in particular alkyl taurates), phosphoric esters of polyoxyethylated alcohols or phenols, fatty acid esters of polyols, and

20 derivatives of the above compounds containing sulphate, sulphonate and phosphate functions. The presence of at least one surfactant is generally essential when the active compound and/or the inert support are water-insoluble and when the vector agent for the application is water. Preferably, surfactant content may be comprised from 5% to 40% by weight of the composition.

25 Optionally, additional components may also be included, e.g. protective colloids, adhesives, thickeners, thixotropic agents, penetration agents, stabilisers, sequestering agents. More generally, the active compounds can be combined with any solid or liquid additive, which complies with the usual formulation techniques.

30 In general, the composition according to the invention may contain from 0.05 to 99% by weight of active compound, preferably 10 to 70% by weight.

Compositions according to the invention can be used in various forms such as aerosol dispenser, capsule suspension, cold fogging concentrate, dustable powder, emulsifiable concentrate, emulsion oil in water, emulsion water in oil, encapsulated granule, fine granule, flowable concentrate for seed treatment, gas (under pressure), gas generating product, granule, hot fogging concentrate, 5 macrogranule, microgranule, oil dispersible powder, oil miscible flowable concentrate, oil miscible liquid, paste, plant rodlet, powder for dry seed treatment, seed coated with a pesticide, soluble concentrate, soluble powder, solution for seed treatment, suspension concentrate (flowable concentrate), ultra low volume (ULV) liquid, ultra low volume (ULV) suspension, water dispersible granules or tablets, water dispersible powder for slurry treatment, water soluble granules or tablets, 10 water soluble powder for seed treatment and wettable powder. These compositions include not only compositions which are ready to be applied to the plant or seed to be treated by means of a suitable device, such as a spraying or dusting device, but also concentrated commercial compositions which must be diluted before application to the crop.

The compounds according to the invention can also be mixed with one or more insecticide, 15 fungicide, bactericide, attractant, acaricide or pheromone active substance or other compounds with biological activity. The mixtures thus obtained have normally a broadened spectrum of activity. The mixtures with other fungicide compounds are particularly advantageous.

Examples of suitable fungicide mixing partners may be selected in the following lists:

20 B1) a compound capable to inhibit the nucleic acid synthesis like benalaxyl, benalaxyl-M, bupirimate, chiralaxyl, clozylacon, dimethirimol, ethirimol, furalaxyl, hymexazol, metalaxyl-M, ofurace, oxadixyl, oxolinic acid ;

B2) a compound capable to inhibit the mitosis and cell division like benomyl, carbendazim, diethofencarb, fuberidazole, pencycuron, thiabendazole thiophanate-methyl, zoxamide;

25 B3) a compound capable to inhibit the respiration for example

as CI-respiration inhibitor like diflumetorim;

as CII-respiration inhibitor like boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, furametpyr, mepronil, oxycarboxine, penthiopyrad, thifluzamide;

as CIII-respiration inhibitor like azoxystrobin, cyazofamid, dimoxystrobin, enestrobin, 30 famoxadone, fenamidone, fluoxastrobin, kresoxim-methyl, metominostrobin, orysastrobin, pyraclostrobin, picoxystrobin, trifloxystrobin;

B4) a compound capable of to act as an uncoupler like dinocap, fluazinam;

B5) a compound capable to inhibit ATP production like fentin acetate, fentin chloride, fentin hydroxide, silthiofam;

B6) a compound capable to inhibit AA and protein biosynthesis like andoprim, blasticidin-S, cyprodinil, kasugamycin, kasugamycin hydrochloride hydrate, mepaniprim, pyrimethanil;

5 B7) a compound capable to inhibit the signal transduction like fenpiclonil, fludioxonil, quinoxifen;

B8) a compound capable to inhibit lipid and membrane synthesis like chlozolate, iprodione, procymidone, vinclozolin, pyrazophos, edifenphos, iprobenfos (IBP), isoprothiolane, tolclofos-methyl, biphenyl, iodocarb, propamocarb, propamocarb-hydrochloride;

10 B9) a compound capable to inhibit ergosterol biosynthesis like fenhexamid, azaconazole, bitertanol, bromuconazole, cyproconazole, diclobutrazole, difenoconazole, diniconazole, diniconazole-M, epoxiconazole, etaconazole, fenbuconazole, fluquinconazole, flusilazole, flutriafol, furconazole, furconazole-cis, hexaconazole, imibenconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, paclobutrazol, penconazole, propiconazole, prothioconazole, simeconazole, 15 tebuconazole, tetraconazole, triadimefon, triadimenol, triticonazole, uniconazole, voriconazole, imazalil, imazalil sulfate, oxpoconazole, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pyrifenoxy, triforine, pefurazoate, prochloraz, triflumizole, viniconazole, aldimorph, dodemorph, dodemorph acetate, fenpropimorph, tridemorph, fenpropidin, spiroxamine, naftifine, pyributicarb, terbinafine;

20 B10) a compound capable to inhibit cell wall synthesis like benthiavalicarb, bialaphos, dimethomorph, flumorph, iprovalicarb, polyoxins, polyoxorim, validamycin A;

B11) a compound capable to inhibit melanine biosynthesis like carpropamid, diclocymet, fenoxanil, phthalide, pyroquilon, tricyclazole;

B12) a compound capable to induce a host defence like acibenzolar-S-methyl, probenazole, tiadinil;

25 B13) a compound capable to have a multisite action like captan, chlorothalonil, copper preparations such as copper hydroxide, copper naphthenate, copper oxychloride, copper sulphate, copper oxide, oxine-copper and Bordeaux mixture, dichlofluanid, dithianon, dodine, dodine free base, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatine, guazatine acetate, iminoctadine, iminoctadine albesilate, iminoctadine triacetate, mancozeb, maneb, metiram, metiram 30 zinc, propineb, sulphur and sulphur preparations including calcium polysulphide, thiram, tolylfluanid, zineb, ziram;

B14) a compound selected in the list consisting of: amibromdole, benthiazole, bethoxazin, capsimycin, carvone, chinomethionat, chloropicrin, cufraneb, cyflufenamid, cymoxanil, dazomet,

debacarb, diclomezine, dichlorophen, dicloran, difenzoquat, difenzoquat methylsulphate, diphenylamine, ethaboxam, ferimzone, flumetover, flusulfamide, fosetyl-aluminium, fosetyl-calcium, fosetyl-sodium, fluopicolide, fluoroimide, hexachlorobenzene, 8-hydroxyquinoline sulfate, irumamycin, methasulphocarb, metrafenone, methyl isothiocyanate, mildiomycin, natamycin, nickel
 5 dimethyldithiocarbamate, nitrothal-isopropyl, octhiline, oxamocarb, oxyfenthion, pentachlorophenol and salts, 2-phenylphenol and salts, phosphorous acid and its salts, piperalin, propanosine-sodium, proquinazid, pyrrolnitrine, quintozone, tecloftalam, tecnazene, triazoxide, trichlamide, zarilamid and 2,3,5,6-tetrachloro-4-(methylsulfonyl)-pyridine, N-(4-Chloro-2-nitrophenyl)-N-ethyl-4-methyl-
 10 benzenesulfonamide, 2-amino-4-methyl-N-phenyl-5-thiazolecarboxamide, 2-chloro-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridinecarboxamide, 3-[5-(4-chlorophenyl)-2,3-dimethylisoxazolidin-3-yl]pyridine, cis-1-(4-chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazole-1-yl)-cycloheptanol, methyl 1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazole-5-carboxylate, 3,4,5-trichloro-2,6-pyridinedicarbonitrile, Methyl 2-[[[cyclopropyl[(4-methoxyphenyl)imino]methyl]thio]methyl]-.alpha.-(methoxymethylene)-
 15 benzeneacetate, 4-Chloro-alpha-propynyloxy-N-[2-[3-methoxy-4-(2-propynyloxy)phenyl]ethyl]-benzeneacetamide, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-chlorophenyl)-2-propynyl]oxy]-3-methoxyphenyl]ethyl]-3-methyl-2-[(methylsulfonyl)amino]-butanamide, 5-chloro-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine, 5-chloro-6-(2,4,6-trifluorophenyl)-N-[(1R)-1,2,2-trimethylpropyl][1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine, 5-chloro-N-[(1R)-1,2-dimethylpropyl]-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine, N-[1-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)ethyl]-2,4-dichloronicotinamide, N-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)methyl-2,4-dichloronicotinamide,
 20 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-benzopyranon-4-one, N-[(Z)-[(cyclopropylmethoxy)imino][6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methyl]-2-phenylacetamide, N-(3-ethyl-3,5,5-trimethylcyclohexyl)-3-formylamino-2-hydroxy-benzamide, 2-[[[1-[3(1Fluoro-2-phenylethyl)oxy]phenyl]ethylidene]amino]oxy]methyl]-alpha-(methoxyimino)-N-methyl-alphaE-
 25 benzeneacetamide, N-{2-[3-chloro-5-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl]ethyl}-2-(trifluoromethyl)benzamide, N-(3',4'-dichloro-5-fluorobiphenyl-2-yl)-3-(difluoromethyl)-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, 2-(2-{[6-(3-chloro-2-methylphenoxy)-5-fluoropyrimidin-4-yl]oxy}phenyl)-2-(methoxyimino)-N-methylacetamide, 1-[(4-methoxyphenoxy)methyl]-2,2-dimethylpropyl-1H-imidazole-1-carboxylic acid, O-[1-[(4-methoxyphenoxy)methyl]-2,2-dimethylpropyl]-1H-imidazole-1-carbothioic acid.
 30

The composition according to the invention comprising a mixture of a compound of formula (I) with a bactericide compound may also be particularly advantageous. Examples of suitable bactericide

mixing partners may be selected in the following list: bronopol, dichlorophen, nitrapyrin, nickel dimethyldithiocarbamate, kasugamycin, othilone, furancarboxylic acid, oxytetracycline, probenazole, streptomycin, tecloftalam, copper sulphate and other copper preparations.

5 The compounds of formula (I) and the fungicide composition according to the invention can be used to curatively or preventively control the phytopathogenic fungi of plants or crops.

Thus, according to a further aspect of the invention, there is provided a method for curatively or preventively controlling the phytopathogenic fungi of plants or crops characterised in that a compound of formula (I) or a fungicide composition according to the invention is applied to the seed,
10 the plant or to the fruit of the plant or to the soil wherein the plant is growing or wherein it is desired to grow.

The method of treatment according to the invention may also be useful to treat propagation material such as tubers or rhizomes, but also seeds, seedlings or seedlings pricking out and plants or plants pricking out. This method of treatment can also be useful to treat roots. The method of treatment
15 according to the invention can also be useful to treat the overground parts of the plant such as trunks, stems or stalks, leaves, flowers and fruit of the concerned plant.

Among the plants that can be protected by the method according to the invention, mention may be made of cotton ; flax ; vine ; fruit or vegetable crops such as *Rosaceae* sp. (for instance pip fruit
20 such as apples and pears, but also stone fruit such as apricots, almonds and peaches), *Ribesioideae* sp., *Juglandaceae* sp., *Betulaceae* sp., *Anacardiaceae* sp., *Fagaceae* sp., *Moraceae* sp., *Oleaceae* sp., *Actinidaceae* sp., *Lauraceae* sp., *Musaceae* sp. (for instance banana trees and plantins), *Rubiaceae* sp., *Theaceae* sp., *Sterculiaceae* sp., *Rutaceae* sp. (for instance lemons, oranges and grapefruit) ; *Solanaceae* sp. (for instance tomatoes), *Liliaceae* sp., *Asteraceae* sp. (for instance
25 lettuces), *Umbelliferae* sp., *Cruciferae* sp., *Chenopodiaceae* sp., *Cucurbitaceae* sp., *Papilionaceae* sp. (for instance peas), *Rosaceae* sp. (for instance strawberries) ; major crops such as *Graminae* sp. (for instance maize, lawn or cereals such as wheat, rice, barley and triticale), *Asteraceae* sp. (for instance sunflower), *Cruciferae* sp. (for instance colza), *Fabaceae* sp. (for instance peanuts), *Papilionaceae* sp. (for instance soybean), *Solanaceae* sp. (for instance potatoes), *Chenopodiaceae*
30 sp. (for instance beetroots) ; horticultural and forest crops ; as well as genetically modified homologues of these crops.

Among the diseases of plants or crops that can be controlled by the method according to the invention, mention may be made of :

- Powdery mildew diseases such as :
Blumeria diseases, caused for example by *Blumeria graminis* ;
5 Podosphaera diseases, caused for example by *Podosphaera leucotricha* ;
Sphaerotheca diseases, caused for example by *Sphaerotheca fuliginea* ;
Uncinula diseases, caused for example by *Uncinula necator* ;
- Rust diseases such as :
Gymnosporangium diseases, caused for example by *Gymnosporangium sabinae* ;
10 Hemileia diseases, caused for example by *Hemileia vastatrix* ;
Phakopsora diseases, caused for example by *Phakopsora pachyrhizi* or *Phakopsora meibomia* ;
Puccinia diseases, caused for example by *Puccinia recondita* ;
Uromyces diseases, caused for example by *Uromyces appendiculatus* ;
- 15 • Oomycete diseases such as :
Bremia diseases, caused for example by *Bremia lactucae* ;
Peronospora diseases, caused for example by *Peronospora pisi* or *P. brassicae* ;
Phytophthora diseases, caused for example by *Phytophthora infestans* ;
Plasmopara diseases, caused for example by *Plasmopara viticola* ;
20 Pseudoperonospora diseases, caused for example by *Pseudoperonospora humuli* or *Pseudoperonospora cubensis* ;
- Pythium diseases, caused for example by *Pythium ultimum* ;
- Leafspot, leaf blotch and leaf blight diseases such as :
Alternaria diseases, caused for example by *Alternaria solani* ;
25 Cercospora diseases, caused for example by *Cercospora beticola* ;
Cladosporium diseases, caused for example by *Cladosporium cucumerinum* ;
Cochliobolus diseases, caused for example by *Cochliobolus sativus* ;
Colletotrichum diseases, caused for example by *Colletotrichum lindemuthianum* ;
Cycloconium diseases, caused for example by *Cycloconium oleaginum* ;
30 Diaporthe diseases, caused for example by *Diaporthe citri* ;
Elsinoe diseases, caused for example by *Elsinoe fawcettii* ;
Gloeosporium diseases, caused for example by *Gloeosporium laeticolor* ;
Glomerella diseases, caused for example by *Glomerella cingulata* ;

Guignardia diseases, caused for example by *Guignardia bidwelli* ;
 Leptosphaeria diseases, caused for example by *Leptosphaeria maculans* ; *Leptosphaeria*
nodorum ;

Magnaporthe diseases, caused for example by *Magnaporthe grisea* ;

5 Mycosphaerella diseases, caused for example by *Mycosphaerella graminicola* ;
Mycosphaerella arachidicola ; *Mycosphaerella fijiensis* ;

Phaeosphaeria diseases, caused for example by *Phaeosphaeria nodorum* ;

Pyrenophora diseases, caused for example by *Pyrenophora teres* ;

Ramularia diseases, caused for example by *Ramularia collo-cygni* ;

10 Rhynchosporium diseases, caused for example by *Rhynchosporium secalis* ;

Septoria diseases, caused for example by *Septoria apii* or *Septoria lycopersici* ;

Typhula diseases, caused for example by *Typhula incarnata* ;

Venturia diseases, caused for example by *Venturia inaequalis* ;

- Root and stem diseases such as :

15 Corticium diseases, caused for example by *Corticium graminearum* ;

Fusarium diseases, caused for example by *Fusarium oxysporum* ;

Gaeumannomyces diseases, caused for example by *Gaeumannomyces graminis* ;

Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani* ;

Tapesia diseases, caused for example by *Tapesia acuformis* ;

20 Thielaviopsis diseases, caused for example by *Thielaviopsis basicola* ;

- Ear and panicle diseases such as :

Alternaria diseases, caused for example by *Alternaria spp.* ;

Aspergillus diseases, caused for example by *Aspergillus flavus* ;

Cladosporium diseases, caused for example by *Cladosporium spp.* ;

25 Claviceps diseases, caused for example by *Claviceps purpurea* ;

Fusarium diseases, caused for example by *Fusarium culmorum* ;

Gibberella diseases, caused for example by *Gibberella zeae* ;

Monographella diseases, caused for example by *Monographella nivalis* ;

- Smut and bunt diseases such as :

30 Sphacelotheca diseases, caused for example by *Sphacelotheca reiliana* ;

Tilletia diseases, caused for example by *Tilletia caries* ;

Urocystis diseases, caused for example by *Urocystis occulta* ;

Ustilago diseases, caused for example by *Ustilago nuda* ;

- Fruit rot and mould diseases such as :
 - Aspergillus diseases, caused for example by *Aspergillus flavus* ;
 - Botrytis diseases, caused for example by *Botrytis cinerea* ;
 - Penicillium diseases, caused for example by *Penicillium expansum* ;
 - 5 Sclerotinia diseases, caused for example by *Sclerotinia sclerotiorum* ;
 - Verticillium diseases, caused for example by *Verticillium alboatrum* ;
- Seed and soilborne decay, mould, wilt, rot and damping-off diseases such as :
 - Fusarium diseases, caused for example by *Fusarium culmorum* ;
 - Phytophthora diseases, caused for example by *Phytophthora cactorum* ;
 - 10 Pythium diseases, caused for example by *Pythium ultimum* ;
 - Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani* ;
 - Sclerotium diseases, caused for example by *Sclerotium rolfsii* ;
 - Microdochium diseases, caused for example by *Microdochium nivale* ;
- Canker, broom and dieback diseases such as :
 - 15 Nectria diseases, caused for example by *Nectria galligena* ;
- Blight diseases such as :
 - Monilinia diseases, caused for example by *Monilinia laxa* ;
 - Leaf blister or leaf curl diseases such as :
 - Taphrina diseases, caused for example by *Taphrina deformans* ;
 - 20 Decline diseases of wooden plants such as :
 - Esca diseases, caused for example by *Phaemoniella clamydospora* ;
 - Eutypa dyebark, caused for example by *Eutypa lata* ;
 - Dutch elm disease, caused for example by *Ceratocystis ulmi* ;
- Diseases of flowers and Seeds such as :
 - 25 Botrytis diseases, caused for example by *Botrytis cinerea* ;
- Diseases of tubers such as :
 - Rhizoctonia diseases, caused for example by *Rhizoctonia solani*.

30 The fungicide composition according to the invention may also be used against fungal diseases liable to grow on or inside timber. The term "timber" means all types of species of wood, and all types of working of this wood intended for construction, for example solid wood, high-density wood, laminated wood, and plywood. The method for treating timber according to the invention mainly consists in contacting one or more compounds according to the invention, or a composition

according to the invention ; this includes for example direct application, spraying, dipping, injection or any other suitable means.

5 The dose of active compound usually applied in the method of treatment according to the invention is generally and advantageously from 10 to 800 g/ha, preferably from 50 to 300 g/ha for applications in foliar treatment. The dose of active substance applied is generally and advantageously from 2 to 200 g per 100 kg of seed, preferably from 3 to 150 g per 100 kg of seed in the case of seed treatment.

10 It is clearly understood that the doses indicated herein are given as illustrative examples of the method according to the invention. A person skilled in the art will know how to adapt the application doses, notably according to the nature of the plant or crop to be treated.

15 The fungicide composition according to the invention may also be used in the treatment of genetically modified organisms with the compounds according to the invention or the agrochemical compositions according to the invention. Genetically modified plants are plants into genome of which a heterologous gene encoding a protein of interest has been stably integrated. The expression "heterologous gene encoding a protein of interest" essentially means genes which give the transformed plant new agronomic properties, or genes for improving the agronomic quality of the modified plant.

20 The compounds or mixtures according to the invention may also be used for the preparation of composition useful to curatively or preventively treat human or animal fungal diseases such as, for example, mycoses, dermatoses, trichophyton diseases and candidiases or diseases caused by *Aspergillus spp.*, for example *Aspergillus fumigatus*.

25 The various aspects of the invention will now be illustrated with reference to the following table of compound examples A and the following preparation or efficacy examples.

The following table illustrates in a non-limiting manner examples of compounds according to the invention.

30 In the following table, M+H (or M-H) means the molecular ion peak, plus or minus 1 a.m.u. (atomic mass unit) respectively, as observed in mass spectroscopy and M (Apcl+) means the molecular ion peak as it was found via positive atmospheric pressure chemical ionisation in mass spectroscopy.

In the following table, the logP values were determined in accordance with EEC Directive 79/831 Annex V.A8 by HPLC (High Performance Liquid Chromatography) on a reversed-phase column (C 18), using the method described below :

5 Temperature: 40°C ; Mobile phases : 0.1% aqueous formic acid and acetonitrile ; linear gradient from 10% acetonitrile to 90% acetonitrile.

Calibration was carried out using unbranched alkan-2-ones (comprising 3 to 16 carbon atoms) with known logP values (determination of the logP values by the retention times using linear interpolation between two successive alkanones).

10 The lambda max values were determined in the maxima of the chromatographic signals using the UV spectra from 190nm to 400nm.

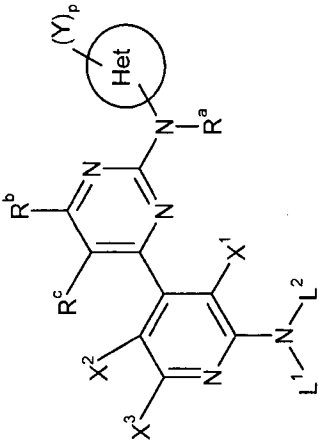
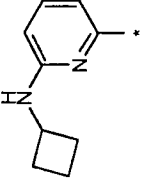
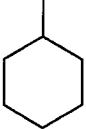
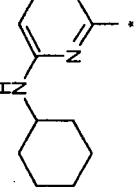
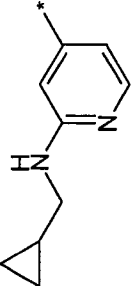
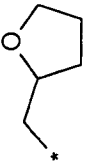
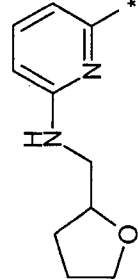
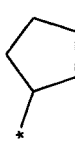
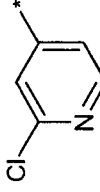
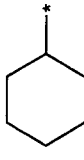
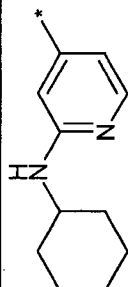
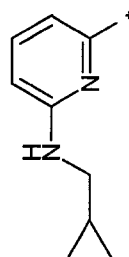
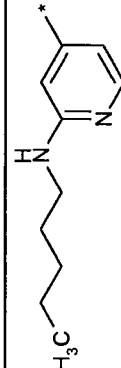
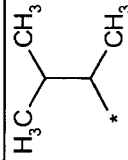
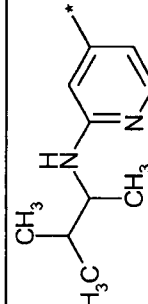
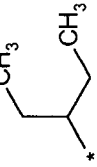
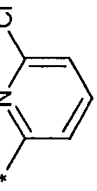
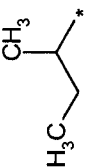
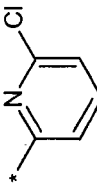
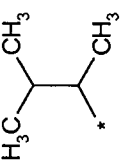
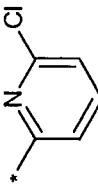
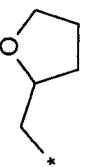
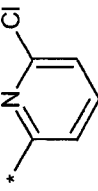
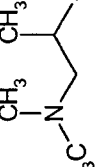
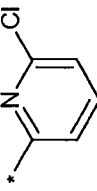
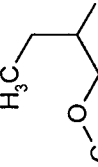
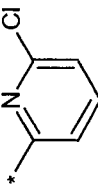


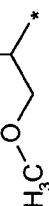
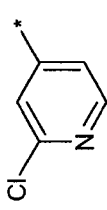
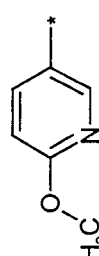
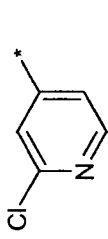
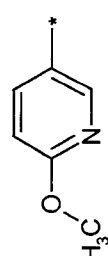
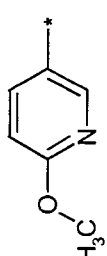
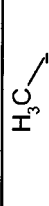
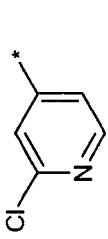
Table A

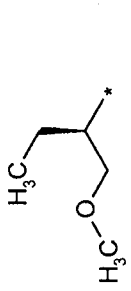
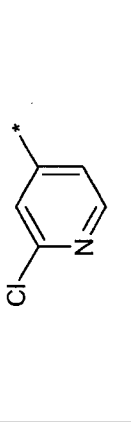
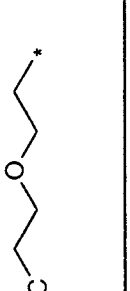
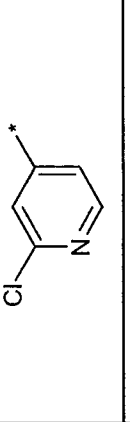
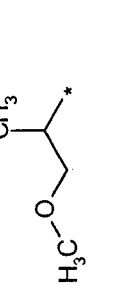
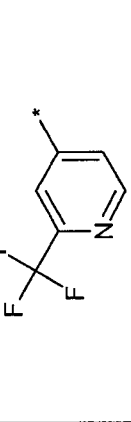
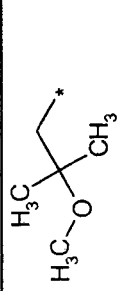
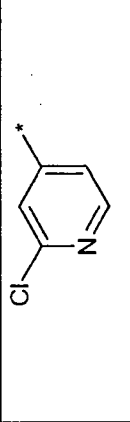
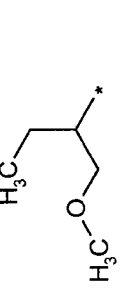
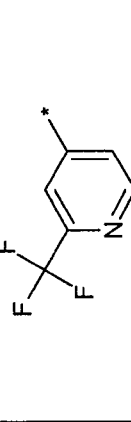
Example Number	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c		X ¹	X ²	X ³	Measured Mw	log p _{HCOOH}
1	H	H ₃ C—*	methyl	H	H		H	H	H		1.24
2	H		H	H	H		H	H	H		1.35

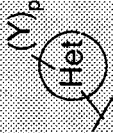
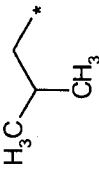
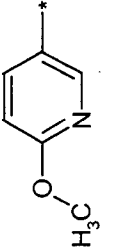
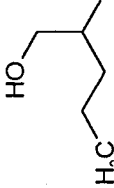
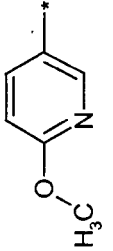
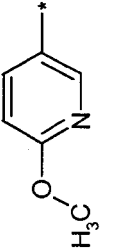
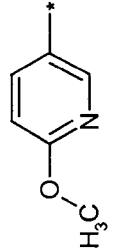
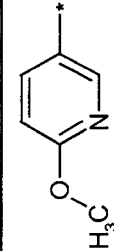
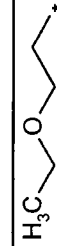
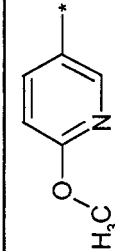
Example Number	R ³	L	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p	X ¹	X ²	X ³	Measured Mw	log p HCOOH
3	H		H	H	H		H	H	H	194,5	1.12
4	H		H	H	H		H	H	H	444	1.70
5	H		H	H	H		H	H	H	388	0.97
6	H		H	H	H		H	H	H	424	0.83
7	H		H	H	H		H	H	H	225	0.86

Example Number	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c		X ¹	X ²	X ³	Measured MW	log p _{HCOOH}
14	H		H	H	H		H	H	H	367	1.58
15	H		H	H	H		H	H	H	444	1.52
16	H		H	H	H		H	H	H	388	0.96
17	H		H	H	H		H	H	H	418	1.57
18	H		H	H	H		H	H	H	420	1.34

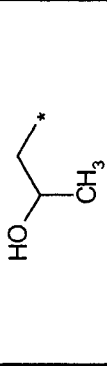
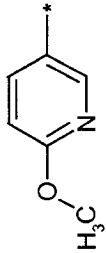
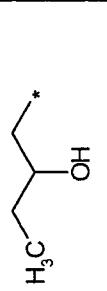
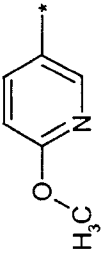
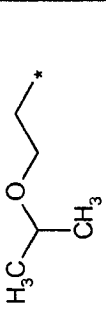
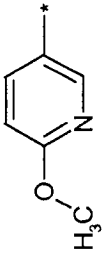
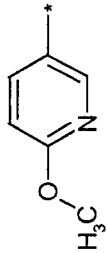
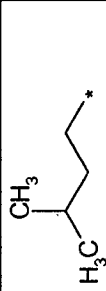
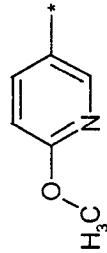
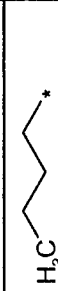
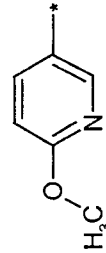
Example Number	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^b (Y) ^b	X ¹	X ²	X ³	Measured Mw	log p HCOOH
24	H		H	H	H		H	H	H	369	2.09
25	H		H	H	H		H	H	H	355	2.00
26	H		H	H	H		H	H	H	369	2.15
27	H		H	H	H		H	H	H	383	1.64
28	H		H	H	H		H	H	H	384	1.42
29	H		H	H	H		H	H	H	385	1.85

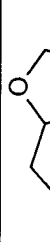
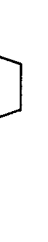
Example Number	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c		X ¹	X ²	X ³	Measured Mw	log p HCOOH
35	H		H	H	H		H	H	H	371	1.34
36	H		H	H	H		H	H	H	351,2	1.10
37*	H		H	H	H		H	H	H	385	1.49
38	H		H	H	H		H	H	H	367,2	1.29
39	H		H	H	H		H	H	H	351	1.48
40	H		H	H	H		H	H	H		

Example Number	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p	X ¹	X ²	X ³	Measured MW	log P _{HCOOH}
41	H		H	H	H		H	H	H		
42	H		H	H	H		H	H	H	385	
43	H		H	H	H		H	H	H	405	
44	H		H	H	H		H	H	H	385	
45	H		H	H	H		H	H	H	419	

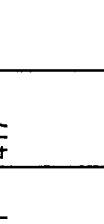
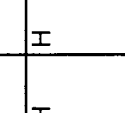
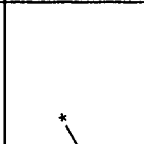
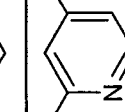
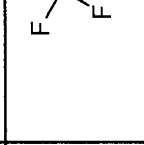
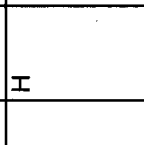
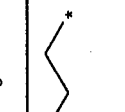
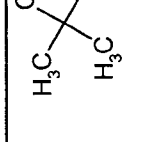
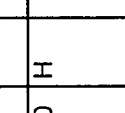
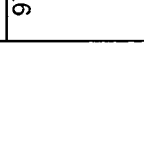
Example Number	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c		X	X ²	X ³	Measured Mw	log p HCOOH
46	H		H	H	H		H	H	H	351	1.42
47	H		H	H	H		H	H	H	381	
48	H		H	H	H		H	H	H	434	
49	H		H	H	H		H	H	H	420	
50	H		H	H	H		H	H	H	367	
51	H		H	H	H		H	H	H	367	

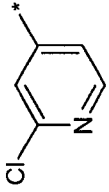
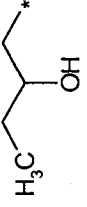
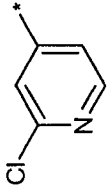
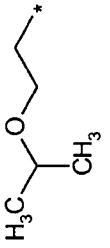
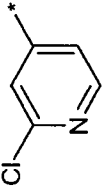
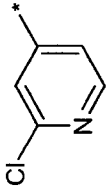
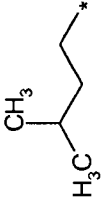
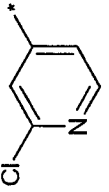
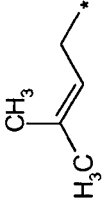
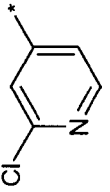
Example Number	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	Het	X ¹	X ²	X ³	Measured Mw	log p HCOOH
58	H	<chem>CCCCS</chem> *	H	H	H	<chem>COc1ccnc(C)c1</chem> *	H	H	H	383	
59	H	<chem>CC(C)CN(C)C</chem> *	H	H	H	<chem>COc1ccnc(C)c1</chem> *	H	H	H	380	
60	H	<chem>CCCC#N</chem> *	H	H	H	<chem>COc1ccnc(C)c1</chem> *	H	H	H	348	
61	H	<chem>CC(C)(O)CC</chem> *	H	H	H	<chem>COc1ccnc(C)c1</chem> *	H	H	H	381	
62	H	<chem>CC(C)=CC</chem> *	H	H	H	<chem>COc1ccnc(C)c1</chem> *	H	H	H	349	
63	H	<chem>CCCCS</chem> *	H	H	H	<chem>COc1ccnc(C)c1</chem> *	H	H	H	383	

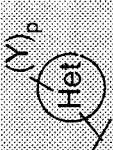
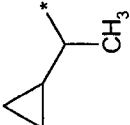
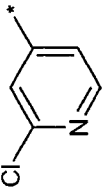
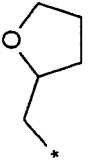
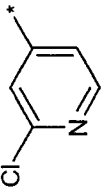
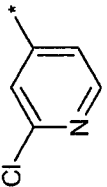
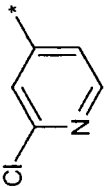
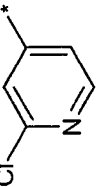
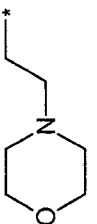
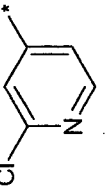
Example Number	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	$\text{Het}^{(M)p}$	X ¹	X ²	X ³	Measured Mw	log p _{HCOOH}
64	H		H	H	H		H	H	H	353	
65	H		H	H	H		H	H	H	367	
66	H		H	H	H		H	H	H	381	
67	H		H	H	H		H	H	H	379	
68	H		H	H	H		H	H	H	365	
69	H		H	H	H		H	H	H	351	

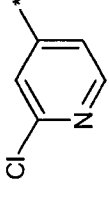
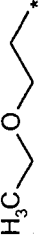
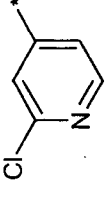
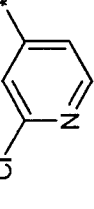
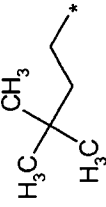
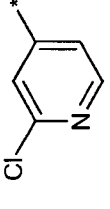
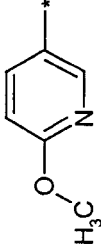
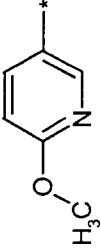
Example Number	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c		X ¹	X ²	X ³	Measured Mw	log p HCOOH
70	H		H	H	H		H	H	H	369	
71	H		H	H	H		H	H	H	379	
72	H		H	H	H		H	H	H	367	
73	H		H	H	H		H	H	H	381	
74	H		H	H	H		H	H	H	381	
75	H		H	H	H		H	H	H	381	

Example Number	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	(Het) ^c (Y) ^p	X ¹	X ²	X ³	Measured Mw	log P HCOOH
91	H		H	H		H	H	H	387	
92	H		H	H		H	H	H	446	
93	H		H	H		H	H	H	472	
94	H		H	H		H	H	H	405	
95	H		H	H		H	H	H	405	

Example Number	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c		X ¹	X ²	X ³	Measured Mw	log p HCOOH
96	H		H	H	H		H	H	H	391	
97	H		H	H	H		H	H	H	417	
98	H		H	H	H		H	H	H	355	2.17
99	H		H	H	H		H	H	H	369	2.17
100	H		H	H	H		H	H	H	387	2.17
101	H		H	H	H		H	H	H	384	2.17

Example Number	R ^a	L	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p (Y) ^q	X	X ²	X ³	Measured Mw	log p HCOOH
102	H		H	H	H		H	H	H	387	
103	H		H	H	H		H	H	H	371	
104	H		H	H	H		H	H	H	385	
105	H		H	H	H		H	H	H	383	
106	H		H	H	H		H	H	H	369	
107	H		H	H	H		H	H	H	367	

Example Number	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c		X ¹	X ²	X ³	Measured Mw	log p HCOOH
108	H		H	H	H		H	H	H	367	
109	H		H	H	H		H	H	H	383	
110	H		H	H	H		H	H	H	371	
111	H		H	H	H		H	H	H	371	
112	H		H	H	H		H	H	H	353	
113	H		H	H	H		H	H	H	412	

Example Number	R ^a	L	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p	X	X ²	X ³	Measured Mw	log p HCOOH
114	H		H	H	H		H	H	H	438	
115	H		H	H	H		H	H	H	371	
116	H		H	H	H		H	H	H	357	
117	H		H	H	H		H	H	H	383	
118	H			H	H		H	H	H		2.11
119	H			H	H		H	H	H	349,3	1.42

The following examples illustrate in a non-limiting manner the preparation and efficacy of the compounds of formula (I) according to the invention.

5 Preparation of N-(2-chloropyridin-4-yl)-4-(2-([1-(methoxymethyl)propyl]amino)pyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine (Compound 9) according to process P1
300 mg of N,4-bis(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine (0.94 mmol), 486mg of 1-methoxybutan-2-amine (4.71mmol), were heated at 240°C for 90minutes under micro-waves irradiation in 0.6 ml of 1-Methyl-2-pyrrolidinone. After cooling, the reaction mixture was poured
10 into 10 ml of dichloromethane, washed twice with 5ml of water. After drying over magnesium sulfate, filtration and concentration *in vacuo*, the crude product was chromatographed on silica (ethyl acetate / heptane) to yield 0.72g of N-(2-chloropyridin-4-yl)-4-(2-([1-(methoxymethyl)propyl]amino)pyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine (yield = 19%).
[M + 1] = 385

15

Preparation of N,4-bis(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine (Compound of formula (II))

Preparation of di-tert-butyl {(Z)-[(2-chloropyridin-4-yl)amino]methylylidene}biscarbamate:

20.22g (0.157 mol) of 4-amino-2-chloropyridine were diluted in triethylamine (67ml) and dichloromethane(600ml) at 0-5°C. 47g of Mercury(II) chloride (0.173mol) and 50.24g (0.173
20 mol) of N,N'-bis(boc)-S-methyl-isothiurea were added to the reaction mixture, which was then stirred at room temperature for 4 days, filtered on a fritted funnel , concentrated *in vacuo* and chromatographed on silica (Heptane90/AcOEt10) to yield 43.67g of di-tert-butyl {(Z)-[(2-chloropyridin-4-yl)amino]methylylidene}biscarbamate (yield = 71%).
[M + 1] = 371

25 Preparation of 1-(2-chloropyridin-4-yl)guanidine bis(trifluoroacetate):

To a solution of 43.67 g (0.117mol) of di-tert-butyl {(Z)-[(2-chloropyridin-4-yl)amino]methylylidene}biscarbamate in dichloromethane (800ml) at room temperature were added 81.64ml of trifluoroacetic acid (1.06 mol). The reaction mixture was stirred at room temperature for 2 days, concentrated *in vacuo*, triturated with 100ml of pentane, and upon
30 standing crystallized to yield 51.68g of 1-(2-chloropyridin-4-yl)guanidine bis(trifluoroacetate) (yield = 99%).

[M + 1-2*CF₃CO₂H] = 171

Preparation of N,4-bis(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine:

To a solution of 6.32g of 1-(2-chloropyridin-4-yl)-3-(dimethylamino)prop-2-en-1-one (30 mmol) in
35 60ml of 2-Propanol was added 2.52g of sodium hydroxide (63mmol) and 11.96g of 1-(2-chloropyridin-4-yl)guanidine bis(trifluoroacetate) (30mmol). The reaction mixture was heated to reflux under stirring for 20h. After filtration, the precipitate was washed with 100ml of *n*-butanol

and 120ml of iPr_2O and then air-dried to yield 4.69g of N,4-bis(2-chloropyridin-4-yl)pyrimidin-2-amine (yield = 37%).

$[M + 1] = 318$

5 Biological Examples

Example A In vivo test on *Peronospora parasitica* (Crucifer downy mildew)

The active ingredients tested are prepared by homogenization in a mixture of acetone/Tween/DMSO, then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

- 10 Cabbage plants (Eminence variety) in starter cups, sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate and grown at 18-20°C, are treated at the cotyledon stage by spraying with the aqueous suspension described above.

Plants, used as controls, are treated with an aqueous solution not containing the active material.

After 24 hours, the plants are contaminated by spraying them with an aqueous suspension of

- 15 *Peronospora parasitica* spores (50 000 spores per ml). The spores are collected from infected plant.

The contaminated cabbage plants are incubated for 5 days at 20°C, under a humid atmosphere.

Grading is carried out 5 days after the contamination, in comparison with the control plants.

Under these conditions, good (at least 70%) or total protection is observed at a dose of 500

- 20 ppm with the following compounds: 9, 11, 13, 15, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 28, 37, 49, 53, 64, 65, 92, 109, 110, 113 and 115.

Example B : in vivo test on *Botrytis cinerea* (Grey mould)

- 25 The active ingredients tested are prepared by homogenization in a mixture of acetone/Tween/DMSO, then diluted with water to obtain the desired active material

Gherkin plants (Vert petit de Paris variety), sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate in starter cups and grown at 18- 20°C, are treated at the cotyledon Z11 stage by spraying with the active ingredient prepared as described above.

- 30 Plants, used as controls, are treated with an aqueous solution not containing the active material.

After 24 hours, the plants are contaminated by depositing drops of an aqueous suspension of *Botrytis cinerea* spores (150,000 spores per ml) on upper surface of the leaves. The spores are collected from a 15-day-old culture and are suspended in a nutrient solution composed of :

- 20 g/L of gelatine;
- 35 - 50 g/L of D-fructose;
- 2 g/L of NH_4NO_3 ;
- 1 g/L of KH_2PO_4 .

The contaminated cucumber plants are settled for 5/7 days in a climatic room at 15-11°C (day/night) and at 80% relative humidity.

Grading is carried out 5/7 days after the contamination, in comparison with the control plants.

Under these conditions, good (at least 70%) or total protection is observed at a dose of 500 ppm with the following compounds: 9, 11, 12, 13, 21, 37, 39, 42, 43, 44, 50, 51, 52, 69, 74, 76 and 106.

Example C : *in vivo* test on *Alternaria brassicae* (Leaf spot of crucifers)

10 The active ingredients tested are prepared by homogenization in a mixture of acetone/tween/DMSO, then diluted with water to obtain the desired active material.

Radish plants (Pernot variety), sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate in starter cups and grown at 18-20°C, are treated at the cotyledon stage by spraying with the active ingredient prepared as described above.

15 Plants, used as controls, are treated with the mixture of acetone/tween/water not containing the active material.

After 24 hours, the plants are contaminated by spraying them with an aqueous suspension of *Alternaria brassicae* spores (40,000 spores per cm³). The spores are collected from a 12 to 13 days-old culture.

20 The contaminated radish plants are incubated for 6-7 days at about 18°C, under a humid atmosphere.

Grading is carried out 6 to 7 days after the contamination, in comparison with the control plants.

Under these conditions, good protection (at least 70%) is observed at a dose of 500ppm with the following compounds: 9, 11, 13, 37, 43, 57, 110 and 115.

25

Example D : *in vivo* test on *Sphaerotheca fuliginea* (cucurbits powdery mildew).

The active ingredients tested are prepared by homogenization in a mixture of acetone/tween/DMSO, then diluted with water to obtain the desired active material.

30 Gherkin plants (Vert petit de Paris variety) in starter cups, sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate and grown at 20°C/23°C, are treated at the cotyledon Z10 stage by spraying with the aqueous suspension described above. Plants, used as controls, are treated with an aqueous solution not containing the active material.

After 24 hours, the plants are contaminateded by spraying them with an aqueous suspension of *Sphaerotheca fuliginea* spores (100 000 spores per ml). The spores are collected from a contaminated plants .The contaminated gherkin plants are incubated at about 20°C/25°C and at 60/70% relative humidity.

- 5 Grading (% of efficacy) is carried out 12 days after the contamination, in comparison with the control plants.

Under these conditions, good (at least 70%) or total protection is observed at a dose of 500ppm with the following compounds: 9, 13, 37 and 39.

10

Example E : in vivo test on *Pyrenophora teres* (Barley Net blotch)

The active ingredients tested are prepared by homogenization in a mixture of acetone/Tween/DMSO, then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

- 15 Barley plants (Express variety), sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate in starter cups and grown at 12°C, are treated at the 1-leaf stage (10 cm tall) by spraying with the active ingredient prepared as described above.

Plants, used as controls, are treated with an aqueous solution not containing the active material. After 24 hours, the plants are contaminated by spraying them with an aqueous suspension of *Pyrenophora teres* spores (12,000 spores per ml). The spores are collected from a 12-day-old culture. The contaminated barley plants are incubated for 24 hours at about 20°C and at 100% relative humidity, and then for 12 days at 80% relative humidity.

- 20 Grading is carried out 12 days after the contamination, in comparison with the control plants. Under these conditions, good (at least 70%) is observed at a dose of 500 ppm with the following compounds: 9, 10, 11, 12, 13, 21, 36, 37, 38, 39, 43, 44, 45, 46, 51, 52, 57, 60, 62, 64, 65, 66, 68, 69, 76 and 110.

25

Example F : in vivo test on *Puccinia recondita* (Brown rust)

- 30 The active ingredients tested are prepared by homogenization in a mixture of acetone/tween/DMSO, then diluted with water to obtain the desired active material.

Wheat plants (Scipion variety) sown on 50/50 peat soil-pozzolana substrate in starter cups and grown at 12°C, are treated at the 1-leaf stage (10 cm tall) by spraying with the aqueous suspension described above.

- 35 Plants, used as controls, are treated with an aqueous solution not containing the active material.

After 24 hours, the plants are contaminateded by spraying the leaves with an aqueous suspension of *Puccinia recondita* spores (100,000 spores per ml). The spores are collected from a 10-day-old contaminated wheat and are suspended in water containing 2.5 ml/l of tween 80 10%. The contaminated wheat plants are incubated for 24 hours at 20°C and at 100% relative humidity, and then for 10 days at 20°C and at 70% relative humidity.

Grading is carried out 10 days after the contamination, in comparison with the control plants.

Under these conditions, good (at least 70%) or total protection is observed at a dose of 500ppm with the following compounds: 9, 37 and 38.

Example G : *in vivo* test on *Mycosphaerella graminicola* (Wheat Leaf Spot)

The active ingredients tested are prepared by homogenization in a mixture of acetone/tween/DMSO, then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

Wheat plants (Scipion variety), sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate in starter cups and grown at 12°C, are treated at the 1-leaf stage (10 cm tall) by spraying with the aqueous suspension described above. Plants, used as controls, are treated with an aqueous solution not containing the active material.

After 24 hours, the plants are contaminated by spraying them with an aqueous suspension of *Mycosphaerella graminicola* spores (500 000 spores per ml). The spores are collected from a 7-day-old culture. The contaminated wheat plants are incubated for 72 hours at 18°C and at 100% relative humidity, and then for 21 to 28 days at 90% relative humidity.

Grading (% of efficacy) is carried out 21 to 28 days after the contamination, in comparison with the control plants.

Under these conditions, good (at least 70%) or total protection is observed at a dose of 500ppm with the following compounds: 9, 13, 15, 21, 34, 37, 39, 51, 66 and 74.

Example H : *in vivo* test on *Pyricularia grisea* (Rice blast)

The active ingredients tested are prepared by homogenization in a mixture of acetone/tween/DMSO, then diluted with water to obtain the desired active material concentration.

Rice plants (Koshihikari variety), sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate in starter cups and grown at 25°C, are treated at the 2-leaf stage (13-15 cm tall) by spraying with the active ingredient prepared as described above. Plants, used as controls, are treated with the mixture of acetone/tween/DMSO/water not containing the active material.

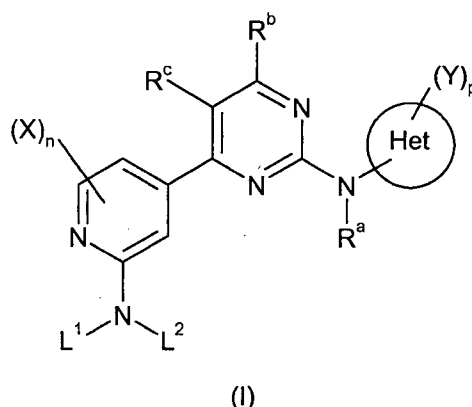
After 24 hours, the plants are contaminateded by spraying them with an aqueous suspension of *Pyricularia grisea* spores (30,000 spores per ml). The spores are collected from a 17-day-old culture and are suspended in water containing 2.5 g/l of gelatin. The contaminated Rice plants are incubated for 72 hours at about 25°C and at 100% relative humidity, and then for 3 days at 25°C at 80% relative humidity during the day and 20% relative humidity during the night.

Grading (% of efficacy) is carried out 6 days after the contamination, in comparison with the control plants.

Under these conditions, good (at least 70%) or total protection is observed at a dose of 500ppm with the following compounds: 9.

CLAIMS

1. A compound of formula (I)



wherein

- Het represents a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to four heteroatoms which may be the same or different;
- Y independently represents a halogen atom, a nitro group, a hydroxy group, an oxo group, a cyano group, an amino group, a sulphenyl group, a pentafluoro- λ^6 -sulphenyl group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, a (hydroxyimino)-C₁-C₈-alkyl group, a C₁-C₈-alkyl, a tri(C₁-C₈-alkyl)silyl, a substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-cycloalkyl, substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-cycloalkyl, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₂-C₈-alkenyloxy, a C₂-C₈-alkynyloxy, a C₁-C₈-alkylamino, a di-C₁-C₈-alkylamino, a C₁-C₈-alkoxy, a C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyloxy, a C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₃-C₈-alkynyloxy, a C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyloxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a N-C₁-C₈-alkyl-C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonylamino, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a di-C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, a C₁-C₈-

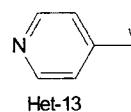
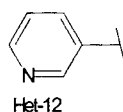
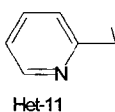
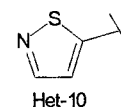
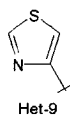
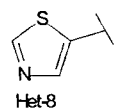
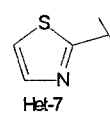
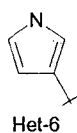
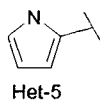
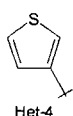
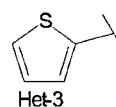
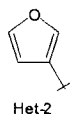
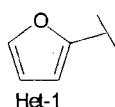
alkyloxycarbonyloxy, a C₁-C₈-alkylsulphenyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphinyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylaminosulfamoyl, a di-C₁-C₈-alkylaminosulfamoyl, a (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkenyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a (C₁-C₆-alkynyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, a 2-oxopyrrolidin-1-yl, substituted or non-substituted (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxyalkyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted benzyloxy, substituted or non-substituted benzylsulphenyl, substituted or non-substituted benzylamino, substituted or non-substituted phenoxy, substituted or non-substituted phenylsulphenyl, or substituted or non-substituted phenylamino ;

- p represents 0, 1, 2, 3, 4, 5 or 6;
- R^a represents a hydrogen atom, a cyano group, a formyl group, a formyloxy group, a C₁-C₈-alkoxycarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylcarbonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkylsulphonyl, a C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-alkyl, a C₁-C₈-cycloalkyl, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyl, a C₂-C₈-alkynyl, a C₁-C₈-alkoxyalkyl, a C₁-C₈-halogenoalkoxyalkyl having 1 to 5 halogen atoms;
- R^b and R^c independently represent a hydrogen atom, a halogen atom, a cyano, a C₁-C₈-alkyl, a C₁-C₈-cycloalkyl, a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₁-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms ;
- X independently represents a C₁-C₁₀-alkyl, a C₁-C₁₀-halogenoalkyl, a halogen atom or a cyano;
- n represents 0, 1, 2 or 3;
- L¹ and L² independently represent a hydrogen atom, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, a carbamoyl group, a N-hydroxycarbamoyl group, a carbamate group, substituted or non-substituted (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl, tri(C₁-C₈-alkyl)silyl, substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-alkyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-cycloalkyl, substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl-C₁-C₈-cycloalkyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylamino, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylamino,

- substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkenyloxy, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyloxy, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkenyloxy, substituted or non-substituted C₂-C₈-halogenoalkenyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₃-C₈-alkynyloxy, substituted or non-substituted C₃-C₈-halogenoalkynyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbamoyl, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylcarbamoyl, substituted or non-substituted N-C₁-C₈-alkyloxycarbamoyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, substituted or non-substituted N-C₁-C₈-alkyl-C₁-C₈-alkoxycarbamoyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxycarbonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonylamino, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyloxycarbonyloxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylsulphenyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylsulphinyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylsulphinyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylsulphonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylaminosulfamoyl, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylaminosulfamoyl, substituted or non-substituted (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted or non-substituted (C₁-C₆-alkenyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, substituted or non-substituted (C₁-C₆-alkynyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C₁-C₈-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C₁-C₈-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C₁-C₈-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted (benzyloxyimino)-C₁-C₆-alkyl;
- L¹ and L² can form together a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic, substituted or non-substituted 4-, 5-, 6- or 7-membered, N-including heterocycle comprising up to 4 heteroatoms independently selected in the list consisting of N, O, S ;

as well as salts, N-oxides, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active or geometric isomers thereof; provided that the following compound is excluded: 4-[2-(ethylamino)-4-pyridinyl]-N-[5-(piperazinyl)-2-pyridinyl]-2-pyrimidinamine.

- 5 2. A compound according to claim 1 wherein Het represents a saturated or unsaturated, aromatic or non-aromatic heterocycle selected in the list consisting of:



10

15

20

25

3. A compound according to claims 1 or 2 wherein Y represents a halogen atom, a cyano group, a formylamino group, a carbamoyl group, a substituted or non-substituted (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl, a substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl, a substituted or non-substituted C₁-C₈-cycloalkyl, a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxy, a substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonylamino.

4. A compound according to claims 1 to 3 wherein Y represents a halogen atom, a cyano group, a formylamino group, a carbamoyl group, a substituted or non-substituted (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl group, a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl, a substituted or non-substituted tri(C₁-C₈-alkyl)silyl, a substituted or non-substituted C₁-C₈-cycloalkyl, a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxy, a substituted or non-substituted C₁-C₈-

halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, a substituted or non-substituted a C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms.

- 5
5. A compound according to claims 1 to 4 wherein p represents 0, 1 or 2.
6. A compound according to claims 1 to 5 wherein p represents 1.
7. A compound according to claims 1 to 6 wherein R^a represents a hydrogen atom.
- 10 8. A compound according to claims 1 to 7 wherein R^b and R^c independently represent a hydrogen atom or a halogen atom.
9. A compound according to claims 1 to 8 wherein R^b and R^c independently represent a hydrogen atom.
- 15 10. A compound according to claims 1 to 9 wherein n represents 0.
11. A compound according to claims 1 to 10 wherein L¹ and L² independently represent a hydrogen atom, a cyano group, a hydroxy group, an amino group, a formyl group, a formyloxy group, a formylamino group, substituted or non-substituted (hydroxyimino)-C₁-C₈-alkyl group, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl, tri(C₁-C₈-alkyl)silyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-cycloalkyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenocycloalkyl having 1 to 5 halogen atoms, a C₂-C₈-alkenyl, substituted or non-substituted C₂-C₈-alkynyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylamino, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylamino, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbamoyle, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylcarbamoyle, substituted or non-substituted N-C₁-C₈-alkyloxycarbamoyle, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxycarbamoyle, substituted or non-substituted N-C₁-C₈-alkyl-C₁-C₈-alkoxycarbamoyle, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkoxycarbonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkoxycarbonyl having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonyloxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyloxy having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylcarbonylamino, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylcarbonylamino having 1 to 5 halogen atoms, substituted or non-substituted C₁-C₈-
- 20
- 25
- 30
- 35

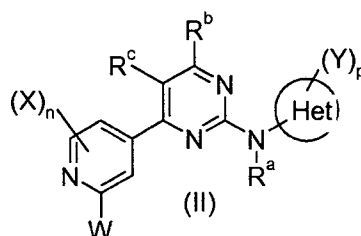
alkylaminocarbonyloxy, substituted or non-substituted di-C₁-C₈-alkylaminocarbonyloxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyloxycarbonyloxy, substituted or non-substituted C₁-C₈-alkylsulphonyl, substituted or non-substituted C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C₁-C₈-alkyl, (2-oxopyrrolidin-1-yl) C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxopiperidin-1-yl) C₁-C₈-alkyl, (2-oxopiperidin-1-yl) C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms, (2-oxoazepan-1-yl) C₁-C₈-alkyl, (2-oxoazepan-1-yl) C₁-C₈-halogenoalkyl having 1 to 5 halogen atoms;

when L¹ and L² form together a substituted or non-substituted, 4-, 5-, 6- or 7-membered heterocycle comprising up to 4 heteroatoms selected in the list consisting of N, O, S, L¹ and L² independently represent a substituted or non-substituted 2-oxopyrrolidin-1-yl or a substituted or non-substituted 2-oxo-1,3-oxazolidin-3-yl.

12. A compound according to claims 1 to 11 wherein L¹ and L² independently represent a hydrogen atom or a linear or branched, a substituted or non-substituted C₁-C₈-alkyl.

13. A compound according to claims 1 to 12 wherein L¹ and L² independently represent a hydrogen atom or a linear or branched, a substituted or non-substituted (C₁-C₈-alkoxy)-C₁-C₈-alkyl.

14. A compound of formula (II)



wherein

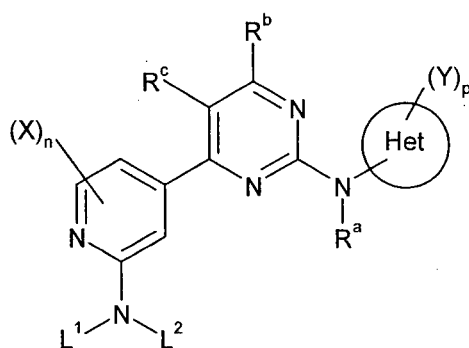
- W represents a leaving group such as a halogen atom, a C₁-C₆ alkylsulfonate, a C₁-C₆ haloalkylsulfonate ; a substituted or non-substituted phenylsulfonate and
- X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c, Het, being as defined in claims 1 to 13.

15. A fungicide composition comprising, as an active ingredient, an effective amount of a compound of formula (I) according to claims 1 to 13 and an agriculturally acceptable support, carrier or filler.

DERIVADOS DE HETEROCICLIL-PIRIMIDINIL-AMINO FUNGICIDAS

DESCRIPCIÓN

- La presente invención se refiere a derivados de heterocicilil-pirimidinil-amino, a su procedimiento de preparación, a sus compuestos intermedios de preparación, a su utilización como agentes fungicidas activos, particularmente en forma de composiciones fungicidas y a los métodos para el control de hongos fitopatógenos, especialmente de plantas, utilizando estos compuestos o composiciones.
- En la solicitud de patente internacional WO-2005/019211, se describen algunos compuestos que tienen tanto un grupo biarilo como un grupo heterocíclico que pueden utilizarse como agentes fungicidas. Incluso si alguno de estos compuestos puede poseer semejanzas estructurales con los compuestos según la invención, este documento no da a conocer ni sugiere los compuestos según la invención.
- Además, en la solicitud de patente internacional WO-2004/065378 se ha dado a conocer que la 4-[2-(etilamino)-4-piridinil]-N-[5-(1-piperazinil)-2-piridinil]-2-pirimidinamina, puede ser útil como inhibidor de la proliferación celular. Este compuesto se ha excluido del alcance de la presente invención.
- Siempre es de gran interés en el campo de la agricultura, el uso de nuevos compuestos plaguicidas con objeto de evitar o luchar contra el desarrollo de cepas resistentes a los ingredientes activos. Es también de gran interés la utilización de nuevos compuestos que sean más activos que los ya conocidos, con objeto de reducir las cantidades de compuesto activo que se han de utilizar, manteniendo al mismo tiempo una eficacia al menos equivalente a la de los compuestos ya conocidos. Se ha encontrado ahora una nueva familia de compuestos que poseen los efectos o ventajas anteriormente mencionados.
- Por consiguiente, la presente invención proporciona derivados de heterocicilil-pirimidil-amino de fórmula (I)



(I)

en la que

- Het representa un heterociclo saturado o insaturado, aromático o no aromático de 4, 5, 6 o 7 elementos que comprende hasta cuatro heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes;
- Y independientemente representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxilo, un grupo oxo, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfenilo, un grupo pentafluoro-λ⁶-sulfenilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquil C₁-C₆, un alquilo C₁-C₈, un tri(alquil C₁-C₈)sililo, un tri(alquil C₁-C₈)silil-alquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido, un cicloalquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, tri(alquil C₁-C₈)silil-cicloalquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido, un halogenoalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueno C₂-C₈, un alquino C₂-C₈, un alqueno C₂-C₈-oxi, un alquino C₂-C₈-oxi, un alquil C₁-C₈-amino, un di-alquil C₁-C₈-amino, un alcoxi C₁-C₈, un halogenoalcoxi C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-sulfenilo, un halogenoalquil C₁-C₈-sulfenilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueno C₂-C₈-oxi, un halogenoalqueno C₂-C₈-oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquino C₃-C₈-oxi, un halogenoalquino C₃-C₈-oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carbonilo, un halogenoalquil C₁-C₈-carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carbamoilo, un di-alquil C₁-C₈-carbamoilo, un alquil N-C₁-C₈-oxicarbamoilo, un alcoxi C₁-C₈-carbamoilo, un N-alquil C₁-C₈-alcoxi C₁-C₈-carbamoilo, un alcoxi C₁-C₈-carbonilo, un halogenoalcoxi C₁-C₈-carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carboniloxi, un halogenoalquil C₁-C₈-carboniloxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carbonilamino, un halogenoalquil C₁-C₈-carbonilamino que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-aminocarboniloxi, un di-

alquil C₁-C₈-aminocarbonilo, un alquil C₁-C₈-oxicarbonilo, un alquil C₁-C₈-sulfenilo, un halogenoalquil C₁-C₈-sulfenilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-sulfinilo, un halogenoalquil C₁-C₈-sulfinilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-sulfonilo, un halógenoalquil C₁-C₈-sulfonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-aminosulfamoilo, un dialquil C₁-C₈-aminosulfamoilo, un (alcoxi C₁-C₆-imino)-alquil C₁-C₆, un alquenil (C₁-C₆-oxiimino)-alquil C₁-C₆, un alquinil (C₁-C₆-oxiimino)-alquil C₁-C₆, un 2-oxopirrolidin-1-ilo, (benciloxiimino)-alquil C₁-C₆ sustituido o no sustituido, alcoxialquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido, halogenoalcoxialquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi sustituido o no sustituido, bencilsulfenilo sustituido o no sustituido, bencilamino sustituido o no sustituido, fenoxi sustituido o no sustituido, fenilsulfenilo sustituido o no sustituido o fenilamino sustituido o no sustituido;

- p representa 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6;
- R^a representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un alcoxi C₁-C₈-carbonilo, un halogenoalcoxi C₁-C₈-carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carbonilo, un halogenoalquil C₁-C₈-carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-sulfonilo, un halogenoalquil C₁-C₈-sulfonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilo C₁-C₈, un cicloalquilo C₁-C₈, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un alcoxialquilo C₁-C₈, un halogenoalcoxialquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno;
- R^b y R^c independientemente representan un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un ciano, un alquilo C₁-C₈, un cicloalquilo C₁-C₈, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno;
- X independientemente representa un alquilo C₁-C₁₀, un halogenoalquilo C₁-C₁₀, un átomo de halógeno o un ciano;
- n representa 0, 1, 2 o 3;
- L¹ y L² independientemente representan un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxil, un grupo amino, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxycarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquil C₁-C₆ sustituido o no sustituido, alquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, tri(alquil C₁-C₈-)sililo, tri(alquil C₁-C₈)silil-alquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido, cicloalquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, tri(alquil C₁-C₈)silil-cicloalquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de

halógeno, halogenocicloalquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de
 halógeno, un alquenilo C₂-C₈, alquinilo C₂-C₈ sustituido o no sustituido, alquilamino C₁-C₈
 sustituido o no sustituido, di-alquil C₁-C₈-amino sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-C₈
 sustituido o no sustituido, halogenoalcoxi C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5
 5 átomos de halógeno, alquenil C₂-C₈-oxi sustituido o no sustituido, alquinil C₂-C₈-oxi
 sustituido o no sustituido, alquenil C₂-C₈-oxi sustituido o no sustituido, halogenoalquenil C₂-
 C₈-oxi sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquinil C₃-C₈-oxi
 sustituido o no sustituido, halogenoalquinil C₃-C₈-oxi sustituido o no sustituido que tiene 1 a
 10 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carbonilo sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-
 C₈-carbonilo sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-
 carbamoilo sustituido o no sustituido, di-alquil C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido,
 N-alquil C₁-C₈-oxicarbamoilo sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-C₈-carbamoilo sustituido o
 no sustituido, N-alquil C₁-C₈-alcoxi C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-
 C₈-carbonilo sustituido o no sustituido, halogenoalcoxi C₁-C₈-carbonilo sustituido o no
 15 sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carboniloxi sustituido o no
 sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-carboniloxi sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5
 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carbonilamino sustituido o no sustituido, halogenoalquil
 C₁-C₈-carbonilamino sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil
 C₁-C₈-aminocarboniloxi sustituido o no sustituido, di-alquil C₁-C₈-aminocarboniloxi
 20 sustituido o no sustituido, alquil C₁-C₈-oxicarboniloxi sustituido o no sustituido, alquil C₁-C₈-
 sulfenilo sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-sulfenilo sustituido o no sustituido
 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-sulfinilo sustituido o no sustituido,
 halogenoalquil C₁-C₈-sulfinilo sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno,
 alquil C₁-C₈-sulfonilo sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-sulfonilo sustituido o
 25 no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-aminosulfamoilo sustituido o
 no sustituido, di-alquil C₁-C₈-aminosulfamoilo sustituido o no sustituido, (alcoxi C₁-C₆-
 imino)-alquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido, (alquenil C₁-C₆-oxiimino)-alquil C₁-C₆
 sustituido o no sustituido, (alquinil C₁-C₆-oxiimino)-alquil C₁-C₆ sustituido o no sustituido, (2-
 oxopirrolidin-1-il) alquil C₁-C₈, (2-oxopirrolidin-1-il) halogenoalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5
 30 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il) alquil C₁-C₈, (2-oxopiperidin-1-il) halogenoalquil
 C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il) alquil C₁-C₈, (2-oxoazepan-
 1-il) halogenoalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-alquil C₁-C₆
 sustituido o no sustituido;

- L^1 y L^2 pueden formar conjuntamente un heterociclo que incluye N, de 4, 5, 6 o 7 elementos sustituido o no sustituido, que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente en la lista consistente en N, O, S;

5 así como sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloides y sus isómeros ópticamente activos o geométricos; con la condición de que esté excluido el compuesto siguiente: 4-[2-(etilamino)-4-piridinil]-N-[5-(-piperazinil)-2-piridinil]-2-pirimidinamina.

10 Cualquiera de los compuestos según la presente invención pueden existir en una o más formas de isómeros ópticos o quirales, dependiendo del número de centros asimétricos en el compuesto. Así, la invención se refiere igualmente a todos los isómeros ópticos y a cualquiera de sus mezclas racémicas o escalémicas (el término "escalémico" indica una mezcla de enantiómeros en diferentes proporciones) y a las mezclas de algunos potenciales estereoisómeros, en cualquier proporción. Los diastereoisómeros o isómeros ópticos pueden ser separados por cualquier método
15 conocido por sí mismo por cualquier experto en la materia.

Cualquiera de los compuestos según la presente invención puede existir también en una o más formas de isómeros geométricos, dependiendo del número de dobles enlaces en el compuesto. La invención por consiguiente se refiere asimismo a cualquier isómero geométrico y a cualquiera de sus mezclas posibles, en cualquier proporción. Los isómeros geométricos pueden ser separados
20 por cualquier método conocido por sí mismo por cualquier experto en la materia.

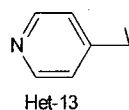
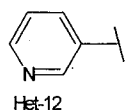
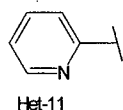
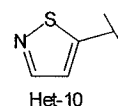
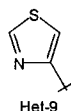
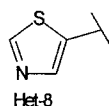
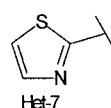
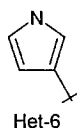
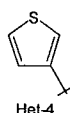
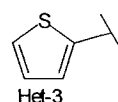
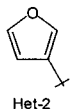
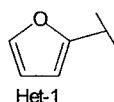
Cualquier compuesto de fórmula (I) según la invención en la que Y representa un grupo hidroxil, un grupo sulfenilo o un grupo amino puede existir en forma tautómera resultante del cambio del protón de dicho grupo hidroxil, grupo sulfenilo o grupo amino respectivamente. Dichas formas tautómeras forman parte asimismo de la presente invención. Generalmente, cualquier forma tautómera de un
25 compuesto de fórmula (I) según la invención en la que Y representa un grupo hidroxil, un grupo sulfenilo o un grupo amino, así como las formas tautómeras de los compuestos que pueden utilizarse opcionalmente como intermedios en los procedimientos de preparación según la invención forman parte también de la presente invención.

De acuerdo con la invención, se usan en general los siguientes términos genéricos con los
30 siguientes significados:

- halógeno se refiere a flúor, cloro, bromo o yodo;
- heteroátomo puede ser nitrógeno, oxígeno o azufre;

- a menos que se indique de otra manera, un grupo o un sustituyente que se sustituye según la invención puede ser sustituido por uno o más de los siguientes grupos o átomos: un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfenilo, un grupo pentafluoro- λ^6 -sulfenilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxycarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquil C₁-C₆, un alquilo C₁-C₈, un tri(alquil C₁-C₈)silil-alquil C₁-C₈, un cicloalquilo C₁-C₈, tri(alquil C₁-C₈)silil-cicloalquil C₁-C₈, un halogenoalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un alquenil C₂-C₈-oxi, un alquinil C₂-C₈-oxi, un alquil C₁-C₈-amino, un di-alquil C₁-C₈-amino, un alcoxi C₁-C₈, un halogenoalcoxi C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-sulfenilo, un halogenoalquil C₁-C₈-sulfenilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenil C₂-C₈-oxi, un halogenoalquenil C₂-C₈-oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquinil C₃-C₈-oxi, un halogenoalquinil C₃-C₈-oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carbonilo, un halogenoalquil C₁-C₈-carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carbamoilo, un di-alquil C₁-C₈-carbamoilo, un N-alquil C₁-C₈-oxicarbamoilo, un alcoxi C₁-C₈-carbamoilo, un N-alquil C₁-C₈-alcoxi C₁-C₈-carbamoilo, un alcoxi C₁-C₈-carbonilo, un halogenoalcoxi C₁-C₈-carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carboniloxi, un halogenoalquil C₁-C₈-carboniloxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carbonilamino, un halogenoalquil C₁-C₈-carbonilamino que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-aminocarboniloxi, un di-alquil C₁-C₈-aminocarboniloxi, un alquil C₁-C₈-oxicarboniloxi, un alquil C₁-C₈-sulfenilo, un halogenoalquil C₁-C₈-sulfenilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-sulfinilo, un halogenoalquil C₁-C₈-sulfinilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-sulfonilo, un halogenoalquil C₁-C₈-sulfonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-aminosulfamoilo, un dialquil C₁-C₈-aminosulfamoilo, un (alcoxi C₁-C₆-imino)-alquil C₁-C₆, un alquenil (C₁-C₆-oxiimino)-alquil C₁-C₆, un alquinil (C₁-C₆-oxiimino)-alquil C₁-C₆, un 2-oxopirrolidin-1-ilo, (benciloxiimino)-alquil C₁-C₆ sustituido o no sustituido, alcoxialquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido, halogenoalcoxialquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi, bencilsulfenilo, bencilamino, fenoxi, fenilsulfenilo o fenilamino.

Los compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Het representa un heterociclo saturado o insaturado, aromático o no aromático seleccionado en la lista consistente en:



Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Y representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo (hidroxiimino)-alquil C₁-C₆ sustituido o no sustituido, un alquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, un sustituido o no sustituido tri(alquil C₁-C₈)sililo, un cicloalquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, un alcoxi C₁-C₈ sustituido o no sustituido, un halogenoalcoxi C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carbonilamino sustituido o no sustituido. Más preferiblemente, Y representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo (hidroxiimino)-alquil C₁-C₆ sustituido o no sustituido, un alquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, un tri(alquil C₁-C₈)sililo sustituido o no sustituido, un cicloalquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, un alcoxi C₁-C₈ sustituido o no sustituido, un halogenoalcoxi C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que p representa 0, 1 o 2. Más preferiblemente, p representa 1.

5 Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^a representa un átomo de hidrógeno.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que R^b y R^c independientemente representan un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno. Más preferiblemente, R^b y R^c representan un átomo de hidrógeno.

10

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que n representa 0.

15 Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que L¹ y L² representan independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo (hidroxiimino)-alquil C₁-C₆ sustituido o no sustituido, alquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, tri(alquil C₁-C₈)sililo, cicloalquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C₂-C₈, alquinilo C₂-C₈ sustituido o no sustituido, alquil C₁-C₈-amino sustituido o no sustituido, di-alquil C₁-C₈-amino sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-C₈ sustituido o no sustituido, halogenoalcoxi C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carbonilo sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-carbonilo sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido, di-alquil C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido, N-alquil C₁-C₈-oxicarbamoilo sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido, N-alquil C₁-C₈-alcoxi C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-C₈-carbonilo sustituido o no sustituido, halogenoalcoxi C₁-C₈-carbonilo sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carboniloxi sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-carboniloxi sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carbonilamino sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-carbonilamino sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-aminocarboniloxi sustituido o no sustituido, di-alquil C₁-C₈-aminocarboniloxi sustituido o no sustituido, alquil C₁-C₈-oxicarboniloxi sustituido o no sustituido, alquil C₁-C₈-sulfonilo sustituido o

no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-sulfonilo sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopirrolidin-1-il)alquil C₁-C₈, (2-oxopirrolidin-1-il) halogenoalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il)alquil C₁-C₈, (2-oxopiperidin-1-il) halogenoalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il) alquil C₁-C₈, (2-oxoazepan-1-il) halogenoalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno;

cuando L¹ y L² forman conjuntamente un heterociclo de 4, 5, 6 o 7 elementos sustituido o no sustituido que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados en la lista consistente en N, O, S, L¹ y L² independientemente representan un 2-oxopirrolidin-1-il sustituido o no sustituido o un 2-oxo-1,3-oxazolidin-3-ilo sustituido o no sustituido.

Los compuestos más preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que L¹ y L² independientemente representan un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₈ lineal o ramificado, sustituido o no sustituido, por ejemplo un (alcoxi C₁-C₈)-alquilo C₁-C₈.

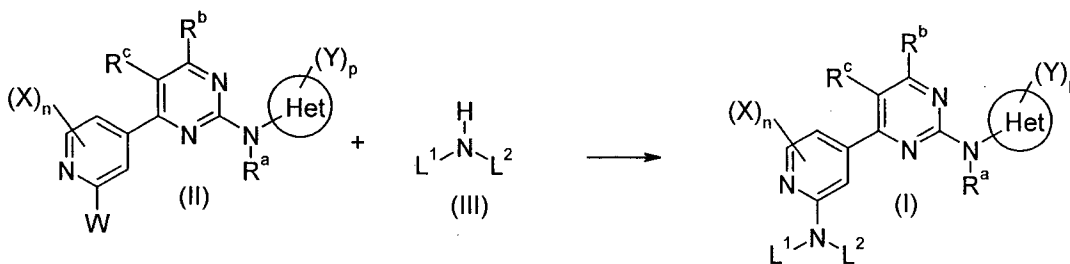
Las preferencias mencionadas anteriormente con respecto a los sustituyentes de los compuestos de fórmula (I) según la invención pueden combinarse de diversas maneras, bien individual, parcial o completamente. Estas combinaciones de características preferidas proporcionan así subclases de compuestos según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

- características preferidas de Het con características preferidas de uno o más de Y, p, R^a, R^b, R^c, X, n, L¹ y L²;
- características preferidas de Y con características preferidas de uno o más de Het, p, R^a, R^b, R^c, X, n, L¹ y L²;
- características preferidas de p con características preferidas de uno o más de Het, Y, R^a, R^b, R^c, X, n, L¹ y L²;
- características preferidas de R^a con características preferidas de uno o más de Het, Y, p, R^b, R^c, X, n, L¹ y L²;
- características preferidas de R^b con características preferidas de uno o más de Het, Y, p, R^a, R^c, X, n, L¹ y L²;
- características preferidas de R^c con características preferidas de uno o más de Het, Y, p, R^a, R^b, X, n, L¹ y L²;
- características preferidas de X con características preferidas de uno o más de Het, Y, p, R^a, R^b, R^c, n, L¹ y L²;

- características preferidas de n con características preferidas de uno o más de Het, Y, p, R^a, R^b, R^c, X, L¹ y L²;
- características preferidas de L¹ con características preferidas de uno o más de Het, Y, p, R^a, R^b, R^c, X, n y L²;
- 5 - características preferidas de L² con características preferidas de uno o más de Het, Y, p, R^a, R^b, R^c, X, n, y L¹.

En estas combinaciones de características preferidas de los sustituyentes de los compuestos según la invención, dichas características preferidas pueden también seleccionarse entre las características más preferidas de cada uno de Het, Y, p, R^a, R^b, R^c, X, n, L¹ y L² para formar la mayoría de las subclases preferidas de los compuestos según la invención.

La presente invención también se refiere a un procedimiento para la preparación de compuestos de fórmula (I). Así, de acuerdo con un aspecto adicional de la presente invención, se proporciona un procedimiento P1 para la preparación del compuesto de fórmula (I) como se define en la presente memoria, ilustrado mediante el siguiente esquema de reacción:



Procedimiento P1

en la que

- W representa un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil C₁-C₆-sulfonato, un haloalquil C₁-C₆-sulfonato; un fenilsulfonato sustituido o no sustituido y
- 20 • siendo X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c, L¹, L², Het, como se definen en la presente memoria; y que comprende
 - hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II) con un derivado de amino de fórmula (III) con objeto de proporcionar un compuesto de fórmula (I), opcionalmente en presencia de un catalizador, preferiblemente un catalizador de un metal de transición, tal como una sal de cobre, preferiblemente una sal de cobre (I) por ejemplo cloruro de cobre (I), cianuro de cobre (I), tales como las sales o complejos de paladio, por ejemplo cloruro de paladio (II), acetato de paladio (II), tetrakis-(trifenilfosfina) paladio (0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina) paladio (II),

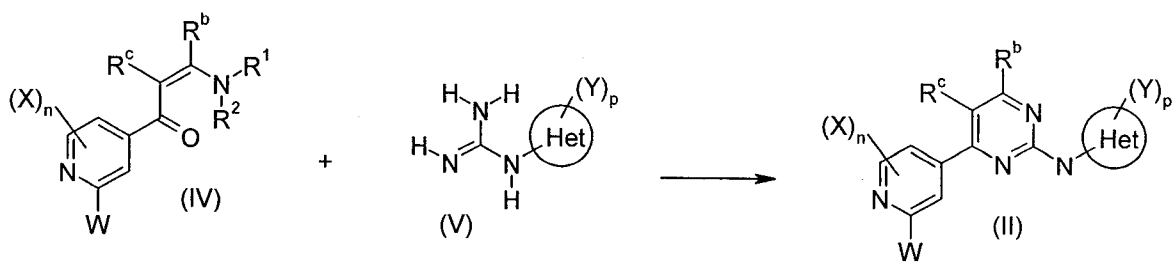
tris(dibencilidenacetona) dipaladio (0), bis(dibencilidenacetona) paladio (0) o
 cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio (II). Como alternativa el complejo
 de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción añadiendo por
 separado a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando complejo tal
 como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina,
 2-(dicrohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfina)bifenilo, 2-(dicrohexilfosfina)-2'-
 (N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-
 (difenilfosfino)benzolsulfonato sódico, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-
 (difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-
 (difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(dicrohexilfosfina)butano, 1,2-bis-
 (dicrohexilfosfina)etano, 2-(dicrohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo,
 bis(difenilfosfino)ferroceno, tris-(2,4-terc-butilfenil)-fosfito, (R)-(-)-1-[(S)-2-
 (difenilfosfino)ferrocenil]etil-di-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-
 (difenilfosfino)ferrocenil]etil-dicrohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-
 (difenilfosfino)ferrocenil]etil-dicrohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-
 (difenilfosfino)ferrocenil]etil-di-t-butilfosfina, opcionalmente en presencia de una
 base tal como una base inorgánica u orgánica; preferiblemente hidruros de metal
 alcalinotérreo o de metal alcalino, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos,
 carbonatos o bicarbonatos, tales como el hidruro de sodio, amida sódica,
 diisopropilamida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato
 de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de
 sodio, hidróxido de potasio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato
 potásico, bicarbonato sódico, carbonato de cesio o carbonato amónico; y también
 aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-
 dimetilnilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina,
 N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicclooctano
 (DABCO), diazabicclononeno (DBN) o diazabiccloundeceno (DBU);

Dependiendo de las definiciones respectivas de X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c, Het, derivados de amino-
 pirimidina de fórmula (II) pueden prepararse por varios procedimientos.

Por consiguiente, se proporciona un procedimiento A según la invención para la preparación de un
 compuesto de fórmula (II) en la que

- R^a representa un átomo de hidrogeno;

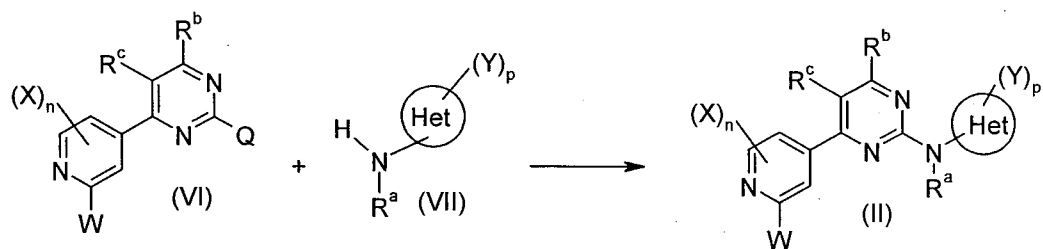
- siendo X, Y, n, p, R^b, R^c, Het como se define en la presente memoria; y que comprende
- una primera etapa de acuerdo con el esquema de reacción A-1:



Esquema A-1:

- 5 en la que
- siendo W, X, Y, n, p, R^b, R^c, Het como se define en la presente memoria;
 - R¹ y R² son independientemente un grupo alquilo C₁-C₈, R¹ y R² pueden formar conjuntamente un heterociclo de 4, 5, 6 o 7 elementos sustituido o no sustituido, que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados en la lista consistente en N, O, S;
- 10 que comprende la formación del resto de pirimidina por condensación, a una temperatura de -50°C a 200°C, de un compuesto de fórmula (IV), opcionalmente en presencia de una base tales como una base inorgánica u orgánica, preferiblemente hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metal alcalino o de metal alcalinotérreo, tales como hidruro sódico, amida sódica, diisopropilamida de litio, metanolato sódico, etanolato sódico, terc-butanolato
- 15 potásico, acetato sódico, acetato potásico, acetato cálcico, hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico, carbonato de cesio o carbonato amónico; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO),
- 20 diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU); con una guanidina o un derivado de la sal de guanidina de fórmula (V) para dar un compuesto de fórmula (II).

- Alternativamente, se proporciona un procedimiento B según la invención para la preparación de un compuesto de fórmula (II) en la que W, X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c, Het son como se define en la
- 25 presente memoria; y que comprende
- una primera etapa de acuerdo con el esquema de reacción B-1:



Esquema B-1

en la que

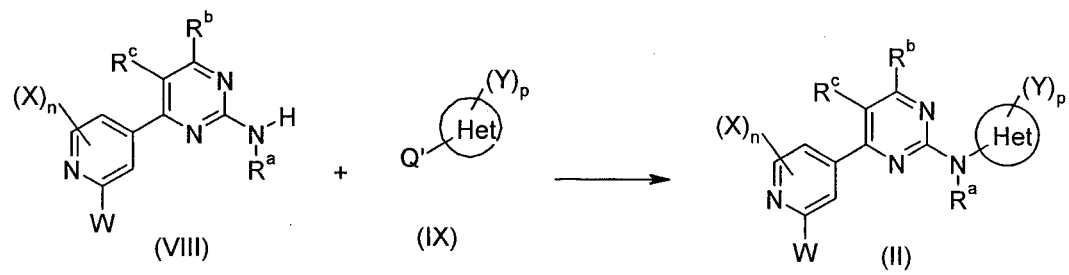
- siendo W, X, Y, n, R^a, R^b, R^c, Het como se define en la presente memoria;
- Q representa un átomo de hidrógeno o un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, un alquil C₁-C₆ -sulfenilo, un haloalquil C₁-C₆-sulfenilo; un fenilsulfenilo sustituido o no sustituido, un alquil C₁-C₆-sulfonato, un haloalquil C₁-C₆-sulfonato; un fenilsulfonato sustituido o no sustituido y que comprende

hacer reaccionar un compuesto de fórmula (VI) con un derivado de amino de fórmula (VII) para dar un compuesto de fórmula (II), opcionalmente en presencia de un catalizador, preferiblemente un catalizador de un metal de transición, tales como las sales de paladio o los complejos por ejemplo cloruro de paladio (II), acetato de paladio (II), tetrakis-(trifenilfosfina) paladio (0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina) paladio (II), tris(dibencilidenacetona) dipaladio (0), bis(dibencilidenacetona) de paladio (0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio (II). Como alternativa el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción por separado añadiendo a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando del complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(diciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfin)bifenilo, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato sódico, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(diciclohexilfosfina)butano, 1,2-bis-(diciclohexilfosfina)etano, 2-(diciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, tris-(2,4-terc-butilfenil)-fosfito, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-di-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-diciclohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-diciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-di-terc-butilfosfina, opcionalmente en presencia de reactivo organometálico tal como reactivo organolítico, por ejemplo *n*-butilo-litio, metil-litio, fenil-litio o reactivo de haluro organomagnesiano (reactivo Grignard) tal como haluro de isopropil-magnesio más preferiblemente tal como el cloruro de

isopropil-magnesio, opcionalmente en presencia de una base, tal como una base inorgánica u orgánica, preferiblemente hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos, de metal alcalino o metal alcalinotérreo tal como el hidruro sódico, amida sódica, diisopropilamida de litio, cloruro de 2,2,6,6-tetrametilpiperidilmagnesio, hexametildisilazida de litio, metanolato sódico, etanolato sódico, terc-butanolato potásico, acetato sódico, acetato potásico, acetato cálcico, hidróxido sódico, hidróxido potásico, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico, carbonato de cesio o carbonato amónico; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU), opcionalmente en presencia de una sal metálica tal como una sal de metal alcalinotérreo, una sal de metal alcalino, una sal de metal de transición tal como una sal de litio, preferiblemente un haluro de litio, más preferiblemente cloruro de litio, tal como una sal de cobre, preferiblemente una sal de cobre (I) tales como cloruro de cobre (I), cianuro de cobre (I), en presencia de un agente oxidante tales como oxígeno, 3,3',5,5'-tetra-terc-butildifenoquinona, 2,3-dicloro-5,6-diciano-1,4-benzoquinona (DDQ) y 2,3,5,6-tetracloro-1,4-benzoquinona (cloranil).

Alternativamente, se proporciona un procedimiento C según la invención para la preparación de un compuesto de fórmula (II) en la que W, X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c, Het son como se define en la presente memoria; y que comprende

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



- en la que
- siendo W, X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c, Het como se define en la presente memoria;
 - Q' representa un grupo saliente tal como un átomo de halógeno, un alquil C₁-C₆-sulfenilo, un haloalquil C₁-C₆-sulfenilo; un fenilsulfenilo sustituido o no sustituido, un alquil C₁-C₆-

sulfonato, un haloalquil C₁-C₆-sulfonato; un fenilsulfonato sustituido o no sustituido y que comprende

hacer reaccionar un derivado amino de fórmula (VIII) con un compuesto de fórmula (IX) para dar un compuesto de fórmula (II), opcionalmente en presencia de un catalizador, preferiblemente un catalizador de un metal de transición, tales como las sales de paladio o los complejos por ejemplo cloruro de paladio (II), acetato de paladio (II), tetrakis-(trifenilfosfina) paladio (0), dicloruro de bis-(trifenilfosfina) paladio (II), tris(dibencilidenacetona) dipaladio (0), bis(dibencilidenacetona) paladio (0) o cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio (II). Como alternativa el complejo de paladio se genera directamente en la mezcla de reacción por separado añadiendo a la mezcla de reacción una sal de paladio y un ligando del complejo tal como una fosfina, por ejemplo trietilfosfina, tri-terc-butilfosfina, triciclohexilfosfina, 2-(díciclohexilfosfina)bifenilo, 2-(di-terc-butilfosfin)bifenilo, 2-(díciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, trifenilfosfina, tris-(o-tolil)fosfina, 3-(difenilfosfino)benzolsulfonato sódico, tris-2-(metoxifenil)fosfina, 2,2'-bis-(difenilfosfina)-1,1'-binaftilo, 1,4-bis-(difenilfosfina)butano, 1,2-bis-(difenilfosfina)etano, 1,4-bis-(díciclohexilfosfina)butano, 1,2-bis-(díciclohexilfosfina)etano, 2-(díciclohexilfosfina)-2'-(N,N-dimetilamino)-bifenilo, bis(difenilfosfino)ferroceno, tris-(2,4-terc-butilfenil)-fosfito, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-di-terc-butilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-díciclohexilfosfina, (R)-(-)-1-[(S)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-díciclohexilfosfina, (S)-(+)-1-[(R)-2-(difenilfosfino)ferrocenil]etil-di-t-butilfosfina, opcionalmente en presencia de un reactivo organometálico tal como un reactivo organolítico por ejemplo *n*-butil-litio, metil-litio, fenil-litio o un reactivo haluro organomagnesiano (reactivo Grignard) tal como el haluro isopropil-magnesio por ejemplo cloruro de isopropil-magnesio, opcionalmente en presencia de una base, tal como una base inorgánica o orgánica; preferiblemente hidruros, hidróxidos, amidas, alcoholatos, acetatos, carbonatos o bicarbonatos de metal alcalinotérreo o de metal alcalino, tales como el hidruro de sodio, amida sódica, diisopropilamida de litio, cloruro de 2,2,6,6-tetrametilpiperidilmagnesio, hexametildisilazida de litio, metanolato de sodio, etanolato de sodio, terc-butanolato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, acetato de calcio, hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico, carbonato de cesio o carbonato amónico; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina (TEA), tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-bencilamina, N,N-diisopropil-etilamina (DIPEA), piridina, N-metilpiperidina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU), opcionalmente en presencia de una sal metálica tal como una sal de metal alcalinotérreo, una sal de metal alcalino, una sal de metal de

transición tal como una sal de litio, preferiblemente un haluro de litio, más preferiblemente cloruro de litio, tal como una sal de cobre, preferiblemente una sal de cobre (I) tales como cloruro de cobre (I), cianuro de cobre (I), en presencia de un agente oxidante tales como oxígeno, 3,3',5,5'-tetraterc-butildifenoquinona, 2,3-dicloro-5,6-diciano-1,4-benzoquinona (DDQ) y 2,3,5,6-tetracloro-1,4-benzoquinona (cloranil).

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

Cuando se llevan a cabo los procedimientos P1, A, B y C según la invención, las temperaturas de reacción pueden variar independientemente dentro de un intervalo relativamente amplio. En general, los procedimientos de acuerdo con la invención se realizan a temperaturas comprendidas entre -80°C y 250°C.

Generalmente, los procesos P1, A, B y C de acuerdo con la invención se realizan independientemente a presión atmosférica. Sin embargo, en cada caso, es también posible operar a presión elevada o reducida.

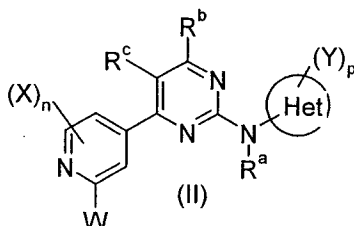
El desarrollo se realiza por métodos habituales. Generalmente, la mezcla de reacción se trata con agua y la fase orgánica puede separarse y, después de secar, se concentra a presión reducida. Si procede, el residuo restante puede liberarse por los métodos convencionales, tal como por cromatografía o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

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

5

Todavía en un aspecto adicional, la presente invención se refiere a compuestos de fórmula (II) útiles como compuestos intermedios o materiales para el procedimiento de preparación según la invención.

La presente invención de este modo proporcionar compuesto de fórmula (II)



10

en la que

- W representa un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil C₁-C₆-sulfonato, un haloalquil C₁-C₆-sulfonato; un fenilsulfonato sustituido o no sustituido y
- siendo X, Y, n, R^a, R^b, R^c y Het como se define en la presente memoria;

15

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

20

La expresión "cantidad eficaz y no fitotóxica" significa una cantidad de composición según la invención que es suficiente para combatir o destruir los hongos presentes o susceptibles de aparecer en los cultivos y que no conlleva ningún síntoma apreciable de fitotoxicidad para dichos cultivos. Dicha cantidad puede variar en un amplio intervalo dependiendo del hongo que se va a combatir, el tipo de cultivo, las condiciones climáticas y los compuestos incluidos en la composición fungicida según la invención. Esta cantidad se puede determinar por ensayos en campo

25

sistemáticos, que están dentro de las cualidades de un experto en la materia.

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

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

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

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

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

Las composiciones según la invención se pueden usar en diversas formas tales como dosificador de aerosol, suspensión en cápsulas, concentrado para fumigación en frío, polvo para espolvorear, concentrado emulsionable, emulsión de aceite en agua, emulsión de agua en aceite, granulados encapsulados, granulados finos, concentrado fluido para el tratamiento de semillas, gas (a presión),

5 producto generador de gas, granulados, concentrado para fumigación en caliente, macrogranulados, microgranulados, polvo dispersable en aceite, concentrado fluido miscible en aceite, líquido miscible en aceite, pasta, barritas vegetales, polvo para tratamiento de semillas en seco, semillas revestidas con un pesticida, concentrado soluble, polvo soluble, solución para el

10 tratamiento de semillas, concentrado en suspensión (concentrado fluido), líquido de muy bajo volumen (ulv), suspensión de muy bajo volumen (ulv), granulado o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para tratamiento en suspensión, granulados o comprimidos dispersables en agua, polvo dispersable en agua para el tratamiento de la suspensión, gránulos o comprimidos solubles en agua, polvo para tratamiento de semillas soluble en agua y polvo humectable. Estas composiciones incluyen no sólo las composiciones que están listas para ser

15 aplicadas a la planta o semilla que se va a tratar por medio de un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo atomizador o pulverizador, sino también las composiciones concentradas comerciales que deben diluirse antes de la aplicación al cultivo.

Los compuestos de acuerdo con la invención pueden mezclarse también con una o más sustancias activas insecticidas, fungicidas, bactericidas, atrayentes, acaricidas o feromonas u otros

20 compuestos con actividad biológica. Las mezclas así obtenidas tienen normalmente un espectro de actividad ampliado. Las mezclas con otros compuestos fungicidas son particularmente ventajosas.

Ejemplos de fungicidas acompañantes de la mezcla adecuados pueden seleccionarse en las listas siguientes:

25 B1) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de ácidos nucleicos como: benalaxil, benalaxil-M, bupirinato, chiralaxil, clozilación, dimetirimol, etirimol, furalaxil, himexazol, metalaxil-M, ofurace, oxadixil, ácido oxolínico ;

B2) un compuesto capaz de inhibir la mitosis y división celular como benomil, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicurón, tiabendazol, tiofanato-metilo, zoxamida;

30 B3) un compuesto capaz de inhibir la respiración, por ejemplo
 como inhibidor de la respiración-CI como diflumetorim;
 como inhibidor de la respiración CII como boscalid, carboxina, fenfuram, flutolanil, furametpir, mepronil, oxicarboxina, pentiopirad, tifluzamida;

como inhibidor de la respiración CIII como: azoxistrobin, ciazofamid, dimoxistrobin, enestrobin, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobin, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobin, piraclostrobin, picoxistrobin, trifloxistrobin;

B4) un compuesto capaz de actuar como desacoplador como dinocap, fluazinam;

5 B5) un compuesto capaz de inhibir la producción de ATP como: acetato de fentín, cloruro de fentín, hidróxido de fentín, siltiofam;

B6) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de AA y proteínas como andoprim, blasticidina-S, ciprodinil, kasugamicina, hidrocloreto de kasugamicina hidratado, mepanipirim, pirimetanil;

10 B7) un compuesto capaz de inhibir la transducción de señales como: fenpiclonil, fludioxonil, quinoxifeno;

B8) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de lípidos y membranas como: clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolin, pirazofós, edifenfós, iprobenfós (IBP), isoprotiolano, tolclófós-metilo, bifenilo, yodocarb, propamocarb, propamocarb-hidrocloreto;

15 B9) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de ergosterol como fenhexamid, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanil, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalil, sulfato de imazalil, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol, aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidin, espiroxamina, naftifina, piributicarb, terbinafina;

20 B10) un compuesto capaz de inhibir la síntesis de la pared celular como: bentiavalicarb, bialafós, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas, polioxorim, validamicina A;

B11) un compuesto capaz de inhibir la biosíntesis de melanina como carpropamid, diclocimet, fenoxanil, ftalida, piroquilon, triciclazol;

B12) un compuesto capaz de inducir una defensa del hospedador como acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinil;

30 B13) un compuesto capaz de actuar en múltiples sitios tal como mezcla de Bordeaux, captafol, captán, clorotalonil, naftenato de cobre, óxido de cobre, oxicloruro de cobre, preparaciones de cobre tales como hidróxido de cobre, sulfato de cobre, diclofluanid, ditianón, dodina, base libre de dodina, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, albesilato de

iminocadina, triacetato de iminocadina, mancozeb, mancozeb, maneb, metiram, metiram cinc, oxina-cobre, propineb, azufre y preparaciones de azufre incluyendo polisulfuro cálcico, tiram, tolilfluanid, zineb y ziram;

- B14) un compuesto seleccionado de la lista consistente en: amibromdol, bentiazol, betoxazina
- 5 capsimicina carvona, quinometionat, cloropicrín, cufraneb, cilufenamid, cioxanil, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofén, diclorán, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, etaboxam, ferimzón, flumetover, flusulfamida, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, fluopicolida, fluoroimida, hexaclorobenzeno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, isotiocianato de metilo, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel,
- 10 nitrotal-isopropilo, octilina, oxamocarb, oxifentiina, pentaclorofenol y sales, 2-fenilfenol y sales, ácido fosforoso y sus sales, piperalín, propanosina-sodio, proquinazid, pirrolnitrina, quintozeno, tecloftalam, tecnazeno, triazóxido, triclámida, zarilamid y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metil-bencenosulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincaboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, 3,4,5-tricloro-2,6-piridindicarbonitrilo, 2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-.alfa-(metoximetileno)-bencenocetato de metilo, 4-cloro-alfa-propinilo-N-[2-[3-metoxi-4-(2-propinilo)fenil]etil]-bencenoacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]-butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil][1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-benzopiranon-4-ona, N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetil-ciclohexil)-3-formilamino-2-hidroxi-benzamida, 2-[[[1-[3(1-fluoro-2-feniletil)oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]-.alfa-(metoxiimino)-N-metil-.alfa-E-benzenoacetamida, N-[2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil]-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil]-1H-imidazol-1-carbotioico.
- 15
- 20
- 25
- 30

La composición según la invención que comprende una mezcla de un compuesto de fórmula (I) con un compuesto bactericida puede ser también particularmente ventajosa. Ejemplos de compuestos asociados de mezcla de bactericidas adecuados pueden seleccionarse en la siguiente lista: bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilina, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomicina, tecloftalam, sulfato de cobre y otras preparaciones de cobre.

Los compuestos de fórmula (I) y la composición fungicida según la invención pueden usarse para combatir de forma terapéutica o preventiva los hongos fitopatógenos de las plantas o de los cultivos.

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

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

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

ejemplo, soja), *Solanaceae* sp. (por ejemplo, patatas), *Chenopodiaceae* sp. (por ejemplo, remolacha); cultivos hortícolas y arbóreos; así como los homólogos genéticamente modificados de estos cultivos.

- 5 Entre las enfermedades de plantas o cultivos que se pueden proteger por el método según la invención, se pueden mencionar:
- Enfermedades por mildiu tales como:
Enfermedades por *Blumeria*, provocadas por ejemplo por *Blumeria graminis*;
enfermedades por *Podosphaera*, producidas por ejemplo por *Podosphaera leucotricha*;
10 enfermedades por *Sphaerotheca*, producidas por ejemplo por *Sphaerotheca fuliginea*;
enfermedades por *Uncinula*, provocadas por ejemplo por *Uncinula necator*;
 - Enfermedades por roya, tales como:
Enfermedades por *Gymnosporangium*, producidas por ejemplo por *Gymnosporangium sabinae*;
15 enfermedades por *Hemileia*, producidas por ejemplo por *Hemileia vastatrix*;
enfermedades por *Phakopsora*, provocadas por ejemplo por *Phakopsora pachyrhizi* o *Phakopsora meibomia*;
Enfermedades por *Puccinia*, producidas por ejemplo por *Puccinia recondita* ;
enfermedades por *Uromyces*, producidas por ejemplo por *Uromyces appendiculatus*;
 - 20 • Enfermedades por oomicetos tales como:
Enfermedades por *Bremia*, provocadas por ejemplo por *Bremia lactucae*;
enfermedades por *Peronospora*, provocadas por ejemplo por *Peronospora pisi* o *P. brassicae*;
enfermedades por *Phytophthora*, producidas por ejemplo por *Phytophthora infestans*;
25 enfermedades por *Plasmopara*, causadas por ejemplo por *Plasmopara viticola*;
enfermedades por *Pseudoperonospora*, producidas por ejemplo por *Pseudoperonospora humuli*
Pseudoperonospora cubensis ;
 - enfermedades por *Pythium*, provocadas por ejemplo por *Pythium ultimum*;
 - 30 • Enfermedades por manchas foliares, enrojecimiento foliar y tizón foliar, tales como:
Enfermedades por *Alternaria*, producidas por ejemplo por *Alternaria solani*;
enfermedades por *Cercospora*, provocadas por ejemplo por *Cercospora beticola*;

- enfermedades por *Cladosporium*, producidas por ejemplo por *Cladosporium cucumerinum*;
- enfermedades por *Cochliobolus*, producidas por ejemplo por *Cochliobolus sativus*;
- 5 enfermedades por *Colletotrichum*, producidas por ejemplo por *Colletotrichum lindemuthianum*;
- enfermedades por *Cycloconium*, producidas por ejemplo por *Cycloconium oleaginum*;
- enfermedades por *Diaporthe*, producidas por ejemplo por *Diaporthe citri*;
- Enfermedades por *Elsinoe*, producidas por ejemplo por *Elsinoe fawcettii* ;
- enfermedades por *Gloeosporium*, producidas por ejemplo por *Gloeosporium laeticolor*;
- 10 enfermedades por *Glomerella*, provocadas por ejemplo por *Glomerella cingulata*;
- enfermedades por *Guignardia*, producidas por ejemplo por *Guignardia bidwelli*;
- enfermedades por *Leptosphaeria*, producidas por ejemplo por *Leptosphaeria maculans*;
- Leptosphaeria nodorum*;
- enfermedades por *Magnaporthe*, producidas por ejemplo por *Magnaporthe grisea*;
- 15 enfermedades por *Mycosphaerella*, provocadas por ejemplo por *Mycosphaerella graminicola*; *Mycosphaerella arachidicola*; *Mycosphaerella fijiensis*;
- enfermedades por *Phaeosphaeria*, producidas por ejemplo por *Phaeosphaeria nodorum*;
- enfermedades por *Pyrenophora*, producidas por ejemplo por *Pyrenophora teres*;
- Enfermedades por *Ramularia*, producidas por ejemplo por *Ramularia collo-cygni* ;
- 20 Enfermedades por *Rhynchosporium*, producidas por ejemplo por *Rhynchosporium secalis* ;
- enfermedades por *Septoria*, producidas por ejemplo por *Septoria apii* o *Septoria lycopersici*;
- enfermedades por *Typhula*, producidas por ejemplo por *Typhula incarnata*;
- 25 enfermedades por *Venturia*, producidas por ejemplo por *Venturia inaequalis*;
- Enfermedades de la raíz y el tallo, tales como :
Enfermedades por *Corticium*, producidas por ejemplo por *Corticium graminearum* ;
enfermedades por *Fusarium*, producidas por ejemplo por *Fusarium oxysporum*;

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

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

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

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

- Enfermedades de la mazorca y de la panícula, tales como:
Enfermedades por *Alternaria*, producidas por ejemplo por *Alternaria spp.* ;
Enfermedades por *Aspergillus*, producidas por ejemplo por *Aspergillus flavus* ;
5 enfermedades por *Cladosporium*, producidas por ejemplo por *Cladosporium spp.* ;
enfermedades por *Claviceps*, provocadas por ejemplo por *Claviceps purpurea* ;
Enfermedades por *Fusarium*, producidas por ejemplo por *Fusarium culmorum* ;
enfermedades por *Gibberella*, producidas por ejemplo por *Gibberella zeae* ;
enfermedades por *Monographella*, producidas por ejemplo por *Monographella nivalis* ;
- Enfermedades por carbón y tizón, tales como:
10 enfermedades por *Sphacelotheca*, provocadas por ejemplo por *Sphacelotheca reiliana* ;
Enfermedades por *Tilletia*, producidas por ejemplo por *Tilletia caries* ;
enfermedades por *Urocystis*, producidas por ejemplo por *Urocystis occulta* ;
enfermedades por *Ustilago*, producidas por ejemplo por *Ustilago nuda* ;
- Enfermedades por podredumbre y moho de la fruta tales como :
15 Enfermedades por *Aspergillus*, producidas por ejemplo por *Aspergillus flavus* ;
Enfermedades por *Botrytis*, producidas por ejemplo por *Botrytis cinerea* ;
Enfermedades por *Penicillium*, producidas por ejemplo por *Penicillium expansum* ;
enfermedades por *Sclerotinia*, producidas por ejemplo por *Sclerotinia sclerotiorum* ;
Enfermedades por *Verticillium*, producidas por ejemplo por *Verticillium alboatrum* ;
- Enfermedades de semillas y putrefacción del suelo, mohos, marchitamiento, descomposición y encharcamiento tales como:
20 Enfermedades por *Fusarium*, producidas por ejemplo por *Fusarium culmorum* ;
enfermedades por *Phytophthora*, producidas por ejemplo por *Phytophthora cactorum* ;
enfermedades por *Pythium*, producidas por ejemplo por *Pythium ultimum* ;
25 enfermedades por *Rhizoctonia*, producidas por ejemplo por *Rhizoctonia solani* ;
enfermedades por *Sclerotium*, producidas por ejemplo por *Sclerotium rolfsii* ;
enfermedades por *Microdochium*, producidas por ejemplo por *Microdochium nivale* ;
- Enfermedades por chancro, retama y puntiseco tales como:
Enfermedades por *Nectria*, provocadas por ejemplo por *Nectria galligena* ;
- enfermedades por tizón, tales como:
30 enfermedades por *Monilinia*, provocadas por ejemplo por *Monilinia laxa* ;
Enfermedades por ampolla de la hoja o encrespamiento de la hoja, tales como:
enfermedades por *Taphrina*, producidas por ejemplo por *Taphrina deformans* ;

Enfermedades de deterioro de plantas madereras tales como:

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

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

enfermedad de los olmos holandeses, producida por ejemplo por *Ceratocystis ulmi*;

- 5 • enfermedades de flores y semillas tales como:

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

- Enfermedades de tubérculos tales como:

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

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

La dosis de compuesto activo aplicada normalmente en el método de tratamiento según la

20 invención está comprendida general y ventajosamente entre 10 y 800 g/ha, preferiblemente, entre 50 y 300 g/ha para aplicaciones en tratamiento foliar. La dosis de sustancia activa aplicada es general y ventajosamente de 2 a 200 g por 100 kg de semillas, preferentemente de 3 a 150 g por 100 kg de semillas en el caso del tratamiento de semillas.

Se entiende claramente que las dosis indicadas en la presente memoria se proporcionan como

25 ejemplos ilustrativos del método de acuerdo con la invención. Un especialista en la técnica sabrá cómo adaptar la dosis de aplicación, especialmente según la naturaleza de la planta o del cultivo a tratar.

La composición fungicida según la invención también se puede usar en el tratamiento de

30 organismos modificados genéticamente con los compuestos según la invención o las composiciones agroquímicas según la invención. Las plantas modificadas genéticamente son plantas en cuyo genoma se ha integrado de forma estable un gen heterólogo que codifica una proteína de interés. La expresión "gen heterólogo que codifica una proteína de interés" significa

básicamente genes que proporcionan a la planta transformada nuevas propiedades agrónomas, o genes para mejorar la calidad agrónoma de la planta modificada.

- Los compuestos o mezclas según la invención pueden utilizarse también para la preparación de una composición útil para tratar en forma curativa o preventiva enfermedades micóticas en seres
- 5 humanos o animales tales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, tricofitosis y candidiasis o enfermedades provocadas por *Aspergillus spp.*, por ejemplo *Aspergillus fumigatus*.

Varios aspectos de la invención se ilustrarán a continuación con relación a la siguiente tabla de ejemplos A del compuesto y la siguiente preparación o ejemplos de eficacia.

- 10 La tabla siguiente ilustra de una manera no limitativa ejemplos de compuestos según la invención.
- En la tabla siguiente, M+H (o M-H) significa el pico del ión molecular, más o menos 1 u.m.a. (unidad de masa atómica) respectivamente, observado en espectroscopia de masas y M (Apcl+) significa el pico del ión molecular que se encontró por ionización química a presión atmosférica positiva en espectroscopia de masas.
- 15 En la tabla siguiente, los valores log P se determinaron de acuerdo con la Directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Resolución) en una columna de fase inversa (C 18), usando el método descrito a continuación:
- Temperatura: 40°C; Fases móviles: Acetonitrilo y ácido fórmico acuoso al 0,1%; gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 90% de acetonitrilo.
- 20 La calibración se realizó usando alcan-2-onas sin ramificar (que comprenden de 3 a 16 átomos de carbono) con valores de log P conocidos (determinación de los valores de log P por los tiempos de retención usando interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).
- Los valores máx. de lambda se determinaron en el máximo de las señales cromatográficas usando el espectro UV de 190 nm a 400 nm.

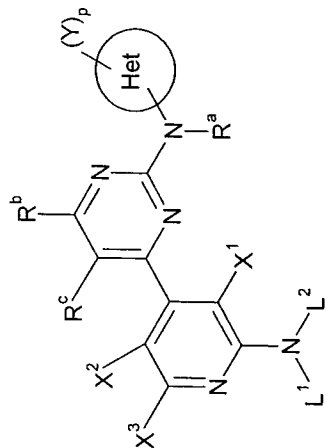
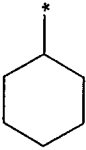
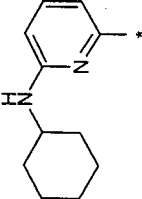
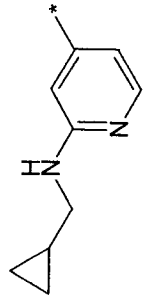
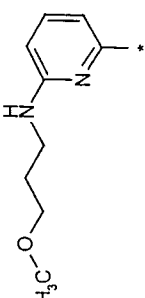
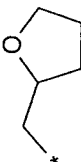
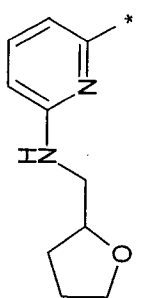
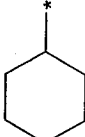
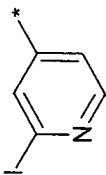
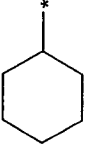
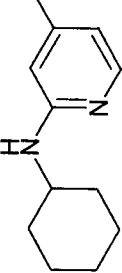
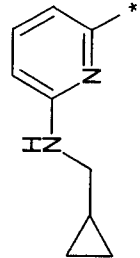
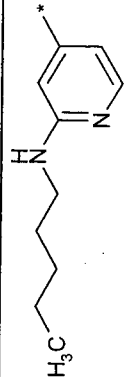
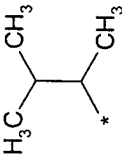
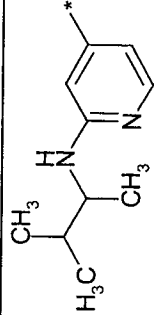
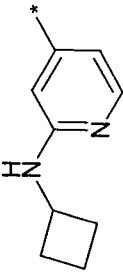


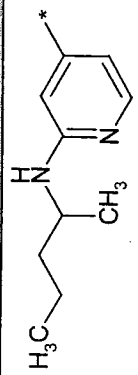
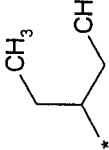
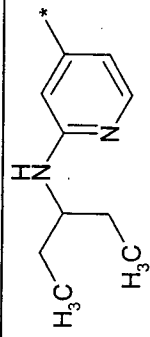
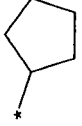
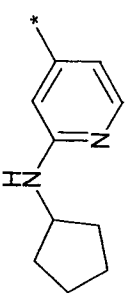
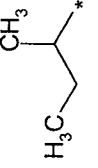
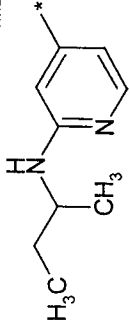
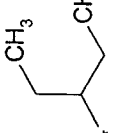
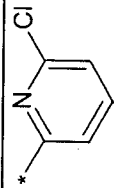
Tabla A -

Numero de ejemplo	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) _p	X ¹	X ²	X ³	P.M. medido	log p HCOOH
1	H	H ₃ C—*	Metilo	H	H		H	H	H		1,24
2	H		H	H	H		H	H	H		1,35
3	H		H	H	H		H	H	H	194,5	1,12

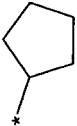
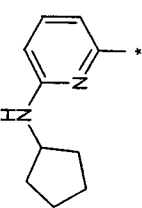
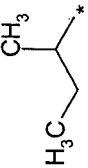
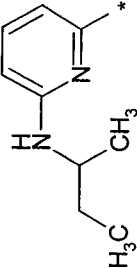
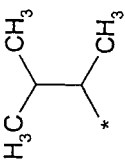
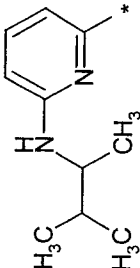
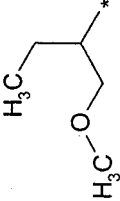
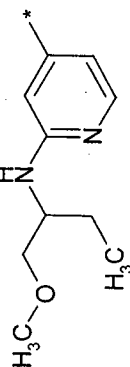
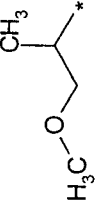
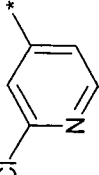
73

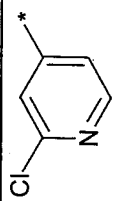
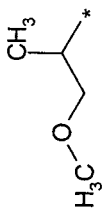
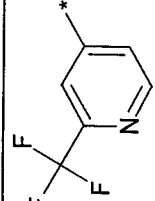
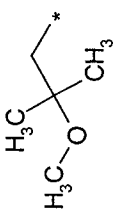
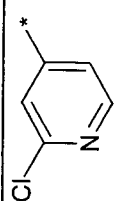
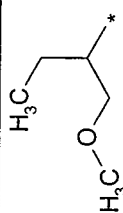
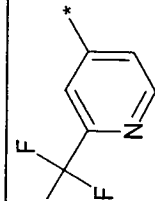
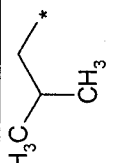
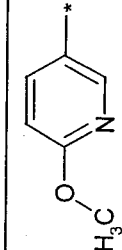
Número de ejemplo	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p	X ¹	X ²	X ³	P.M. medido	log p HCOOH
4	H		H	H	H		H	H	H	444	1,70
5	H		H	H	H		H	H	H	388	0,97
6	H		H	H	H		H	H	H	424	0,83
7	H		H	H	H		H	H	H	225	0,86
8	H		H	H	H		H	H	H	381	1,64

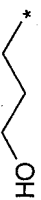
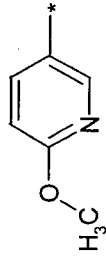
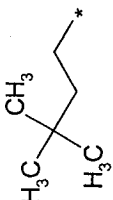
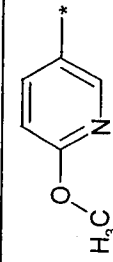
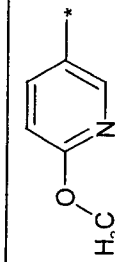
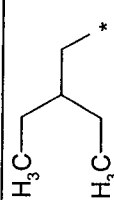
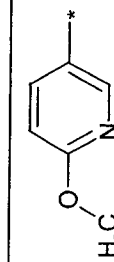
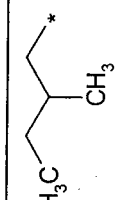
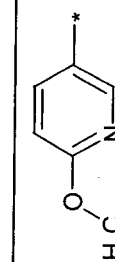
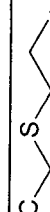
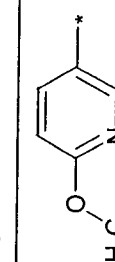
Número de ejemplo	R ³	L ¹	L ²	R ^p	R ^c	Het (Y)_p	X1	X2	X ³	P.M. medido	log p HCOOH
15	H		H	H	H		H	H	H	444	1,52
16	H		H	H	H		H	H	H	388	0,96
17	H		H	H	H		H	H	H	418	1,57
18	H		H	H	H		H	H	H	420	1,34
19	H		H	H	H		H	H	H	388	1,05

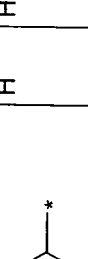
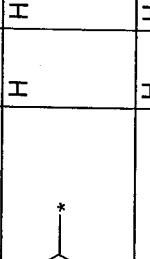
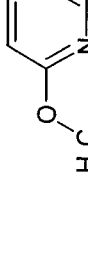
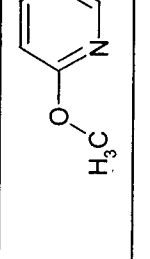
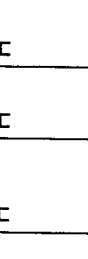
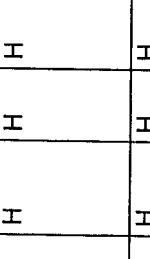
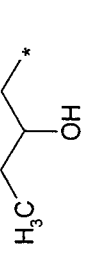
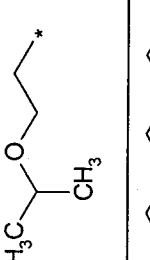
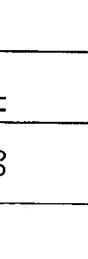
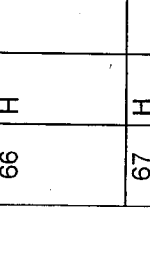
Número de ejemplo	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	Het (Y)^p	X1	X2	X ³	P.M. medido	log p HCOOH
20	H		H	H	H		H	H	H	420	1,43
21	H		H	H	H		H	H	H	420	1,33
22	H		H	H	H		H	H	H	416	1,22
23	H		H	H	H		H	H	H	392	1,10
24	H		H	H	H		H	H	H	369	2,09

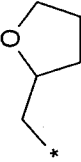
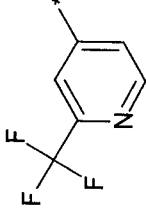
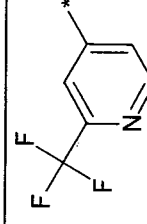
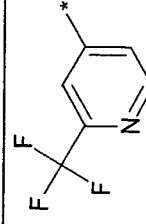
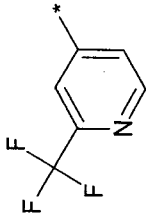
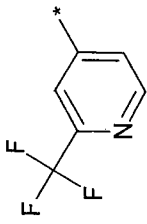
Número de ejemplo	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p	X ¹	X ²	X ³	P.M. medido	log p H _{000H}
25	H		H	H	H		H	H	H	355	2,00
26	H		H	H	H		H	H	H	369	2,15
27	H		H	H	H		H	H	H	383	1,64
28	H		H	H	H		H	H	H	384	1,42
29	H		H	H	H		H	H	H	385	1,85
30	H		H	H	H		H	H	H	420	1,47

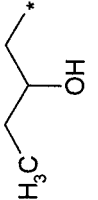
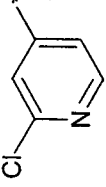
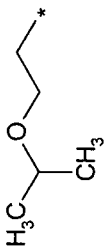
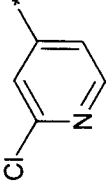
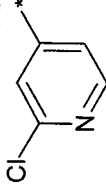
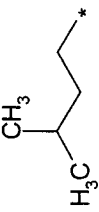
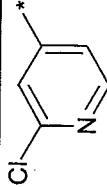
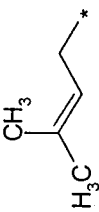
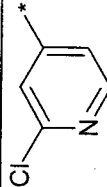
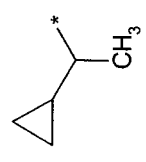
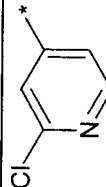
Número de ejemplo	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	Het (M)_p	X1	X2	X ³	P.M. medido	log p _{HCOOH}
31	H		H	H	H		H	H	H	208,5	1,23
32	H		H	H	H		H	H	H	196,5	1,23
33	H		H	H	H		H	H	H	420	1,43
34	H		H	H	H		H	H	H	452	1,10
35	H		H	H	H		H	H	H	371	1,34

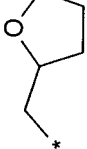
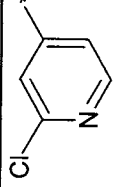
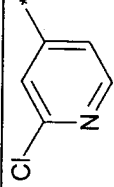
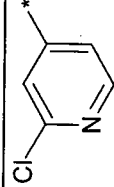
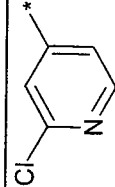
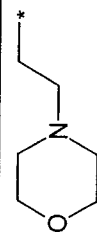
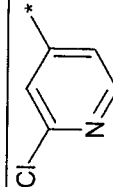
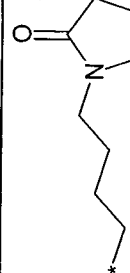
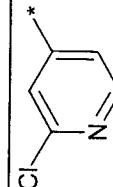
Numero de ejemplo	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	Het (Y)_p	X ¹	X ²	X ³	P _M medido	log p HCOOH
42	H		H	H	H		H	H	H	385	
43	H		H	H	H		H	H	H	405	
44	H		H	H	H		H	H	H	385	
45	H		H	H	H		H	H	H	419	
46	H		H	H	H		H	H	H	351	1,42

Numero de ejemplo	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p	X ¹	X ²	X ³	P M medido	log P HCOOH
53	H		H	H	H		H	H	H	353	
54	H		H	H	H		H	H	H	379	
55	H		H	H	H		H	H	H	333	
56	H		H	H	H		H	H	H	379	
57	H		H	H	H		H	H	H	365	
58	H		H	H	H		H	H	H	383	

Numero de ejemplo	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p (Y) ^p	X ¹	X ²	X ³	P.M. medido	log p HCOOH
65	H		H	H	H		H	H	H	367	
66	H		H	H	H		H	H	H	381	
67	H		H	H	H		H	H	H	379	
68	H		H	H	H		H	H	H	365	
69	H		H	H	H		H	H	H	351	
70	H		H	H	H		H	H	H	369	

Número de ejemplo	R ^a	L	L ²	R ^b	R ^c	(Y) _p Het	X1	X2	X ³	P.M. medido	log p HCOOH
87	H		H	H	H		H	H	H	417	
88	H		H	H	H		H	H	H	405	
89	H		H	H	H		H	H	H	419	
90	H		H	H	H		H	H	H	417	
91	H		H	H	H		H	H	H	387	

Número de ejemplo	R ^a	L	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p (Y) _p	X ¹	X ²	X ³	P.M. medido	log p HCOOH
103	H		H	H	H		H	H	H	371	
104	H		H	H	H		H	H	H	385	
105	H		H	H	H		H	H	H	383	
106	H		H	H	H		H	H	H	369	
107	H		H	H	H		H	H	H	367	
108	H		H	H	H		H	H	H	367	

Número de ejemplo	R ^a	L	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p	X ¹	X ²	X ³	P M medido	log p HCOOH
109	H		H	H	H		H	H	H	383	
110	H		H	H	H		H	H	H	371	
111	H		H	H	H		H	H	H	371	
112	H		H	H	H		H	H	H	353	
113	H		H	H	H		H	H	H	412	
114	H		H	H	H		H	H	H	438	

Los siguientes ejemplos ilustran de forma no limitativa la preparación y eficacia de los compuestos de fórmula (I) según la invención.

Preparación de N-(2-cloropiridin-4-il)-4-(2-([1-(metoximetil)propil]amino)piridin-4-il)pirimidin-2-amina (Compuesto 9) según el procedimiento P1

- 5 300 mg de N,4-bis(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-amina (0,94 mmoles), 486 mg de 1-metoxibutan-2-amina (4,71 mmoles), se calentaron a 240°C durante 90 minutos bajo irradiación de microondas en 0,6 ml de 1-metil-2-pirrolidinona. Después del enfriamiento, la mezcla de reacción se vertió en 10 ml de diclorometano, se lavó dos veces con 5 ml de agua. Después de
10 secar sobre sulfato de magnesio, filtración y concentración *al vacío*, el producto en bruto se cromatografió sobre sílice (acetato de etilo / heptano) para dar 0,72 g de N-(2-cloropiridin-4-il)-4-(2-([1-(metoximetil)propil]amino)piridin-4-il)pirimidin-2-amina (rendimiento = 19%).
[M + 1] = 385

15 Preparación de N,4-bis(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-amina (Compuesto de fórmula (II))

Preparación de {(Z)-[(2-cloropiridin-4-il)amino]metililideno}biscarbamato de di-terc-butilo :

- Se diluyeron 20,22 g (0,157 moles) de 4-amino-2-cloropiridina en trietilamina (67 ml) y diclorometano (600 ml) a 0-5°C. Se añadieron a la mezcla de reacción 47g de cloruro de mercurio (II) (0,173 moles) y 50,24 g (0,173 moles) de N,N'-bis(boc)-S-metil-isotiourea, que se
20 agitó a continuación a temperatura ambiente durante 4 días, se filtró en un embudo fritado, se concentró *al vacío* y se cromatografió en sílice (Heptano 90/AcOEt 10) para dar 43,67 g de {(Z)-[(2-cloropiridin-4-il)amino]metililideno}biscarbamato de di-terc-butilo (rendimiento = 71%).
[M + 1] = 371

25 Preparación de bis(trifluoroacetato) de 1-(2-cloropiridin-4-il)guanidina:

- A una solución de 43,67 g (0,117 moles) de {(Z)-[(2-cloropiridin-4-il)amino]metililideno}biscarbamato de di-terc-butilo en diclorometano (800 ml) a temperatura ambiente se añadieron 81,64 ml de ácido trifluoroacético (1,06 moles). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 días, se concentró *al vacío*, se disgregó con 100 ml de
30 pentano, y en reposo cristalizó para dar 51,68 g de bis(trifluoroacetato) de 1-(2-cloropiridin-4-il)guanidina (rendimiento = 99%).
[M + 1-2*CF₃CO₂H] = 171

Preparación de N,4-bis(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-amina:

- 35 A una solución de 6,32 g de 1-(2-cloropiridin-4-il)-3-(dimetilamino)prop-2-en-1-ona (30 mmoles) en 60 ml de 2-propanol se añadieron 2,52 g de hidróxido de sodio (63 mmoles) y 11,96 g de

bis(trifluoroacetato) de 1-(2-cloropiridin-4-il)guanidina (30 mmoles). La mezcla de reacción se calentó a reflujo en agitación durante 20 h. Tras la filtración, se lavó el precipitado con 100 ml de *n*-butanol y 120 ml de *i*Pr₂O y a continuación se secó con aire para dar 4,69 g de N,4-bis(2-cloropiridin-4-il)pirimidin-2-amina (rendimiento = 37%).

5 [M + 1] = 318

Ejemplos Biológicos

Prueba *in vivo* del Ejemplo A en *Peronospora parasitica* (mildiu velloso de crucíferas)

10 Los ingredientes activos probados se preparan por homogeneización en una mezcla de acetona/Tween/DMSO, a continuación se diluyen con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

Las plantas de repollo (variedad Eminence), en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 18-20°C, se tratan en la fase de cotiledón pulverizándolas con la suspensión acuosa descrita anteriormente.

15 Las plantas, utilizadas como referencias, se tratan con una disolución acuosa que no contiene el material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Peronospora parasitica* (50.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de la planta infectada.

20 Las plantas de berza contaminadas se incuban durante 5 días a 20°C, en una atmósfera húmeda.

La clasificación se lleva a cabo 5 días después de la contaminación, comparando con las plantas de referencia.

25 En estas condiciones, se observa buena protección (al menos del 70%) o total a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 9, 11, 13, 15, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 28, 37, 49, 53, 64, 65, 92, 109, 110, 113 y 115.

Ejemplo B: Ensayo *in vivo* en *Botrytis cinerea* (moho gris del pepino)

30 Los ingredientes activos probados se preparan por homogeneización en una mezcla de acetona/Tween/DMSO, a continuación se diluyen con agua para obtener el material activo deseado

Las plantas de pepinillo (variedad Petit vert de Paris) en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana en vasos de arranque y cultivadas a 18-20°C, se tratan en fase de cotiledón Z11 pulverizando con el ingrediente activo preparado como se describió anteriormente.

35 Las plantas, utilizadas como referencias, se tratan con una disolución acuosa que no contiene el material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan depositando gotas de una suspensión acuosa de esporas de *Botrytis cinerea* (150.000 esporas por ml) sobre la superficie superior de las hojas. Las esporas se recogen de un cultivo de 15 días y se ponen en suspensión en una disolución de nutrientes compuesta de:

- 5 - 20 g/l de gelatina;
- 50 g/l de D-fructosa;
- 2 g/l de NH_4NO_3 ;
- 1 g/l de KH_2PO_4 .

10 Las plantas de pepino contaminadas se mantienen durante 5/7 días en una habitación climatizada a 15-11°C (día/noche) y una humedad relativa de 80%.

La clasificación se lleva a cabo 5/7 a días después de la contaminación, en comparación con las plantas de control.

15 En estas condiciones, se observa buena protección (al menos del 70%) o total a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 9, 11, 12, 13, 21, 37, 39, 42, 43, 44, 50, 51, 52, 69, 74, 76 y 106.

Ejemplo C: ensayo *in vivo* sobre *Alternaria brassicae* (mancha de las hojas de las crucíferas)

20 Los ingredientes activos probados se preparan por homogeneización en una mezcla de acetona/Tween/DMSO, a continuación se diluyen con agua para obtener el material activo deseado.

Plantas de rábano (variedad Pernot), en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas entre 18 y 20°C, se tratan en el estadio de cotiledón pulverizándolas con el ingrediente activo preparado como se describió anteriormente.

25 Las plantas, utilizadas como referencias, se tratan con la mezcla acetona/Tween/agua que no contiene el material activo.

Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Alternaria brassicae* (40.000 esporas por cm^3). Las esporas se han obtenido en un cultivo de 12 a 13 días.

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

La clasificación se llevó a cabo 6 a 7 días después de la contaminación, comparando con las plantas de referencia.

En estas condiciones, se observa una buena protección (al menos 70%) a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 9, 11, 13, 37, 43, 57, 110 y 115.

Ejemplo D: Prueba *in vivo* en *Sphaerotheca fuliginea* (polvo de mildiu en calabazas)

Los ingredientes activos probados se preparan por homogeneización en una mezcla de acetona/Tween/DMSO, a continuación se diluyen con agua para obtener el material activo deseado.

- 5 Plantas de pepinillo (variedad vert petit de Paris) en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y cultivadas a 20°C/23°C, se tratan en el estadio de cotiledón Z10 pulverizando con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las plantas, utilizadas como referencias, se tratan con una disolución acuosa que no contiene el material activo. Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa
- 10 de esporas de *Sphaerotheca fuliginea* (100.000 esporas por ml). Se recogen esporas de una planta contaminada. Se incuban plantas de pepinillo contaminadas entre aproximadamente 20°C y 25°C y a humedad relativa del 60 al 70%. La clasificación (% de eficacia) se llevó a cabo 12 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de control.
- 15 En estas condiciones, se observa buena protección (al menos del 70%) o total a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 9, 13, 37 y 39.

Ejemplo E: Prueba *in vivo* sobre *Pyrenophora teres* (manchas reticulares de la cebada)

Los ingredientes activos probados se preparan por homogeneización en una mezcla de acetona/Tween/DMSO, a continuación se diluyen con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

- 20 Las plantas de cebada (variedad Express), sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y cultivadas a 12°C, se tratan en la etapa de 1 hoja (10 cm de altura), pulverizándolas con el ingrediente activo preparado como se describió anteriormente.
- 25 Las plantas, utilizadas como referencias, se tratan con una disolución acuosa que no contiene el material activo. Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Pyrenophora teres* (12.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de un cultivo de 12 días. Las plantas de cebada contaminadas se incuban durante 24 horas a
- 30 aproximadamente 20°C y 100% de humedad relativa y luego durante 12 días a 80% de humedad relativa. La clasificación se lleva a cabo 12 días después de la contaminación, comparando con las plantas de control. En estas condiciones, se observa una buena protección (al menos 70%) a una dosis de 500
- 35 ppm con los siguientes compuestos: 9, 10, 11, 12, 13, 21, 36, 37, 38, 39, 43, 44, 45, 46, 51, 52, 57, 60, 62, 64, 65, 66, 68, 69, 76 y 110.

Ejemplo F : Prueba *in vivo* en *Puccinia recondita* (roya parda)

Los ingredientes activos probados se preparan por homogeneización en una mezcla de acetona/Tween/DMSO, a continuación se diluyen con agua para obtener el material activo deseado.

- 5 Las plantas de trigo (variedad Scipion), en semilleros, sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana y mantenidas a 12°C, se tratan en la etapa de 1 hoja (10 cm de altura), pulverizándolas con la suspensión acuosa descrita anteriormente.

Las plantas, utilizadas como referencias, se tratan con una disolución acuosa que no contiene el material activo.

- 10 Después de 24 horas, las plantas se contaminaron pulverizando sus hojas con una suspensión acuosa de esporas de *Puccinia recondita* (100.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de trigo contaminado de diez días de edad y se suspenden en agua que contiene 2,5 ml/l de tween 80 al 10%. Las plantas de trigo contaminadas se incuban durante 24 horas a 20°C y 100% de humedad relativa y luego durante 10 días a 20°C y 70% de humedad relativa.

- 15 La clasificación se lleva a cabo 10 días después de la contaminación, comparando con las plantas de control.

En estas condiciones, se observa buena protección (al menos del 70%) o total a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 9, 37 y 38.

20 Ejemplo G : Ensayo *in vivo* sobre *Mycosphaerella graminicola* (mancha de las hojas del trigo)

Los ingredientes activos probados se preparan por homogeneización en una mezcla de acetona/Tween/DMSO, a continuación se diluyen con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

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

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

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

- 35 En estas condiciones, se observa buena protección (al menos del 70%) o total a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 9, 13, 15, 21, 34, 37, 39, 51, 66 y 74.

Ejemplo H : ensayo in vivo en *Pyricularia grisea* (quemazón del arroz)

Los ingredientes activos probados se preparan por homogeneización en una mezcla de acetona/Tween/DMSO, a continuación se diluyen con agua para obtener la concentración deseada de material activo.

Las plantas de arroz (variedad Koshihikari), sembradas en un sustrato 50/50 de turba-puzolana en semilleros y cultivadas a 25°C, se tratan en la etapa de 2 hojas (13-15 cm de altura), pulverizándolas con el ingrediente activo preparado como se describió anteriormente. Plantas, utilizadas como referencias, se tratan con la mezcla acetona/Tween/DMSO/agua que no contiene el material activo.

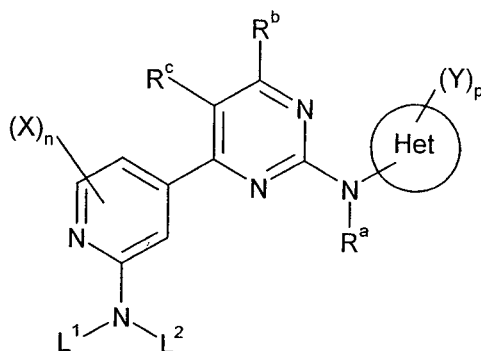
Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Pyricularia grisea* (30,000 esporas por ml). Las esporas se recogen de un cultivo de 17 días y se suspenden en agua que contiene 2,5 ml/l de gelatina. Las plantas de arroz contaminadas se incuban durante 72 horas a aproximadamente 25°C y a 100% de humedad relativa, y a continuación durante 3 días a 25°C a 80% de humedad relativa durante el día y 20% de humedad relativa durante la noche.

La clasificación (% de eficacia) se lleva a cabo 6 días después de la contaminación, en comparación con las plantas de referencia.

En estas condiciones, se observa buena protección (al menos del 70%) o total a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 9.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



(I)

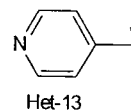
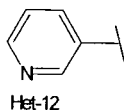
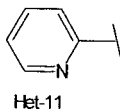
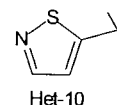
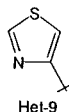
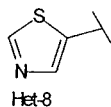
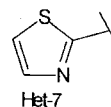
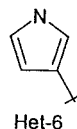
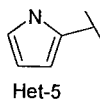
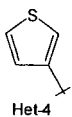
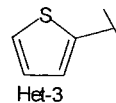
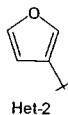
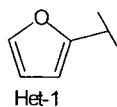
en la que

- Het representa un heterociclo saturado o insaturado, aromático o no aromático de 4, 5, 6 o 7 elementos que comprende hasta cuatro heteroátomos que pueden ser iguales o diferentes;
- Y independientemente representa un átomo de halógeno, un grupo nitro, un grupo hidroxilo, un grupo oxo, un grupo ciano, un grupo amino, un grupo sulfenilo, un grupo pentafluoro-λ⁶-sulfenilo, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxicarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquil C₁-C₆, un alquilo C₁-C₈, un tri(alquil C₁-C₈)sililo, un tri(alquil C₁-C₈)silil-alquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido, un cicloalquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, tri(alquil C₁-C₈)silil-cicloalquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido, un halogenoalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un alquenil C₂-C₈-oxi, un alquinil C₂-C₈-oxi, un alquil C₁-C₈-amino, un di-alquil C₁-C₈-amino, un alcoxi C₁-C₈, un halogenoalcoxi C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-sulfenilo, un halogenoalquil C₁-C₈-sulfenilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenil C₂-C₈-oxi, un halogenoalquenil C₂-C₈-oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquinil C₃-C₈-oxi, un halogenoalquinil C₃-C₈-oxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carbonilo, un halogenoalquil C₁-C₈-carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carbamoilo, un di-alquil C₁-C₈-carbamoilo, un alquil N-C₁-C₈-oxicarbamoilo, un alcoxi C₁-C₈-carbamoilo, un N-alquil C₁-C₈-alcoxi C₁-C₈-carbamoilo, un alcoxi C₁-C₈-carbonilo, un halogenoalcoxi C₁-C₈-carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carboniloxi, un halogenoalquil C₁-C₈-carboniloxi que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carbonilamino, un

- halogenoalquil C₁-C₈-carbonilamino que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-aminocarboniloxi, un di-alquil C₁-C₈-aminocarboniloxi, un alquil C₁-C₈-oxicarboniloxi, un alquil C₁-C₈-sulfenilo, un halogenoalquil C₁-C₈-sulfenilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-sulfinilo, un halogenoalquil C₁-C₈-sulfinilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-sulfonilo, un halógenoalquil C₁-C₈-sulfonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-aminosulfamoilo, un dialquil C₁-C₈-aminosulfamoilo, un (alcoxi C₁-C₆-imino)-alquil C₁-C₆, un alquenil (C₁-C₆-oxiimino)-alquil C₁-C₆, un alquinil (C₁-C₆-oxiimino)-alquil C₁-C₆, un 2-oxopirrolidin-1-ilo, (benciloxiimino)-alquil C₁-C₆ sustituido o no sustituido, alcoxialquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido, halogenoalcoxialquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, benciloxi sustituido o no sustituido, bencilsulfenilo sustituido o no sustituido, bencilamino sustituido o no sustituido, fenoxi sustituido o no sustituido, fenilsulfenilo sustituido o no sustituido o fenilamino sustituido o no sustituido;
- p representa 0, 1, 2, 3, 4, 5 o 6;
 - R^a representa un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un alcoxi C₁-C₈-carbonilo, un halogenoalcoxi C₁-C₈-carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-carbonilo, un halogenoalquil C₁-C₈-carbonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C₁-C₈-sulfonilo, un halogenoalquil C₁-C₈-sulfonilo que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquilo C₁-C₈, un cicloalquilo C₁-C₈, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C₂-C₈, un alquinilo C₂-C₈, un alcoxialquilo C₁-C₈, un halogenoalcoxialquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno;
 - R^b y R^c independientemente representan un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno, un ciano, un alquilo C₁-C₈, un cicloalquilo C₁-C₈, un halogenoalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenocicloalquilo C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno;
 - X independientemente representa un alquilo C₁-C₁₀, un halogenoalquilo C₁-C₁₀, un átomo de halógeno o un ciano;
 - n representa 0, 1, 2 o 3;
 - L¹ y L² independientemente representan un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxí, un grupo amino, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo N-hidroxycarbamoilo, un grupo carbamato, un grupo (hidroxiimino)-alquil C₁-C₆ sustituido o no sustituido, alquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, tri(alquil C₁-C₈-)sililo, tri(alquil C₁-C₈)silil-alquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido, cicloalquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, tri(alquil C₁-C₈)silil-cicloalquil C₁-

C₈ sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquenilo C₂-C₈, alquinilo C₂-C₈ sustituido o no sustituido, alquilamino C₁-C₈ sustituido o no sustituido, di-alquil C₁-C₈-amino sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-C₈ sustituido o no sustituido, halogenoalcoxi C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquenil C₂-C₈-oxi sustituido o no sustituido, alquinil C₂-C₈-oxi sustituido o no sustituido, alquenil C₂-C₈-oxi sustituido o no sustituido, halogenoalquenil C₂-C₈-oxi sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquinil C₃-C₈-oxi sustituido o no sustituido, halogenoalquinil C₃-C₈-oxi sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carbonilo sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-carbonilo sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido, di-alquil C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido, N-alquil C₁-C₈-oxicarbamoilo sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido, N-alquil C₁-C₈-alcoxi C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-C₈-carbonilo sustituido o no sustituido, halogenoalcoxi C₁-C₈-carbonilo sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carboniloxi sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-carboniloxi sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carbonilamino sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-carbonilamino sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-aminocarboniloxi sustituido o no sustituido, di-alquil C₁-C₈-aminocarboniloxi sustituido o no sustituido, alquil C₁-C₈-oxicarboniloxi sustituido o no sustituido, alquil C₁-C₈-sulfenilo sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-sulfenilo sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-sulfinilo sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-sulfinilo sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-sulfonilo sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-sulfonilo sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-aminosulfamoilo sustituido o no sustituido, di-alquil C₁-C₈-aminosulfamoilo sustituido o no sustituido, (alcoxi C₁-C₆-imino)-alquil C₁-C₆ sustituido o no sustituido, (alquenil C₁-C₆-oxiimino)-alquil C₁-C₆ sustituido o no sustituido, (alquinil C₁-C₆-oxiimino)-alquil C₁-C₆ sustituido o no sustituido, (2-oxopirrolidin-1-il) alquil C₁-C₈, (2-oxopirrolidin-1-il) halogenoalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopiperidin-1-il) alquil C₁-C₈, (2-oxopiperidin-1-il) halogenoalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il) alquil C₁-C₈, (2-oxoazepan-1-il) halogenoalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, (benciloxiimino)-alquil C₁-C₆ sustituido o no sustituido;

- L^1 y L^2 pueden formar conjuntamente un heterociclo que incluye N, de 4, 5, 6 o 7 elementos sustituido o no sustituido, que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados independientemente en la lista consistente en N, O, S;
- 5 así como sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloides y sus isómeros ópticamente activos o geométricos; con la condición de que esté excluido el compuesto siguiente: 4-[2-(etilamino)-4-piridinil]-N-[5-(-piperazinil)-2-piridinil]-2-pirimidinamina.
2. Un compuesto según la reivindicación 1 en el que Het representa un heterociclo saturado o insaturado, aromático o no aromático seleccionado en la lista consistente en:
- 10



15

3. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2 en el que Y representa un átomo de halógeno, un grupo ciano, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo (hidroxiimino)-alquil C_1-C_6 sustituido o no sustituido, un alquilo C_1-C_8 sustituido o no sustituido, un tri(alquil C_1-C_8)sililo sustituido o no sustituido, un cicloalquilo C_1-C_8 sustituido o no sustituido,
- 20 un alcoxi C_1-C_8 sustituido o no sustituido, un halogenoalcoxi C_1-C_8 sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C_1-C_8 sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alquil C_1-C_8 -carbonilamino sustituido o no sustituido.
4. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 3 en el que Y representa un átomo
- 25 de halógeno, un grupo ciano, un grupo formilamino, un grupo carbamoilo, un grupo (hidroxiimino)-alquil C_1-C_6 sustituido o no sustituido, un alquilo C_1-C_8 sustituido o no sustituido,

un tri(alquil C₁-C₈)silo sustituido o no sustituido, un cicloalquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, un alcoxi C₁-C₈ sustituido o no sustituido, un halogenoalcoxi C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un halogenoalquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno.

5

5. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 4 en el que p representa 0, 1 o 2.

6. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 5, en el que p representa 1.

10 7. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 6, en el que R^a representa un átomo de hidrógeno.

8. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 7 en el que R^b y R^c independientemente representan un átomo de hidrógeno o un átomo de halógeno.

15

9. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 8 en el que R^b y R^c independientemente representan un átomo de hidrógeno.

10. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 9, en el que n representa 0.

20

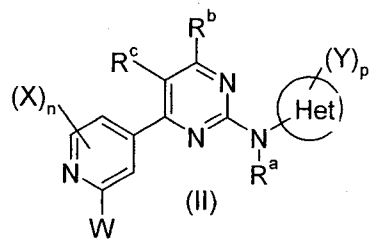
11. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 10 en el que L₁ y L₂ representan independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo ciano, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo formilo, un grupo formiloxi, un grupo formilamino, un grupo (hidroxilimino)-alquil C¹-C₆ sustituido o no sustituido, alquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, tri(alquil C₁-C₈)silo, cicloalquilo C₁-C₈ sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, halogenocicloalquil C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, un alqueno C₂-C₈, alqueno C₂-C₈ sustituido o no sustituido, alquil C₁-C₈-amino sustituido o no sustituido, di-alquil C₁-C₈-amino sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-C₈ sustituido o no sustituido, halogenoalcoxi C₁-C₈ sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carbonilo sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-carbonilo sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido, di-alquil C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido, N-alquil C₁-C₈-oxicarbamoilo sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido, N-alquil C₁-C₈-alcoxi C₁-C₈-carbamoilo sustituido o no sustituido, alcoxi C₁-C₈-carbonilo sustituido o no sustituido, halogenoalcoxi C₁-C₈-carbonilo sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-carboniloxi sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-

25

30

35

- carboniloxi sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-
carbonilamino sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-carbonilamino sustituido o no
sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, alquil C₁-C₈-aminocarboniloxi sustituido o no
sustituido, di-alquil C₁-C₈-aminocarboniloxi sustituido o no sustituido, alquil C₁-C₈-oxicarboniloxi
5 sustituido o no sustituido, alquil C₁-C₈-sulfonilo sustituido o no sustituido, halogenoalquil C₁-C₈-
sulfonilo sustituido o no sustituido que tiene 1 a 5 átomos de halógeno, (2-oxopirrolidin-1-
il)alquil C₁-C₈, (2-oxopirrolidin-1-il) halogenoalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5 átomos de halógeno,
(2-oxopiperidin-1-il)alquil C₁-C₈, (2-oxopiperidin-1-il) halogenoalquil C₁-C₈ que tiene 1 a 5
átomos de halógeno, (2-oxoazepan-1-il) alquil C₁-C₈, (2-oxoazepan-1-il)halogenoalquil C₁-C₈
10 que tiene 1 a 5 átomos de halógeno;
cuando L¹ y L² forman conjuntamente un heterociclo de 4, 5, 6 o 7 elementos sustituido o no
sustituido que comprende hasta 4 heteroátomos seleccionados en la lista consistente en N, O,
S, L¹ y L² independientemente representan un 2-oxopirrolidin-1-il sustituido o no sustituido o un
2-oxo-1,3-oxazolidin-3-ilo sustituido o no sustituido.
- 15 12. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 11 en el que L¹ y L² independientemente
representan un átomo de hidrógeno o un alquilo C₁-C₈ lineal o ramificado, sustituido o no
sustituido.
- 20 13. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 12 en el que L¹ y L² independientemente
representan un átomo de hidrógeno o un (alcoxi C₁-C₈)-alquilo C₁-C₈ lineal o ramificado,
sustituido o no sustituido.
14. Un compuesto de fórmula (II)



25

en la que

- W representa un grupo saliente elegido entre un átomo de halógeno, un alquil C₁-C₆-sulfonato, un haloalquil C₁-C₆-sulfonato; un fenilsulfonato sustituido o no sustituido y
- siendo X, Y, n, p, R^a, R^b, R^c y Het, como se define en las reivindicaciones 1 a 13.

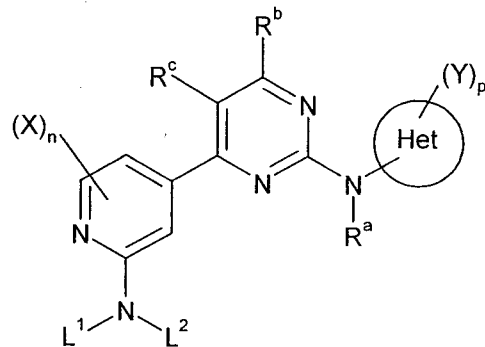
30

- 15 Una composición fungicida que comprende, como ingrediente activo, una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 13 y un soporte, vehículo o carga aceptable desde un punto de vista agrícola.
- 5 16. Un método para controlar los hongos fitopatógenos de los cultivos, caracterizado porque se aplica una cantidad eficaz en el sector agronómico y sustancialmente no fitotóxica de un compuesto según las reivindicaciones 1 a 13 o una composición según la reivindicación 15 se aplica al suelo en el que crecen o pueden crecer las plantas, a las hojas o a los frutos o a las semillas de las plantas.

RESUMEN

5

La presente invención se refiere a derivados de heterociclil-pirimidil-amino de fórmula (I)



(I)

10

derivados de heterociclil-pirimidinil-amino de fórmula (I) en la que Het, Y, p, R^a, R^b, R^c, X, n, L¹ y L² representan varios sustituyentes, a su procedimiento de preparación, a la preparación de compuestos intermedios, a su utilización como agentes fungicidas activos, específicamente en forma de composiciones fungicidas, y a los métodos para el control de hongos fitopatógenos, especialmente de plantas, utilizando estos compuestos o composiciones.

108



Baker & McKenzie Colombia S.A.
Av. 82 No. 10 - 62 Piso 6
Bogotá, Colombia
NIT: 900.034.906-9
Tel: +57 1 634 1500
Fax: +57 1 376 2211
www.bakernet.com

Señores
Centro de Documentación e Info
SUPERINTENDENCIA DE INDUST.
E. _____ S. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

No. 09-047370- -00000-0000
Fecha: 2009-05-11 15:44:29 Dep. 2014 REGISTRO
Tra. 380 PODERES Evt:
Act. 411 PRESENTACION Folios: 5

Referencia: Archivo de poder general para Wyeth
Apoderados: Alvaro Correa-Ordoñez y/o Olga Georgette Otero y/o Ricardo Metke y/o Juan Pablo Concha

SOLICITUD DE ARCHIVO DE PODER GENERAL DE ACUERDO CON LA CIRCULAR EXTERNA
NO. 007 DEL 10 DE SEPTIEMBRE DE 2008

ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ, mayor de edad y vecino de Bogotá D.C., identificado según aparece al pie de mi firma, en mi condición de apoderado de la sociedad en referencia, manifiesto lo siguiente:

1. En atención a lo dispuesto en la Circular Externa No. 007 del 10 de septiembre de 2008, la cual implementó el procedimiento para archivo de poderes generales para los asuntos en materia de Propiedad Industrial ante la Superintendencia de Industria y Comercio, solicito el archivo del poder otorgado por la sociedad Wyeth domiciliada en Estados Unidos de América, a mi favor.
2. En consecuencia, solicito se me informe el número de radicación en el archivo de poderes generales para consulta y referencia en futuros trámites para esta sociedad.

Atentamente,

ÁLVARO CORREA ORDÓÑEZ
C.C.No.79.143.366 de Usaquén
T.P.20.281

Anexo: Copia autentica del Poder de Abogado

109

2

TRADUCCIÓN OFICIAL No. 446/08 de un documento escrito en inglés, el cual para su identificación se sella con el sello del Traductor. Esta es una Traducción Oficial efectuada el día 4 de agosto de 2008 por la Sra. María Teresa Lara, c.c. 41.568.055 de Bogotá, Traductora Oficial según Resolución No. 01016 del 2 de octubre de 1998, expedida por el Ministerio de Justicia.

=====

Poder otorgado por WYETH para su representación en relación con asuntos de propiedad industrial en Colombia. Certificación notarial suscrita por Michelle L. McGowan, Notario Público del estado de Nueva Jersey, y legalizaciones subsiguientes.

EL PODER Y LA CERTIFICACIÓN NOTARIAL NO SE TRADUCEN POR
ENCONTRARSE EN INGLÉS Y ESPAÑOL EN EL DOCUMENTO ORIGINAL.

MARIA TERESA LARA R.
TRADUCTORA OFICIAL
RESOLUCION No. 01016
DE MINISTERIO DE JUSTICIA

(Fdo.) Michelle L. McGowan

[Sello] MICHELLE L. MCGOWAN
Notario Público, Estado de Nueva Jersey
No. 2108903
Habilitada en el Condado de Morris
La comisión expira el 9 de febrero de 2011

(Sello notarial
en relieve)

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. País: Estados Unidos de América
2. Este documento público ha sido firmado por: Michelle L. McGowan
3. actuando en calidad de: Notario Público de Nueva Jersey
4. lleva el sello/timbre de: Michelle L. McGowan, Notario



CERTIFICADO

5. en Trenton, Nueva Jersey
6. el día 28 de julio de 2008
7. por R. David Rousseau, TESORERO DE NUEVA JERSEY
8. No. A334737
9. Sello/Timbre:
10. Firma

(Sello del Estado
de Nueva Jersey)

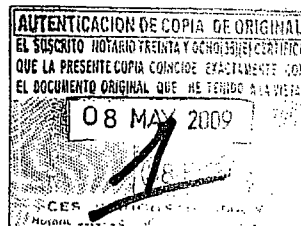
(Fdo.) R. David Rousseau

La anterior es traducción fiel y completa del documento en referencia, de la cual se deja copia en este archivo para su confrontación.

MARIA TERESA LARA R.
TRADUCTORA OFICIAL
RESOLUCION No. 01016
DE OCTUBRE DE 1998

Maria Teresa Lara R.

María Teresa Lara R.
c.c. 41.568.055 de Bogotá
Traductora Oficial según
Resolución No. 01016 del
2 de octubre de 1998, del
Ministerio de Justicia



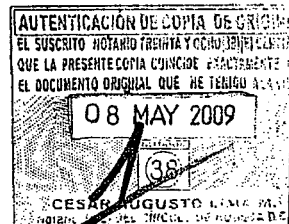
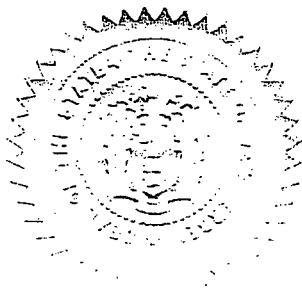
APOSTILLE

(CONVENTION DE LA HAYE DU 5 OCTOBRE 1961)

1. COUNTRY: UNITED STATES OF AMERICA
2. THIS PUBLIC DOCUMENT HAS BEEN SIGNED BY:
MICHELLE L MC GOWAN
3. ACTING IN THE CAPACITY OF:
NOTARY PUBLIC OF NEW JERSEY
4. BEARS THE SEAL/STAMP OF:
MICHELLE L MC GOWAN, NOTARY

CERTIFIED

5. AT TRENTON, NEW JERSEY
6. THE 28TH DAY OF JULY 2008
7. BY: R. David Rousseau, NEW JERSEY TREASURER
8. NO. A334737
9. SEAL/STAMP:
10. SIGNATURE



BAKER & MCKENZIE

Colombia

Baker & McKenzie Colombia S.A.
Av. 82 No. 10 - 62 6th Floor
Bogotá, Colombia

NT: 860.068.840-3
Tel: +57 1 634 1500
Fax: +57 1 376 2211
www.bakernet.com

POWER OF ATTORNEY

The undersigned,

WYETH

with offices at

**Five Giralda Farms, Madison, NJ 07940,
United States of America**

declares that it hereby grants to

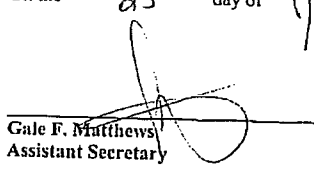
**ALVARO CORREA-ORDOÑEZ and/or
OLGA GEORGETTE OTERO and/or
RICARDO METKE and/or
JUAN PABLO CONCHA**

all members of the law firm Baker & McKenzie Colombia S.A., with domicile at Av. 82 No. 10 - 62, 6th floor, of Bogotá D. C., Colombia, and for so long as they remain members of the law firm, a full and sufficient Power of Attorney to obtain the protection of my (our) industrial property for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before administrative, and judicial authorities or persons, in all matters concerning the following: a) obtainment of patents, including filing of assignments, change of name or address, and at my (our) specific direction, voluntary cancellation, defending and filing of oppositions, cancellations, annulment and criminal actions, and in general the civil, criminal, and administrative processes relating to those rights.

I hereby ratify all lawful actions previously taken on behalf of this company by the aforementioned attorneys with respect to the mentioned matters.

Done and subscribed in

On the 25th day of July, 2008


Gale F. Matthews
Assistant Secretary

Signature of the person issuing the Power

PODER DE ABOGADO

La abajo firmada,

WYETH

con oficinas en

**Five Giralda Farms, Madison, NJ 07940,
Estados Unidos de América**

declara por el presente que otorga a

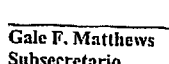
**ALVARO CORREA-ORDOÑEZ y/o
OLGA GEORGETTE OTERO y/o
RICARDO METKE y/o
JUAN PABLO CONCHA**

todos miembros de la firma de abogados Baker & McKenzie Colombia S.A., con domicilio en la Av. 82 No. 10 - 62 Piso 6 en Bogotá D. C., Colombia, y hasta tanto ellos continúen siendo miembros de la firma, poder amplio y suficiente para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial a, cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante autoridades o personas del orden administrativo y judicial, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes, incluyendo presentación de traspasos, cambio de nombre o dirección y bajo mi (nuestra) expresa(s) instrucción(es), cancelación voluntaria, defensa y presentación de oposiciones, cancelaciones, nulidades, y en general procesos civiles, penales, administrativos relacionados con estos derechos.

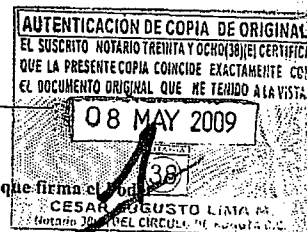
Igualmente, ratifico todo lo actuado en derecho hasta el momento en nombre de esta compañía por cualquiera de los mencionados apoderados en los casos mencionados.

Dado y firmado en

A los 25 días del mes de julio de 2008


Gale F. Matthews
Subsecretario

Firma de la persona que firma el Poder



NOTARIAL CERTIFICATION

On this 25th day of July
2008, the undersigned Notary

CERTIFIES

1. That **Gale F. Matthews**

set his hand on the foregoing document.

2. That the grantor is to me personally known and that he/she has legal capacity to execute the instrument.

3. That the grantor has executed the foregoing document as

Assistant Secretary

of the judicial person **WYETH**

4. That the judicial person **WYETH**
having its home office in

Five Giralda Farms, Madison, NJ 07940,
United States of America

is duly organized, has present legal existence and that the purposes for which the power of attorney is granted are within the scope of its corporate purposes.

5. That the grantor has in fact the referred to authority and that his/her representation is legal.

6. That I have based certifications 3, 4 and 5 above on the following authentic documents for such purpose exhibited to me and which I mention specifically, giving their dates and their origin or source:

Minutes of the Board of Directors Meeting held on May 24, 2008.

Michelle L. McGowan
Notary Public

MICHELLE L. MCGOWAN
Notary Public, State of New Jersey
No. 2108903
Qualified in Morris County
Commission Expires Feb. 9, 2011

CERTIFICACION NOTARIAL

A los 25 días del mes de julio
de 2008, el suscrito Notario

- 1 Que **Gale F. Matthews**

suscribió de su puño y letra el documento que antecede.

2. Que conozco al otorgante y que éste tiene capacidad legal para el otorgamiento.

3. Que el otorgante ha suscrito el referido documento en su carácter de

Subsecretario

de la persona jurídica **WYETH**

4. Que la persona jurídica **WYETH**
con sede en

Five Giralda Farms, Madison, NJ 07940,
Estados Unidos de América

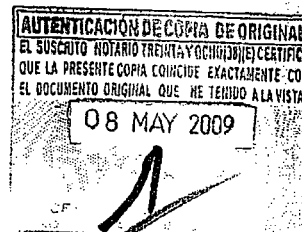
está legalmente constituida, que tiene existencia legal actual y que el acto para el cual se otorga el poder está comprendido entre los que constituyen su objeto social.

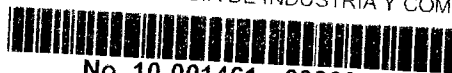
5. Que el otorgante tiene efectivamente la representación que ostenta y que ésta es legítima.

6. Que he basado las certificaciones 3, 4 y 5 anteriores en los siguientes documentos auténticos que al efecto se me exhibieron y que menciono específicamente con expresión de sus fechas y de su origen o procedencia:

Actas de la reunión de la Junta Directiva celebrada el 24 de mayo de 2008.

El Notario Público





No. 10-001461-00000-0000

Fecha: 2010-01-07 16:34:08

Dep: 2020 DIR.NUEVASCR

Tra: 11 PATENTEIYII

Eve: 378 FASENACIONALI

Act: 411 PRESENTACION

Folios: 107

LISTA DE CHEQUEO
ADMISIÓN A TRÁMITE - NUEVAS CREACIONESPATENTE DE INVENCION ☐MODELO DE UTILIDAD ☐

Art 33 Decisión 486/00

☐	Indicación que se solicita una patente.
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Descripción de la invención
☐	Dibujos de ser estos pertinentes
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas (De ser el caso formato de descuento)
Completa ☐	Incompleta ☐

PATENTE DE INVENCION PCT ☐MODELO DE UTILIDAD PCT ☐

Art.33 Decisión 486/00, Circular Única

☐	Indicación que se solicita una PCT
☐	Copia de la solicitud en español, tal como fue presentada inicialmente (capítulo descriptivo, reivindicatorio, resumen)
☐	Dibujos de ser estos pertinentes
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas (de ser el caso formato de descuento)
Completa ☐	Incompleta ☐

DISEÑO INDUSTRIAL ☐

(Art. 119 Decisión 486/00)

☐	Indicación que se solicita Diseño Industrial
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Representación gráfica y fotográfica del Diseño industrial o muestra del material que incorpora el diseño
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas
Completa ☐	Incompleta ☐

ESQUEMA DE TRAZADO ☐

(Art. 92 Decisión 486/00)

☐	Indicación que se solicita un esquema de trazado
☐	Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud
☐	Representación gráfica de un esquema de trazado
☐	Comprobante de pago de las tasas establecidas
Completa ☐	Incompleta ☐



Bogotá,
2020

Doctor(a)
CORREA ORDOÑEZ ALVARO
Apoderado(a) y/o Representante de
BAYER CROPS SCIENCE S.A.

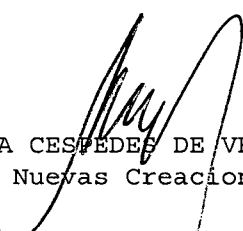
REFERENCIA	Radicación No.	10 1461
	Solicitud internacional	PCT/EP2008/057126
	Fecha inicio fase nacional	08/01/2010
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	430
	Oficio No.	2160

Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante, conforme a lo establecido por el artículo 26 literal k) de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina. Cuando se trate de documentos otorgados en el extranjero, estos deberán legalizarse de conformidad con lo dispuesto por los artículos 259 y 260 del Código de Procedimiento Civil. Cuando se trate de las declaraciones a que hace referencia la Regla 4.17 ii) del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes PCT., el alcance de las tales declaraciones se determinará según indiquen claramente una cesión de derechos del inventor al solicitante o su causante, de conformidad con lo dispuesto en el numeral 5.2.15 del Capítulo Quinto, Título X de la Circular Única de Superintendencia de Industria y Comercio.

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Única No.10 de 2001.


ALIX CARMENZA CESTEDER DE VERGEL
Directora de Nuevas Creaciones (c)

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de
fecha 19 FEB. 2010
adpall

Al contestar favor indique el número
de radicación consignado en el rótulo

Sede Centro: Carrera 13 No. 27-00 pisos 2, 5, 7 y 10 PBX: 5870000
Sede CAN: Av. Carrera 50 No. 26 - 55 int.2. Tel 5880070
Call Center 6513240. Línea 01800-910165
Web: www.sic.gov.co e-mail: info@sic.gov.co
Bogotá D.C. Colombia