



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

PG

Delegatura de Propiedad Industrial
División de Nuevas Creaciones

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO
INVENTARIO

SOLICITUD
PATENTE DE INVENCION

10-22117

21. EXPEDIENTE No.

54. TÍTULO DERIVADOS FUNCIONALES DE (HETERO)ARIL-HETILEN-N-
CICLOALQUIL CARBOXAMIDA CONDENSADOS DE 6 ELEMENTOS CON N

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE BAYER CROPS SCIENCE SA

DOMICILIO F-69009 LYON, FRANCIA

74. APODERADO ALVARO CORREA ORDÓÑEZ

22. BOGOTÁ, D.C., Febrero 24, 2010.

(FORMA P-10)

Power

PJ

01-03-2010

PETITORIO



Industria y Comercio
SUPERINTENDENCIA

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-022117- -00000-0000

Fecha: 2010-02-24 16:47:04 Dep. 2020 DIR. NUEVASCR
Tra 11 PATENTE/III Eva: 378 FASENACIONALI
Act 411 PRESENTACION Folioz: 78

ión

FORMULARIO ÚNICO DE SOLICITUD DE PATENTE
PCT
ENTRADA EN FASE NACIONAL

1

SOLICITUD DE :

☒ X

Patente de Invención

☐

Patente de Modelo de Utilidad

☒ X

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.

☒ X

NIT

☐

C.E.

☐

Otro

☐

Cual

Número 79.143.366 Usaquén TP 20281

En caso de haber presentado poder general para asuntos que se adelanten ante la Delegatura de propiedad Industrial, sírvase indicar el número de radicación (del poder). 09.009.929

4

INVENTOR (ES)

(72)

Nombre: DESBORDES, Philippe; GARY, Stéphanie; GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire; HARTMANN, Benoît; RINOLFI, Philippe; TUCH, Arounarith; VORS, Jean-Pierre

Dirección: 14 rue du Docteur Mouisset, F-69006 Lyon, (FR); 9, rue Simon Buisson F-69410 Champagne au Mont d'Or (FR); Le Trève Collonge Route d'Albigny F-69250 Curis au Mont d'Or (FR); 113 bis, rue du Commandant Charcot F-69110 Sainte Foy les Lyon (FR); Résidence le Coleau lieu dit la Colletière F-69300 Chatillon d'Azergues (FR); 45, rue de Saint Cyr F-69009 Lyon (FR); 6, allée Adanson F-69110 Sainte Foy les Lyon (FR)

Nacionalidad o Domicilio: Francia

5

PCT (85)

Solicitud Internacional No. PCT/EP2008/060040

Fecha 31.07.2008

Publicación Internacional No. WO 2009/016221

Fecha 05.02.2009

6

Título (54)

DERIVADOS FUNGICIDAS DE (HETEPO)AFIL-METILEN-H-CICLOALQUIL CARBOXAMIDA
CONDENSADOS DE 6 ELEMENTOS CON N

7

Clasificación Internacional (51)

C07D 207/34; C07D 231/20; C07D 401/12; C07D 417/12; A01N 43/56; A01N 43/36; A01N 43/78; C07D 231/14; C07D 231/16

8

Prioridad

SI

☒ X

NO

☐

(33) País de Origen

EP

EP

(32) Fecha

31.07.2007

16.04.2008

(31) Número de Solicitud

07356105.2

08356061.5

9

Comprobante de pago No. 10-3,805 - 10-10,141 -10-10,142

Fecha Febrero 24, 2010

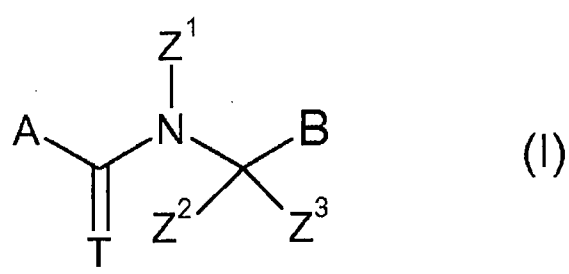
10

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
- ☒ Fedensa, si fuere el caso. Documento de Poder radicado en el Expediente No. 09 009.929
- ☒ 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 COPPEA ORDONEZ

FIRMA:

C.C. 79.143.366 de Usaquén T.F. 20.281

Instrucciones para la presentación de los anexos, ver reverso de esta página

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-022117- -00000-0000

Fecha: 2010-02-24 16:47:04 Dep. 2020 DIR.NUEVASOR
 Tra. 11 PATENTEINII Eje: 278 FASENACIONALI
 Act. 411 PRESENTACION Folios: 78

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

VIT : 800176089-2

2010/002

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 3,805
 FECHA : ENERO 15 DE 2010

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	VR. PAGO
BAKER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	111704736	14/01/2010	66.910.000.00

***** CONCEPTO *****

TANT. RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1 50005-01 01 SOLICITUDES	1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN	554.000.00
	TOTAL :	\$ 554.000.00

SON: QUINIENTOS CINCUENTA Y CUATRO MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

4

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-022117- -00000-0000

Fecha: 2010-02-24 16:47:04 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra 11 PATENTEIYII Evt: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 78

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 10,141
FECHA : FEBRERO 9 DE 2010

2010/004

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	148651613	09/02/2010	27,412,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09	OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	54 INFORMACION DETALLADA DE UN TRAMI
			TOTAL : \$ 26,000.00

SON: VEINTISEIS MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 10-022117-00000-0000

Fecha: 2010-02-24 16:47:04 Dep. 2020 DIR.NUEVASCR
Tra. 11 PATENTE/VI Evt: 378 FASENACIONALI
Act. 411 PRESENTACION Folios: 78

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

RECIBO OFICIAL DE CAJA : 10 - 10,142
FECHA : FEBRERO 9 DE 2010

2010/004

***** CONSIGNACION *****

DEPOSITANTE	TIPO PAGO	BANCO	CUENTA	No. PAGO	FECHA PGO	Vr. PAGO
ER & MCKENZIE	CONSIGNACION	BANCO DE BOGOTA	062754387	148651613	08/02/2010	27,412,000.00

***** CONCEPTO *****

CANT.	RENTISTICO	CONCEPTO	TOTAL CONCEPTO
1	50005-01-09 OTROS SERVICIOS DE PROPIEDAD I	54 INFORMACION DETALLADA DE UN TRAMI	26,000.00
TOTAL :			\$ 26,000.00

SON: VEINTISEIS MIL PESOS

RESPONSABLE :

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. _____



Industria y Comercio

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

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

DIVISION DE NUEVAS CREACIONES

TARJETA ARCHIVO PROPIETARIOS

(21) N° de solicitud:

(22) Fecha de solicitud:

(51) Clasificación Internacional: C07D 207/34; C07D 231/29; C07D 401/12; C07D 417/12; A01N 43/56; A01N 43/36; A01N 43/78; C07D 231/14; C07D 231/16

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

(72) Inventor(es) DESBORDES, Philippe; GARY, Stéphanie; GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire; HARTMANN Benoît; RINOLFI, Philippe; TUCH, Arounarith; VORS, Jean-Pierre

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

(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	07356105.2	31.07.2007	EP
	08356061.5	16.04.2008	EP

(85) Fecha inicio fase nacional: 28-02-2010

(87) Publicación internacional

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

Fecha: 05.02.2009

Fecha de presentación de la solicitud: 31.07.2008

N° publicación: WO 2009/016221

No. de solicitud PCT/EP2008/060040

(54) Título: DERIVADOS FUNGICIDAS DE (HETERO)ARIL-METILEN-CICLOALQUIL CARBOXYAMIDA
CONDENSADOS DE 6 ELEMENTOS CON N

7



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 207/34; C07D 231/20; C07D 401/12; C07D 417/12; A01N 43/56; A01N 43/36; A01N 43/78; C07D 231/14; C07D 231/16

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

(72) Inventor(es) DESBORDES, Philippe; GARY, Stéphanie; GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire; HARTMANN, Benoît; RINOLFI, Philippe; TUCH, Arounarith; VORS, Jean-Pierre

(74) Apoderado: ALVARO CORREA ORDOÑEZ

(30) Prioridad	(31) No. Prioridad	(32) Fecha	(33) País
	07356105.2	31.07.2007	EP
	08356061.5	16.04.2008	EP

(85) Fecha límite inicio fase nacional: 28-02-2010

(86) Datos relativos a la presentación de la solíc. PCT

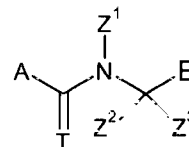
Fecha de presentación de la solicitud: 31.07.2008

No. de solicitud PCT/EP2008/060040

(87) Publicación internacional:

Fecha: 05.02.2009

No. Publicación: WO 2009/016221



(I)

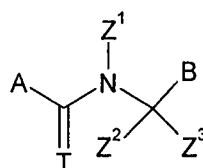
(54) Título: DERIVADOS FUNGICIDAS DE (HETERO)ARIL-METILEN-N-CICLOALQUIL CARBOXAMIDA CONDENSADOS DE 6 ELEMENTOS CON N

(57) Resumen: La presente invención se refiere a derivados de N-(aromático, de 6 elementos, condensado, (hetero)aril-metileno)-N-cicloalquil carboxamida, a su tiocarboxamida o análogos de carboximidamida N-sustituídos, todos de fórmula (I) en la que A representa un grupo heterocíclico de 5 elementos unido a carbono; T representa O, S, N-R¹, N-OR¹, N-NR²R³ o N-CN; Z¹ a Z³ y B representa un (hetero)arilo aromático, de 6 elementos, condensado; a su procedimiento de preparación; a su utilización como agentes fungicidas activos, particularmente en forma de composiciones

CONTINUA AL RESPALDO ...

 Industria y Comercio SUPERINTENDENCIA		SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO DIVISION DE NUEVAS CREACIONES EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT	
(21) N° de solicitud: 22) Fecha de solicitud:		(51) Int Cl: C07D 207/34; C07D 231/20; C07D 401/12; C07D 417/12; A01N 43/56; A01N 43/36; A01N 43/78; C07D 231/14; C07D 231/16 (71) Solicitante(s) BAYER CROPSCIENCE SA (72) Inventor(es) DESBOPDES, Philippe; GARY, Stéphanie; GROSJEAN-COUPNOYER, Marie-Claire; HARTMANN, Benoît; RINOLFI, Philippe; TUCH, Arounarith; VORS, Jean-Pierre (74) Apoderado: ALVARO CORREA ORDOÑEZ	
(30) Prioridad (31) No. 07356105.2 08356061.5	(32) Fecha 31.07.2007 16.04.2008	(33) País EP EP	(85) Fecha límite inicio fase nacional: 20-02-2010 (86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT Fecha de presentación de la solicitud: 31.07.2009 No. de solicitud PCT/EP2008/060040
(87) Publicación internacional Fecha: 05.02.2009 N° publicación: WO 2009/016221		(54) Título: DERIVADOS FUNGICIDAS DE (HETERO)ARIL-METILEN-1-CICLOALQUIL CARBOXYAMIDA CONDENSADOS DE 6 ELEMENTOS CON N	

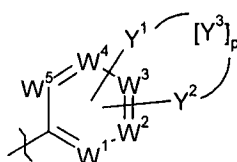
Reivindicación(es): 1. Un compuesto de fórmula (I):



(I)

en la que

- A representa un grupo heterociclilo de 5 elementos insaturado o parcialmente saturado, unido por carbono, que puede estar sustituido por hasta cuatro grupos R²;
- B representa:



en la que

- W¹ a W⁵ independientemente representan N o CR^{b1};
- Y¹ a Y³ independientemente representan N, O, S, NR^{b2} o CR^{b3};
- Y¹ a Y³ junto con los átomos Wⁿ a que están unidos, forman un anillo heterociclilo condensado, aromático de 5 o 6 elementos, que comprende hasta cuatro heteroátomos o un anillo carbociclilo condensado aromático de 6 elementos;
- p representa 1 ó 2;
- T representa O, S, N-F^c, N-OR^d, N-NR^eF^d o N-CN;
- Z¹ representa un cicloalquilo C³-C⁷ no sustituido o un cicloalquilo C³-C⁷ sustituido por hasta 10 átomos o grupos que pueden ser iguales o diferentes y que pueden seleccionarse de la lista consistente en átomos de halógeno; ciano; alquilo C¹-C₆; halógenoalquilo (C¹-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C¹-C₆); halógenoalcoxi (C¹-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C¹-C₆)carbonilo; halógenoalcoxi (C¹-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil C¹-C₆-aminocarbonilo; di-(alquil C¹-C₆)aminocarbonilo; ...

(19) World Intellectual Property Organization
International Bureau(43) International Publication Date
5 February 2009 (05.02.2009)

PCT

(10) International Publication Number
WO 2009/016221 A1

(51) International Patent Classification:

C07D 207/34 (2006.01) A01N 43/36 (2006.01)
 C07D 231/20 (2006.01) A01N 43/78 (2006.01)
 C07D 401/12 (2006.01) C07D 231/14 (2006.01)
 C07D 417/12 (2006.01) C07D 231/16 (2006.01)
 A01N 43/56 (2006.01)

F-69009 Lyon (FR). VORS, Jean-Pierre [FR/FR]; 6, allée Adancon, F-69110 Sainte Foy les Lyon (FR).

(21) International Application Number:

PCT/EP2008/060040

(22) International Filing Date: 31 July 2008 (31.07.2008)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:

07356105.2 31 July 2007 (31.07.2007) EP
 08356061.5 16 April 2008 (16.04.2008) 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): DESBORDES, Philippe [FR/FR]; 5, avenue Général Brorret, F-69006 Lyon (FR). GARY, Stéphanie [FR/FR]; 9, rue Simon Buison, F-69410 Champagne au Mont d'Or (FR). GROS-JEAN-COURNOYER, Marie-Claire [FR/FR]; Le Trève Collonge, Route d'Albigny, F-69250 Curie au Mont d'Or (FR). HARTMANN, Benoît [FR/FR]; 113 bis, rue du Commandant Charcot, F-69110 Sainte Foy les Lyon (FR). RINOLFI, Philippe [FR/FR]; Résidence le Coteau, lieu dit la Colletière, F-69330 Chatillon d'Azergues (FR). TUCH, Arounath [FR/FR]; 45, rue de Saint Cyr,

(74) Agent: BALMEFREZOL, Ludovic; Bayer CropScience SA, Patents & Licensing Department, 14-20, rue Pierre Bailet, EP 9163, F-69263 Lyon Cedex 09 (FR).

(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every kind of national protection available): AE, AG, AL, AM, AO, AT, AU, AZ, BA, BE, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GE, GR, GU, HK, HN, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LE, LI, LT, LU, LV, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SE, SG, SI, SK, SL, SM, ST, 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, HE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, EG, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, 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).

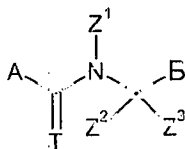
Declarations under Rule 4.17:

- 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
- before the expiration of the time limit for amending the claims and to be republished in the event of receipt of amendments

(54) Title: FUNGICIDE N-6-MEMBERED FUSED (HETERO)ARYL-METHYLENE-N-CYCLOALKYL CARBOXAMIDE DERIVATIVES



(I)

(57) Abstract: The present invention relates N-(aromatic, 6-membered, fused, (hetero)aryl-methylene)-N-cycloalkyl carboxamide derivatives, their thiocarboxamide or N-substituted carboximidamide analogues, all of formula (I) wherein A represents a carbo-linked 5-membered heterocyclyl group; T represents O, S, H-F^a, H-Ge^d, H-It^e, T^d or H-Cl^h; Z¹ to Z³ and E represents an aromatic, 6-membered, fused, (hetero)aryl; their process of preparation; 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.

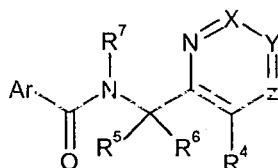
FUNGICIDE N-6-MEMBERED FUSED (HETERO)ARYL-METHYLENE-N-CYCLOALKYL CARBOXAMIDE DERIVATIVES

DESCRIPTION

The present invention relates to N-(aromatic, 6-membered, fused, (hetero)aryl-methylene)-N-cycloalkyl carboxamide derivatives, their thiocarboxamide or N-substituted carboximidamide analogues, their process of preparation, 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.

International patent application WO-2001/11966 generically mentions certain haloalkyl-2-pyridyl-methylene-heterocyclyl-amide derivatives. However, there is no disclosure in this document of any such derivative substituted by any cycloalkyl group.

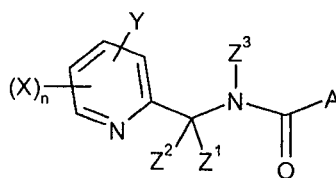
International patent application WO-2004/074259 discloses GABA_A receptor-bondable compounds of the following formula:



wherein Ar can represent a 5- to 10-heterocycle, R⁷ can represent a C₃-C₇-cycloalkyl while X, Y and Z can represent N or CR¹, at least one representing N.

However, there is no disclosure in this document of any compound including a 5-membered heterocycle or a cycloalkyl linked to the nitrogen atom.

International patent application WO-2006/120224 discloses 2-pyridyl-methylene-carboxamide derivatives of the following formula:



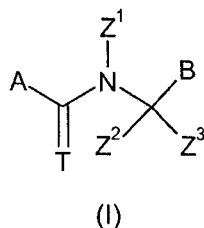
there was no hint in this document to prepare the fungicide bicyclic derivatives according to the invention.

International patent application WO-2007/117773 discloses quinoline derivatives useful as inducible nitric oxide synthase inhibitors, including 11-cyclopropyl-11-((7,8-fluoro-2-oxo-1,2-

dihydroquinolin-4-yl)methyl)-4-methylthiazole-5-carboxamide and N-cyclopropyl-N-((8-fluoro-2-oxo-1,2-dihydroquinolin-4-yl)methyl)-4-methylthiazole-5-carboxamide. These compounds do not form part of the present invention.

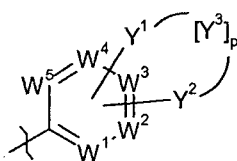
- 5 It is always of high-interest in agriculture to use novel pesticide compounds in order to avoid or to control the development of resistant strains to the active ingredients. It is also of high-interest to use novel compounds being more active than those already known, with the aim of decreasing the 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
- 10 family of compounds that possess the above mentioned effects or advantages.

Accordingly, the present invention provides N-(aromatic, 6-membered, fused, (hetero)aryl-methylene)-N-cycloalkyl-carboxamide derivatives of formula (I)



wherein

- A represents a carbo-linked, unsaturated or partially saturated, 5-membered heterocyclyl group that can be substituted by up to four groups R^a ;
- B represents



wherein

- W¹ to W⁵ independently represent N or CR^{b1} ;
- Y¹ to Y³ independently represent N, O, S, NR^{b2} or CR^{b3} ;
- Y¹ to Y³ together with the atoms Wⁿ to which they are linked, form an aromatic 5- or 6-membered, fused heterocyclyl ring comprising up to four heteroatoms, or an aromatic 6-membered fused carbocyclyl ring ;
- p represents 1 or 2 ;

- T represents O, S, H-F^c , H-OR^d , $\text{H-IR}^e\text{F}^d$ or H-CN ;
- Z^1 represents a non substituted $\text{C}_3\text{-C}_7$ -cycloalkyl or a $\text{C}_3\text{-C}_7$ cycloalkyl substituted by up to 10 atoms or groups that can be the same or different and that can be selected in the list consisting of halogen atoms ; cyano ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkoxy ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkoxycarbonyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -halogenoalkoxycarbonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkylaminocarbonyl ; di- $(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl})$ aminocarbonyl ;
- Z^2 and Z^3 independently represent a hydrogen atom ; a halogen atom ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -alkenyl ; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -alkynyl ; cyano ; nitro ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkoxy ; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -alkenyloxy ; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -alkynyloxy ; $\text{C}_3\text{-C}_7$ -cycloalkyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkylsulphenyl ; amino ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkylamino ; di- $(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl})$ amino ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkoxycarbonyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkylcarbonyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkylcarbamoyl ; di- $(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl})$ carbamoyl ; $\text{H-C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl-C}_1\text{-C}_8\text{-alkoxycarbamoyl}$; or
- Z^2 and Z^3 together with the carbon atom to which they are linked can form a substituted or non substituted $\text{C}_3\text{-C}_7$ cycloalkyl ;
- R^a independently represents a hydrogen atom ; halogen atom ; cyano ; nitro ; amino ; sulfanyl ; hydroxyl ; pentafluoro- λ -6-sulfanyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkylamino ; di- $(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl})$ amino ; tri- $(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl})$ silyl ; tri- $(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl})$ silyl- $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl}$; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkylsulfanyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -halogenoalkylsulfanyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -alkenyl ; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -halogenoalkenyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -alkynyl ; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -halogenoalkynyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkoxy ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkoxy- $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -alkenyloxy ; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -alkynyloxy ; $\text{C}_3\text{-C}_7$ -cycloalkyl ; $\text{C}_3\text{-C}_7$ -cycloalkyl- $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkylsulphinyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkylsulphonyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkoxyimino ; $(\text{C}_1\text{-C}_8\text{-alkoxyimino})\text{-C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl}$; $(\text{benzyloxyimino})\text{-C}_1\text{-C}_8\text{-alkyl}$; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkylcarbonyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -halogenoalkylcarbonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -alkoxycarbonyl ; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -halogenoalkoxycarbonyl

comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-alkylaminocarbonyl ; di-(C₁-C₈-alkyl)aminocarbonyl ;

- 5 • R^c and R^d, that can be the same or different, represent a hydrogen atom ; C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl ; C₂-C₈-alkenyl ; C₂-C₈-halogenoalkenyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₂-C₈-alkynyl ; C₂-C₈-halogenoalkynyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₃-C₇-cycloalkyl ; C₃-C₇-cycloalkyl-C₁-C₈-alkyl ; C₃-C₇-halogenocycloalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; formyl ; C₁-C₈-alkylcarbonyl ; C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-alkylsulphonyl ; C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; phenyl that can be substituted by up to 5 groups Q ; naphthyl that can be substituted by up to 6 groups Q ; phenylmethylene that can be substituted by up to 5 groups Q ; phenylsulphonyl that can be substituted by up to 5 groups Q ;
- 10 • R^{b1} and R^{b3} independently represent a hydrogen atom ; halogen atom ; nitro ; cyano ; hydroxyl ; sulphanyl ; amino ; pentafluoro-λ6-sulphanyl ; C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-alkylamino ; di-(C₁-C₈-alkyl)amino ; C₁-C₈-alkoxy ; C₁-C₈-halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-alkylsulphanyl ; C₁-C₈-halogenoalkylsulphanyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-alkylsulphenyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulphenyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different, C₁-C₈-alkylsulphinyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulphinyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different, C₁-C₈-alkylsulphonyl, C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₂-C₈-alkenyl ; C₂-C₈-halogenoalkenyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₂-C₈-alkynyl ; C₂-C₈-halogenoalkynyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₂-C₈-alkenyloxy ; C₂-C₈-halogenoalkenyloxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₂-C₈-alkinyloxy ; C₂-C₈-halogenoalkinyloxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₃-C₇-cycloalkyl ; C₃-C₇-cycloalkyl-C₁-C₈-alkyl ; C₃-C₇-halogenocycloalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; formyl ; formyloxy ;

formylamino ; carboxy ; carbamoyl ; N-hydroxycarbamoyl ; carbamate ; (hydroxyimino)-C₁-C₆-alkyl ; C₁-C₆-alkylcarbonyl ; C₁-C₆-halogenoalkylcarbonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; N-C₁-C₆-alkyl-C₁-C₆-alkoxycarbamoyl ; C₁-C₆-alkoxycarbonyl ; C₁-C₆-halogenoalkoxycarbonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₆-alkylaminocarbonyl ; di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyl ; C₁-C₆-alkylcarbonyloxy ; C₁-C₆-halogenoalkylcarbonyloxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₆-alkylcarbonylamino ; C₁-C₆-alkylaminocarbonyloxy ; di-(C₁-C₆-alkyl)aminocarbonyloxy ; C₁-C₆-alkyloxycarbonyloxy ; C₁-C₆-alkoxyimino ; (C₁-C₆-alkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl ; (C₁-C₆-alkenylalkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl ; (C₁-C₆-alkynylalkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl ; (benzylalkoxyimino)-C₁-C₆-alkyl ; tri(C₁-C₆-alkyl)silyl ; tri(C₁-C₆-alkyl)silyl-C₁-C₆-alkyl ; phenyl that can be substituted by up to 5 groups Q ; benzyl that can be substituted by up to 5 groups Q ; benzylsulphanyl that can be substituted by up to 5 groups Q ; benzylamino that can be substituted by up to 5 groups Q ; phenoxy that can be substituted by up to 5 groups Q ; phenylamino that can be substituted by up to 5 groups Q ; phenylsulphanyl that can be substituted by up to 5 groups Q ; benzyl that can be substituted by up to 5 groups Q ; pyridinyl that can be substituted by up to four groups Q and pyridinyl that can be substituted by up to four groups Q ;

- R^{b2} represents a hydrogen atom ; C₁-C₆-alkyl ; C₁-C₆-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkyl ; C₂-C₆-alkenyl ; C₂-C₆-halogenoalkenyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₂-C₆-alkynyl ; C₂-C₆-halogenoalkynyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₃-C₇-cycloalkyl ; C₃-C₇-cycloalkyl-C₁-C₆-alkyl ; C₃-C₇-halogenocycloalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; formyl, C₁-C₆-alkylcarbonyl ; C₁-C₆-halogenoalkylcarbonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₆-alkylsulphonyl ; C₁-C₆-halogenoalkylsulphonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; phenylsulfonyl can be substituted by up to 5 groups Q ; benzyl that can be substituted by up to 5 groups Q ;

- Q, that can be the same or different, represents a halogen atom ; cyano ; nitro ; C₁-C₆-alkyl ; C₁-C₆-alkoxy ; C₁-C₆-alkylsulfonyl ; C₁-C₆-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₆-halogenoalkoxy comprising up

to 9 halogen atoms that can be the same or different ; tri(C₁-C₈)alkylsilyl and tri(C₁-C₈)alkylsilyl-C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-alkoxyimino ; (C₁-C₈-alkoxyimino)- C₁-C₈-alkyl ;

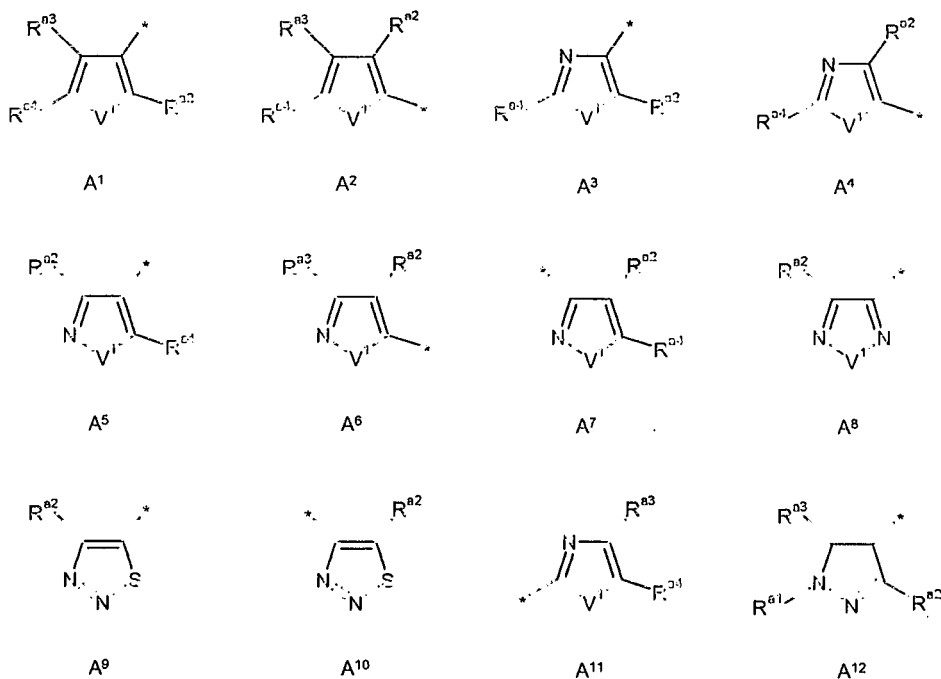
as well as salts, N-oxides, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active or
 5 geometric isomers thereof provided that compound of formula (I) differs from N-cyclopropyl-N-
 ((6,8-dimethyl-2-oxo-1,2-dihydroquinolin-3-yl)methyl)-furane-2-carboxamide, N-cyclopropyl-N-
 ((6-ethoxy-2-oxo-1,2-dihydroquinolin-3-yl)methyl)-furane-2-carboxamide, N-cyclopropyl-N-((6-
 methyl-2-oxo-1,2-dihydroquinolin-3-yl)methyl)-furane-2-carboxamide, N-cyclopropyl-N-((7,8-
 difluoro-2-oxo-1,2-dihydroquinolin-4-yl)methyl)-4-methylthiazole-5-carboxamide and from N-
 10 cyclopropyl-N-((8-fluoro-2-oxo-1,2-dihydroquinolin-4-yl)methyl)-4-methylthiazole-5-carboxamide.

Any of the compounds according to the invention can exist as one or more stereoisomers
 depending on the number of stereogenic units (as defined by the IUPAC rules) in the compound.
 The invention thus relates equally to all the stereoisomers, and to the mixtures of all the
 15 possible stereoisomers, in all proportions. The stereoisomers can be separated according to the
 methods that are known *per se* by the man ordinary skilled in the art.

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

- 20 • halogen means fluorine, chlorine, bromine or iodine ;
- heteroatom can be nitrogen, oxygen or sulphur ;
- halogenated groups, notably haloalkyl, haloalkoxy and cycloalkyl groups, can comprise
 up to nine identical or different a halogen atoms ;
- Any alkyl, alkenyl or alkynyl group can be linear or branched ;
- 25 • the term "aryl" means phenyl or naphthyl, optionally substituted by one to five groups
 selected in the list consisting of halogen, [C₁-C₆]-alkyl, [C₁-C₆]-haloalkyl, [C₂-C₆]-alkenyl,
 [C₂-C₆]-haloalkenyl, [C₂-C₆]-alkynyl, [C₂-C₆]-haloalkynyl, [C₁-C₆]-alkoxy, [C₁-C₄]-alkoxy-
 [C₁-C₄]-alkyl, [C₁-C₄]-alkoxy-[C₁-C₄]-alkoxy, [C₁-C₆]-haloalkoxy and [C₁-C₄]-haloalkoxy-
 [C₁-C₄]-alkyl ;
- 30 • In the case of an amino group or the amino moiety of any other amino-comprising group,
 substituted by two substituents that can be the same or different, the two substituents
 together with the nitrogen atom to which they are linked can form a heterocyclyl group,
 preferably a 5- to 7-membered heterocyclyl group, that can be substituted or that can
 include other hetero atoms, for example a morpholino group or piperidinyl.

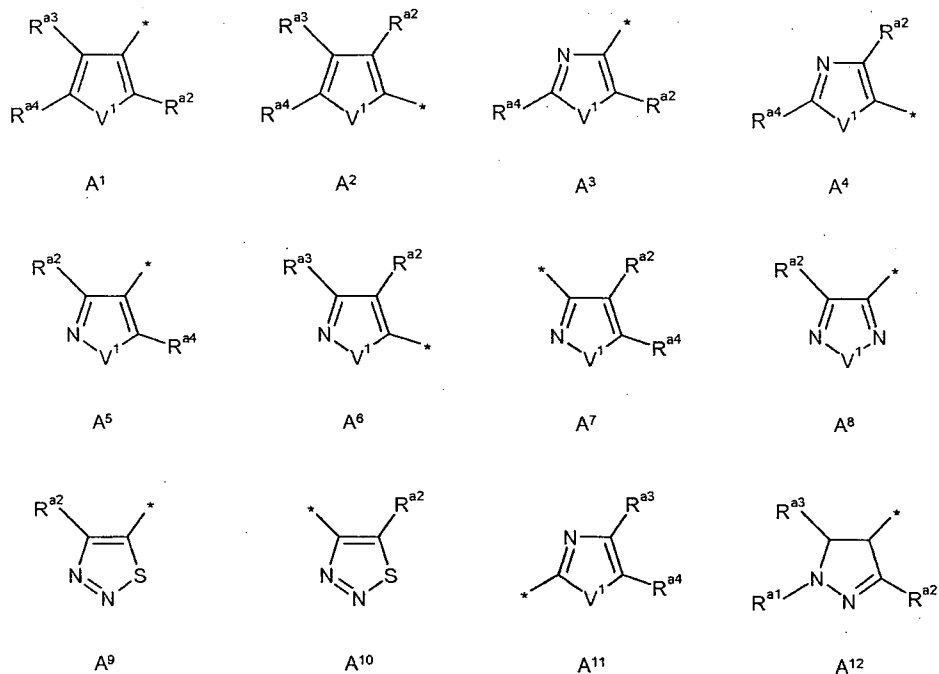
Preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein A is selected in the list consisting of:



wherein:

- -* represents the attachment point to the carbonyl moiety ;
- V¹ represents O, S or NR^{a1} ;
- R^{a1} represents a hydrogen atom ; C₁-C₆-alkyl ; C₁-C₆-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₆-alkoxy-C₁-C₆-alkyl ;
- R^{a2} and R^{a3}, that can be the same or different represent a hydrogen atom ; a halogen atom ; cyano ; C₁-C₆-alkyl ; C₁-C₆-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₆-alkoxy or C₁-C₆-halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₃-C₇-cycloalkyl ;
- R^{a4} represents a hydrogen atom, a halogen atom ; cyano ; C₁-C₆-alkyl ; C₁-C₆-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₆-alkoxy or C₁-C₆-halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₃-C₇-cycloalkyl ; C₁-C₆-alkylsulfanyl ; amino ; C₁-C₆-alkylamino ; di-(C₁-C₆-alkyl)amino ; C₁-C₆-alkyloxycarbonyl.

More preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein A is selected in the list consisting of:



wherein:

- -* represents the attachment point to the carbonyl group ;
- V¹ represents O, S or NR^{a1} ;
- 5 • R^{a1} represents a hydrogen atom ; C₁-C₈-alkyl ; C₁ C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl ;
- R^{a2} represents C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-alkoxy ;
- R^{a3} represents a hydrogen atom ; a halogen atom ; C₁-C₈-alkyl ;
- R^{a4} represents a hydrogen atom, a halogen atom ; C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-halogenoalkyl
- 10 comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different.

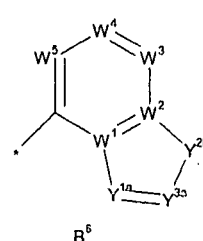
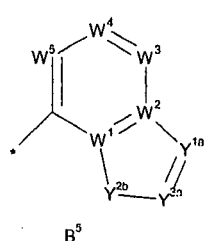
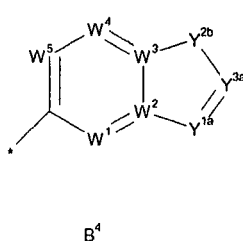
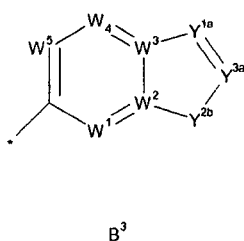
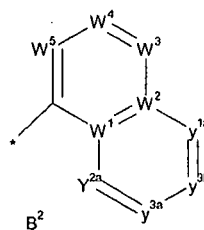
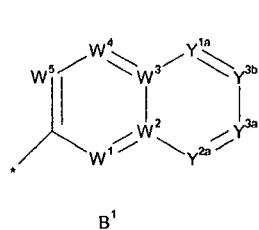
Other more preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein

- A represents A⁵ ;
- V¹ represents NR^{a1} ;
- 15 • R^{a1} represents C₁-C₈-alkyl ;
- R^{a2} and R^{a3}, that can be the same or different represent a hydrogen atom ; a halogen atom ; C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; or
- A represents A⁴ ;
- 20 • V¹ represents S ;

- R^{a2} represents a C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ;
- R^{a4} represents a hydrogen atom ; C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different.

5

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein B is selected in the list consisting of :



wherein

- W^1 to W^5 , Y^{1a} , Y^{2a} , Y^{3a} and Y^{3b} independently represent NR^{b2} or CR^{b3} ;
- Y^{2b} represents O, S or NR^{b2} .

10

Other more preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein B represent B^1 or B^2 ; W^1 to W^5 , Y^{1a} , Y^{2a} , Y^{3a} and Y^{3b} independently represent CR^{b3} ; or B represent B^5 or B^6 ; W^1 to W^5 , Y^{1a} and Y^{3a} independently represent CR^{b1} ; Y^{2b} represents S.

15

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein T represents O or S.

20

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein Z^1 represents cyclopropyl.

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein Z^2 and Z^3 independently represent a hydrogen atom or C_1 - C_8 alkyl.

Other preferred compounds of formula (I) according to the invention are those wherein Q represents a halogen atom ; C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-alkoxy ; C₁-C₈-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different.

5

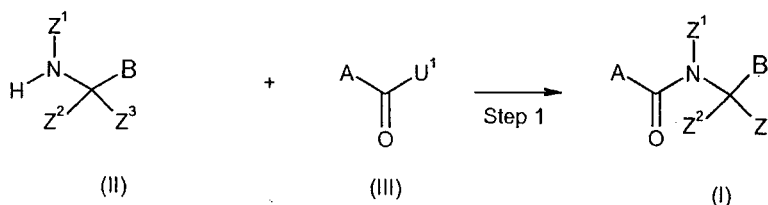
The above mentioned preferences with regard to the substituents of the compounds of formula (I) according to the invention can be combined in various manners, either individually, partially or entirely. These combinations of preferred features thus provide sub-classes of compounds according to the invention.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

- preferred features of A with preferred features of one or more T, Z¹ to Z³, R^a, R^b, T, V¹ and Q ;
- preferred features of T with preferred features of one or more A, Z¹ to Z³, R^a, R^b, V¹ and Q ;
- preferred features of Z¹ with preferred features of one or more A, T, Z², Z³, R^a, R^b, V¹ and Q ;
- preferred features of Z² with preferred features of one or more A, T, Z¹, Z³, R^a, R^b, V¹ and Q ;
- preferred features of Z³ with preferred features of one or more A, T, Z¹, Z², R^a, R^b, V¹ and Q ;
- preferred features of R^a with preferred features of one or more A, T, Z¹ to Z³, R^b, V¹ and Q ;
- preferred features of R^b with preferred features of one or more A, T, Z¹ to Z³, R^a, V¹ and Q ;
- preferred features of V¹ with preferred features of one or more A, T, Z¹ to Z³, R^a, R^b and Q ;
- preferred features of Q with preferred features of one or more A, T, Z¹ to Z³, R^a, R^b and V¹ ;

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 A, T, Z¹ to Z³, R^a, R^b, V¹ and Q ; 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) wherein T represents O, as illustrated by the following reaction scheme:



30

Process P1

wherein

- A, Z¹ to Z³, W¹ to W⁵ and B are as herein-defined ;
- U¹ represents a halogen atom or a leaving group.

In process P1 according to the invention, step 1 can be performed if appropriate in the presence
5 of a solvent and if appropriate in the presence of an acid binder.

N-cycloalkyl-amine derivatives of formula (II) are known or can be prepared by known
processes such as reductive amination of aldehyde or ketone (Bioorganics and Medicinal
Chemistry Letters, 2006, p 2014 synthesis of compounds 7 and 8), or reduction of imines
10 (Tetrahedron, 2005, p 11689), or nucleophilic substitution of halogen, mesylate or tosylate
(Journal of Medicinal Chemistry, 2002, p 3887 preparation of intermediate for compound 28).

Carboxylic acid derivatives of formula (III) are known or can be prepared by known processes
(WO-93/11117 ; EP-545 099 ; Nucleosides & Nucleotides, 1987, p737-759, Bioorg. Med. Chem.,
15 2002, p2105-2108).

Suitable acid binders for carrying out process P1 according to the invention are in each case all
inorganic and organic bases that are customary for such reactions. Preference is given to using
alkaline earth metal, alkali metal hydride, alkali metal hydroxides or alkali metal alkoxides, such
20 as sodium hydroxide, sodium hydride, calcium hydroxide, potassium hydroxide, potassium tert-
butoxide or other ammonium hydroxide, alkali metal carbonates, such as cesium carbonate,
sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate, alkali
metal or alkaline earth metal acetates, such as sodium acetate, potassium acetate, calcium
acetate, and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, diisopropylethylamine,
25 tributylamine, N,N-dimethylaniline, pyridine, N-methylpiperidine, N,N-dimethylaminopyridine,
diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBN) or diazabicycloundecene (DBU).

It is also possible to work in the absence of an additional condensing agent or to employ an
excess of the amine component, so that it simultaneously acts as acid binder agent.

Suitable solvents for carrying out process P1 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
35 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.

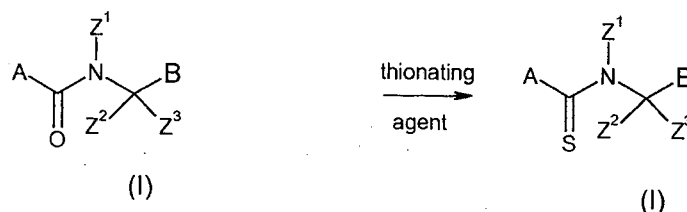
When carrying out process P1 according to the invention, the reaction temperatures can independently be varied within a relatively wide range. Generally, processes according to the invention are carried out at temperatures between 0°C and 160°C, preferably between 10°C and 120°C. A way to control the temperature for the processes according to the invention is to use micro-wave technology.

Process P1 according to the invention is generally independently carried out under atmospheric pressure. However, in each case, it is also possible to operate under elevated or reduced pressure.

When carrying out step 1 of process P1 according to the invention, generally 1 mol or other an excess of the acid derivative of formula (III) and from 1 to 3 mol of acid binder are employed per mole of amine of formula (II). It is also possible to employ the reaction components in other ratios.

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 can still be present.

According to a further aspect according to the invention, there is provided a process P2 for the preparation of a compound of formula (I), wherein T represents S, and illustrated according to the following reaction scheme :



Process P2

wherein A, Z¹ to Z³, W¹ to W⁵ and B are as herein-defined.

Process P2 can be performed in the presence of a thionating agent.

Starting amide derivatives of formula (I) can be prepared according to process P1.

5

10

Suitable thionating agents for carrying out process P2 according to the invention can be sulphur (S), sulphydric acid (H₂S), sodium sulfide (Na₂S), sodium hydrosulfide (NaHS), boron trisulfide (B₂S₃), bis (diethylaluminium) sulfide ((AlEt₂)₂S), ammonium sulfide ((NH₄)₂S), phosphorous pentasulfide (P₂S₅), Lawesson's reagent (2,4-bis(4-methoxyphenyl)-1,2,3,4-dithiadiphosphetane 2,4-disulfide) or a polymer-supported thionating reagent such as described in *J.Chem.Soc. Perkin 1*, (2001), 358.

15

in the presence or in the absence, of a catalytic or stoichiometric or more, quantity of a base such as an inorganic and organic base. Preference is given to using alkali metal carbonates, such as sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate ; heterocyclic aromatic bases, such as pyridine, picoline, lutidine, collidine ; and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, tributylamine, N,N-dimethylaniline, N,N-dimethylaminopyridine or N-methylpiperidine.

20

25

Suitable solvents for carrying out process P2 according to the invention can be 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 or 1,2-diethoxyethane ; nitriles, such as acetonitrile, propionitrile, n- or i-butyronitrile or benzonitrile ; sulphurous solvents, such as sulpholane or carbon disulfide.

30

When carrying out process P2 according to the invention, the reaction temperatures can be varied within a relatively wide range. In general, these processes are carried out at temperatures from 0°C to 160°C, preferably from 10°C to 120°C. A way to control the temperature for the processes according to the invention is to use micro-wave technology.

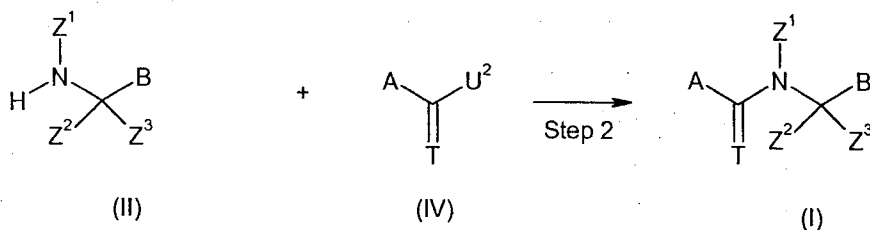
Process P2 according to the invention is generally carried out under atmospheric pressure. It is also possible to operate under elevated or reduced pressure.

When carrying out process P2 according to the invention, 1 mole or an excess of the sulphur equivalent of the thionating agent and from 1 to 3 moles of the base can be employed per mole of the amide derivative (I).

It is also possible to employ the reaction components in other ratios. Work-up is carried out by known methods.

In general, the reaction mixture is concentrated under reduced pressure. The residue that remains can be freed by known methods, such as chromatography or recrystallization, from any impurities that can still be present.

According to a further aspect according to the invention, there is provided a process P3 for the preparation of a compound of formula (I), wherein T represents N-R^c, N-OR^d, N-NR^cR^d or N-CN, and illustrated according to the following reaction scheme :



Process P3

wherein

- A, Z¹ to Z³, W¹ to W⁵ and B are as herein-defined ;
- U² represents a chlorine atom or a methylsulfonyl group,

In process P3 according to the invention, step 2 can be performed in the presence of an acid binder and in the presence of a solvent.

N-cycloalkyl-amine derivatives of formula (II) are known or can be prepared by known processes such as reductive amination of aldehyde or ketone (Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters, 2006, p 2014 synthesis of compounds 7 and 8), or reduction of imines (Tetrahedron, 2005, p 11689), or nucleophilic substitution of halogen, mesylate or tosylate (Journal of Medicinal Chemistry, 2002, p 3887 preparation of intermediate for compound 28).

11-substituted carbodiimidoyl chloride of formula (IV) are known or can be prepared by known processes, for example as described in Houben-Weyl, "Methoden der organischen Chemie" (1955), E5/1, p 628-633 and Fatai, "The chemistry of amidines and imidates" (1975), p 296-301.

5 11-substituted or 11,11-disubstituted hydrazonoyl chloride of formula (IV) are known or can be prepared by known processes, for example as described in Tetrahedron, 1991, 47, p 447 and Journal of Heterocyclic Chemistry, 1983, 20, p 225

10 11-cyano carbodiimidoyl chloride of formula (IV) are known or can be prepared by known processes, for example as described in Tetrahedron Letters, 1968, p 5523 and Bioorganic and Medicinal Chemistry, 2006, p 4723.

Suitable acid binders for carrying out process P3 according to the invention can be inorganic and organic bases that are customary for such reactions. Preference is given to using alkaline
15 earth metal or alkali metal hydroxides, such as sodium hydroxide, calcium hydroxide, potassium hydroxide or other ammonium hydroxide derivatives ; alkali metal carbonates, such as sodium carbonate, potassium carbonate, potassium bicarbonate, sodium bicarbonate ; alkali metal or alkaline earth metal acetates, such as sodium acetate, potassium acetate, calcium acetate ;
alkaline earth metal or alkali metal hydrides, such as sodium hydride or potassium hydride ;
20 alkaline earth metal or alkali metal alcoholates, such as sodium methylate, sodium ethylate, sodium propylate or potassium t-butylate (and also tertiary amines, such as trimethylamine, triethylamine, tributylamine, 11,11-dimethylaniline, pyridine, N-methylpiperidine, N,N-dimethylaminopyridine, diazabicyclooctane (DABCO), diazabicyclononene (DBU) or diazabicycloundecene (DBU) ; or a polymer-supported acid scavenger (for example as detailed in
25 <http://www.iris-biotech.de/downloads/scavengers.pdf>).

It is also possible to work in the absence of any additional acid binder.

Suitable solvents for carrying out process P3 according to the invention can be customary inert organic solvents. Preference is given to using optionally halogenated aliphatic, alicyclic or
30 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
35 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, sulfoxides, such as dimethyl sulfoxide, or sulphones, such as sulfolane.

5 When carrying out process P3 according to the invention, the reaction temperatures can be varied within a relatively wide range. In general, these processes are carried out at temperatures from 0°C to 160°C, preferably from 10°C to 120°C. A way to control the temperature for the processes according to the invention is to use micro-wave technology.

10 Process P3 according to the invention is generally carried out under atmospheric pressure. It is also possible to operate under elevated or reduced pressure.

When carrying out process P3 according to the invention, the amine derivative of formula (III) can be employed as its salt, such as chlorhydrate or any other convenient salt.

15

When carrying out process P3 according to the invention, 1 mole or an excess of the amine derivative of formula (II) and from 1 to 3 moles of the acid binder can be employed per mole of the N-substituted carboximidoyl chloride of formula (IV).

It is also possible to employ the reaction components in other ratios. Work-up is carried out by
20 known methods.

In general, the reaction mixture is concentrated under reduced pressure. The residue that remains can be freed by known methods, such as chromatography or recrystallization, from any impurities that can still be present.

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

30 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 that is sufficient to control or destroy the fungi present or liable to
35 appear on the crops, and that 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, that are within the capabilities of a person skilled in the art.

5

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.

10

According to the invention, the term "support" denotes a natural or synthetic, organic or inorganic compound with that 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 can 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 can also be used.

15

The composition according to the invention can also comprise additional components. In particular, the composition can 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. Mention can 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 derivatives of the above compounds comprising 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 can be comprised from 5% to 40% by weight of the composition.

20

Optionally, additional components can 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, that complies with the usual formulation techniques.

25

30

35

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

- 5 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, macrogranule, microgranule, oil dispersible powder, oil miscible
- 10 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, water soluble powder for seed treatment and
- 15 wettable powder. These compositions include not only compositions that 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 that must be diluted before application to the crop.
- 20 The compounds according to the invention can also be mixed with one or more insecticide, 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.
- 25 Examples of suitable fungicide mixing partners can be selected in the following lists:
(1) Inhibitors of the nucleic acid synthesis, for example benalaxyl, benalaxyl-M, bupirimate, clozylacon, dimethirimol, ethirimol, furalaxyl, hymexazol, metalaxyl, metalaxyl-M, ofurace, oxadixyl and oxolinic acid.
(2) Inhibitors of the mitosis and cell division, for example benomyl, carbendazim, chlorfenazole,
- 30 diethofencarb, ethaboxam, fuberidazole, pencycuron, thiabendazole, thiophanate, thiophanate-methyl and zoxamide.
(3) Inhibitors of the respiration, for example diflumetorim as CI-respiration inhibitor; bixafen, boscalid, carboxin, fenfuram, flutolanil, fluopyram, furametpyr, furmecyclox, isopyrazam (9R-component), isopyrazam (9S-component), mepronil, oxycarboxin, penthiopyrad, thifluzamide as
- 35 CII-respiration inhibitor; amisulbrom, azoxystrobin, cyazofamid, dimoxystrobin, enestroburin,

famoxadone, fenamidone, fluoxastrobin, lresoxim-methyl, metominostrobin, oryastrobin, picoxystrobin, pyraclostrobin, pyribencarb, trifloxystrobin as CIII-respiration inhibitor.

(4) Compounds capable to act as an uncoupler, like for example binapacryl, dinocap, fluazinam and meptyldinocap.

(5) Inhibitors of the ATP production, for example fentin acetate, fentin chloride, fentin hydroxide, and silthiofam.

(6) Inhibitors of the amino acid and/or protein biosynthesis, for example andoprim, blastocidin-S, cyprodinil, kasugamycin, kasugamycin hydrochloride hydrate, mepanipyrim and pyrimethanil.

(7) Inhibitors of the signal transduction, for example fenpiclonil, fludioxonil and quinoxifen.

(8) Inhibitors of the lipid and membrane synthesis, for example biphenyl, chlozolinate, edifenphos, etridiazole, iodocarb, iprobenfos, iprodione, isoprothiolane, procymidone, propamocarb, propamocarb hydrochloride, pyrazophos, tolclofos-methyl and vinclozolin.

(9) Inhibitors of the ergosterol biosynthesis, for example aldimorph, azaconazole, bitertanol, bromuconazole, cyproconazole, diclobutrazole, difenoconazole, diniconazole, diniconazole-M, dodemorph, dodemorph acetate, epoxiconazole, etaconazole, fenarimol, fenbuconazole, fenhexamid, fenpropidin, fenpropimorph, fluquinconazole, flurprimidol, flusilazole, flutriafol, furconazole, furconazole-cis, hexaconazole, imazalil, imazalil sulfate, imibenconazole, ipconazole, metconazole, myclobutanil, naftifine, nuarimol, oxpoconazole, paclobutrazol, pefurazoate, penconazole, piperalin, prochloraz, propiconazole, prothioconazole, pyributicarb, pyrifenoxy, quinconazole, simeconazole, spiroxamine, tebuconazole, terbinafine, tetraconazole, triadimefon, triadimenol, tridemorph, triflumizole, triforine, triticonazole, uniconazole, viniconazole and voriconazole.

(10) Inhibitors of the cell wall synthesis, for example benthiavalicarb, dimethomorph, flumorph, iprovalicarb, mandipropamid, polyoxins, polyoxorim, prothiocarb, validamycin A, and valiphenal.

(11) Inhibitors of the melanine biosynthesis, for example carpropamid, diclocymet, fenoxanil, phthalide, pyroquilon and tricyclazole.

(12) Compounds capable to induce a host defence, like for example acibenzolar-S-methyl, probenazole, and tiadinil.

(13) Compounds capable to have a multisite action, like for example bordeaux mixture, captafol, captan, chlorothalonil, copper naphthenate, copper oxide, copper oxychloride, copper preparations such as copper hydroxide, copper sulphate, dichlofluanid, dithianon, dodine, dodine free base, ferbam, fluorefolpet, folpet, guazatine, guazatine acetate, iminoctadine, iminoctadine albesilate, iminoctadine triacetate, mancooper, mancozeb, maneb, metiram, metiram zinc, oxine-copper, propamidine, propineb, sulphur and sulphur preparations including calcium polysulphide, thiram, tolyfluanid, zineb and ziram.

(14) Further compounds like for example 2,3-dibutyl-6-chlorothieno[2,3-d]pyrimidin-4(3H)-one, ethyl (2Z)-3-amino-2-cyano-3-phenylprop-2-enoate, N-[2-(1,3-dimethylbutyl)phenyl]-5-fluoro-1,3-dimethyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, N-{2-[1,1'-bi(cyclopropyl)-2-yl]phenyl}-3-(difluoromethyl)-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide, (2E)-2-(2-[[6-(3-chloro-2-methylphenoxy)-5-fluoropyrimidin-4-yl]oxy]phenyl)-2-(methoxyimino)-N-methylethanamide, (2E)-2-{2-[[[(2E,3E)-4-(2,6-dichlorophenyl)but-3-en-2-ylidene]amino]oxy)methyl]phenyl}-2-(methoxyimino)-N-methylethanamide, 2-chloro-N-(1,1,3-trimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-4-yl)pyridine-3-carboxamide, N-(3-ethyl-3,5,5-trimethylcyclohexyl)-3-(formylamino)-2-hydroxybenzamide, 5-methoxy-2-methyl-4-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluoromethyl)phenyl]ethylidene]amino]oxy)methyl]phenyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one, (2E)-2-(methoxyimino)-N-methyl-2-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluoromethyl)phenyl]ethylidene]amino]oxy)methyl]phenyl)ethanamide, (2E)-2-(methoxyimino)-N-methyl-2-{2-[(E)-1-[3-(trifluoromethyl)phenyl]ethoxy]imino)methyl]phenyl}ethanamide, (2E)-2-{2-[[[(1E)-1-(3-[[E)-1-fluoro-2-phenylethenyl]oxy]phenyl]ethylidene]amino]oxy)methyl]phenyl}-2-(methoxyimino)-N-methylethanamide, 1-(4-chlorophenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)cycloheptanol, methyl 1-(2,2-dimethyl-2,3-dihydro-1H-inden-1-yl)-1H-imidazole-5-carboxylate, N-ethyl-N-methyl-N'-{2-methyl-5-(trifluoromethyl)-4-[3-(trimethylsilyl)propoxy]phenyl}imidoformamide, N'-{5-(difluoromethyl)-2-methyl-4-[3-(trimethylsilyl)propoxy]phenyl}-N-ethyl-N-methylimidoformamide, O-{1-[(4-methoxyphenoxy)methyl]-2,2-dimethylpropyl} 1H-imidazole-1-carbothioate, N-[2-(4-{[3-(4-chlorophenyl)prop-2-yn-1-yl]oxy}-3-methoxyphenyl)ethyl]-N2-(methylsulfonyl)valinamide, 5-chloro-7-(4-methylpiperidin-1-yl)-6-(2,4,6-trifluorophenyl)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pyrimidine, 5-amino-1,3,4-thiadiazole-2-thiol, propamocarb-fosetyl, 1-[(4-methoxyphenoxy)methyl]-2,2-dimethylpropyl 1H-imidazole-1-carboxylate, 1-methyl-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroethoxy)phenyl]-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazole-4-carboxamide, 2,3,5,6-tetrachloro-4-(methylsulfonyl)pyridine, 2-butoxy-6-iodo-3-propyl-4H-chromen-4-one, 2-phenylphenol and salts, 3-(difluoromethyl)-1-methyl-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroethoxy)phenyl]-1H-pyrazole-4-carboxamide, 3,4,5-trichloropyridine-2,6-dicarbonitrile, 3-[5-(4-chlorophenyl)-2,3-dimethylisoxazolidin-3-yl]pyridine, 3-chloro-5-(4-chlorophenyl)-4-(2,6-difluorophenyl)-6-methylpyridazine, 4-(4-chlorophenyl)-5-(2,6-difluorophenyl)-3,6-dimethylpyridazine, quinolin-8-ol, quinolin-8-ol sulfate (2:1) (salt), benthiazole, bethoxazin, capsimycin, carvone, chinomethionat, chloroneb, cufraneb, cyflufenamid, cymoxanil, cyprosulfamide, dazomet, debacarb, dichlorophen, diclomezine, dicloran, difenzoquat, difenzoquat methylsulphate, diphenylamine, ecomate, ferimzone, flumetover, fluopicolide, fluoroimide, flusulfamide, fosetyl-aluminium, fosetyl-calcium, fosetyl-sodium, hexachlorobenzene, irumamycin, isotianil, methasulfocarb, methyl (2E)-2-(2-

5 [({cyclopropyl}[(4-methoxyphenyl)imino]methyl)thio)methyl]phenyl)-3-methoxyacrylate, methyl isothiocyanate, metrafenone, (5-bromo-2-methoxy-4-methylpyridin-3-yl)(2,2,4-trimethoxy-6-methylphenyl)methanone, mildiomyacin, tolnifanide, 11-(4-chlorobenzyl)-3-[3-methoxy-4-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]propanamide, 11-[(4-chlorophenyl)(cyano)methyl]-2-[3-methoxy-4-(prop-2-yn-1-yloxy)phenyl]propanamide, 11-[(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)methyl]-2,4-dichloropyridine-3-carboxamide, 11-[1-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)ethyl]-2,4-dichloropyridine-3-carboxamide, N-11-[1-(5-bromo-3-chloropyridin-2-yl)ethyl]-2-fluoro-4-iodopyridine-3-carboxamide, 11-[(Z)-[({cyclopropylmethoxy}imino)[6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methyl]-2-phenylacetamide, 11-[(E)-[({cyclopropylmethoxy}imino)[6-(difluoromethoxy)-2,3-difluorophenyl]methyl]-2-phenylacetamide, natamycin, nickel dimethyldithiocarbamate, nitrothal-isopropyl, oethillinone, oxamocarb, oxyfenthion, pentachlorophenol and salts, phenazine-1-carboxylic acid, phenothrin, phosphorous acid and its salts, propamocarb fosetylato, propanosine-sodium, proquinazid, pyrrolnitrine, quintozene, S-prop-2-en-1-yl 5-amino-2-(1-methylethyl)-4-(2-methylphenyl)-3-oxo-2,3-dihydro-1H-pyrazole-1-carbothioate, tecloftalam, tecnazene, triazoxide, trichlamide, 5-chloro-11'-phenyl-11'-prop-2-yn-1-ylthiophene-2-sulfonohydrazide and zarilamid.

20 The composition according to the invention comprising a mixture of a compound of formula (I) with a bactericide compound can also be particularly advantageous. Examples of suitable bactericide mixing partners can be selected in the following list: bronopol, dichlorophen, nitrapyrin, nickel dimethyldithiocarbamate, kasugamycin, oethillinone, furancarboxylic acid, oxytetracycline, probenazole, streptomycin, tecloftalam, copper sulphate and other copper preparations.

25 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.

30 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, 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.

35 The method of treatment according to the invention can 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 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 may 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 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 plantains), 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 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, rye, 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 sp. (for instance beetroots), Elaeis sp. (for instance oil palm); 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 can be made of :

- Powdery Mildew Diseases such as
- Blumeria diseases caused for example by *Blumeria graminis*;
 - 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*;
 - Hemileia diseases caused for example by *Hemileia vastatrix*;
 - Phakopsora diseases caused for example by *Phakopsora pachyrhizi* and *Phakopsora meibomia*;
 - Puccinia diseases caused for example by *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* or *Puccinia striiformis*;
 - Uromyces diseases caused for example by *Uromyces appendiculatus*;
- Oomycete Diseases such as

21

Albugo diseases caused for example by *Albugo candida*;

Bremia diseases caused for example by *Bremia lactucae*;

Peronospora diseases caused for example by *Peronospora pisi* and *Peronospora brassicae*;

Phytophthora diseases caused for example by *Phytophthora infestans*;

5 Plasmopara diseases caused for example by *Plasmopara viticola*;

Pseudoperonospora diseases caused for example by *Pseudoperonospora humuli* and *Pseudoperonospora cubensis*;

Pythium diseases caused for example by *Pythium ultimum*;

10 Leaf spot, Leaf blotch and Leaf Blight Diseases such as

Alternaria diseases caused for example by *Alternaria solani*;

Cercospora diseases caused for example by *Cercospora beticola*;

Cladosporium diseases caused for example by *Cladosporium cucumerinum*;

15 Cochliobolus diseases caused for example by *Cochliobolus sativus* (Conidiaform: *Drechslera*,
Syn: *Helminthosporium*) or *Cochliobolus miyabeanus*;

Colletotrichum diseases caused for example by *Colletotrichum lindemuthianum*;

Cycloconium diseases caused for example by *Cycloconium oleaginum*;

Diaporthe diseases caused for example by *Diaporthe citri*;

Elsinoe diseases caused for example by *Elsinoe fawcettii*;

20 Gloeosporium diseases caused for example by *Gloeosporium laeticolor*;

Glomerella diseases caused for example by *Glomerella cingulata*;

Guignardia diseases caused for example by *Guignardia bidwellii*;

Leptosphaeria diseases caused for example by *Leptosphaeria maculans* and *Leptosphaeria nodorum*;

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

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

Phaeosphaeria diseases caused for example by *Phaeosphaeria nodorum*;

Pyrenophora diseases caused for example by *Pyrenophora teres* or *Pyrenophora tritici repentis*;

30 Ramularia- diseases caused for example by *Ramularia collo-cygni* or *Ramularia areola*;

Rhynchosporium diseases caused for example by *Rhynchosporium secalis*;

Septoria diseases caused for example by *Septoria apii* and *Septoria lycopersici*;

Typhula diseases caused for example by *Thyphula incarnata*;

Venturia diseases caused for example by *Venturia inaequalis*;

- Root-, Sheath and Stem Diseases such as
- Corticium diseases caused for example by *Corticium graminearum*;
 - Fusarium diseases caused for example by *Fusarium oxysporum*;
 - Gaeumannomyces diseases caused for example by *Gaeumannomyces graminis*;
 - 5 Rhizoctonia diseases caused for example by *Rhizoctonia solani*;
 - Sarocladium diseases caused for example by *Sarocladium oryzae*;
 - Sclerotium diseases caused for example by *Sclerotium oryzae*;
 - Tapesia diseases caused for example by *Tapesia acuformis*;
 - Thielaviopsis diseases caused for example by *Thielaviopsis basicola*;
 - 10
- Ear and Panicle Diseases including Maize cob 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 cladosporioides*;
 - 15 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*;
 - 20
- Smut- and Bunt Diseases such as
- 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*;
 - 25
- 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* and *Penicillium*
 - 30 *purpurogenum*;
 - Rhizopus diseases caused by example by *Rhizopus stolonifer*
 - Sclerotinia diseases caused for example by *Sclerotinia sclerotiorum*;
 - Verticillium diseases caused for example by *Verticillium alboatrum*;
 - 35
- Seed- and Soilborne Decay, Mould, Wilt, Rot and Damping-off diseases

Alternaria diseases caused for example by *Alternaria brassicicola*;
Aphanomyces diseases caused for example by *Aphanomyces euteiches*;
Ascochyta diseases caused for example by *Ascochyta lentis*;
Aspergillus diseases caused for example by *Aspergillus flavus*;
5 Cladosporium diseases caused for example by *Cladosporium herbarum*;
Cochliobolus diseases caused for example by *Cochliobolus sativus*;
(Conidiaform: Drechslera, Bipolaris Syn: Helminthosporium);
Colletotrichum diseases caused for example by *Colletotrichum coccodes*;
Fusarium diseases caused for example by *Fusarium culmorum*;
10 Gibberella diseases caused for example by *Gibberella zeae*;
Macrophomina diseases caused for example by *Macrophomina phaseolina*;
Microdochium diseases caused for example by *Microdochium nivale*;
Monographella diseases caused for example by *Monographella nivalis*;
Penicillium diseases caused for example by *Penicillium expansum*;
15 Phoma diseases caused for example by *Phoma lingam*;
Phomopsis diseases caused for example by *Phomopsis sojae*;
Phytophthora diseases caused for example by *Phytophthora cactorum*;
Pyrenophora diseases caused for example by *Pyrenophora graminea*;
Pyricularia diseases caused for example by *Pyricularia oryzae*;
20 Pythium diseases caused for example by *Pythium ultimum*;
Rhizoctonia diseases caused for example by *Rhizoctonia solani*;
Rhizopus diseases caused for example by *Rhizopus oryzae*;
Sclerotium diseases caused for example by *Sclerotium rolfsii*;
Septoria diseases caused for example by *Septoria nodorum*;
25 Typhula diseases caused for example by *Typhula incarnata*;
Verticillium diseases caused for example by *Verticillium dahliae*;

Canker, Broom and Dieback Diseases such as

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 including deformation of blooms and fruits such as
 Exobasidium diseases caused for example by *Exobasidium vexans*.
 Taphrina diseases caused for example by *Taphrina deformans*;

- 5 Decline Diseases of Wooden Plants such as
 Esca disease caused for example by *Phaeomoniella clamydospora*, *Phaeoacremonium aleophilum* and *Fomitiporia mediterranea*;
 Ganoderma diseases caused for example by *Ganoderma boninense*;

- 10 Diseases of Flowers and Seeds such as
 Botrytis diseases caused for example by *Botrytis cinerea*;

- Diseases of Tubers such as
 Rhizoctonia diseases caused for example by *Rhizoctonia solani*;
 15 Helminthosporium diseases caused for example by *Helminthosporium solani*;

Club root diseases such as
 Plasmodiophora diseases, caused for example by *Plasmodiophora brassicae*.

- 20 Diseases caused by Bacterial Organisms such as
 Xanthomonas species for example *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;
 Pseudomonas species for example *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;
 Erwinia species for example *Erwinia amylovora*.

- 25 The fungicide composition according to the invention can 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
 30 composition according to the invention ; this includes for example direct application, spraying,
 dipping, injection or any other suitable means.

- 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
 35 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.

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.

The fungicide composition according to the invention can 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 that a heterologous gene encoding a protein of interest has been stably integrated. The expression "heterologous gene encoding a protein of interest" essentially means genes that give the transformed plant new agronomic properties, or genes for improving the agronomic quality of the modified plant.

The compounds or mixtures according to the invention can 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*.

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

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

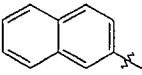
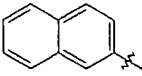
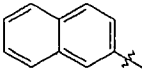
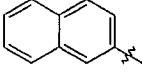
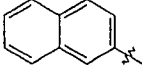
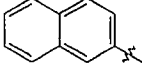
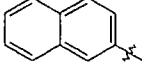
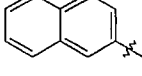
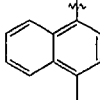
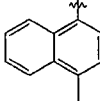
In the following table, M+H (or M-H) means the molecular ion peak, plus or minus 1 a.m.u. (atomic mass unit) respectively, as observed in mass spectroscopy and M (Apcl+) means the molecular ion peak as it was found via positive atmospheric pressure chemical ionisation in mass spectroscopy.

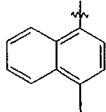
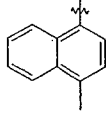
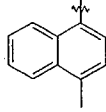
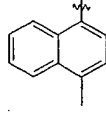
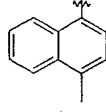
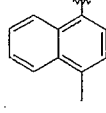
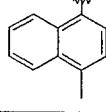
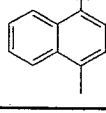
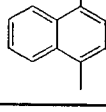
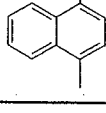
In the following table, the logP values were determined in accordance with EEC Directive 79/831 Annex V.A2 by HPLC (High Performance Liquid Chromatography) on a reversed-phase column (C 18), using the method described below :

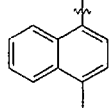
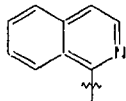
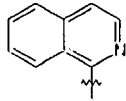
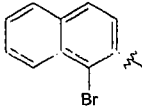
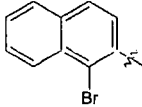
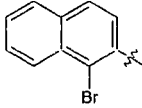
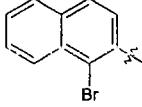
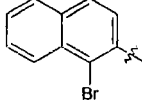
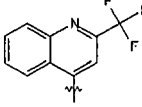
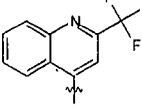
Temperature: 40°C; Mobile phases : 0.1% aqueous formic acid and acetonitrile; linear gradient from 10% acetonitrile to 90% acetonitrile.

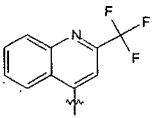
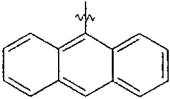
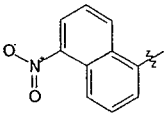
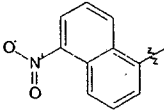
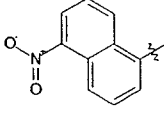
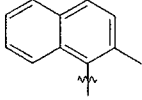
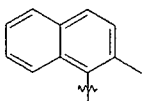
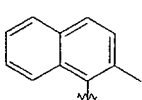
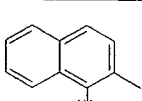
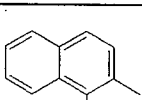
Calibration was carried out using unbranched alkan-2-ones (comprising 3 to 16 carbon atoms) with known logP values (determination of the logP values by the retention times using linear interpolation between two successive alkanones).

24

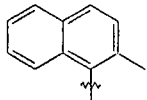
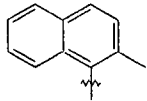
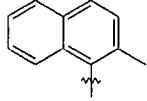
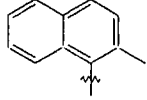
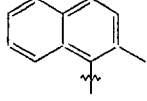
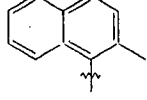
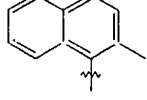
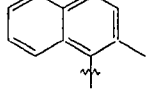
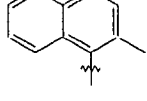
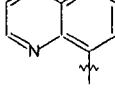
Ex. N°	A	V ¹	R ⁰²	R ⁰³	R ⁰⁴	T	Z ²	Z ³	E	LcgP	M+H
1	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			330
2	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			352
3	A5	N-Me	Me	-	F	S	H	H			354
4	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			360
5	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			356
6	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			370
7	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			336
8	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			350
9	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			352
10	A5	N-Me	Me	-	F	S	H	H			363

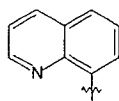
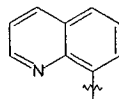
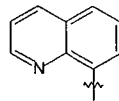
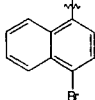
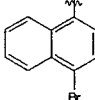
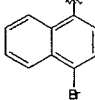
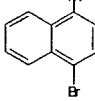
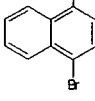
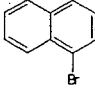
Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
11	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			370
12	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			384
13	A2	N-Me	H	H	H	O	Me	H			333
14	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H			348
15	A2	S	Me	H	H	O	Me	H			350
16	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			366
17	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			350
18	A5	N-Me	CF3	-	F	O	Me	H			420
19	A1	O	Me	H	H	O	Me	H			334
20	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			364

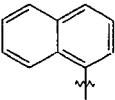
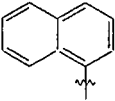
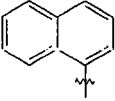
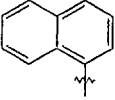
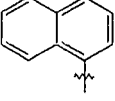
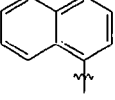
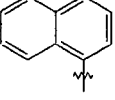
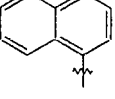
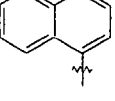
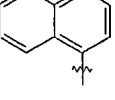
Ex. N°	A	V ¹	R ⁰²	R ⁰³	R ⁰⁴	T	Z ²	Z ³	E	LogP	M+H
21	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	Me	H			401
22	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
23	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
24	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			416
25	A5	N-Me	Me	-	F	S	H	H		4,39	
26	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H		2,63	
27	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		3,24	
28	A5	N-Me	OMe	-	H	S	H	H		4,25	
29	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			407
30	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			421

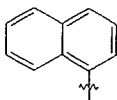
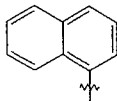
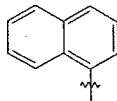
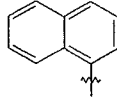
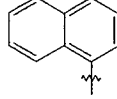
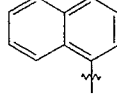
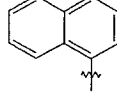
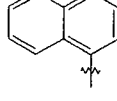
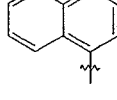
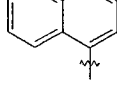
Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
31	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			425
32	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			406
33	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			383
34	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			401
35	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			381
36	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			352
37	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			
38	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			
39	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			
40	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		3,25	

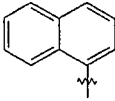
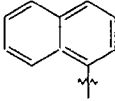
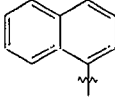
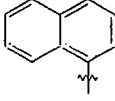
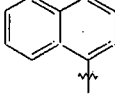
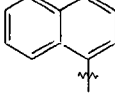
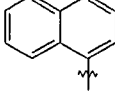
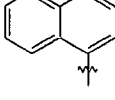
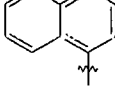
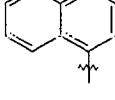
28

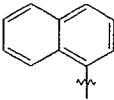
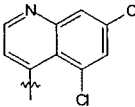
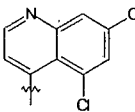
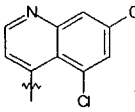
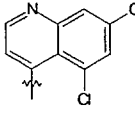
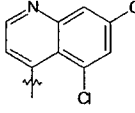
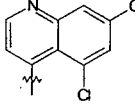
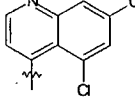
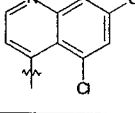
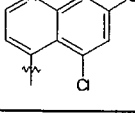
Ex. N°	A	V¹	R²²	R²²	R²²	T	Z²	Z³	E	LogP	M+H
41	A5	H-Me	OMe	-	H	O	H	H			350
42	A5	N-Me	OMe	-	H	S	H	H			366
42	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			
44	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			319
45	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			334
46	A2	ε	Me	H	H	O	H	H			326
47	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			406
48	A1	O	Me	H	H	O	H	H			320
49	A1	H-Me	H	CF3	H	O	H	H			307
50	A5	H-Me	Me	-	F	O	H	H			329

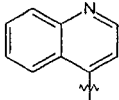
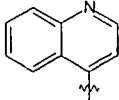
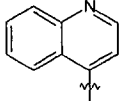
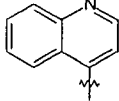
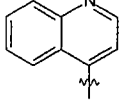
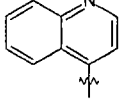
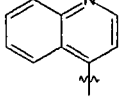
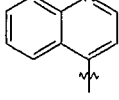
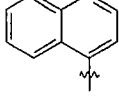
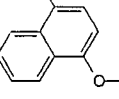
Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
51	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			357
52	A5	N-Me	CHF2	-	H	S	H	H			373
53	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
54	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		3,62	
55	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		3,69	
56	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			414
57	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			430
58	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			444
59	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			448
60	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H		5,2	

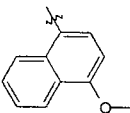
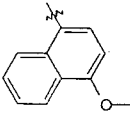
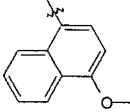
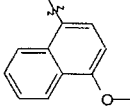
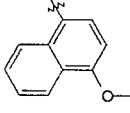
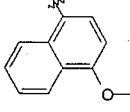
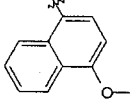
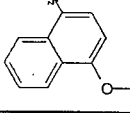
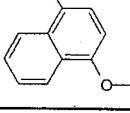
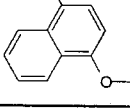
Ex. N°	A	V ¹	R ²²	R ²³	R ²⁴	T	Z ²	Z ³	E	LogP	M+H
61	A5	N-Me	CF ₃	-	H	O	COOMe	H			452
62	A1	N-Me	H	CF ₂	H	O	COOMe	H			431
63	A5	N-Me	Me	-	F	O	COOMe	H		2,02	
64	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			330
65	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			352
66	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			360
67	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			366
68	A5	N-Me	Et	-	F	S	Me	H			382
69	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	COOMe	H		3,02	
70	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			356

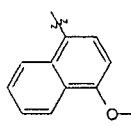
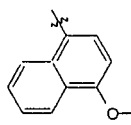
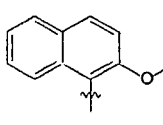
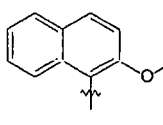
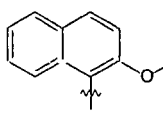
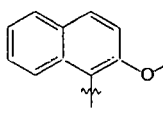
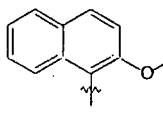
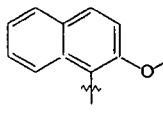
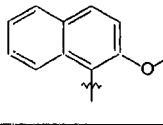
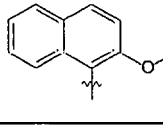
Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
71	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			370
72	A5	N-Me	CHF2	-	H	S	H	H			372
73	A5	N-Me	OMe	-	H	O	COOMe	H			394
74	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			336
75	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H		2,86	
76	A2	N-Me	H	H	H	O	Me	H			319
77	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H			334
78	A2	S	Me	H	H	O	Me	H			336
79	A5	N-Me	CF3	-	F	O	Me	H			406
80	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			

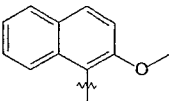
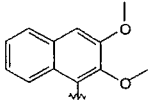
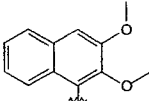
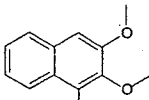
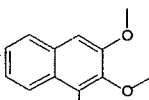
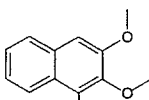
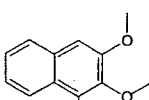
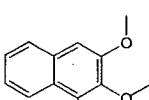
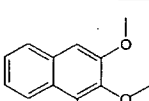
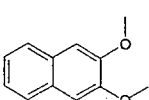
Ex. N°	A	V ¹	R ⁿ²	R ⁿ³	R ⁿ⁴	T	Z ²	Z ³	E	LogP	M+H
81	AC	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			
82	A1	N-Me	H	CHF2	H	O	Me	H			369
83	A5	N-Me	Me	-	F	O	Et	H			368
84	A1	O	Me	H	H	O	Me	H			320
85	A5	N-Me	Et	-	F	O	Et	H			369
86	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Et	H			381
87	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			
88	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			
89	A5	N-Me	CHF2	-	F	O	Me	H			363
90	A1	N-Me	H	CF2	H	O	Me	H			367

Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
91	A5	N-Me	CF ₂ Me	-	H	O	Me	H			384
92	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			405
93	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			374
94	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			389
95	A2	S	Me	H	H	O	H	H			391
96	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			461
97	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			407
98	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			425
99	A1	O	Me	H	H	O	H	H			375
100	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			442

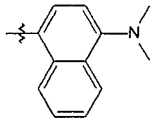
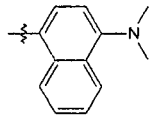
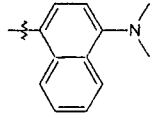
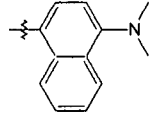
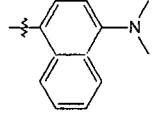
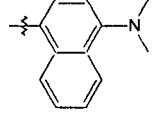
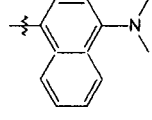
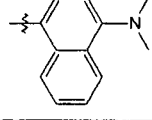
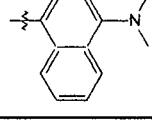
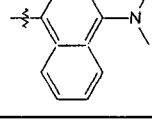
Ex. N°	A	V ¹	R ⁿ²	R ⁿ³	R ⁿ⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
101	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
102	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			306
103	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			321
104	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
105	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			393
106	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			330
107	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			357
108	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
109	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			374
110	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			368

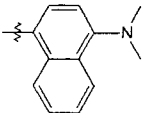
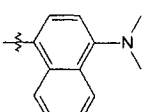
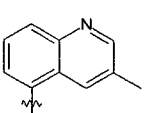
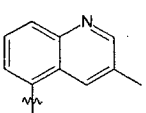
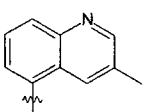
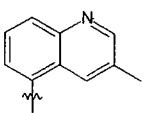
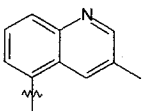
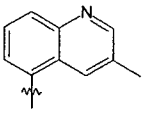
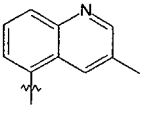
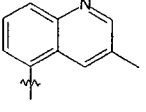
Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
111	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			335
112	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			350
113	A2	S	Me	H	H	O	H	H			352
114	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			422
115	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			368
116	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			386
117	A1	O	Me	H	H	O	H	H			336
118	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			403
119	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			382
120	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			396

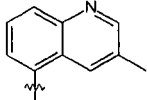
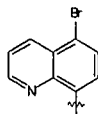
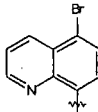
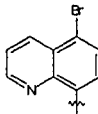
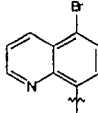
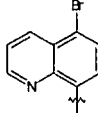
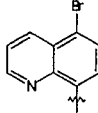
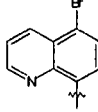
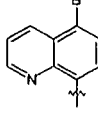
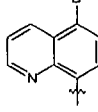
Ex. N°	A	V ¹	R ²	R ³	R ⁴	T	Z ²	Z ³	E	LogP	M+H
121	A5	H-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			100
122	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H			361
123	A5	H-Me	OMe	-	H	O	H	H			266
124	A2	H-Me	H	H	H	O	H	H			335
125	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			350
126	A2	S	Me	H	H	O	H	H			352
127	A5	H-Me	CF3	-	F	O	H	H			422
128	A5	H-Me	Me	-	F	O	H	H			369
129	A5	H-Me	CHF2	-	H	O	H	H			266
130	A1	O	Me	H	H	O	H	H			336

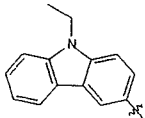
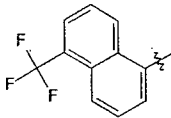
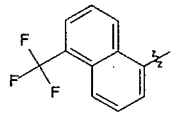
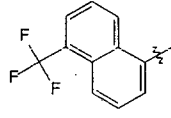
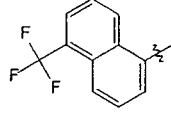
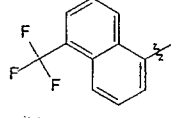
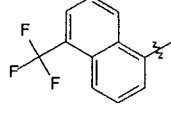
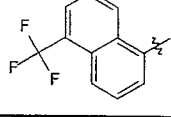
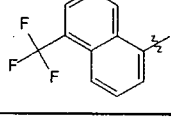
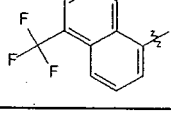
Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
131	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			403
132	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			396
133	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			365
134	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			380
135	A2	S	Me	H	H	O	H	H			382
136	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			452
137	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			398
138	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			416
139	A1	O	Me	H	H	O	H	H			366
140	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			433

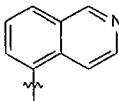
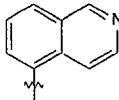
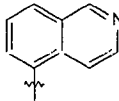
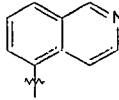
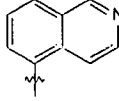
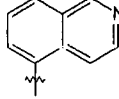
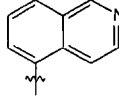
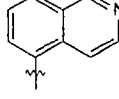
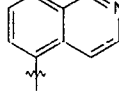
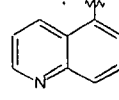
31

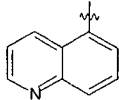
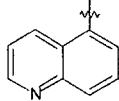
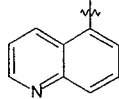
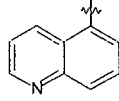
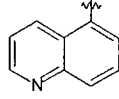
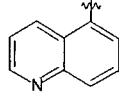
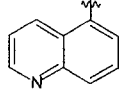
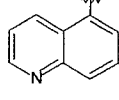
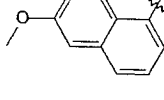
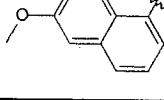
Ex. N°	A	V ¹	R ²²	R ²³	R ²⁴	T	Z ²	Z ³	E	LogP	M+H
141	A2	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			279
142	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			243
143	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			263
144	A2	S	Me	H	H	O	H	H			365
145	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			425
146	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			231
147	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			399
148	A1	O	Me	H	H	O	H	H			249
149	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			413
150	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			395

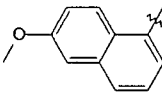
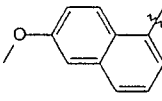
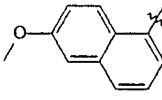
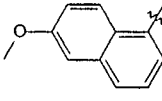
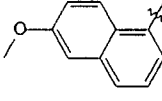
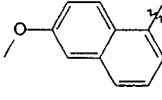
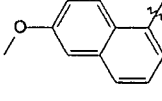
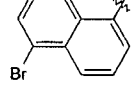
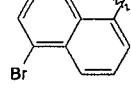
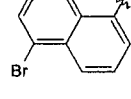
Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
151	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			409
152	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			413
153	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			351
154	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			320
155	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			335
156	A2	S	Me	H	H	O	H	H			337
157	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			407
158	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			353
159	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			371
160	A1	O	Me	H	H	O	H	H			321

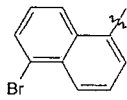
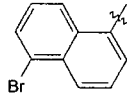
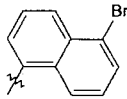
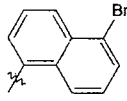
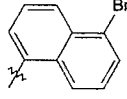
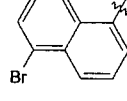
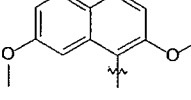
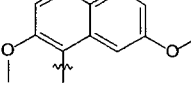
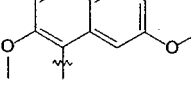
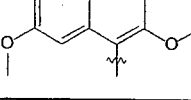
Ex. N°	A	V ¹	R ⁰²	R ⁰³	R ⁰⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
161	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			363
162	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			415
163	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			384
164	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			399
165	A2	S	Me	H	H	O	H	H			401
166	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			471
167	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		2.9	
168	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			435
169	A1	O	Me	H	H	O	H	H			385
170	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			452

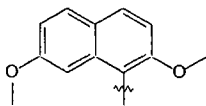
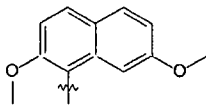
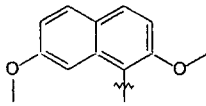
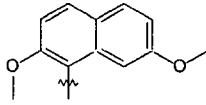
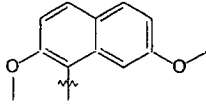
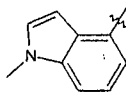
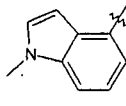
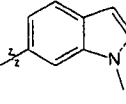
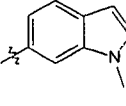
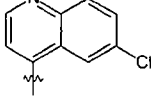
Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
171	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			405
172	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			404
173	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			373
174	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			388
175	A2	S	Me	H	H	O	H	H			390
176	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			460
177	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			406
178	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			424
179	A1	O	Me	H	H	O	H	H			374
180	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			441

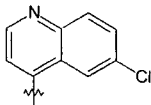
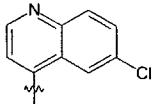
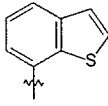
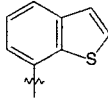
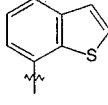
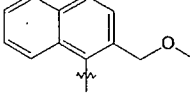
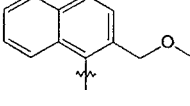
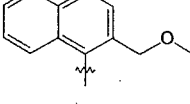
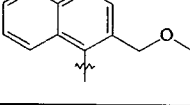
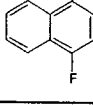
Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	E	LogP	M+H
101	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
102	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			306
103	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			321
104	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
105	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			393
106	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
107	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			357
108	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
109	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			374
190	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337

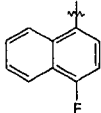
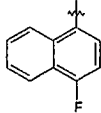
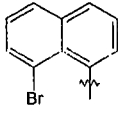
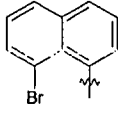
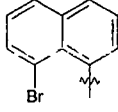
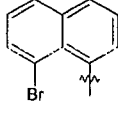
Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
191	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			306
192	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			321
193	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
194	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			393
195	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
196	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			357
197	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
198	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			374
199	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			366
200	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			335

Ex. N°	A	V ¹	R ²²	R ²³	R ²⁴	T	Z ²	Z ³	E	LogP	M+H
201	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			250
202	A2	S	Me	H	H	O	H	H			252
203	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			422
204	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			263
205	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			265
206	A1	O	Me	H	H	O	H	H			325
207	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			403
208	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			414
209	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			333
210	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			330

Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
211	A2	S	Me	H	H	O	H	H			400
212	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			470
213	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			416
214	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			434
215	A1	O	Me	H	H	O	H	H			384
216	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			451
217	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			396
218	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			365
219	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			380
220	A2	S	Me	H	H	O	H	H			382

Ex. N°	A	V ¹	R ⁰²	R ⁰³	R ⁰⁴	T	Z ²	Z ³	E	LogP	M+H
221	A5	H-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			452
222	A5	H-Me	Me	-	F	O	H	H		2.95	
223	A5	H-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			416
224	A1	O	Me	H	H	O	H	H			366
225	A1	H-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			423
226	A5	H-Me	Me	-	F	O	H	H			341
227	A5	H-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			350
228	A5	H-Me	Me	-	F	O	H	H			341
229	A5	H-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			350
230	A5	H-Me	Me	-	F	O	H	H			373

Ex. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
231	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			387
232	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			355
233	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			344
234	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			358
235	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			362
236	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			382
237	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			396
238	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			400
239	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			364
240	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			370

Ex. N°	A	V ¹	R ⁿ²	R ⁿ³	R ⁿ⁴	T	Z ²	Z ³	E	LogP	M+H
241	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			303
242	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			324
243	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			416
244	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			429
245	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			434
246	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			390

General preparation example 1 : preparation of an amide derivative of formula (I) on Optimizer™ micro-waves apparatus

In a 8 ml Optimizer™ vial is weighted 1.7 mmole of amine (II). 2 ml of a 1 molar solution of the acyl chloride (III) (2 mmole) in acetonitrile are added followed by 1 ml of triethylamine. The vial is sealed, pre-stirred 10 s at ambient temperature then heated at 150 °C for 60 s under micro-waves. After cooling, the vial is opened and poured onto 10 ml of a saturated solution of potassium carbonate. The watery layer is extracted twice by 5 ml of dichloromethane. The organic phases are dried over magnesium sulfate. The solvents are removed and the crude amide is analyzed by LCMS and NMR. Insufficiently pure compounds are further purified by preparative LCMS.

General preparation example 2 : thionation of an amide derivative of formula (I) on Chemspeed™ apparatus

In a 13 ml Chemspeed™ vial is weighted 0.27 mmole of phosphorous pentasulfide (P_2S_5). 3 ml of a 0.18 molar solution of the amide (I) (0.54 mmole) in dioxane is added and the mixture is heated at reflux for two hours. The temperature is then cooled to 80°C and 2.5 ml of water are added. The mixture is heated at 80°C for one more hour. 2 ml of water are then added and the reaction mixture is extracted twice by 4 ml of dichloromethane. The organic phase is deposited on a basic alumina cartridge (2g) and eluted twice by 8 ml of dichloromethane. The solvents are removed and the crude thioamide is analyzed by LCMS and NMR. Insufficiently pure compounds are further purified by preparative LCMS.

10 Efficacy example A : *in vivo* preventive test on *Pyrenophora teres* (Barley net blotch)

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

15 Barley plants (Express variety) in starter cups, sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate 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 the mixture of acetone/tween/DMSO/water 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 15-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.

Grading 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 500 ppm with the following compounds: 1, 2, 3, 6, 8, 9, 11, 12, 16, 18, 24, 25, 26, 27, 33, 36, 40, 42, 25 47, 50, 54, 55, 57, 58, 59, 64, 65, 66, 67, 69, 71, 72, 75, 79, 80, 81, 82, 83, 85, 86, 87, 88, 89, 100, 109, 116, 119, 120, 145, 149, 166, 167, 168, 176, 177, 178, 204, 213, 214, 222, 226, 227, 228, 240, 241 and 242.

Efficacy example B : *in vivo* preventive test on *Sphaerotheca fuliginea* (cucurbit powdery mildew)

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

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 2 first leaves stage by spraying with the aqueous suspension 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 *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 11-12 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 500 ppm with the following compounds: 2, 6, 8, 11, 12, 17, 18, 22, 23, 25, 26, 36, 40, 41, 42, 47, 49, 50, 51, 53, 55, 56, 57, 58, 59, 63, 64, 65, 66, 67, 69, 70, 71, 72, 74, 75, 79, 80, 81, 82, 83, 85, 86, 87, 88, 89, 100, 105, 109, 120, 128, 129, 136, 137, 138, 149, 157, 158, 159, 166, 167, 168, 176, 177, 178, 180, 185, 194, 195, 196, 198, 204, 205, 221, 222, 240, 241 and 242.

Efficacy example C : *in vivo* preventive test on *Mycosphaerella graminicola* (wheat leaf spot)

15 The active ingredients tested are prepared by homogenisation in a mixture of acetone/tween/DMSO, and 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 active ingredient prepared as described above.

20 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 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.

25 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 500 ppm with the following compounds: 1, 2, 5, 6, 7, 8, 9, 11, 17, 18, 22, 23, 24, 26, 27, 32, 33, 34, 36, 40, 41, 47, 48, 49, 50, 51, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 63, 64, 65, 67, 69, 70, 71, 74, 75, 79, 80, 81, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 94, 96, 97, 100, 105, 109, 115, 116, 119, 120, 128, 129, 134, 136, 137, 138, 140, 145, 146, 147, 149, 155, 157, 158, 161, 164, 166, 167, 168, 170, 172, 174, 176, 177, 178, 180, 183, 185, 186, 187, 190, 192, 194, 195, 221, 225, 226, 227, 228, 229, 240, 241 and 242.

Efficacy example D : *in vivo* test on *Puccinia recondita* f. *Sp. tritici* (wheat brown rust).

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

Wheat plants (Scipion variety) in starter cups, sown on 50/50 peat soil-pozzolana substrate and
 5 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 the mixture of acetone/tween/DMSO/water not containing the active material.

After 24 hours, the plants are contaminated by spraying the leaves with an aqueous suspension of
 10 *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.

15 Under these conditions, good (at least 70%) or total protection is observed at a dose of 500 ppm with the following compounds: 1, 2, 9, 16, 24, 25, 26, 36, 47, 49, 54, 57, 58, 63, 64, 65, 66, 67, 80, 83, 85, 87, 88, 89, 94, 100, 109, 119, 120, 134, 136, 137, 138, 140, 149, 158, 167, 176, 177, 178, 240 and 242.

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

The active ingredients tested are prepared by homogenization in a mixture of acetone/tween/DMSO, and 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
 25 as described above.

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
 30 days-old culture.

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: 2, 6, 12, 16, 26, 47, 49, 57, 65, 66, 67, 69, 79, 80, 83, 166, 167, 176, 204, 213, 214 and 240.

5 Example F: *in vivo* test on *Botrytis cinerea* (Gray mould)

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
10 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 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 :

- 15 - 20 g/L of gelatin;
 - 50 g/L of D-fructose;
 - 2 g/L of NH₄NO₃;
 - 1 g/L of KH₂PO₄.

The contaminated cucumber plants are settled for 5-7 days in a climatic room at 15-11°C (day/night)
20 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%) protection is observed at a dose of 500ppm with the following compounds: 36, 64, 65, 67,80 and 89.

25 Example G: *in vivo* test on *Peronospora parasitica* (Crucifer downy mildew)

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

Cabbage plants (Eminence variety) in starter cups, sown on a 50/50 peat soil-pozzolana substrate and grown at 13-20°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
30 active material. After 24 hours, the plants are contaminated by spraying them with an aqueous suspension of *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
35 plants.

Under these conditions, good (at least 70% of disease control) to total protection (100% of disease control) is observed at a dose of 500 ppm with the following compounds : 2, 6, 8, 19, 27, 48, 49, 57, 73, 75, 83, 84, 87, 88, 94, 99, 108, 109, 129, 134, 135, 136, 149, 155, 164, 169, 174, 176, 179, 183, 198, 219 and 240 according to the invention whereas weak protection (less than 30% of disease control) to no protection at all is observed at a dose of 500 ppm with the compounds of examples 5, 45 and 50 disclosed in patent application WO-2006/120224

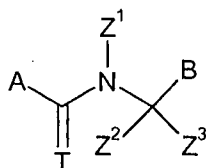
Examples 5, 45 and 50 disclosed in patent application WO-2006/120224 correspond, respectively, to following compounds :

- N-cyclopropyl-N-[(3-Chloro-5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-methylene]-2,5-dimethyl-furane-3-carboxamide;
- N-cyclopropyl-N-[(3-Chloro-5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-methylene]-5-fluoro-1,3-dimethyl-1H-pyrazole-4-carboxamide;
- N-cyclopropyl-N-[(3-Chloro-5-trifluoromethyl-pyridin-2-yl)-methylene]-5-fluoro-3-(trifluoromethyl)-1-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamide;

These results show that the compounds according to the invention have a much better biological activity than the structurally closest compounds disclosed in WO-2006/120224

CLAIMS

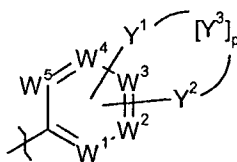
1. A compound of formula (I)



(I)

wherein

- A represents a carbo-linked, unsaturated or partially saturated, 5-membered heterocyclyl group that can be substituted by up to four groups R^a ;
- B represents



wherein

- W^1 to W^5 independently represent N or CR^{b1} ;
- Y^1 to Y^3 independently represent H, O, S, NR^{b2} or CR^{b3} ;
- Y^1 to Y^3 together with the atoms W^n to which they are linked, form an aromatic 5- or 6-membered, fused heterocyclyl ring comprising up to four heteroatoms, or an aromatic 6-membered fused carbocyclyl ring;
- p represents 1 or 2;
- T represents O, S, NR^c , NR^d , NR^cR^d or NCN ;
- Z^1 represents a non substituted C_3 - C_7 -cycloalkyl or a C_3 - C_7 cycloalkyl substituted by up to 10 atoms or groups that can be the same or different and that can be selected in the list consisting of halogen atoms; cyano; C_1 - C_6 -alkyl; C_1 - C_6 -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different; C_1 - C_6 -alkoxy; C_1 - C_6 -halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different; C_1 - C_6 -alkoxycarbonyl; C_1 - C_6 -halogenoalkoxycarbonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different; C_1 - C_6 -alkylaminocarbonyl; di- $(C_1$ - C_6 -alkyl)aminocarbonyl;

- 5 Z^2 and Z^3 independently represent a hydrogen atom ; a halogen atom ; C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C_2 - C_8 -alkenyl ; C_2 - C_8 -alkynyl ; cyano ; nitro ; C_1 - C_8 -alkoxy ; C_2 - C_8 -alkenyloxy ; C_2 - C_8 -alkynyloxy ; C_3 - C_7 -cycloalkyl ; C_1 - C_8 -alkylsulphenyl ; amino ; C_1 - C_8 -alkylamino ; di- $(C_1$ - C_8 -alkyl)amino ; C_1 - C_8 -alkoxycarbonyl ; C_1 - C_8 -alkylcarbonyl ; C_1 - C_8 -alkylcarbamoyl ; di- $(C_1$ - C_8 -alkyl)carbamoyl ; N- C_1 - C_8 -alkyl- C_1 - C_8 -alkoxycarbamoyl ; or

10 Z^2 and Z^3 together with the carbon atom to which they are linked can form a substituted or non substituted C_3 - C_7 cycloalkyl ;
- 15 R^a independently represents a hydrogen atom ; halogen atom ; cyano ; nitro ; amino ; sulfanyl ; hydroxyl ; pentafluoro- λ -6-sulfanyl ; C_1 - C_8 -alkylamino ; di- $(C_1$ - C_8 -alkyl)amino ; tri- $(C_1$ - C_8 -alkyl)silyl ; tri- $(C_1$ - C_8 -alkyl)silyl- C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -alkylsulfanyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkylsulfanyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C_2 - C_8 -alkenyl ; C_2 - C_8 -halogenoalkenyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C_2 - C_8 -alkynyl ; C_2 - C_8 -halogenoalkynyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C_1 - C_8 -alkoxy ; C_1 - C_8 -alkoxy- C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C_2 - C_8 -alkenyloxy ; C_2 - C_8 -alkynyloxy ; C_3 - C_7 -cycloalkyl ; C_3 - C_7 -cycloalkyl- C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -alkylsulphinyl ; C_1 - C_8 -alkylsulphonyl ; C_1 - C_8 -alkoxyimino ; $(C_1$ - C_8 -alkoxyimino)- C_1 - C_8 -alkyl ; (benzyloxyimino)- C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -alkylcarbonyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkylcarbonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C_1 - C_8 -alkoxycarbonyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkoxycarbonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C_1 - C_8 -alkylaminocarbonyl ; di- $(C_1$ - C_8 -alkyl)aminocarbonyl ;

20

25
- 30 R^c and R^d , that can be the same or different, represent a hydrogen atom ; C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C_1 - C_8 -alkoxy- C_1 - C_8 -alkyl ; C_2 - C_8 -alkenyl ; C_2 - C_8 -halogenoalkenyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C_2 - C_8 -alkynyl ; C_2 - C_8 -halogenoalkynyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C_3 - C_7 -cycloalkyl ; C_3 - C_7 -cycloalkyl- C_1 - C_8 -alkyl ; C_3 - C_7 -halogenocycloalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; formyl ; C_1 - C_8 -alkylcarbonyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkylcarbonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or

35

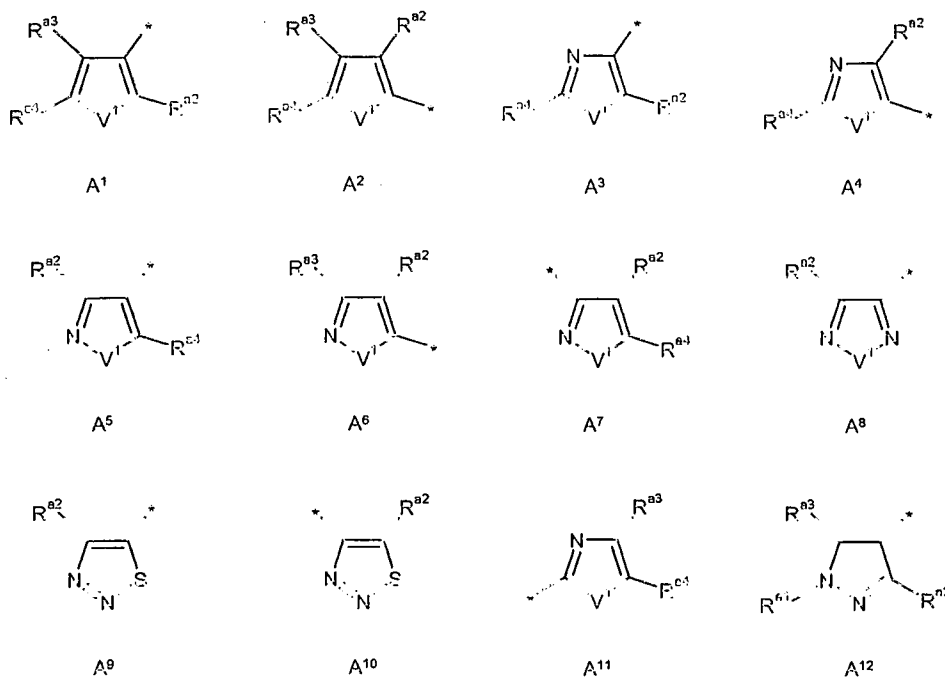
phenyl that can be substituted by up to 5 groups Q ; benzyloxy that can be substituted by up to 5 groups Q ; benzylsulphanyl that can be substituted by up to 5 groups Q ; benzylamino that can be substituted by up to 5 groups Q ; phenoxy that can be substituted by up to 5 groups Q ; phenylamino that can be substituted by up to 5 groups Q ; phenylsulphanyl that can be substituted by up to 5 groups Q ; benzyl that can be substituted by up to 5 groups Q ; pyridinyl that can be substituted by up to four groups Q and pyridinyloxy that can be substituted by up to four groups Q ;

- R^{b2} represents a hydrogen atom ; C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl ; C₂-C₈-alkenyl ; C₂-C₈-halogenoalkenyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₂-C₈-alkynyl ; C₂-C₈-halogenoalkynyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₃-C₇-cycloalkyl ; C₃-C₇-cycloalkyl-C₁-C₈-alkyl ; C₃-C₇-halogenocycloalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; formyl, C₁-C₈-alkylcarbonyl ; C₁-C₈-halogenoalkylcarbonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-alkylsulphonyl ; C₁-C₈-halogenoalkylsulphonyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; phenylsulfonyl can be substituted by up to 5 groups Q ; benzyl that can be substituted by up to 5 groups Q ;

- Q, that can be the same or different, represents a halogen atom ; cyano ; nitro ; C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-alkoxy ; C₁-C₈-alkylsulfonyl ; C₁-C₈-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; tri(C₁-C₈)alkylsilyl and tri(C₁-C₈)alkylsilyl-C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-alkoxyimino ; (C₁-C₈-alkoxyimino)- C₁-C₈-alkyl ;

as well as salts, N-oxides, metallic complexes, metalloidic complexes and optically active or geometric isomers thereof provided that compound of formula (I) differs from N-cyclopropyl-N-((6,8-dimethyl-2-oxo-1,2-dihydroquinolin-3-yl)methyl)-furane-2-carboxamide, N-cyclopropyl-N-((6-ethoxy-2-oxo-1,2-dihydroquinolin-3-yl)methyl)-furane-2-carboxamide, N-cyclopropyl-N-((6-methyl-2-oxo-1,2-dihydroquinolin-3-yl)methyl)-furane-2-carboxamide, N-cyclopropyl-N-((7,8-difluoro-2-oxo-1,2-dihydroquinolin-4-yl)methyl)-4-methylthiazole-5-carboxamide and from N-cyclopropyl-N-((8-fluoro-2-oxo-1,2-dihydroquinolin-4-yl)methyl)-4-methylthiazole-5-carboxamide.

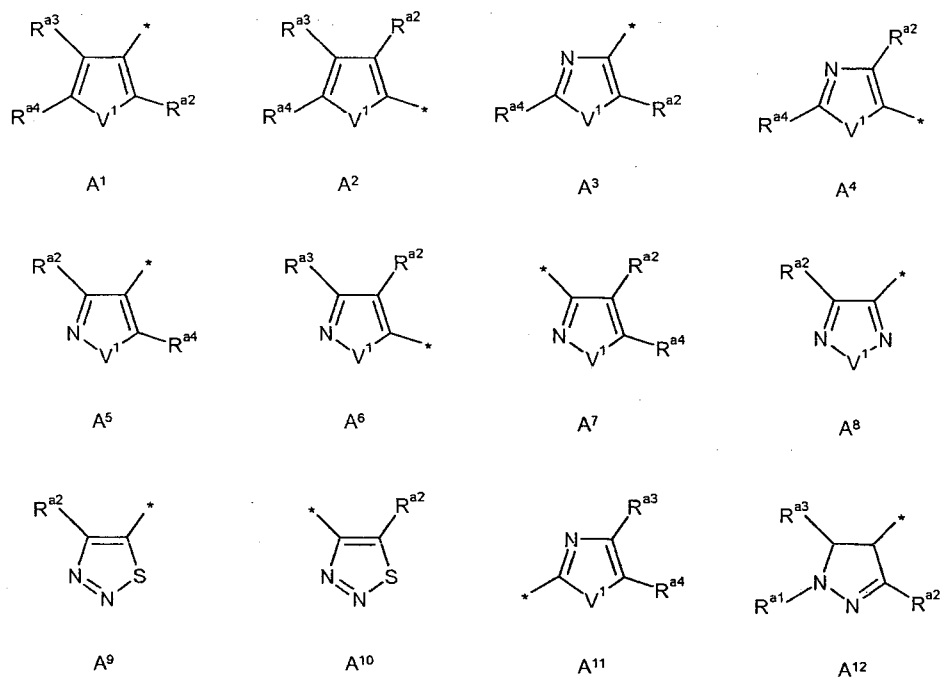
2. A compound according to claim 1 wherein A is selected in the list consisting of:



wherein:

- -* represents the attachment point to the carbonyl moiety ;
- V¹ represents O, S or NR^{a1} ;
- R^{a1} represents a hydrogen atom ; C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-alkoxy-C₁-C₈-alkyl ;
- R^{a2} and R^{a3}, that can be the same or different represent a hydrogen atom ; a halogen atom ; cyano ; C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-alkoxy or C₁-C₈-halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₃-C₇-cycloalkyl ;
- R^{a4} represents a hydrogen atom, a halogen atom ; cyano ; C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-alkoxy or C₁-C₈-halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₃-C₇-cycloalkyl ; C₁-C₈-alkylsulfanyl ; amino ; C₁-C₈-alkylamino ; di-(C₁-C₈-alkyl)amino ; C₁-C₈-alkyloxycarbonyl.

3. A compound according to claims 1 or 2 wherein A is selected in the list consisting of:



wherein:

- -* represents the attachment point to the carbonyl group ;
- V^1 represents O, S or NR^{a1} ;
- 5 • R^{a1} represents a hydrogen atom ; C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 C_8 -alkoxy- C_1 - C_8 -alkyl ;
- R^{a2} represents C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C_1 - C_8 -alkoxy ;
- R^{a3} represents a hydrogen atom ; a halogen atom ; C_1 - C_8 -alkyl ;
- R^{a4} represents a hydrogen atom, a halogen atom ; C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkyl
- 10 comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different.

4. A compound according to claims 1 to 3 wherein

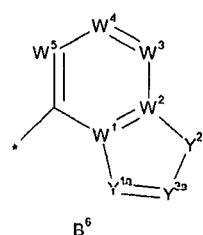
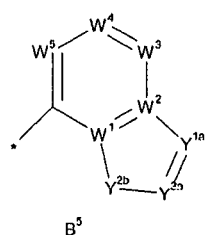
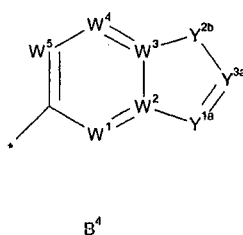
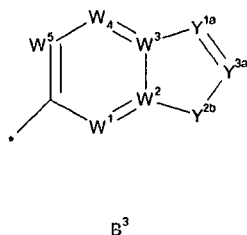
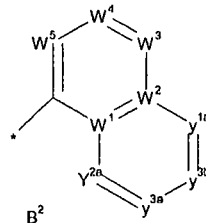
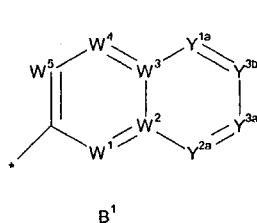
- A represents A^5 ;
- V^1 represents NR^{a1} ;
- 15 • R^{a1} represents C_1 - C_8 -alkyl ;
- R^{a2} and R^{a3} , that can be the same or different represent a hydrogen atom ; a halogen atom ; C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; or
- A represents A^4 ;
- 20 • V^1 represents S ;

42

- R^{a2} represents a C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ;
- R^{a4} represents a hydrogen atom ; C_1 - C_8 -alkyl ; C_1 - C_8 -halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different.

5

5. A compound according to claims 1 to 4 wherein B is selected in the list consisting of :



wherein

- W^1 to W^5 , Y^{1a} , Y^{2a} , Y^{3a} and Y^{3b} independently represent NR^{b2} or CR^{b3} ;
- Y^{2b} represents O, S or NR^{b2} .

10

6. A compound according to claim 5 wherein

- B represent B^1 or B^2 ;
- W^1 to W^5 , Y^{1a} , Y^{2a} , Y^{3a} and Y^{3b} independently represent CR^{b3} ; or
- B represent B^5 or B^6 ;
- W^1 to W^5 , Y^{1a} and Y^{3a} independently represent CR^{b1} ;
- Y^{2b} represents S.

15

7. A compound according to claims 1 to 6 wherein T represents O or S.

20

8. A compound according to claims 1 to 7 wherein Z^1 represents cyclopropyl.

9. A compound according to claims 1 to 8 wherein Z^2 and Z^3 independently represent a hydrogen atom or C_1 - C_8 alkyl.

10. A compound according to claims 1 to 9 wherein Q represents a halogen atom ; C₁-C₈-alkyl ; C₁-C₈-alkoxy ; C₁-C₈-halogenoalkyl comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different ; C₁-C₈-halogenoalkoxy comprising up to 9 halogen atoms that can be the same or different.
- 5 11. A fungicide composition comprising, as an active ingredient, an effective amount of a compound of formula (I) according to claims 1 to 10 and an agriculturally acceptable support, carrier or filler.
- 10 12. A method for controlling phytopathogenic fungi of crops, characterized in that an agronomically effective and substantially non-phytotoxic quantity of a compound according to claims 1 to 10 or a composition according to claim 11 is applied to the soil where plants grow or are capable of growing, to the leaves and/or the fruit of plants or to the seeds of plants.

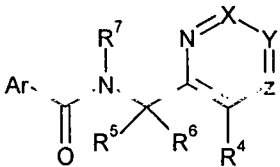
DERIVADOS FUNGICIDAS DE (HETERO)ARIL-METILEN-N-CICLOALQUIL CARBOXAMIDA CONDENSADOS DE 6 ELEMENTOS CON N

DESCRIPCIÓN

La presente invención se refiere a derivados de N-(aromáticos, de 6 elementos, condensados, (hetero)aril-metileno)-N-cicloalquil-carboxamida, a su tiocarboxamida o a los análogos de carboximidamida N-sustituida, a su procedimiento 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, que utilizan estos compuestos o composiciones.

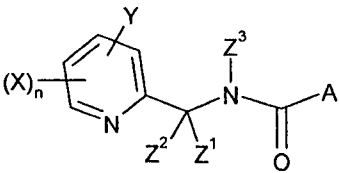
La solicitud de patente internacional WO-2001/11966 menciona genéricamente determinados derivados de haloalquil-2-piridil-metilen-heterociclil-amida. Sin embargo, no existe ninguna descripción en este documento de ninguno de dichos derivados sustituidos por algún grupo cicloalquilo.

La solicitud de patente internacional WO-2004/074259 da a conocer los compuestos enlazables al receptor GABAA de la siguiente fórmula:



en la que Ar puede representar un heterociclo de 5 a 10, R⁷ puede representar un cicloalquilo (C₃-C₇) mientras que X, Y y Z pueden representar N o CR¹, al menos uno representando N. Sin embargo, no hay ninguna descripción en este documento de ningún compuesto que incluya un heterociclo o un cicloalquilo de 5 elementos unido al átomo de nitrógeno.

La Solicitud de patente Internacional WO-2006/120224 da a conocer derivados de 2-piridil-metilen-carboxamida de la fórmula siguiente:

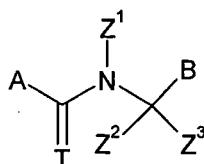


no existe ninguna indicación en este documento para preparar los derivados bicíclicos fungicidas según la invención.

La Solicitud de patente internacional WO-2007/117778 da a conocer derivados de quinolina útiles como inhibidores inducibles de óxido nítrico sintasa, incluyendo la N-ciclopropil-N-((7,8-fluoro-2-oxo-1,2-dihidroquinolin-4-il)metil)-4-metiltiazol-5-carboxamida y la N-ciclopropil-N-((8-fluoro-2-oxo-1,2-dihidroquinolin-4-il)metil)-4-metiltiazol-5-carboxamida. Estos compuestos no forman parte 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. Los autores han encontrado ahora una nueva familia de compuestos que poseen los efectos o ventajas mencionados anteriormente.

Por consiguiente, la presente invención proporciona derivados N-(aromáticos, de 6 elementos, condensados, (hetero)aril-metilen)-N-cicloalquil-carboxamida de fórmula (I)

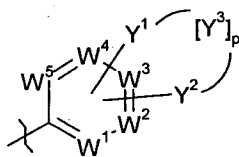


(I)

en la que

• A representa un grupo heterociclilo de 5 elementos insaturado o parcialmente saturado, unido por carbo, que puede estar sustituido por hasta cuatro grupos R^a;

• B representa:



en la que

- W¹ a W⁵ independientemente representan N o CR^{b1};
- Y¹ a Y³ independientemente representan N, O, S, NR^{b2} o CR^{b3};

- o Y^1 a Y^3 junto con los átomos W^n a que están unidos, forman un anillo heterociclilo condensado, aromático de 5 o 6 elementos, que comprende hasta cuatro heteroátomos o un anillo carbociclilo condensado aromático de 6 elementos;
- o p representa 1 ó 2;

- T representa O, S, $N-R^c$, $N-OR^d$, $N-NR^cR^d$ o $N-CN$;
- Z_1 representa un cicloalquilo C^3-C_7 no sustituido o un cicloalquilo C_3-C_7 sustituido por hasta 10 átomos o grupos que pueden ser iguales o diferentes y que pueden seleccionarse de la lista consistente en átomos de halógeno; ciano; alquilo C_1-C_6 ; halogenoalquilo (C_1-C_6) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C_1-C_3); halogenoalcoxi (C_1-C_3) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C_1-C_3)carbonilo; halogenoalcoxi (C_1-C_6) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil C_1-C_3 aminocarbonilo; di-(alquil C_1-C_3)aminocarbonilo;
- Z^2 y Z^3 representan independientemente un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C_1-C_6 ; halogenoalquilo (C_1-C_6) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquenilo C_2-C_6 ; alquinilo C_2-C_6 ; ciano; nitro; alcoxi C_1-C_6 ; alquinoxilo C_2-C_3 ; alquinoxilo C_2-C_3 ; cicloalquilo C_3-C_7 ; alquil (C_1-C_6)sulfenilo; amino; alquil(C_1-C_3)-amino; di-(alquil C_1-C_3)aminocarbonilo; alcoxi (C_1-C_3)carbonilo; alquil (C_1-C_3)carbonilo; alquil (C_1-C_3)carbamilo; di-(alquil C_1-C_3)carbonilo; N-alquil (C_1-C_6)alcoxi (C_1-C_6)carbamilo; o
- Z^2 y Z^3 junto con el átomo de carbono al que están unidos pueden formar un cicloalquilo C_3-C_7 sustituido o no sustituido;
- R^a representa independientemente un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; ciano; nitro; amino; sulfenilo; hidroxilo; pentafluoro- λ -6-sulfenilo; alquil (C_1-C_3)amino; di-(alquil C_1-C_3)aminocarbonilo; tri(alquil C_1-C_3)silo; tri(alquil C_1-C_6)silo-alquilo C_1-C_6 ; alquil (C_1-C_3)sulfenilo; halogenoalquil (C_1-C_6)-sulfenilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquilo C_1-C_6 ; halogenoalquilo (C_1-C_6) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquenilo C_2-C_6 ; halogenoalquenilo (C_2-C_6) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquinilo C_2-C_6 ; halogenoalquinilo (C_2-C_6) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

alcoxi C₁-C₈; alcoxi (C₁-C₈)-alquilo (C₁-C₈); halogenoalcoxi (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alqueniloxi (C₂-C₈); alquiniloxi C₂-C₈; cicloalquilo C₃-C₇; cicloalquilo (C₃-C₇)-alquilo C₁-C₈; alquil (C₁-C₈)-sulfinilo; alquil (C₁-C₈)-sulfonilo; alcoxi (C₁-C₈)-imino; (alcoxi C₁-C₈-imino)-alquilo C₁-C₈; alquilo (C₁-C₈)-benciloxiimino; alquil (C₁-C₈)-carbonilo; halogenoalquil (C₁-C₈)-carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C₁-C₈)-carbonilo; halogenoalcoxi (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil C₁-C₈-aminocarbonilo; di-(alquil C₁-C₈)-aminocarbonilo;

- R^c y R^d, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C₁-C₈)-alquilo (C₁-C₈); alquenilo C₂-C₈; halogenoalquenilo (C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquinilo C₂-C₈; halogenoalquinilo (C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo C₃-C₇; cicloalquilo (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₈); halogenocicloalquilo (C₃-C₇) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; formilo; alquil (C₁-C₈)-carbonilo; halogenoalquil (C₁-C₈)-carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil (C₁-C₈)-sulfinilo; halogenoalquil (C₁-C₈)-sulfinilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; fenilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; naftilo que puede estar sustituido por hasta 6 grupos Q; fenilmetileno que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; fenilsulfinilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q;

- R^{b1} y R^{b3} representan independientemente un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; nitro; ciano; hidroxilo; sulfanilo; amino; pentafluoro-λ6-sulfanilo; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil (C₁-C₈)-amino; di-(alquil C₁-C₈)-aminocarbonilo; alcoxi C₁-C₈; halogenoalcoxi (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C₁-C₈)-alquilo (C₁-C₈); alquil (C₁-C₈)-sulfanilo; halogenoalquil (C₁-C₈)-sulfanilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C₁-C₈)-sulfenilo, halogenoalquil(C₁-C₈)-sulfenilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes, alquil(C₁-C₈)-sulfinilo, halogenoalquil (C₁-C₈)-sulfinilo que comprende hasta 9 átomos

de halógeno que pueden ser iguales o diferentes, alquil(C₁-C₆)-sulfonilo, halogenoalquil(C₁-C₆)-sulfonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquenilo C₂-C₆; halogenoalquenilo (C₂-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquinilo C₂-C₆; halogenoalquinilo (C₂-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquinoxil(C₂-C₆) iguales o diferentes; halogenoalquinoxil(C₂-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquinoxil(C₂-C₆)-oxi que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo C₃-C₇; cicloalquilo (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₆); halogenocicloalquilo (C₃-C₇) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; formilo; formiloxi; formilamino; carboxi; carbamoylo; N-hidroxicarbamoylo; carbamato; alquil (C₁-C₆)-hidroxilimino; alquil (C₁-C₆)-carbonilo; halogenoalquil (C₁-C₆)-carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; N-alquil (C₁-C₆)-alcoxi (C₁-C₆)-carbamoylo; alcoxil(C₁-C₆)-carbonilo; halogenoalcoxi (C₁-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil C₁-C₆-aminocarbonilo; di-(alquil C₁-C₆)-aminocarbonilo; alquil (C₁-C₆)-carboniloxi; halogenoalquil (C₁-C₆)-carboniloxi que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil (C₁-C₆)-carbonilamino; alquil (C₁-C₆)-aminocarboniloxi; di-(alquil C₁-C₆)-aminocarboniloxi; alquil(C₁-C₆)-oxycarboniloxi; alcoxil(C₁-C₆)-imino; (alcoxil C₁-C₆-imino)-alquilo C₁-C₆; (alquenil C₁-C₆-oxilimino)-alquil (C₁-C₆); (alquinil C₁-C₆-oxilimino)-alquilo (C₁-C₆); alquilo (C₁-C₆)-benciloxilimino; tri(alquil C₁-C₆)-silo; tri(alquil C₁-C₆)-silo-alquilo C₁-C₆; fenilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; benciloxi que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilsulfonilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilamino que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; fenoxi que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; fenilamino que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; fenilsulfonilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; piridinilo que puede estar sustituido por hasta cuatro grupo Q y piridiniloxi que puede estar sustituido por hasta cuatro grupo Q;

- R⁶² representa un átomo de hidrógeno; alquilo C₁-C₆; halogenoalquilo (C₁-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxil(C₁-C₆)-alquilo (C₁-C₆); alquenilo C₂-C₆; halogenoalquenilo (C₂-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquinilo C₂-C₆; halogenoalquinilo (C₂-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser

iguales o diferentes; cicloalquilo C₃-C₇; cicloalquilo (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₈); halogenocicloalquilo (C₃-C₇) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; formilo, alquil (C₁-C₈)carbonilo; halogenoalquil (C₁-C₈)carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil (C₁-C₈)-sulfonilo; halogenoalquil (C₁-C₈)sulfonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; fenilsulfonilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q;

- Q, que puede ser igual o diferente, representa un átomo de halógeno; ciano; nitro; alquilo C₁-C₈; alcoxi C₁-C₈; alquil (C₁-C₈)sulfanilo; halogenoalquilo (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; halogenoalcoxi (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil tri(C₁-C₈)sililo y alquil tri(C₁-C₈) alquilo (C₁-C₈)sililo; alcoxi (C₁-C₈)imino; (alcoxi C₁-C₈-imino)-alquilo C₁-C₈;

así como las sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloides y sus isómeros ópticamente activos o geométricos con la condición de que el compuesto de fórmula (I) se diferencie de la N-ciclopropil-N-((6,8-dimetil-2-oxo-1,2-dihidroquinolin-3-il)metil)-furano-2-carboxamida, de la N-ciclopropil-N-((6-etoxi-2-oxo-1,2-dihidroquinolin-3-il)metil)-furano-2-carboxamida, de la N-ciclopropil-N-((6-metil-2-oxo-1,2-dihidroquinolin-3-il)metil)-furano-2-carboxamida, de la N-ciclopropil-N-((7,8-difluoro-2-oxo-1,2-dihidroquinolin-4-il)metil)-4-metiltiazol-5-carboxamida y de la N-ciclopropil-N-((8-fluoro-2-oxo-1,2-dihidroquinolin-4-il)metil)-4-metiltiazol-5-carboxamida.

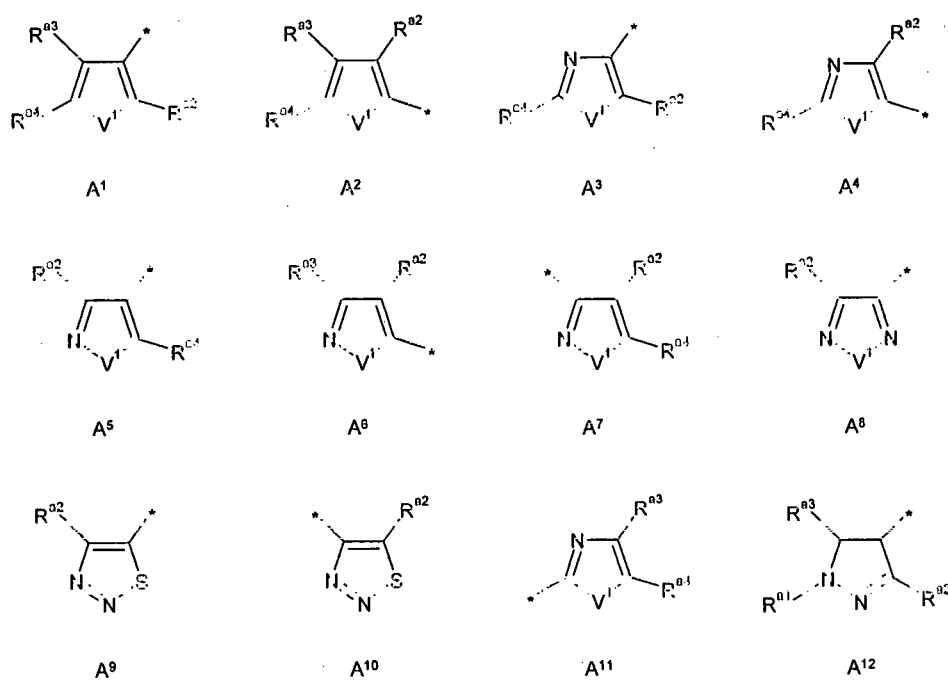
Cualquiera de los compuestos de acuerdo con la invención puede existir en forma de uno o más estereoisómeros dependiendo del número de unidades estereógenas (definidas por las reglas de la IUPAC) en el compuesto. Por lo tanto, la invención se refiere de la misma manera a todos los estereoisómeros, y a las mezclas de todos los estereoisómeros posibles, en todas las proporciones. Los estereoisómeros pueden separarse de acuerdo con los métodos que se conocen de por sí por el experto en la materia.

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

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

- los grupos halogenados, en particular los grupos haloalquilo, haloalcoxi y cicloalquilo, pueden comprender hasta nueve átomos de halógeno idénticos o diferentes;
- Cualquier grupo alquilo, alquenilo o alquinilo puede ser lineal o ramificado;
- el término "arilo" se refiere a fenilo o naftilo, opcionalmente sustituido por uno a cinco grupos seleccionados de la lista que consiste en halógeno, alquilo [C₁-C₆], haloalquilo [C₁-C₆], alquenilo [C₂-C₆], haloalquenilo [C₂-C₆], alquinilo [C₂-C₆], haloalquinilo [C₂-C₆], alcoxi [C₁-C₆], alcoxi [C₁-C₄]-alquilo [C₁-C₄], alcoxi [C₁-C₄]-alcoxi [C₁-C₄], haloalcoxi [C₁-C₆] y haloalcoxi [C₁-C₄]-alquilo [C₁-C₄].
- En el caso de un grupo amino o el resto amino de cualquier grupo que comprende amino, sustituido por dos sustituyentes que pueden ser iguales o diferentes, los dos sustituyentes junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos pueden formar un grupo heterociclilo, preferiblemente un grupo heterociclilo de 5 a 7 elementos, que puede estar sustituido o que puede incluir otros heteroátomos, por ejemplo un grupo morfolino o piperidinilo.

Los compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que A se selecciona de la lista que consiste en:



en la que:

- -* representa el punto de unión al grupo carbonilo;
- V¹ representa O, S o NR^{a1};

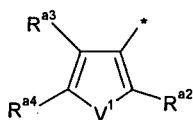
5

10

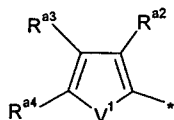
15

- R^7 representa un átomo de hidrógeno; alquilo C_1-C_8 ; halogenoalquilo (C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C_1-C_8)-alquilo (C_1-C_8);
- R^{a2} y R^{a3} , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; ciano; alquilo C_1-C_8 ; halogenoalquilo (C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C_1-C_8) o halogenoalcoxi (C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. cicloalquilo C_3-C_7 ;
- R^{a4} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno; ciano; alquilo C_1-C_8 ; halogenoalquilo (C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C_1-C_8) o halogenoalcoxi (C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. cicloalquilo C_3-C_7 ; alquil (C_1-C_8)-sulfanilo; amino; alquil (C_1-C_8)-amino; di-(alquil C_1-C_8)-aminocarbonilo; alquil (C_1-C_8)-oxicarbonilo.

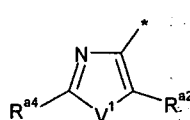
Los compuestos más preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que A se selecciona de la lista que consiste en:



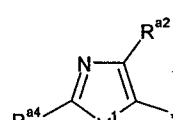
A¹



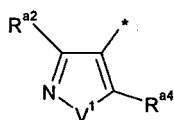
A²



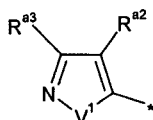
A³



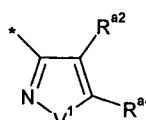
A⁴



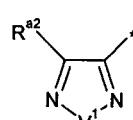
A⁵



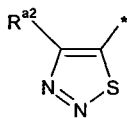
A⁶



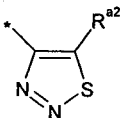
A⁷



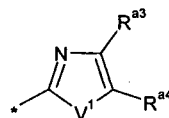
A⁸



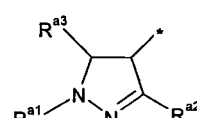
A⁹



A¹⁰



A¹¹



A¹²

en donde:

20

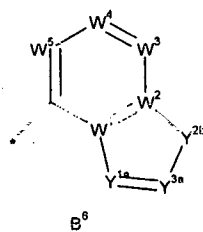
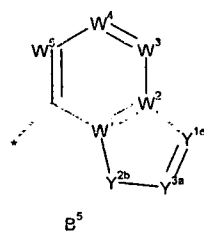
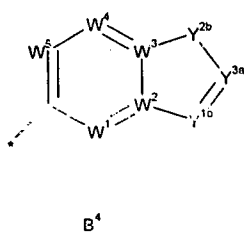
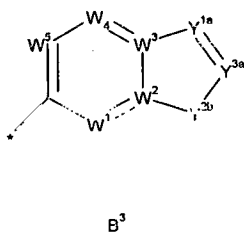
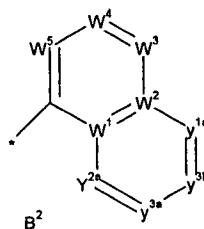
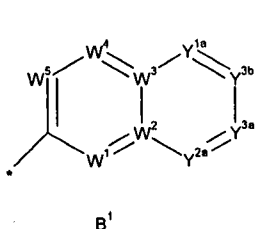
- -* representa el punto de unión al grupo carbonilo;
- V^1 representa O, S o NR^{a1} ;

- R^7 representa un átomo de hidrógeno; alquilo C_1-C_3 ; alcoxi $(C_1-C_3)-$ alquilo (C_1-C_3) ;
- R^{a2} representa alquilo (C_1-C_6) ; halogenoalquilo (C_1-C_9) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi C_1-C_6 ;
- R^{a3} representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C_1-C_3 ;
- R^{a4} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno; alquilo C_1-C_3 ; halogenoalquilo C_1-C_6 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

Otros compuestos más preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que

- A representa A^5 ;
- V^1 representa NR^{a1} ;
- R^{a2} representa alquilo (C_1-C_6) ;
- R^{a2} y R^{a3} , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C_1-C_6 ; halogenoalquilo (C_1-C_6) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; o
- A representa A^4 ;
- V^1 representa S;
- R^{a2} representa alquilo (C_1-C_3) ; halogenoalquilo (C_1-C_3) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;
- R^{a4} representa un átomo de hidrógeno; alquilo C_1-C_6 ; halogenoalquilo C_1-C_6 que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que B se selecciona de la lista que consiste en:



en la que

- W^1 a W^5 , Y^{1a} , Y^{2a} , Y^{3a} e Y^{3b} independientemente representan NR^{b2} o CR^{b3} ;
- Y^{2b} representa O, S o NR^{b2} .

- 5 Otros compuestos más preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que B representa B^1 o B^2 ; W^1 a W^5 , Y^{1a} , Y^{2a} , Y^{3a} e Y^{3b} independientemente representan CR^{b3} ; o B representa B^5 o B^6 ; W^1 a W^5 , Y^{1a} y Y^{3a} independientemente representan CR^{b1} ; Y^{2b} representa S.

- 10 Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que T representa O o S.

Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Z^1 representa ciclopropilo.

- 15 Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Z^2 y Z^3 independientemente representan un átomo de hidrógeno o alquilo (C_1-C_8).

- 20 Otros compuestos preferidos de fórmula (I) según la invención son aquellos en los que Q representa un átomo de halógeno. alquilo C_1-C_8 ; alcoxi C_1-C_8 ; halogenoalquilo (C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; halogenoalcoxi (C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;

- 25 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:

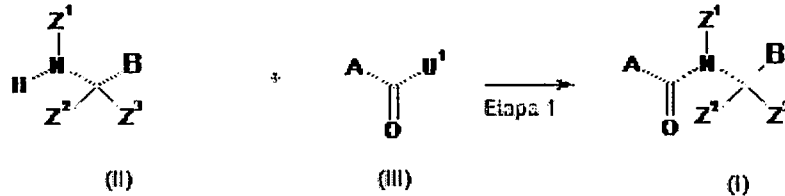
- características preferidas de A con características preferidas de uno o más T, Z^1 a Z^3 , R^a , R^b , T, V^1 y Q;
- 30 - características preferidas de T con características preferidas de uno o más A, Z^1 a Z^3 , R^a , R^b , V^1 y Q;
- características preferidas de Z^1 con características preferidas de uno o más A, T, Z^2 , Z^3 , R^a , R^b , V^1 y Q;
- características preferidas de Z^2 con características preferidas de uno o más A, T, Z^1 , Z^3 , R^a , R^b , V^1 y Q;
- 35 - características preferidas de Z^3 con características preferidas de uno o más A, T, Z^1 , Z^2 , R^a , R^b , V^1 y Q;

- características preferidas de Z^3 con características preferidas de uno o más A, T, Z^1 , Z^2 , R^a , R^b , V^1 y Q;
- características preferidas de R^a con características preferidas de uno o más A, T, Z^1 a Z^3 , R^b , V^1 y Q;
- características preferidas de R^b con características preferidas de uno o más A, T, Z^1 a Z^3 , R^a , V^1 y Q;
- características preferidas de V^1 con características preferidas de uno o más A, Z^1 a Z^3 , R^a , R^b y Q;
- características preferidas de Q con características preferidas de uno o más A, T, Z^1 a Z^3 , R^a , R^b y V^1 ;

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 A, T, Z^1 a Z^3 , R^a , R^b , V^1 y Q; para formar subclases aún más preferidas de compuestos de acuerdo con 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) en el que T representa O, como se ilustra en el siguiente esquema de reacción:



Procedimiento P1

en el que

- A, Z^1 a Z^3 , W^1 a W^5 y B son como se define en la presente memoria;
- U^1 representa un átomo de halógeno o un grupo saliente.

En el procedimiento P1 según la invención, la etapa 1 puede realizarse si procede en presencia de un disolvente y si corresponde en presencia de un aglutinante ácido.

Los derivados de N-cicloalquil-amina de fórmula (II) son conocidos o pueden prepararse por procedimientos conocidos tales como la aminación reductora de aldehído o cetona

(*Bioorganics and Medicinal Chemistry Letters*, 2006, pág. 2014 síntesis de los compuestos 7 y 8), o reducción de iminas (*Tetrahedron*, 2005, pág. 11689), o sustitución nucleófila de halógeno, mesilato o tosilato (*Journal of Medicinal Chemistry*, 2002, pág. 3887 preparación del producto intermedio para el compuesto 28).

5

Los derivados del ácido carboxílico de fórmula (III) son conocidos o pueden prepararse por procedimientos conocidos (documento WO-93/11117; documento EP-545 099; Nucleosides & Nucleotides, 1987, págs. 737-759, *Bioorg. Med. Chem.*, 2002, págs. 2105-2108).

- 10 Aglutinantes ácidos adecuados para llevar a cabo el procedimiento P1 según la invención son, en cada caso, todas las bases inorgánicas y orgánicas que son habituales para dichas reacciones. Se da preferencia a la utilización de metales alcalinotérreos, hidruros de metales alcalinos, hidróxidos de metales alcalinos o alcóxidos de metales alcalinos, tales como hidróxido sódico, hidruro sódico, hidróxido de calcio, hidróxido potásico, terc-butóxido potásico
- 15 u otro hidróxido de amonio, carbonatos de metales alcalinos, tales como carbonato de cesio, carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico, acetatos de metales alcalinos o de metales alcalinotérreos, tales como acetato sódico, acetato potásico, acetato de calcio y también aminas terciarias, tal como trimetilamina, trietilamina, diisopropilamina, tributilamina, N,N-dimetilaminilina, piridina, N-metilpiperidina, N,N-dimetil-
- 20 aminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU).

También es posible operar en ausencia de un agente de condensación adicional o emplear un exceso de componente amino, de manera que actúe simultáneamente como agente aglutinante ácido.

25

- Los disolventes adecuados para llevar a cabo el procedimiento P1 según la invención son en cada caso todos los disolventes orgánicos inertes habituales. Se da preferencia a la utilización opcional de hidrocarburos halogenados alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalino;
- 30 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 del

ácido hexametilfosfórico; ésteres, tales como acetato de metilo o acetato de etilo, sulfóxidos, tales como sulfóxido de dimetilo o sulfonas, tales como sulfolano.

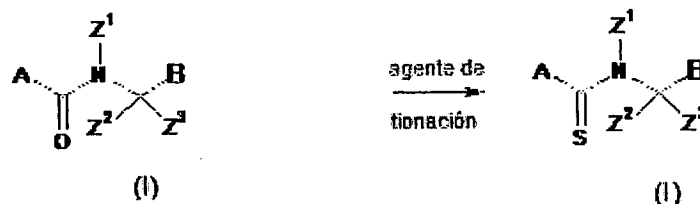
Cuando se realiza el procedimiento P1 según la invención, las temperaturas de reacción pueden variar independientemente dentro de un intervalo relativamente grande. Generalmente, los procedimientos según la invención se realizan a temperaturas entre 0°C y 160°C, preferentemente entre 10°C y 120°C. Una forma de controlar la temperatura en los procedimientos según la invención es usar tecnología de microondas.

En general, el procedimiento P1 de acuerdo con la invención se realiza independientemente a presión atmosférica. Sin embargo, en cada caso, es también posible operar a presión elevada o reducida.

Cuando se realiza la etapa 1 del procedimiento P1 según la invención, generalmente 1 mol u otro exceso del derivado ácido de fórmula (III) y de 1 a 3 moles de aglutinante ácido se emplean por mol de amina de fórmula (II). También es posible emplear los componentes de la reacción en otras proporciones.

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

Según un aspecto adicional de acuerdo con la invención, se proporciona un procedimiento P2 para la preparación de un compuesto de fórmula (I) en el que T representa S, y se ilustra según el siguiente esquema de reacción:



Procedimiento P2

en el que A, Z¹ a Z³, W¹ a W⁵ y B son como se define en la presente memoria;

El procedimiento P2 puede llevarse a cabo en presencia de un agente de tionación.

A partir de derivados de amida de fórmula (I) pueden prepararse según el procedimiento P1.

5 Los agentes de tionación adecuados para llevar a cabo el procedimiento P2 según la invención pueden ser azufre (S), ácido sulfhídrico (H_2S), sulfuro de sodio (Na_2S), bisulfuro de sodio ($NaHS$), trisulfuro de boro (B_2S_3), sulfuro de bis(dietilaluminio) ($(AlEt_2)_2S$), sulfuro de amonio ($(NH_4)_2S$), pentasulfuro fosforoso (P_2S_5), reactivo de Lawesson (2,4-disulfuro de 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,2,3,4-ditiadifosfenato) o un agente de tionación soportado por un polímero tal como se describe en *J.Chem.Soc. Perkin 1*, (2001), 358.

10 en presencia o en ausencia de una cantidad analítica o estequiométrica o más de una base tal como una base orgánica o inorgánica. Se da preferencia a utilizar carbonatos de metales alcalinos, tales como el carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico; bases heterocíclicas aromáticas, tales como piridina, picolina, lutidina, colidina; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, N,N-dimetil-aminopiridina o N-metilpiperidina.

Disolventes adecuados para realizar el procedimiento P2 según la invención pueden ser los disolventes orgánicos inertes habituales. Se da preferencia a la utilización opcional de
20 hidrocarburos halogenados alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalino; 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 o 1,2-dietoxietano; nitrilos, tales como acetonitrilo,
25 propionitrilo, n- o i-butironitrilo o benzonitrilo; disolventes sulfurosos, tales como sulfolano o disulfuro de carbono.

Cuando se realiza el procedimiento P2 según la invención, las temperaturas de reacción pueden variar dentro de un intervalo relativamente amplio. En general, estos procedimientos se
30 realizan a temperaturas de $0^{\circ}C$ a $160^{\circ}C$, preferiblemente de $10^{\circ}C$ a $120^{\circ}C$. Una forma de controlar la temperatura en los procedimientos según la invención es usar tecnología de microondas.

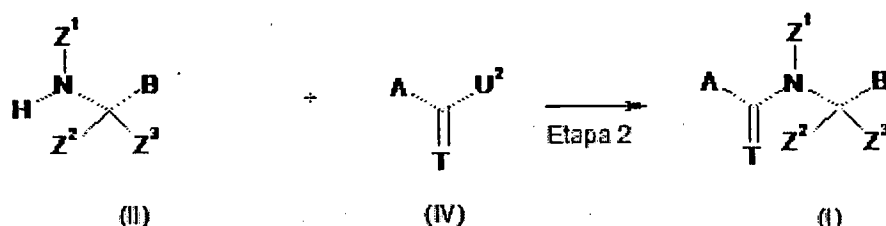
El procedimiento P2 según la invención se realiza generalmente a presión atmosférica.
35 También es posible operar a presión elevada o reducida.

Cuando se realiza el procedimiento P2 según la invención, 1 mol o un exceso del equivalente de azufre del agente de tionación y de 1 a 3 moles de la base pueden emplearse por mol del derivado amidado (I).

También es posible emplear los componentes de la reacción en otras proporciones. El desarrollo se realiza por métodos conocidos.

En general, la mezcla de reacción se concentra a presión reducida. El residuo que queda puede separarse de cualquier impureza que pueda estar todavía presente por métodos conocidos, tales como cromatografía o recristalización.

Según un aspecto adicional de acuerdo con la invención, se proporciona un procedimiento P3 para la preparación del compuesto de fórmula (I), en el que T representa N-R^c, N-OR^d, N-NR^eR^d o N-CN, y se ilustra según el siguiente esquema de reacción:



Procedimiento P3

en el que

- A, Z¹ a Z³, W¹ a W⁵ y B son como se define en la presente memoria;
- U² representa un átomo de cloro o un grupo metilsulfanilo,

En el procedimiento P3 según la invención, la etapa 2 puede realizarse en presencia de un aglutinante ácido y en presencia de un disolvente.

Los derivados de N-cicloalquil-amina de fórmula (II) son conocidos o pueden prepararse por procedimientos conocidos tales como la aminación reductora de aldehído o cetona (*Biorganics and Medicinal Chemistry Letters*, 2006, pág. 2014 síntesis de los compuestos 7 y 8), o reducción de iminas (*Tetrahedron*, 2005, pág. 11689), o sustitución nucleófila de halógeno, mesilato o tosilato (*Journal of Medicinal Chemistry*, 2002, pág. 3887 preparación del producto intermedio para el compuesto 28).

El cloruro de carboximidolilo N-sustituido de fórmula (IV) se conoce o puede prepararse por procedimientos conocidos, por ejemplo como se describe en Houben-Weyl, "Methoden der

organischen Chemie" (1985), E5/1, 628-633 y Patai, "The chemistry of amidines and imidates" (1975), págs. 296-301.

El cloruro de hidrazonoilo N-sustituido o N,N-disustituido de fórmula (IV) son conocidos o pueden prepararse por procedimientos conocidos, por ejemplo como se describe en *Tetrahedron*, 1991, 47, pág. 447 y *Journal of Heterocyclic Chemistry*, 1983, 20, págs. 225

El cloruro de N-ciano carboximidoilo de fórmula (IV) es conocido o puede prepararse por procedimientos conocidos, por ejemplo como se describe en *Tetrahedron Letters*, 1968, págs. 5523 y *Bioorganic and Medicinal Chemistry*, 2006, pág. 4723.

Los aglutinantes ácidos adecuados para realizar el procedimiento P3 según la invención pueden ser bases inorgánicas y orgánicas que son habituales para dichas reacciones. Se da preferencia al uso de hidróxidos de metales alcalinos o alcalinotérreos, tales como hidróxido sódico, hidróxido de calcio, hidróxido potásico u otros derivados de hidróxido de amonio; carbonatos de metales alcalinos, tales como carbonato sódico, carbonato potásico, bicarbonato potásico, bicarbonato sódico; acetatos de metales alcalinos o alcalinotérreos, tales como acetato sódico, acetato potásico, acetato de calcio; metales alcalinotérreos o hidruros de metales alcalinos, tal como el hidruro sódico o hidruro potásico; los alcoholatos de metales alcalinos o alcalinotérreos, tales como metilato de sodio, etilato de sodio, propilato de sodio o t-butilato de potasio; y también aminas terciarias, tales como trimetilamina, trietilamina, tributilamina, N,N-dimetilanilina, piridina, N-metilpiperidina, N,N-dimetilaminopiridina, diazabicyclooctano (DABCO), diazabicyclononeno (DBN) o diazabicycloundeceno (DBU); o un antioxidante ácido soportado sobre polímero (por ejemplo como se detalla en <http://www.iris-biotech.de/downloads/scavengers.pdf>).

También es posible trabajar en ausencia de cualquier aglutinante ácido adicional.

Disolventes adecuados para realizar el procedimiento P3 según la invención pueden ser los disolventes orgánicos inertes habituales. Se da preferencia a la utilización opcional de hidrocarburos halogenados alifáticos, alicíclicos o aromáticos, tales como éter de petróleo, hexano, heptano, ciclohexano, metilciclohexano, benceno, tolueno, xileno o decalino; 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-butyronitrilo 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.

5 Cuando se realiza el procedimiento P3 según la invención, las temperaturas de reacción pueden variar dentro de un intervalo relativamente amplio. En general, estos procedimientos se realizan a temperaturas de 0°C a 160°C, preferiblemente de 10°C a 120°C. Una forma de controlar la temperatura en los procedimientos según la invención es usar tecnología de microondas.

10 El procedimiento P2 según la invención se realiza generalmente a presión atmosférica. También es posible operar a presión elevada o reducida.

15 Cuando se realiza el procedimiento P3 según la invención, el derivado aminado de fórmula (III) puede emplearse como su sal, tal como clorhidrato o cualquier otra sal conveniente.

20 Cuando se realiza el procedimiento P3 según la invención, puede emplearse 1 mol o un exceso del derivado aminado de fórmula (II) y de 1 a 3 moles de aglutinante ácido por mol de cloruro de carboximidilo N-sustituido de fórmula (IV).

25 También es posible emplear los componentes de la reacción en otras proporciones. El desarrollo se realiza por métodos conocidos.

En general, la mezcla de reacción se concentra a presión reducida. El residuo que queda puede separarse de cualquier impureza que pueda estar todavía presente por métodos conocidos, tales como cromatografía o recristalización.

30 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.

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).

La expresión "cantidad eficaz y no fitotóxica" se refiere a una cantidad de composición de acuerdo con la invención que es suficiente para controlar o destruir los hongos presentes o que pueden 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 sistemáticos, que están dentro de las cualidades de un experto en la materia.

10 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.

15 Según la presente invención, el término "soporte" indica 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 sobre 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 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.

25 La composición según la invención puede comprender también componentes adicionales. En particular, la composición puede comprender además un tensioactivo. El tensioactivo puede ser un emulsionante, un agente dispersante o un agente humectante de tipo iónico o no iónico o una mezcla de dichos tensioactivos. Se puede hacer mención, por ejemplo, a 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 alquifenoles o arilfenoles), sales de ésteres del ácido sulfosuccínico, derivados de 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 comprenden 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
35 inerte son insolubles en agua, y cuando el agente vector para la aplicación es agua.

Preferiblemente, el contenido en tensioactivo puede estar comprendido entre 5% y 40% en peso de la composición.

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

En general, la composición según 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), 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 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 composiciones que están listas para ser aplicadas a la planta o semilla a tratar por medio de un dispositivo adecuado, tal como un dispositivo de atomización o de pulverización, sino también las composiciones comerciales concentradas que han de 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 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 de mezcla asociados adecuados pueden seleccionarse de las siguientes listas:

- (1) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos, por ejemplo benalaxilo, benalaxil-M, bupirimato, clozilacón, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxilo, metalaxil-M, ofurace, oxadixilo y ácido oxolínico.
- (2) Inhibidores de la mitosis y de la división celular, por ejemplo benomilo, carbendazim, clorfenazol, dietofencarb, etaboxam, fuberidazol, pencicurón, tiabendazol, tiofanato, tiofanato-metilo y zoxamida.
- (3) Inhibidores de la respiración, por ejemplo diflumentorim como inhibidor de la respiración CI; bixafeno, boscalid, carboxín, fenfuram, flutolanil, fluopiram, furametpir, furmeciclox, isopirazam (componente 9R), isopirazam (componente 9S), mepronil, oxicarboxín, pentiopirad, tifluzamida como inhibidor de la respiración CII; amisulbrom, azoxistrobina, ciazofamid, dimoxistrobina, enestroburina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, kresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, piribencarb y trifloxistrobina como inhibidor de la respiración CIII;
- (4) Compuestos capaces de actuar como desacopladores, como por ejemplo binapacril, dinocap, fluazinam y meptildinocap.
- (5) Inhibidores de la producción ATP, por ejemplo acetato de fentín, cloruro de fentín, hidróxido de fentín y siltiofam.
- (6) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y/o proteínas, por ejemplo andoprim, blasticidin-S, ciprodinil, kasugamicina, hidrocloreto de kasugamicina hidratado, mepanipirim y pirimetanilo.
- (7) Inhibidores de la transducción de señal, por ejemplo fenpiclonil, fludioxonil y quinoxifén.
- (8) Inhibidores de la síntesis de lípidos y de la membrana, por ejemplo bifenilo, clozolato, edifenfós, etridiazol, yodocarb, iprobenfós, iprodiona, isoprotilano, procimidona, propamocarb, hidrocloreto de propamocarb, pirazofós, tolclofos-metilo y vinclozólín.
- (9) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo aldimorf, azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, dodemorf, acetato de dodemorf, epoxiconazol, etaconazol, fenarimol, fenbuconazol, fenhexamid, fenpropidín, fenpropimorf, fluquinconazol, flurprimidol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, naftifina, nuarimol, oxpoconazol, paclobutrazol, pefurazoato, penconazol, piperalín, procloraz, propiconazol, protioconazol, piributicarb, pirifenox, quinconazol, simeconazol, espiroxamina, tebuconazol, terbinafina, tetraconazol, triadimefón, triadimenol, tridemorf, triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol, viniconazol y voriconazol.

(10) Inhibidores de la síntesis de la pared celular, por ejemplo benthiavalicarb, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, mandipropamid, polioxinas, polioxorim, protiocarb, validamicina A y valifenal.

(11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo carpropamid, diclocimet, fenoxanil, ftalida, piroquilón y triciclazol.

(12) Compuestos capaces de inducir una defensa del hospedador, como por ejemplo acibenzolar-S-metil, probenazol e tiadinilo.

(13) Compuestos capaces de presentar una acción en múltiples puntos, como por ejemplo: mezcla Bordeaux, captafol, captán, clorotalonil, naftenato de cobre, óxido de cobre, oxiclورو de cobre, preparaciones de cobre tales como: hidróxido de cobre, sulfato de cobre, diclofluanid, ditanón, dodina, base libre de dodina, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminocladina, albesilato de iminocladina, triacetato de iminocladina, mancozeb, mancozeb, maneb, metiram, metiram cinc, oxina-cobre, propamidina, propineb, azufre y preparaciones de azufre incluyendo: polisulfuro de calcio, tiram, tolilfluanid, zineb y ziram.

(14) Compuestos adicionales como por ejemplo 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilprop-2-enoato de etilo, N-[2-(1,3-dimetilbutil)fenil]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-[2-[1,1'-bi(ciclopropil)-2-il]fenil]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2E)-2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (2E)-2-[2-[[[(2E,3E)-4-(2,6-diclorofenil)but-3-en-2-ilideno]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridina-3-carboxamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxibenzamida, 5-metoxi-2-metil-4-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil)etanamida, (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[(E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino)metil]fenil)etanamida, (2E)-2-[2-[[[(1E)-1-[3-[(E)-1-fluoro-2-feniletetil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, N-etil-N-metil-N'-(2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil)-imidoformamida, N'-(5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, 1H-imidazol-1-carbotiicato de O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil], N-[2-(4-[[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi]-3-metoxifenil]etil)-N2-(metilsulfonil)valinamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, propamocarb-fosetil, 1H-imidazole-1-carboxilato de 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropilo, 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-

- ona, 2-fenilfenol y sales, 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, 3,4,5-tricloropiridina-2,6-dicarbonitrilo, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, quinolin-8-ol, sulfato de quinolin-8-ol (2:1) (sal), bentiazol,
- 5 betoxazina, capsimicina, carvona, quinometionat, cloroneb, cufraneb, ciflufenamid, cimoxanil, cipsulfamida, dazomet, debacarb, diclorofeno, diclomezina, diclorán, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, ecomato, ferimzona, flumetover, fluopicolida, fluoroimida, flusulfamida, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, hexaclorobenceno, irumamicina, isotianil, metasulfocarb, (2E)-2-{2-[(ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]tio)metil]fenil}-3-
- 10 metoxiacrilato de metilo, isotiocianato de metilo, metrafenona, (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, mildiomicina, tolifenida, N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloropiridina-3-carboxamida, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloropiridina-3-carboxamida, N-[1-(5-
- 15 bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodopiridina-3-carboxamida, N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)-imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida, N-[(E)-[(ciclopropilmetoxi)-imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-fenilacetamida; natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, octilina, oxamocarb, oxifentina, pentaclorofenol y sus sales, ácido fenazina-1-carboxílico, fenotrin, ácido fosforoso y sus sales, fosetilato de propamocarb, propanosina-sodio, proquinazid, pirrolnitrina, quintoceno, 5-amino-2-(1-metiletil)-4-(2-metilfenil)-3-oxo-2,3-dihidro-1H-pirazol-1-carbotioato de S-prop-2-en-1-ilo, tecloftalam, tecnaceno, triazoxida, triclamida, 5-cloro-N'-fenil-N'-prop-2-in-1-iltiofen-2-sulfonohidrazida e
- 20 zarilamid.
- 25 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 bactericidas adecuados que se mezclan juntos pueden seleccionarse de la siguiente lista: bronopol, diclorofeno, nitrapirina, dimetilditiocarbamato de níquel, kasugamicina, octilina, ácido furancarboxílico, oxitetraciclina, probenazol, estreptomicina, tecloftalam, sulfato de cobre
- 30 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 servir 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 presente invención se pueden mencionar el algodón; el lino; la vid; los cultivos de 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 plataneras), 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, remolachas), Elaeis sp. (por ejemplo, palma de aceite); cultivos hortícolas y arbóreos; así como los homólogos genéticamente modificados de estos cultivos.

Entre las enfermedades de plantas o cultivos que se pueden proteger por el método según la invención, se pueden mencionar:

- Enfermedades por mildiu pulverulento, tales como:
- Enfermedades por *Blumeria*, producidas por ejemplo por *Blumeria graminis*;
- enfermedades por *Podosphaera*, producidas por ejemplo por *Podosphaera leucotricha*;
- enfermedades por *Sphaerotheca*, producidas por ejemplo por *Sphaerotheca fuliginea*;
- enfermedades por *Uncinula*, producidas por ejemplo por *Uncinula necator*;

Enfermedades por roya, tales como:

Enfermedades por *Gymnosporangium*, producidas por ejemplo por *Gymnosporangium sabinae*;
enfermedades por *Hemileia*, producidas por ejemplo por *Hemileia vastatrix*;

- 5 enfermedades por *Phakopsora*, producidas por ejemplo por *Phakopsora pachyrhizi* y *Phakopsora meibomia*;
enfermedades por *Puccinia*, producidas por ejemplo por *Puccinia recondita*, *Puccinia graminis* o *Puccinia striiformis*;
enfermedades por *Uromyces*, producidas por ejemplo por *Uromyces appendiculatus*;

10

enfermedades por oomicetos tales como:

enfermedades por *Albugo* producidas por ejemplo por *Albugo candida*;

enfermedades por *Bremia*, producidas por ejemplo por *Bremia lactucae*;

- 15 enfermedades por *Peronospora* producidas por ejemplo por *Peronospora pisi* y *Peronospora brassicae*;

enfermedades por *Phytophthora*, producidas por ejemplo por *Phytophthora infestans*;

enfermedades por *Plasmopara*, producidas por ejemplo por *Plasmopara viticola*;

enfermedades por *Pseudoperonospora*, producidas por ejemplo por *Pseudoperonospora humuli* y *Pseudoperonospora cubensis*;

- 20 enfermedades por *Pythium*, producidas por ejemplo por *Pythium ultimum*;

enfermedades por manchas foliares, Septorios foliar y marchitez foliar tales como:

Enfermedades por *Alternaria*, producidas por ejemplo por *Alternaria solani*;

enfermedades por *Cercospora*, producidas por ejemplo por *Cercospora beticola*;

- 25 enfermedades por *Cladosporium*, producidas por ejemplo por *Cladosporium cucumerinum*;

enfermedades por *Cochliobolus*, producidas por ejemplo por *Cochliobolus sativus* (en forma de conidio: *Drechslera*, Syn: *Helminthosporium*) o *Cochliobolus miyabeanus*;

enfermedades por *Colletotrichum*, producidas por ejemplo por *Colletotrichum coccodes*;

enfermedades por *Cycloconium*, producidas por ejemplo por *Cycloconium oleaginum*;

- 30 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*;

enfermedades por *Glomerella*, producidas por ejemplo por *Glomerella cingulata*;

enfermedades por *Guignardia*, producidas por ejemplo por *Guignardia bidwelli*;

enfermedades por *Leptosphaeria*, producidas por ejemplo por *Leptosphaeria maculans* y *Leptosphaeria nodorum*;

enfermedades por *Magnaporthe*, producidas por ejemplo por *Magnaporthe grisea*;

enfermedades por *Mycosphaerella* producidas por ejemplo por *Mycosphaerella graminicola*, *Mycosphaerella arachidicola* y *Mycosphaerella fijiensis*;

enfermedades por *Phaeosphaeria*, producidas por ejemplo por *Phaeosphaeria nodorum*;

enfermedades por *Pyrenophora* producidas por ejemplo por *Pyrenophora teres* o *Pyrenophora tritici repentis*;

enfermedades por *Ramularia* producidas por ejemplo por *Ramularia collo-cygni* o *Ramularia areola*;

enfermedades por *Rhynchosporium*, producidas por ejemplo por *Rhynchosporium secalis*;

enfermedades por *Septoria*, producidas por ejemplo por *Septoria apii* y *Septoria lycopersici*;

enfermedades por *Typhula*, producidas por ejemplo por *Typhula incarnata*;

enfermedades por *Venturia*, producidas por ejemplo por *Venturia inaequalis*;

enfermedades de la raíz, de la vaina y del tallo, tales como:

Enfermedades por *Corticium*, producidas por ejemplo por *Corticium graminearum*;

enfermedades por *Fusarium*, producidas por ejemplo por *Fusarium oxysporum*;

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

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

enfermedades por *Sarocladium* producidas por ejemplo por *Sarocladium oryzae*;

enfermedades por *Sclerotium*, producidas por ejemplo por *Sclerotium oryzae*;

enfermedades por *Tapesia*, producidas por ejemplo por *Tapesia acutiformis*;

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

enfermedades de la mazorca y del panículo incluyendo la mazorca del maíz, tales como:

enfermedades por *Alternaria*, producidas por ejemplo por *Alternaria spp.*;

enfermedades por *Aspergillus*, producidas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;

enfermedades por *Cladosporium*, producidas por ejemplo por *Cladosporium cucumerinum*;

enfermedades por *Claviceps*, producidas 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:

Enfermedades por *Sphacelotheca*, producidas 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*;

5

enfermedades por moho y roña de la fruta, tales como:

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* y *Penicillium*
purpurogenum;

10

enfermedades por *Rhizopus*, producidas por ejemplo por *Rhizopus oryzae*;

enfermedades por *Sclerotinia*, producidas por ejemplo por *Sclerotinia sclerotiorum*;

enfermedades por *Verticillium*, producidas por ejemplo por *Verticillium alboatrum*;

15

enfermedades por podredumbre de las semillas y del suelo, moho, marchitamiento, roña y
 caída de almáciga:

Enfermedades por *Alternaria* producidas por ejemplo por *Alternaria brassicicola*;

enfermedades por *Aphanomyces* producidas por ejemplo por *Aphanomyces euteiches*;

enfermedades por *Ascochyta* producidas por ejemplo por *Ascochyta lentis*;

20

enfermedades por *Aspergillus*, producidas por ejemplo por *Aspergillus flavus*;

enfermedades por *Cladosporium*, producidas por ejemplo por *Cladosporium herbarum*;

enfermedades por *Cochliobolus*, producidas por ejemplo por *Cochliobolus sativus*;

(con forma de conidios: *Drechslera*, *Bipolaris* Syn: *Helminthosporium*);

enfermedades por *Colletotrichum*, producidas por ejemplo por *Colletotrichum coccodes*;

25

enfermedades por *Fusarium*, producidas por ejemplo por *Fusarium culmorum*;

enfermedades por *Gibberella*, producidas por ejemplo por *Gibberella zeae*;

enfermedades por *Macrophomina*, producidas por ejemplo por *Macrophomina phaseolina*;

enfermedades por *Microdochium*, producidas por ejemplo por *Microdochium nivale*;

enfermedades por *Monographella*, producidas por ejemplo por *Monographella nivalis*;

30

enfermedades por *Penicillium*, producidas por ejemplo por *Penicillium expansum*;

enfermedades por *Phoma*, producidas por ejemplo por *Phoma lingam*;

enfermedades por *Phomopsis*, producidas por ejemplo por *Phomopsis sojae*;

enfermedades por *Phytophthora*, producidas por ejemplo por *Phytophthora cactorum*;

enfermedades por *Pyrenophora*, producidas por ejemplo por *Pyrenophora graminea*;

35

enfermedades por *Pyricularia*, producidas por ejemplo por *Pyricularia oryzae*;

enfermedades por *Pythium*, producidas por ejemplo por *Pythium ultimum*;
enfermedades por *Rhizoctonia*, producidas por ejemplo por *Rhizoctonia solani*;
enfermedades por *Rhizopus*, producidas por ejemplo por *Rhizopus oryzae*;
enfermedades por *Sclerotium*, producidas por ejemplo por *Sclerotium rolfsii*;
5 enfermedades por *Septoria*, producidas por ejemplo por *Septoria nodorum*;
enfermedades por *Typhula*, producidas por ejemplo por *Typhula incarnata*;
enfermedades por *Verticillium*, producidas por ejemplo por *Verticillium dahliae*;

enfermedades por cancro, retama, puntiseco tales como:

10 Enfermedades por *Nectria*, producidas por ejemplo por *Nectria galligena*;

enfermedades por tizón, tales como:

Enfermedades por *Monilinia*, producidas por ejemplo por *Monilinia laxa*;

enfermedades por ampollas foliares o rizos foliares incluyendo la deformación de flores y frutos,
15 tales como:

Enfermedades por *Exobasidium* producidas por ejemplo por *Exobasidium vexans*.

Enfermedades por *Taphrina*, producidas por ejemplo por *Taphrina deformans*;

enfermedades de deterioro de plantas madereras tales como:

Enfermedad por Esca producida por ejemplo por *Phaeoconiella clamydospora*,
20 *Phaeoacremonium aleophilum* y *Fomitiporia mediterranea*;

enfermedades por *Ganoderma* producidas por ejemplo por *Ganoderma boninense*;

enfermedades de flores y semillas, tales como:

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

25 enfermedades de tubérculos, tales como:

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

enfermedades por *Helminthosporium* producidas por ejemplo por *Helminthosporium solani*;

30 enfermedades por club root, tales como:

Enfermedades por *Plasmodiophora*, producidas por ejemplo por *Plasmodiophora brassicae*.

Enfermedades producidas por organismos bacterianos, tales como:

especie *Xanthomonas*, por ejemplo *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

35 especie *Pseudomonas*, por ejemplo *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

especie *Erwinia*, por ejemplo *Erwinia amylovora*.

La composición fungicida según la invención también se puede usar 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 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 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 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 de acuerdo con la invención también se puede usar en el tratamiento de organismos modificados genéticamente con los compuestos de acuerdo con la invención o las composiciones agroquímicas de acuerdo con la invención. Las plantas modificadas genéticamente son plantas en cuyo genoma se ha integrado de forma estable un gen heterólogo que codifica una proteína de interés. La expresión "gen heterólogo que codifica una proteína de interés" significa básicamente genes que aportan a la planta transformada nuevas propiedades agrónomas, o genes para mejorar la calidad agrónoma de la planta transformada. Los compuestos o mezclas de acuerdo con la invención pueden también utilizarse para la preparación de una composición útil para tratar en forma terapéutica o preventiva enfermedades micóticas en seres humanos o animales tales como, por ejemplo, micosis, dermatosis, tricofitosis y candidiasis o enfermedades producidas por *Aspergillus spp.*, por ejemplo *Aspergillus fumigatus*.

Varios aspectos de la invención se ilustrarán ahora con relación a la tabla siguiente de ejemplos de compuestos y los siguientes ejemplos de preparación.

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.

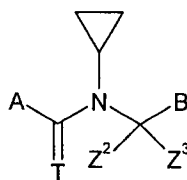
En la tabla siguiente, los valores log P se determinaron de acuerdo con la Directiva EEC 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (Cromatografía Líquida de Alta Resolución) en una columna de fase inversa (C 18), usando el método descrito a continuación:

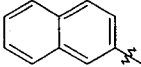
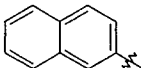
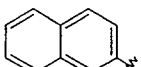
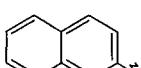
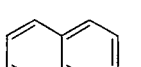
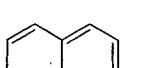
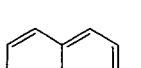
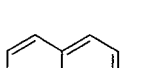
Temperatura: 40°C; Fases móviles: Acetonitrilo y ácido fórmico acuoso al 0,1%; gradiente lineal de 10% de acetonitrilo a 90% de acetonitrilo.

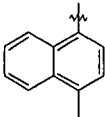
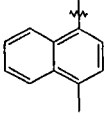
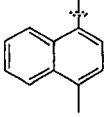
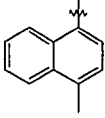
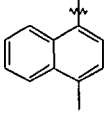
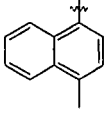
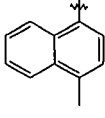
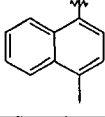
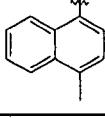
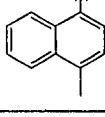
La calibración se realizó usando alcan-2-onas sin ramificar (que comprenden de 3 a 16 átomos de carbono) con valores de log P conocidos (determinación de los valores de log P por los tiempos de retención usando interpolación lineal entre dos alcanonas sucesivas).

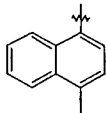
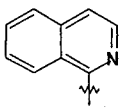
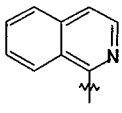
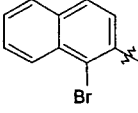
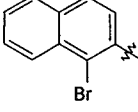
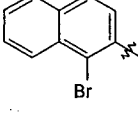
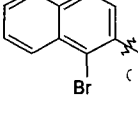
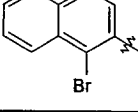
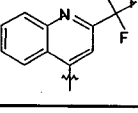
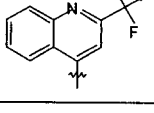
Los valores máx. de lambda se determinaron en el máximo de las señales cromatográficas usando el espectro UV de 190 nm a 400 nm.

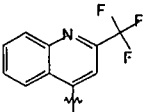
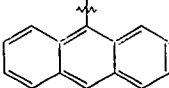
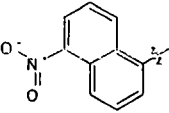
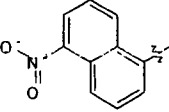
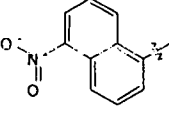
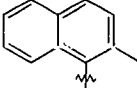
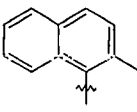
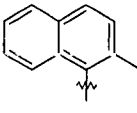
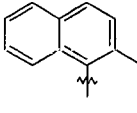
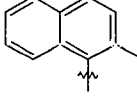
Los siguientes ejemplos ilustran de una manera no limitativa la preparación de los compuestos de fórmula (I) según la invención.

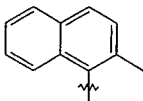
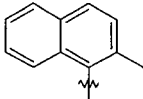
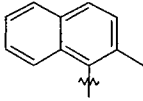
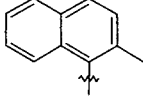
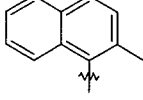
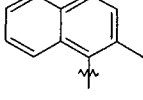
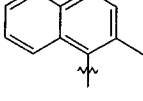
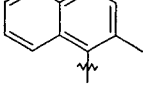
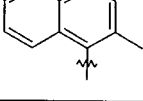
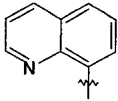


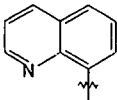
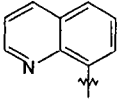
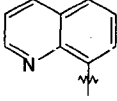
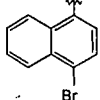
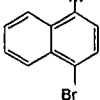
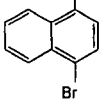
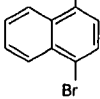
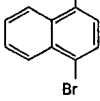
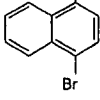
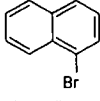
Ej. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
1	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			338
2	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			352
3	A5	N-Me	Me	-	F	S	H	H			354
4	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			368
5	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			356
6	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			370
7	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			336
8	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			350
9	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			352
10	A5	N-Me	Me	-	F	S	H	H			368

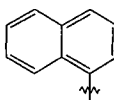
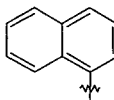
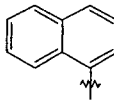
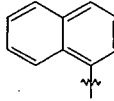
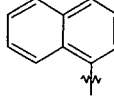
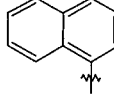
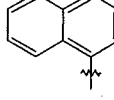
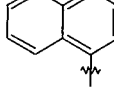
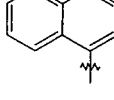
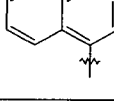
EJ. N°	A	V¹	R¹²	R¹³	R¹⁴	T	Z²	Z³	B	LogP	M+H
11	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			370
12	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			384
13	A2	N-Me	H	H	H	O	Me	H			333
14	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H			348
15	A2	S	Me	H	H	O	Me	H			350
16	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			366
17	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			350
18	A5	N-Me	CF3	-	F	O	Me	H			420
19	A1	O	Me	H	H	O	Me	H			334
20	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			364

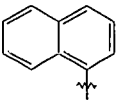
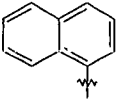
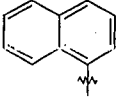
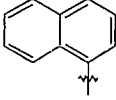
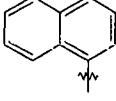
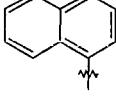
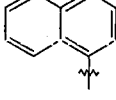
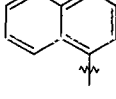
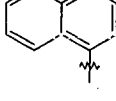
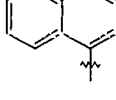
Ej. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
21	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	Me	H			401
22	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
23	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			357
24	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			416
25	A5	N-Me	Me	-	F	S	H	H		4,39	
26	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H		3,68	
27	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H		3,24	
28	A5	N-Me	OMe	-	H	S	H	H		4,25	
29	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			407
30	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			421

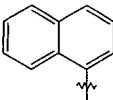
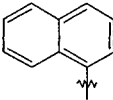
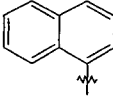
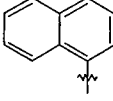
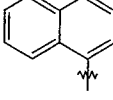
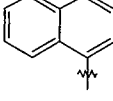
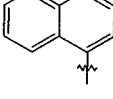
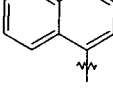
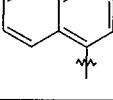
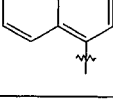
EJ. N°	A	V ¹	R ⁰²	R ³³	R ⁰⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
31	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			425
32	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			406
33	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			383
34	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			401
35	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			381
36	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			382
37	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			
38	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			
39	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			
40	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		3,25	

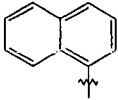
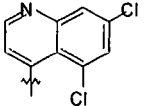
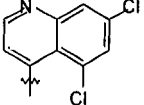
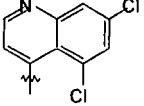
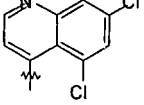
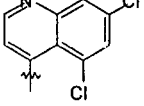
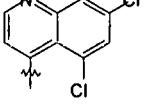
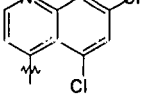
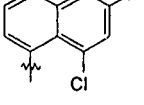
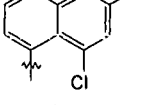
Ej. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
41	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			350
42	A5	N-Me	OMe	-	H	S	H	H			366
43	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H			
44	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			319
45	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			334
46	A2	S	Me	H	H	O	H	H			336
47	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			406
48	A1	O	Me	H	H	O	H	H			320
49	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			387
50	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339

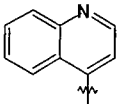
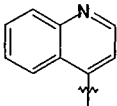
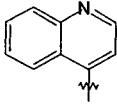
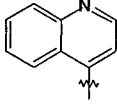
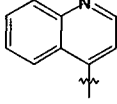
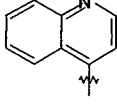
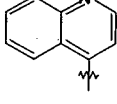
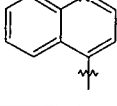
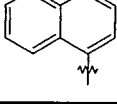
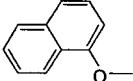
Ej. N°	A	V¹	R¹²	R¹³	R¹⁴	T	Z²	Z³	B	LogP	M+H
51	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			357
52	A5	N-Me	CHF2	-	H	S	H	H			373
53	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
54	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		3,62	
55	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H		3,69	
56	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			414
57	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			430
58	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			444
59	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			449
60	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H		5,2	

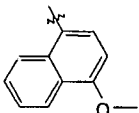
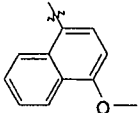
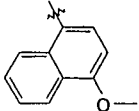
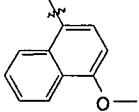
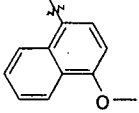
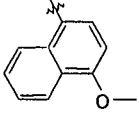
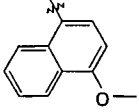
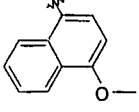
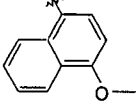
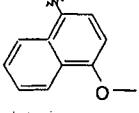
Ej. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
61	A5	N-Me	CF3	-	H	O	COOMe	H			432
62	A1	N-Me	H	CF3	H	O	COOMe	H			431
63	A5	N-Me	Me	-	F	O	COOMe	H		2,92	
64	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			338
65	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			352
66	A5	N-Me	Me	-	F	S	Me	H			368
67	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			366
68	A5	N-Me	Et	-	F	S	Me	H			382
69	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	COOMe	H		3,02	
70	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			356

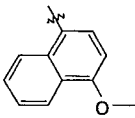
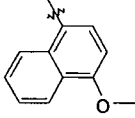
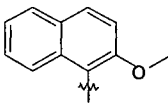
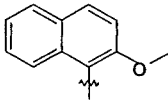
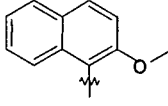
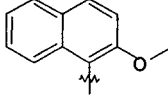
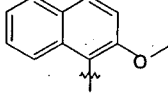
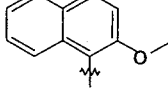
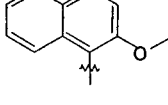
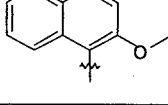
EJ. N°	A	V¹	R²²	R³³	R⁴⁴	T	Z²²	Z³³	B	LogP	M+H
71	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			370
72	A5	N-Me	CHF2	-	H	S	H	H			372
73	A5	N-Me	OMe	-	H	O	COOMe	H			394
74	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			336
75	A5	N-Me	OMe	-	H	O	Me	H		2,86	
76	A2	N-Me	H	H	H	O	Me	H			319
77	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H			334
78	A2	S	Me	H	H	O	Me	H			336
79	A5	N-Me	CF3	-	F	O	Me	H			406
80	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			

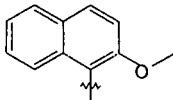
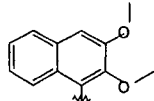
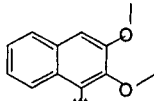
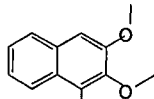
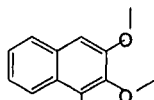
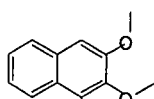
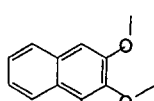
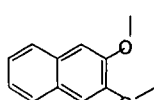
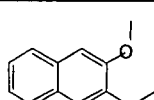
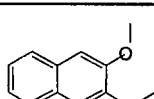
Ej. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
81	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			
82	A1	N-Me	H	CHF2	H	O	Me	H			369
83	A5	N-Me	Me	-	F	O	Et	H			366
84	A1	O	Me	H	H	O	Me	H			320
85	A5	N-Me	Et	-	F	O	Et	H			380
86	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Et	H			384
87	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			
88	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			
89	A5	N-Me	CHF2	-	F	O	Me	H			388
90	A1	N-Me	H	CF3	H	O	Me	H			387

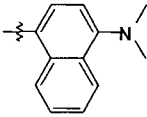
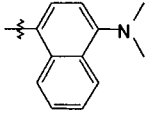
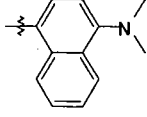
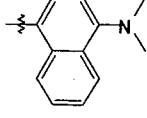
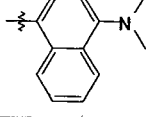
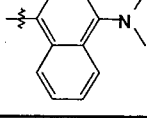
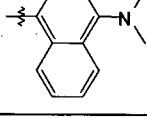
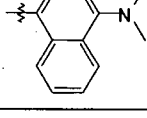
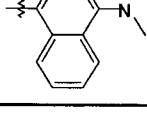
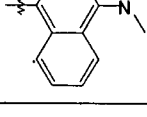
EJ. N°	A	V¹	R¹²	R¹³	R¹¹	T	Z²	Z³	B	LogP	M+H
91	A5	N-Me	CF2Me	-	H	O	Me	H			384
92	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			405
93	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			374
94	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			389
95	A2	S	Me	H	H	O	H	H			391
96	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			461
97	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			407
98	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			425
99	A1	O	Me	H	H	O	H	H			375
100	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			442

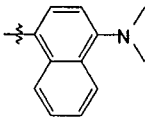
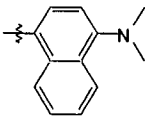
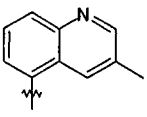
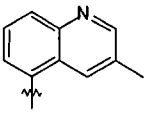
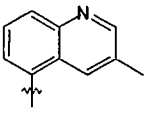
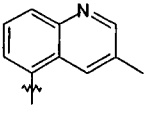
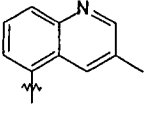
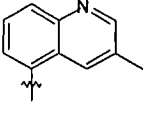
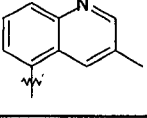
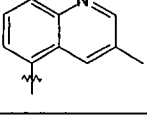
Ej. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
101	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
102	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			306
103	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			321
104	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
105	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			393
106	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
107	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			357
108	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
109	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			374
110	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			366

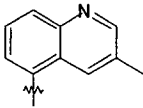
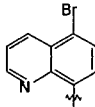
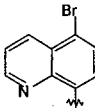
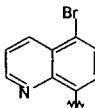
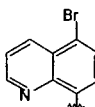
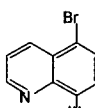
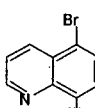
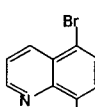
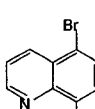
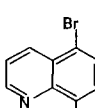
EJ. N°	A	V ¹	R ¹²	R ⁰³	R ⁰⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
111	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			335
112	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			350
113	A2	S	Me	H	H	O	H	H			352
114	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			422
115	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			368
116	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			396
117	A1	O	Me	H	H	O	H	H			336
118	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			403
119	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			382
120	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			396

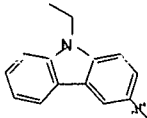
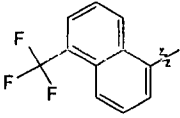
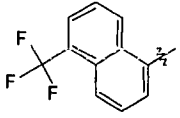
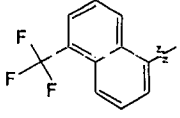
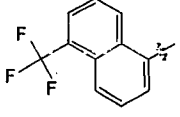
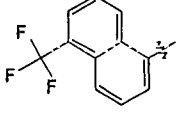
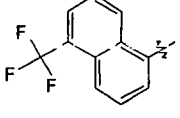
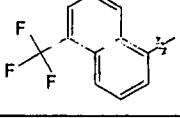
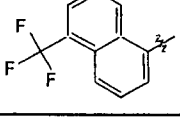
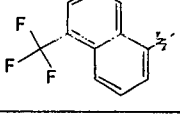
Ej. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
121	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			400
122	A1	O	Me	H	Me	O	Me	H			364
123	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			366
124	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			335
125	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			350
126	A2	S	Me	H	H	O	H	H			352
127	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			422
128	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			368
129	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			386
130	A1	O	Me	H	H	O	H	H			336

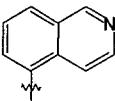
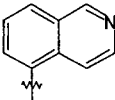
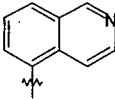
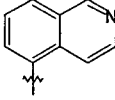
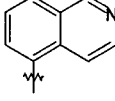
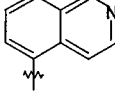
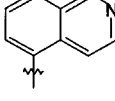
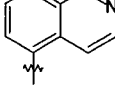
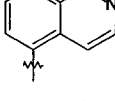
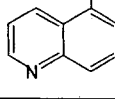
EJ. N°	A	V ¹	R ³²	R ³³	R ³⁴	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
131	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			403
132	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			396
133	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			365
134	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			380
135	A2	S	Me	H	H	O	H	H			382
136	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			452
137	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			398
138	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			416
139	A1	O	Me	H	H	O	H	H			366
140	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			433

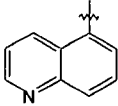
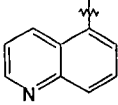
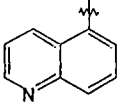
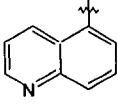
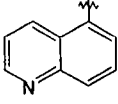
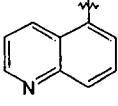
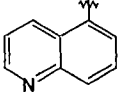
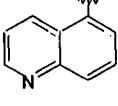
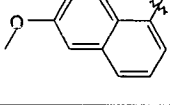
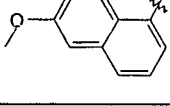
Ej. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
141	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			379
142	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			348
143	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			363
144	A2	S	Me	H	H	O	H	H			365
145	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			435
146	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			381
147	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			399
148	A1	O	Me	H	H	O	H	H			349
149	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			416
150	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			395

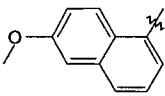
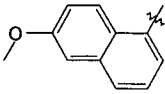
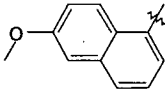
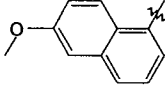
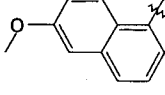
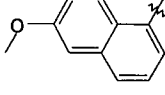
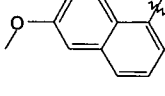
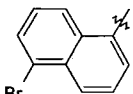
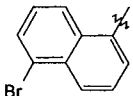
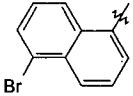
Ej. N°	A	V¹	R ^{o2}	R ^{o3}	R ^{o4}	T	Z²	Z³	B	LogP	M+H
151	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			409
152	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			413
153	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			351
154	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			320
155	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			335
156	A2	S	Me	H	H	O	H	H			337
157	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			407
158	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			353
159	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			371
160	A1	O	Me	H	H	O	H	H			321

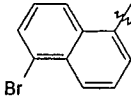
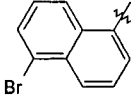
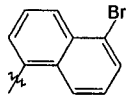
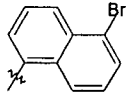
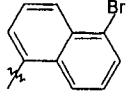
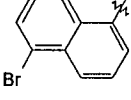
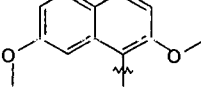
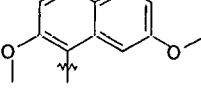
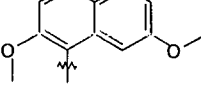
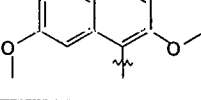
Ej. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
161	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			388
162	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			415
163	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			384
164	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			399
165	A2	S	Me	H	H	O	H	H			401
166	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			471
167	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		2,9	
168	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			435
169	A1	O	Me	H	H	O	H	H			385
170	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			452

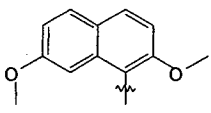
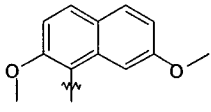
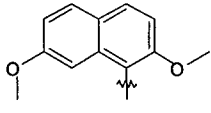
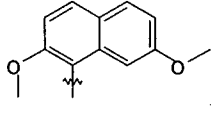
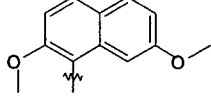
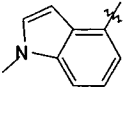
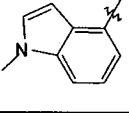
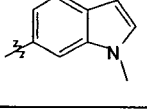
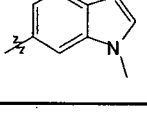
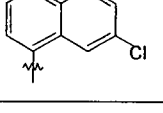
EJ. N°	A	V¹	R²²	R³³	R⁴⁴	T	Z²	Z³	B	LogP	M+H
171	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			405
172	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			404
173	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			373
174	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			333
175	A2	S	Me	H	H	O	H	H			390
176	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			460
177	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			406
178	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			424
179	A1	O	Me	H	H	O	H	H			374
180	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			441

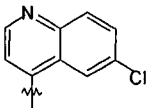
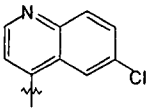
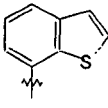
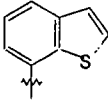
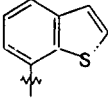
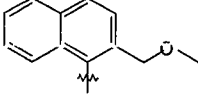
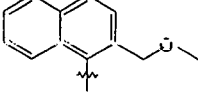
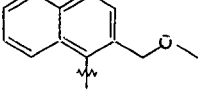
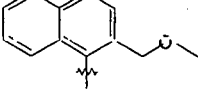
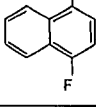
Ej. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
181	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337
182	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			306
183	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			321
184	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
185	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			393
186	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
187	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			357
188	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
189	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			374
190	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			337

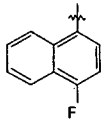
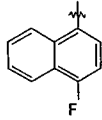
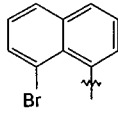
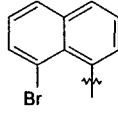
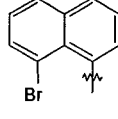
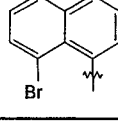
EJ. N°	A	V¹	R ⁰²	R ⁰³	R ⁰⁴	T	Z²	Z³	B	LogP	M+H
191	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			306
192	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			321
193	A2	S	Me	H	H	O	H	H			323
194	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			393
195	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			339
196	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			357
197	A1	O	Me	H	H	O	H	H			307
198	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			374
199	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			366
200	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			335

Ej. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
201	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			350
202	A2	S	Me	H	H	O	H	H			352
203	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			422
204	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			368
205	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			386
206	A1	O	Me	H	H	O	H	H			336
207	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			403
208	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			414
209	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			383
210	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			398

EJ. N°	A	V¹	R²²	R²³	R²⁴	T	Z²	Z³	B	LogP	M+H
211	A2	S	Me	H	H	O	H	H			400
212	A5	N-Me	CF3	-	F	O	H	H			470
213	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			416
214	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			434
215	A1	O	Me	H	H	O	H	H			384
216	A1	N-Me	H	CF3	H	O	H	H			451
217	A5	N-Me	OMe	-	H	O	H	H			396
218	A2	N-Me	H	H	H	O	H	H			365
219	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			390
220	A2	S	Me	H	H	O	H	H			392

Ej. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
221	A5	N-Me	CF ₃	-	F	O	H	H			452
222	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H		2,96	
223	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			416
224	A1	O	Me	H	H	O	H	H			366
225	A1	N-Me	H	CF ₃	H	O	H	H			433
226	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			341
227	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			359
228	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			341
229	A5	N-Me	CHF ₂	-	H	O	H	H			359
230	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			373

EJ. N°	A	V¹	R²²	R²³	R²¹	T	Z²	Z³	B	LogP	M+H
231	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			387
232	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			355
233	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			344
234	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			358
235	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			362
236	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			302
237	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			398
238	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			400
239	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			364
240	A5	N-Me	Me	-	F	O	Me	H			370

Ej. N°	A	V ¹	R ^{a2}	R ^{a3}	R ^{a4}	T	Z ²	Z ³	B	LogP	M+H
241	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	Me	H			388
242	A5	N-Me	Et	-	F	O	Me	H			384
243	A5	N-Me	Me	-	F	O	H	H			416
244	A5	N-Me	Et	-	F	O	H	H			430
245	A5	N-Me	CHF2	-	H	O	H	H			434
246	A1	O	Me	H	Me	O	H	H			398

- Ejemplo 1 de preparación general: preparación de un derivado de amida de fórmula (I) en el aparato de microondas Optimizer™

En un vial Optimizer™ de 8 ml se pesan 1,7 mmoles de amina (II). Se añaden 2 ml de una solución 1 molar del cloruro de acilo (III) (2 mmoles) en acetonitrilo seguido de 1 ml de trietilamina. El vial se sella, se agita previamente 10 s a temperatura ambiente, a continuación se calienta a 180°C durante 60 s en microondas. Después del enfriamiento, el vial se abre y se vierte sobre 10 ml de una solución saturada de carbonato potásico. La capa acuosa se extrae dos veces mediante 5 ml de diclorometano. Las fases orgánicas se secan sobre sulfato de magnesio. Se eliminan los disolventes y la amida en bruto se analiza por LCMS y RMN. Los compuestos con pureza insuficiente se purifican más por LCMS de preparación.
- Ejemplo 2 de preparación general: tionación de un derivado de amida de fórmula (I) en el aparato Chemspeed™

En un vial Chemspeed de 13 ml se pesan 0,27 mmoles de pentasulfuro de fósforo (P_2S_5). Se añaden 3 ml de una disolución 0,18 molar de la amida (I) (0,54 mmoles) en diclorano y la mezcla se calienta a reflujo durante dos horas. La temperatura se enfría a continuación a 80°C y se añaden 2,5 ml de agua. La mezcla se calienta a 80°C durante una hora más. Se añaden a continuación 2 ml de agua y la mezcla de reacción se extrae dos veces con 4 ml de diclorometano. La fase orgánica se deposita sobre un cartucho de alúmina básica (2 g) y se eluye dos veces con 8 ml de diclorometano. Se eliminan los disolventes y la tioamida en bruto se analiza por LCMS y RMN. Los compuestos con pureza insuficiente se purifican más por LCMS de preparación.

Ejemplo de eficacia A: ensayo *in vivo* sobre *Pyrenophora teres* (manchas reticulares de la cebada)

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

Las plantas de cebada (variedad Express o Plaisant), en semilleros, 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 descrito 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 *Pyrenophora teres* (12.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de un cultivo de 15 días. Las plantas de cebada contaminadas se incuban durante 24 horas a 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 buena protección (al menos del 70%) o total protección a una dosis de 500 ppm con los siguientes compuestos: 1, 2, 3, 6, 8, 9, 11, 12, 16, 18, 24, 25, 26, 27, 33, 36, 40, 42, 47, 50, 54, 55, 57, 58, 59, 64, 65, 66, 67, 69, 71, 72, 75, 79, 80, 81, 82, 83, 85, 86, 87, 88, 89, 100, 109, 116, 119, 120, 145, 149, 166, 167, 168, 176, 177, 178, 204, 213, 214, 222, 226, 227, 228, 240, 241 y 242.

Ejemplo de eficacia B: prueba preventiva *in vivo* sobre *Sphaerotheca fuliginea* (mildiu de las cucurbitáceas)

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

- 5 Plantas de pepinillo (variedad Petit vert de París) en semilleros, sembradas en un sustrato de turba-puzolana 50/50 y cultivadas entre 20°C y 23°C, se tratan en la etapa de las 2 primeras hojas pulverizándolas con la suspensión acuosa descrita anteriormente. Las 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 *Sphaerotheca fuliginea* (100.000 esporas por ml). Se recogen esporas de una planta
- 10 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 lleva a cabo 11 a -12 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
- 15 ppm con los siguientes compuestos: 2, 6, 8, 11, 12, 17, 18, 22, 23, 25, 26, 36, 40, 41, 42, 47, 49, 50, 51, 53, 55, 56, 57, 58, 59, 63, 64, 65, 66, 67, 69, 70, 71, 72, 74, 75, 79, 80, 81, 82, 83, 85, 86, 87, 88, 89, 100, 105, 109, 120, 128, 129, 136, 137, 138, 149, 157, 158, 159, 166, 167, 168, 176, 177, 178, 180, 185, 194, 195, 196, 198, 204, 205, 221, 222, 240, 241 y 242.

- 20 Ejemplo de eficacia C: ensayo preventivo *in vivo* sobre *Mycosphaerella graminicola* (mancha de las hojas del trigo)

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

- 25 Las plantas de trigo (variedad Express o Plaisant), 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 el ingrediente activo descrito anteriormente.

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

- 30 Después de 24 horas, las plantas se contaminan pulverizándolas con una suspensión acuosa de esporas de *Mycosphaerella graminicola* (500.000 esporas por ml). Las esporas se obtienen 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 a continuación durante 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
- 35 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: 1, 2, 5, 6, 7, 8, 9, 11, 17, 18, 22, 23, 24, 26, 27, 32, 33, 34, 36, 40, 41, 47, 48, 49, 50, 51, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 63, 64, 65, 67, 69, 70, 71, 74, 75, 79, 80, 81, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 89, 94, 96, 97, 100, 105, 109, 115, 116, 119, 120, 123, 129, 134, 136, 137, 138, 140, 145, 146, 147, 149, 155, 157, 158, 161, 164, 166, 167, 168, 170, 172, 174, 176, 177, 178, 180, 183, 185, 186, 187, 190, 192, 194, 195, 221, 225, 226, 227, 228, 229, 240, 241 y 242.

Ejemplo D de eficacia: ensayo *in vivo* sobre *Puccinia recondita* f. *Sp. tritici* (roya parda del trigo).

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

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 el ingrediente activo descrito 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 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. La clasificación se lleva a cabo 10 días después de la contaminación, comparando 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: 1, 2, 9, 16, 24, 25, 26, 36, 47, 49, 54, 57, 58, 63, 64, 65, 66, 67, 80, 83, 85, 87, 88, 89, 94, 100, 109, 119, 120, 134, 136, 137, 138, 140, 149, 158, 167, 176, 177, 178, 240 y 242.

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

Los ingredientes activos probados se preparan por homogeneización en una mezcla de acetona/Tween/DMSO y 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.

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.

Las plantas de rábano contaminadas se incuban durante 6-7 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: 2, 6, 12, 16, 18, 26, 47, 49, 57, 65, 66, 67, 69, 79, 80, 83, 166, 167, 176, 204, 213, 214 y 240.

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

- 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 París) 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.

- 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:

- 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 .

- 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.

- En estas condiciones, se observa una buena protección (de al menos 70%) a una dosis de 500 ppm con los compuestos siguientes: 36, 64, 65, 67, 80 y 89.

Ejemplo G: Ensayo in vivo en *Peronospora parasitica* (mildiu veloso de crucíferas)

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

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 el estadio de cotiledón pulverizándolas 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 de esporas de *Peronospora parasitica* (50.000 esporas por ml). Las esporas se recogen de la planta infectada. 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.

En estas condiciones, se observa buena protección (al menos 70% de control de la enfermedad) a protección total (100% de control de la enfermedad) a una dosis de 500 ppm con los compuestos siguientes: 2, 6, 8, 19, 27, 48, 49, 57, 73, 75, 83, 84, 87, 88, 94, 99, 100, 109, 129, 134, 135, 136, 149, 155, 164, 169, 174, 176, 179, 183, 198, 219 y 240 según la invención mientras que se observa débil protección (inferior al 30% de control de enfermedad) a ninguna protección absolutamente a una dosis de 500 ppm con los compuestos de los ejemplos 5, 45 y 50 dados a conocer en la solicitud de patente WO-2006/120224

Los ejemplos 5, 45 y 50 descritos en la solicitud de patente WO-2006/120224 corresponden, respectivamente, a los compuestos siguientes:

N-ciclopropil-N-[(3-cloro-5-trifluorometil-piridin-2-il)-metilen]-2,5-dimetil-furano-3-carboxamida;

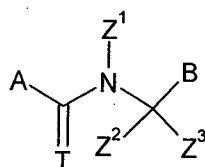
N-ciclopropil-N-[(3-cloro-5-trifluorometil-piridin-2-il)-metilen]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida;

N-ciclopropil-N-[(3-cloro-5-trifluorometil-piridin-2-il)-metilen]-5-fluoro-3-(trifluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida;

Estos resultados demuestran que los compuestos según la invención tienen una actividad biológica mucho mejor que los compuestos estructuralmente más próximos descritos en el documento WO-2006/120224.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):

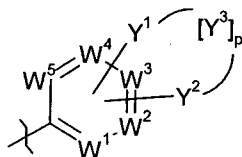


(I)

en la que

- A representa un grupo heterociclilo de 5 elementos insaturado o parcialmente saturado, unido por carbo, que puede estar sustituido por hasta cuatro grupos R^a ;

- B representa:



en la que

- W^1 a W^5 independientemente representan N o CR^{b1} ;
- Y^1 a Y^3 independientemente representan N, O, S, NR^{b2} o CR^{b3} ;
- Y^1 a Y^3 junto con los átomos W^n a que están unidos, forman un anillo heterociclilo condensado, aromático de 5 o 6 elementos, que comprende hasta cuatro heteroátomos o un anillo carbociclilo condensado aromático de 6 elementos;
- p representa 1 ó 2;

- T representa O, S, $N-R^c$, $N-OR^d$, $N-NR^cR^d$ o $N-CN$;

- Z_1 representa un cicloalquilo C^3-C7 no sustituido o un cicloalquilo C_3-C7 sustituido por hasta 10 átomos o grupos que pueden ser iguales o diferentes y que pueden seleccionarse de la lista consistente en átomos de halógeno; ciano; alquilo C_1-C_8 ; halogenoalquilo (C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C_1-C_8); halogenoalcoxi (C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C_1-C_8)carbonilo; halogenoalcoxi (C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil C_1-C_8 aminocarbonilo; di-(alquil C_1-C_8)aminocarbonilo;

- Z^2 y Z^3 representan independientemente un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C_1-C_9 ; halogenoalquilo (C_1-C_9) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquenilo C_2-C_6 ; alquinilo C_2-C_6 ; ciano; nitro; alcoxi C_1-C_6 ; alqueniloxi C_2-C_6 ; alquiniloxi C_2-C_6 ; cicloalquilo C_3-C_7 ; alquil (C_1-C_6)sulfenilo; amino; alquil(C_1-C_6)-amino; di-(alquil C_1-C_6)aminocarbonilo; alcoxi (C_1-C_6)carbonilo; alquil (C_1-C_6)carbonilo; alquil (C_1-C_6)carbamoilo; di-(alquil C_1-C_6)carbonilo; N-alquil (C_1-C_6)alcoxi (C_1-C_6)carbamoilo; o
- Z^2 y Z^3 junto con el átomo de carbono al que están unidos pueden formar un cicloalquilo C_3-C_7 sustituido o no sustituido;
- R^a representa independientemente un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; ciano; nitro; amino; sulfanilo; hidroxilo; pentafluoro- λ -6-sulfanilo; alquil (C_1-C_6)amino; di-(alquil C_1-C_6)aminocarbonilo; tri(alquil C_1-C_6)silo; tri(alquil C_1-C_6)silit-alquilo C_1-C_6 ; alquil (C_1-C_6)sulfanilo; halogenoalquil (C_1-C_6)-sulfanilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquilo C_1-C_9 ; halogenoalquilo (C_1-C_9) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquenilo C_2-C_6 ; halogenoalquenilo (C_2-C_6) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquinilo C_2-C_6 ; halogenoalquinilo (C_2-C_6) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi C_1-C_6 ; alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6); halogenoalcoxi (C_1-C_6) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alqueniloxi (C_2-C_6); alquiniloxi C_2-C_6 ; cicloalquilo C_3-C_7 ; cicloalquilo (C_3-C_7)alquilo C_1-C_6 ; alquil (C_1-C_6)sulfenilo; alquil (C_1-C_6)-sulfonilo; alcoxi (C_1-C_6)imino; (alcoxi C_1-C_6 -imino)-alquilo C_1-C_6 ; alquilo (C_1-C_6)benciloimidino; alquil (C_1-C_6)carbonilo; halogenoalquil (C_1-C_6)-carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C_1-C_6)carbonilo; halogenoalcoxi (C_1-C_6) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil C_1-C_6 aminocarbonilo; di-(alquil C_1-C_6)aminocarbonilo;
- R^c y R^d , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; alquilo C_1-C_6 ; halogenoalquilo (C_1-C_6) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C_1-C_6)-alquilo (C_1-C_6); alquenilo C_2-C_6 ; halogenoalquenilo (C_2-C_6) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquinilo C_2-C_6 ; halogenoalquinilo (C_2-C_6) que comprende hasta 9

átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo C₃-C₇; cicloalquilo (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₈); halogenocicloalquilo (C₃-C₇) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; formilo; alquil (C₁-C₈)carbonilo; halogenoalquil (C₁-C₈)-carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil (C₁-C₈)-sulfonilo; halogenoalquil (C₁-C₈)sulfonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; fenilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; naftilo que puede estar sustituido por hasta 6 grupos Q; fenilmetileno que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; fenilsulfonilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q;

- R^{b1} y R^{b3} representan independientemente un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; nitro; ciano; hidroxilo; sulfanilo; amino; pentafluoro-λ6-sulfanilo; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil (C₁-C₈)amino; di-(alquil C₁-C₈)aminocarbonilo; alcoxi C₁-C₈; halogenoalcoxi (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C₁-C₈)-alquilo (C₁-C₈); alquil (C₁-C₈)-sulfanilo; halogenoalquil (C₁-C₈)-sulfanilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil(C₁-C₈)-sulfenilo, halogenoalquil(C₁-C₈)-sulfenilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes, alquil(C₁-C₈)-sulfenilo, halogenoalquil(C₁-C₈)-sulfenilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes, alquil(C₁-C₈)-sulfonilo, halogenoalquil(C₁-C₈)-sulfonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquenilo C₂-C₈; halogenoalquenilo (C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquinilo C₂-C₈; halogenoalquinilo (C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser alqueniloxi (C₂-C₈) iguales o diferentes; halogenoalquinilo (C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquiniloxi C₂-C₈; halogenoalquinil (C₂-C₈)-oxi que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo C₃-C₇; cicloalquilo (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₈); halogenocicloalquilo (C₃-C₇) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; formilo; formiloxi; formilamino; carboxi; carbamoilo; N-hidroxicarbamoilo; carbamato; alquil (C₁-C₈)hidroxiimino; alquil (C₁-C₈)carbonilo; halogenoalquil (C₁-C₈)-carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; N-alquil (C₁-C₈)alcoxi (C₁-C₈)carbamoilo; alcoxi (C₁-C₈)carbonilo; halogenoalcoxi (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de

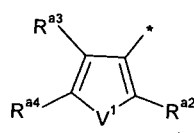
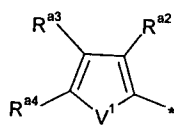
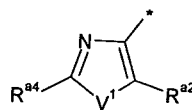
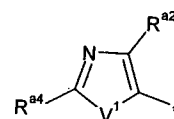
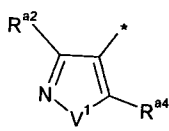
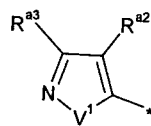
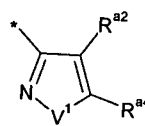
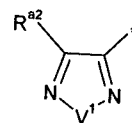
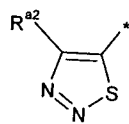
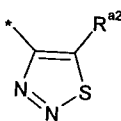
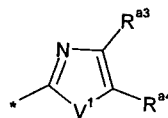
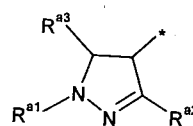
halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil C₁-C₈aminocarbonilo; di-(alquil C₁-C₈)aminocarbonilo; alquil (C₁-C₈)carbonilo; halógenoalquil (C₁-C₈)-carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil (C₁-C₈)carbonilamino; alquil (C₁-C₈)aminocarbonilo; di-(alquil C₁-C₈)aminocarbonilo; alquil(C₁-C₈)oxycarbonilo; alcoxi (C₁-C₈)imino; (alcoxi C₁-C₈-imino)-alquilo C₁-C₈; (alquenil C₁-C₈-oxiimino)- alquil (C₁-C₈); (alquinil C₁-C₈-oxiimino)-alquilo (C₁-C₈); alquilo (C₁-C₈)benciloxiimino; tri(alquil C₁-C₈)sililo; tri(alquil C₁-C₈)silil-alquilo C₁-C₈; fenilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; benciloxi que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilsulfanilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilamino que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; fenoxi que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; fenilamino que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; fenilsulfanilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; piridinilo que puede estar sustituido por hasta cuatro grupo Q y piridinilo que puede estar sustituido por hasta cuatro grupo Q;

- R^{b2} representa un átomo de hidrógeno; alquilo C₁-C₈; halógenoalquilo (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C₁-C₈)-alquilo (C₁-C₈); alquenilo C₂-C₈; halógenoalquenilo (C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquinilo C₂-C₈; halógenoalquinilo (C₂-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; cicloalquilo C₃-C₇; cicloalquilo (C₃-C₇)-alquilo (C₁-C₈); halógenocicloalquilo (C₃-C₇) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; formilo, alquil (C₁-C₈)carbonilo; halógenoalquil (C₁-C₈)-carbonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil (C₁-C₈)-sulfonilo; halógenoalquil (C₁-C₈)sulfonilo que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; fenilsulfonilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q; bencilo que puede estar sustituido por hasta 5 grupos Q;
- Q, que puede ser igual o diferente, representa un átomo de halógeno; ciano; nitro; alquilo C₁-C₈; alcoxi C₁-C₈; alquil (C₁-C₈)sulfanilo; halógenoalquilo (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; halógenoalcoxi (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alquil tri(C₁-C₈)sililo y alquil tri(C₁-C₈) alquilo (C₁-C₈)sililo; alcoxi (C₁-C₈)imino; (alcoxi C₁-C₈-imino)-alquilo C₁-C₈;

así como las sales, N-óxidos, complejos metálicos, complejos metaloides y sus isómeros ópticamente activos o geométricos con la condición de que el compuesto de fórmula (I) se diferencie de la N-ciclopropil-N-((6,8-dimetil-2-oxo-1,2-dihidroquinolin-3-il)metil)-furano-2-carboxamida, de la N-ciclopropil-N-((6-etoxi-2-oxo-1,2-dihidroquinolin-3-il)metil)-furano-2-carboxamida, de la N-ciclopropil-N-((6-metil-2-oxo-1,2-dihidroquinolin-3-il)metil)-furano-2-carboxamida, de la N-ciclopropil-N-((7,8-difluoro-2-oxo-1,2-dihidroquinolin-4-il)metil)-4-metilthiazol-5-carboxamida y de la N-ciclopropil-N-((8-fluoro-2-oxo-1,2-dihidroquinolin-4-il)metil)-4-metilthiazol-5-carboxamida.

10

2. Un compuesto según la reivindicación 1, en el que A se selecciona en la lista consistente en:

A¹A²A³A⁴A⁵A⁶A⁷A⁸A⁹A¹⁰A¹¹A¹²

en donde:

15

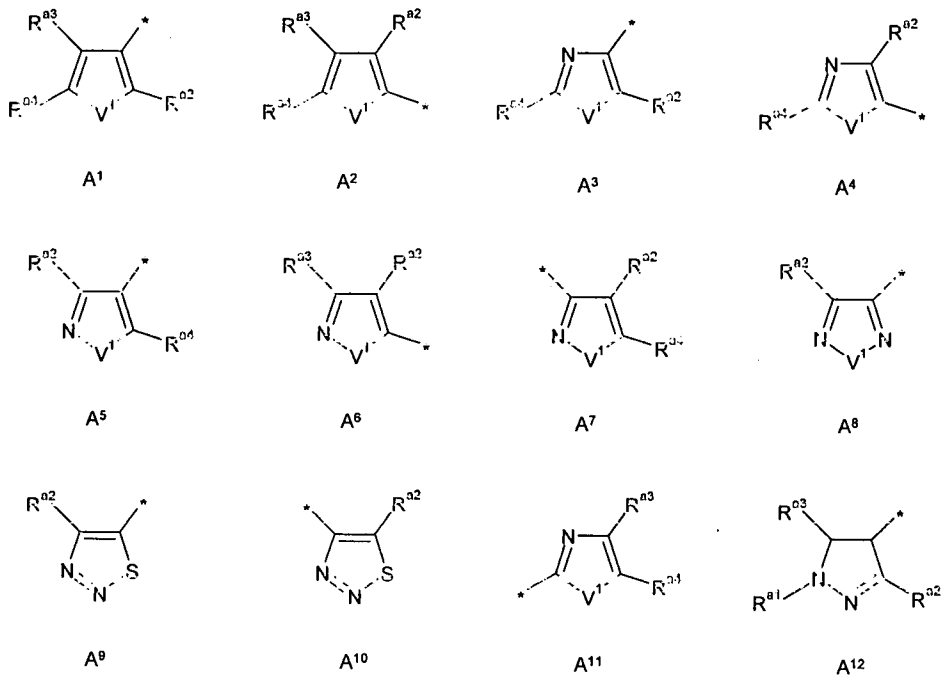
- -* representa el punto de unión al grupo carbonilo;
- V¹ representa O, S o NR^{a1};
- R⁷ representa un átomo de hidrogeno; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo (C₁-C₈) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C₁-C₈)-alquilo (C₁-C₈);
- R^{a2} y R^{a3}, que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; ciano; alquilo C₁-C₈; halogenoalquilo (C₁-C₈) que comprende hasta

20

9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C₁-C₆) o halogenoalcoxi (C₁-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. cicloalquilo C₃-C₇;

- R^{a4} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno; ciano; alquilo C₁-C₆; halogenoalquilo (C₁-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi (C₁-C₆) o halogenoalcoxi (C₁-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. cicloalquilo C₃-C₇; alquil (C₁-C₆)sulfanilo; amino; alquil (C₁-C₆)amino; di-(alquil C₁-C₆)aminocarbonilo; alquil (C₁-C₆)-oxicarbonilo.

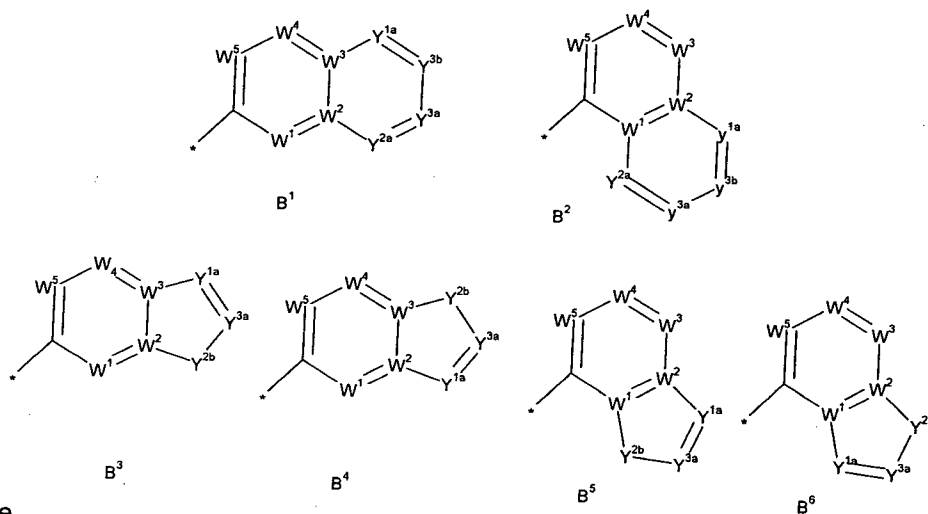
3. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2, en el que el compuesto A se selecciona de la lista que consiste en:



en donde:

- -* representa el punto de unión al grupo carbonilo;
- V¹ representa O, S o NR^{a1};
- R^{a7} representa un átomo de hidrógeno; alquilo C₁-C₆; alcoxi (C₁-C₆)- alquilo (C₁-C₆);
- R^{a2} representa alquilo (C₁-C₆); halogenoalquilo (C₁-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; alcoxi C₁-C₆;
- R^{a3} representa un átomo de hidrógeno; un átomo de halógeno; alquilo C₁-C₆;

- R^{a4} representa un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno; alquilo C_1-C_8 ; halogenoalquilo $C(1-C_8)$ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;
- 5 4. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 3, en el que
- A representa A^5 ;
 - V^1 representa NR^{a1} ;
 - R^{a2} representa alquilo (C_1-C_8);
 - R^{a2} y R^{a3} , que pueden ser iguales o diferentes, representan un átomo de hidrógeno; un
- 10 átomo de halógeno; alquilo C_1-C_8 ; halogenoalquilo (C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; o
- A representa A^4 ;
 - V^1 representa S;
 - R^{a2} representa alquilo (C_1-C_8); halogenoalquilo (C_1-C_8) que comprende hasta 9 átomos
- 15 de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;
- R^{a4} representa un átomo de hidrogeno; alquilo C_1-C_8 ; halogenoalquilo $C(1-C_8)$ que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;
5. Un compuesto de acuerdo con las reivindicaciones 1 a 4, en el que B se selecciona de
- 20 la lista que consiste en:



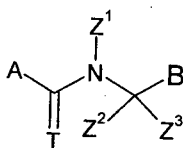
en la que

- W^1 a W^5 , Y^{1a} , Y^{2a} , Y^{3a} y Y^{3b} independientemente representan NR^{b2} o CR^{b3} ;
- Y^{2b} representa O, S o NR^{b2} .

6. Un compuesto según la reivindicación 5, en el que
- B representa B¹ o B²;
 - W¹ a W⁵, Y^{1a}, Y^{2a}, Y^{3a} e Y^{3b} independientemente representan CR^{ba}; o
 - B representa B⁵ o B⁶;
- 5 • W¹ a W⁵, Y^{1a} y Y^{3a} independientemente representan CR^{ba};
- Y^{2b} representa S.
7. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 6 en el que T representa Q o S.
- 10 8. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 7, en el que Z¹ representa ciclopropilo.
9. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 8, en el que Z² y Z³ representan independientemente un átomo de hidrógeno o alquilo (C₁-C₈).
10. Un compuesto según las reivindicaciones 1 a 9, en el que Q representa un átomo de
- 15 halógeno; alquilo C₁-C₈; alcoxi C₁-C₆; halogenoalquilo (C₁-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes; halogenoalcoxi (C₁-C₆) que comprende hasta 9 átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes;
11. Una composición fungicida que comprende, como ingrediente activo, una cantidad
- 20 eficaz de un compuesto de fórmula (I) según las reivindicaciones 1 a 10 y un soporte, vehículo o carga aceptable desde un punto de vista agrícola.
12. Un método para controlar los hongos fitopatógenos de los cultivos agrícolas, caracterizado porque se aplica una cantidad eficaz en el sector agronómico y sustancialmente
- 25 no fitotóxica de un compuesto según las reivindicaciones 1 a 10 o de una composición según la reivindicación 11 en el suelo en el que crecen o pueden crecer las plantas, en las hojas y/o en los frutos o en las semillas de las plantas.

RESUMEN

La presente invención se refiere a derivados de N-(aromático, de 6 elementos, condensado, (hetero)aril-metileno)-N-cicloalquil carboxamida, a su tiocarboxamida o análogos de carboximidamida N-sustituídos, todos de fórmula (I) en la que A representa un grupo heterociclilo de 5 elementos unido a carbo; T representa O, S, N-R^c, N-OR^d, N-NR^cR^d o N-CN; Z¹ a Z³ y B representa un (hetero)arilo aromático, de 6 elementos, condensado; a su procedimiento 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, principalmente de plantas, que utilizan estos compuestos o composiciones.



(I)

Je soussigné M^r Karine Gidon
Notaire à Chasselay (Rhône)

Certifie sincère la signature de

M^r Desbordes Philippe - Grosjean Cournoyer
qui a été apposée Hartmann Benoît - Rinolfi Philippe
Chasselay, le 20/09/09ASSIGNMENTDESBORDES, Philippe
GARY, Stéphanie
GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire
HARTMANN, Benoît
RINOLFI, Philippe
TUCH, Arounarith
VORS, Jean-Pierreby means of this document assign(s) to
BAYER CROPSCIENCE SA

A company organized under the laws of

FRANCE

Domiciled in

16 rue Jean-Marie Leclair, F-69009 Lyon, France

all my (our) rights, title and interest in and to my (our)
invention entitled and as fully set forth and described in:" FUNGICIDE N-6-MEMBERED FUSED (HETERO)ARYL-
METHYLENE-N-CYCLOALFYL CARBOXYAMIDE
DERIVATIVES "So far as the Republic of Colombia is concerned and any
other country in which the application is filed.

Done and subscribed in

On the _____ day of _____ of 2009

DESBORDES, Philippe

GARY, Stéphanie

GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire

HARTMANN, Benoît

RINOLFI, Philippe

VORS, Jean-Pierre

TUCH, Arounarith

Signature of the inventors

CESIONDESBORDES, Philippe
GARY, Stéphanie
GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire
HARTMANN, Benoît
RINOLFI, Philippe
TUCH, Arounarith
VORS, Jean-Pierrepor medio de la presente cedo (cedemos) a
BAYER CROPSCIENCE SA

Una compañía organizada bajo las leyes de

domiciliada en

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

todos mis (nuestros) derechos, título e interés sobre mi
(nuestra) invención titulada y tal como describe en:en lo que concierne a la República de Colombia y cualquier
otro país del mundo en donde se presente la solicitud.

Dado y firmado en

A los _____ días del mes de _____ de 2009

DESBORDES, Philippe
GARY, Stéphanie
GROSJEAN-COURNOYER, Marie-Claire
HARTMANN, Benoît
RINOLFI, Philippe
VORS, Jean-Pierre
TUCH, Arounarith

Firma de los inventores

APOSTILLE

(Convention de La Haye du 5 octobre 1961)

1. République française
Le présent acte public
2. a été signé par **Me Karine GIDON**
3. agissant en qualité de **Notaire**
4. est revêtu du sceau/timbre de son étude à **Chasselay (Rhône)**

Attesté

5. à **LYON**
6. le **3 février 2010**
7. par le **Procureur général de la Cour d'appel de LYON**
8. sous n° **1190**



10. Signature
Jacqueline MORANDO

"L'Apostille confirme seulement l'authenticité de la signature, du sceau ou timbre sur le document. Elle ne signifie pas que le contenu du document est correct ou que la République française approuve son contenu."

Traducción oficial del inglés- francés por Marlen Neira resolución 2117 y 2413 del ministerio de Justicia de Colombia.

APOSTILLA EN CESION A BAYER CROPSCIENCE SA.

Cesión bilingüe inglés y español a Bayer Cropscience SA, compañía establecida conforme a leyes de Francia, referente a la invención descrita en "Fungicide N-6- Membered Fused (Hetero)aryl- Methylene -N- Cycloalkyl Carboxamide Derivatives" (Derivados de carboxamida N-cicloalkil (hetero)aril metileno amalgamado de N-6-miembros fungicida)

Firmada el día ____ de 2009

Firma de los inventores

Desbordes Philippe.

Gary Stéphanie

Grosjean- Cournoyer Marie Claire

Hartmann Benoit

Rinolfi Philippe

Vors Jean- Pierre

Tuch Arounarith

Sello de legalización notarial:

El suscrito Dr. Karine Gidon, notario de Chasselay (Rodano) certifica la autenticidad de la firma de Desbordes, Gary. Grosjean- Cournoyer, Hartman, Rinolfi, Vors y Tuch, puesta en el documento, Chasselay, el 20-2-2010.

Firma ilegible de Karine Gidon –

Sello redondo del notario de Chasselay. Rodano

Página adjunta en francés

APOSTILLA

(Convención de la Haya del 5 octubre de 1961)

1. Republica francesa
2. el presente documento ha sido firmado por Karine Gidon
3. Actuando como notario
4. lleva el sello de la notaria de Chasselay (Rodano)
- Certificado
5. en Lyon
6. el 3 de febrero de 2010.
7. Por el procurador general del tribunal de apelación de Lyon
8. Bajo el No. 1190.
9. Sello del procurador general de Lyon
10. firma ilegible de Jacqueline Morando

La apostilla confirma la autenticidad de la firma, el sello en el documento, pero no significa que el contenido del documento es correcto o que la republica francesa apruebe su contenido.

Es traducción conforme con copia para confrontar. Bogota Febrero 20- 2010.

MARLEN NEIRA CASTRO
Traductor e Intérprete Oficial
Inglés - Español - Inglés
Resolución No. 2117 del 7 Oct 1987

MARLEN NEIRA CASTRO
Traductor e Intérprete Oficial
Francés - Español - Francés
Resolución No. 2413 del 12 Nov. 1987

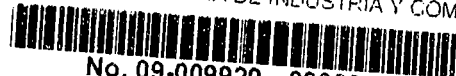
Señores

Centro de Documentación e Informac

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y

E. S.

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO



No. 09-009929- -00000-0000

Fecha: 2009-02-03 16:24:49
Tra 334 REMISIINFORMA
Act. 411 PRESENTACIONDep 2000 DESPROPIINDUS
Eve:
Folios: 6

Referencia: Archivo de poder general para Bayer CropScience SA

Apoderados: Alvaro Correa-Ordóñez 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 Bayer CropScience SA domiciliada en 16, Rue Jean-Marie Leclair 69009 Lyon, Francia, 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

2

POD-02638

Traducción oficial del francés por Marlen Heira Castro, resolución 2413 del Ministerio de Justicia

APOSTILLA EN PODER DE BAYER CROPSCIENCE SA

Poder bilingüe otorgado por Bayer CropScience SA, firmado en Lyon el 11 de febrero de 2005 por Alexander Nowak.

Sello de Legalización notarial en francés: El suscrito, P. Garel Galais, Notario de Chasselay (Ródano) certifica la firma de Alexander Nowak puesta en el documento como auténtica. Chasselay fechado el 15- 02- 05. Sello oficial de Patrice Garel Galais, Notario de Chasselay-Ródano (firma).

Al reverso:

APOSTILLA

(Convención de la Haya del 5 de octubre de 1961)- Colombia

1. País: República Francesa. Este documento Público
13. ha sido firmado por el Notario Garel Galaz Patrice.
3. Quien ejerce funciones de Notario
4. Lleva el sello de la Notaría de Chasselay- 69

CERTIFICADO

5. en Lyon
6. El 16 - 04- 05
7. Por el Procurador General ante el tribunal de apelación de Lyon
8. Bajo el No. 773
9. Sello del Tribunal de Apelación de Lyon Procurador General
10. Firma ilegible.

CERTIFICACIÓN NOTARIAL

Bilingüe inglés- español sobre cargo de Alexander Nowak como representante autorizado de Bayer CropScience S.A.

6- La certificaciones 3,4 y 5 se basan en: Página de la Gaceta "anuncios judiciales y legales" del periódico "Le Tout Lyon- Moniteur Judiciaire Reunis", fechado el 21 al 27 de junio de 2003.

- Poder de representación de Bayer CropScience SA (del Presidente de la Junta Directiva) fechado el 15 de octubre de 2004.

Sello oficial de Ceril Borel Girau, Notario de Chasselay- Ródano (firma). Al reverso

APOSTILLA

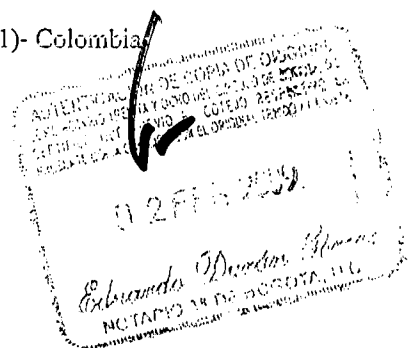
(Convención de la Haya del 5 de octubre de 1961)- Colombia

1. País: República Francesa. Este documento Público
14. ha sido firmado por el Notario Borel Giraud Cédric
3. Quien ejerce funciones de Notario
4. Lleva el sello de la Notaría de Chasselay- Ródano

CERTIFICADO

5. Lyon
6. El 10 de marzo de- 2005
7. Por el Procurador General ante el tribunal de apelación de Lyon
8. Bajo el No. 1752 (ilegible)
9. Sello: Tribunal de Apelación de Lyon Procurador General.
10. Firma ilegible.

Es traducción conforme con copia para confrontar- Bogotá, Marzo 29- 2005



MARLEN HEIRA CASTRO
Traductor e Intérprete Oficial
Inglés - Español - Inglés
Resolución No. 2117 del 7 Oct 1987
Marlen Heira Castro
MARLEN HEIRA CASTRO
Traductor e Intérprete Oficial
Francés - Español - Francés
Resolución No. 2413 del 12 Nov 1987

POWER OF ATTORNEY

PODER

The undersigned,

La abajo firmada,

BAYER CROPSCIENCE SA

BAYER CROPSCIENCE SA

domiciled in

domiciliada en

16, rue Jean-Marie Leclair
69009 LYON, France

16, rue Jean-Marie Leclair
69009 LYON, France

declares that it hereby grants to

declara por el presente que otorga a

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

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

with domicile at Av. 82 No. 10 - 62, 6th floor, of Bogotá D. C., Colombia, a full and sufficient power of attorney to obtain the protection of my (our) industrial property and against the unfair competition, for which purpose I (we) authorize the said attorneys to represent me (us) before any authorities or persons, with or without jurisdiction, specially those administrative, administrative contentious and judicial, as well as before Arbitration Court, in all matters concerning the following: a) Obtainment of patents, utility models, industrial designs, integrated circuits, layout-designs and vegetal varieties; the registration of trademarks, denominations of origin, commercial names, trade emblems, slogans and domain names; its renewal, assignments, change of name or domicile, voluntary cancellation; and the registration of licenses of use of the above rights; b) Processes of protection to the consumer, unfair competition, oppositions, cancellations, nullity, precautionary injunctions, infringement, granting of licenses, writ mandamus, the protection of trade secrets, and in general the civil, penal, an administrative processes relating to those rights. And that in all the above matters they may substitute this Power of Attorney, compromise, conciliate, admit the facts of the case, desist, cancel, receive, resign, and ratify acts done by representatives without a power of attorney.

con domicilio en la Av. 82 No. 10 - 62 Piso 6 en Bogotá D. C., Colombia, poder especial amplio y suficiente, para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad industrial y contra la competencia desleal, a cuyo efecto autorizo (amos) a los dichos apoderados para que me (nos) representen ante cualesquiera autoridades o personas, ejerzan o no jurisdicción, especialmente ante las del orden administrativo, contencioso-administrativo y judicial, así como los tribunales de arbitramento, en todo lo concerniente a los siguientes asuntos: a) Obtención de patentes de invención, modelos de utilidad, diseños industriales, esquemas de trazado de circuitos integrados y variedades vegetales; el registro de marcas, denominaciones de origen, nombres comerciales, enseñas, lemas comerciales y nombres de dominio; su renovación, traspaso, cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria; y el registro de licencias de uso de esos derechos; b) Los procesos para la protección del consumidor, competencia desleal, oposiciones, cancelaciones, nulidades, medidas cautelares, infracciones, concesión de licencias, la tutela, la protección de secretos industriales, y en general procesos civiles, penales, administrativos relacionados con estos derechos. Y para que en todos los asuntos arriba determinados, puedan sustituir este mandato, transigir, conciliar, admitir los hechos del caso, desistir, cancelar, recibir, renunciar, y ratificar los actos de agentes oficiosos.

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

Iguualmente, ratifico todo lo actuado hasta el momento en los mismos asuntos, por cualquiera de los mencionados apoderados en representación de esta sociedad.

Done and subscribed in
Lyon

Dado y firmado en Lyon

On the
February 11th, 2005

Alexander NOWAK

de soussigné M^r **GAREL LACHAT**
Notaire à Chasselay (Rhône)
Certifie sincère la signature de
M^r **Alexander NOWAK**
qui a été apposée
Chasselay, le 15/02/2005

GAREL LACHAT
Notaire
Chasselay (Rhône)

NOTARIAL CERTIFICATION

On this _____ day of 10 HATS
2005, the undersigned Notary

CERTIFIES

Alexander NOWAK

1. That _____
of legal age and domiciled in Neuenhouse Weg 10,
51467 Bergisch Gladbach, Germany
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
Authorized Representative

of the judicial person Bayer CropScience S.A.

4. That the judicial person Bayer Crop Science S.A.
having its home office in 16, rue Jean-Marie Leclair
69009 LYON, France

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:

-Page "annonces judiciaires et légales" from the
newspaper "Le Tout Lyon-Moniteur Judiciaire
Reunis" dated 21 to 27 June 2003

-Power of Attorney from Bayer CropScience SA
(from the Chairman of the Management Board)
dated 15 October 2004

Notary Public

CERTIFICACION NOTARIAL

A los 10 días del mes de Marzo
de 2005, el suscrito Notario

DA FE

Alexander NOWAK

1. Que _____
mayor y domiciliado en Neuenhouse Weg 10,
51467 Bergisch Gladbach, Alemania
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 Representante Autorizado

de la persona jurídica Bayer CropScience S.A.

4. Que la persona jurídica Bayer CropScience S.A.
con sede en 16, rue Jean-Marie Leclair
69009 Lyon, Francia

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:

El Notario Público



No. 10-022117- -00000-0000

Fecha: 2010-02-24 16:47:04 Dep. 2020 DIR. NUEVASOR
Tra. 11 PATENTE/II Evt. 378 FASE NACIONAL I
Act. 411 PRESENTACION Folios. 78

PATENTE 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 ☐



2020
Bogotá D.C.,

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

REFERENCIA	Radicación No.	10 22117
	Solicitud internacional	PCT/EP2003/060040
	Fecha inicio fase nacional	28/02/2010
	Trámite	11
	Evento	378
	Actuación	416
	Oficio No.	10203
	Folios	1

Teniendo en cuenta que la solicitud de privilegio de patente que se tramita bajo el expediente indicado en la referencia, reúne los requisitos de forma establecidos en la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, el Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), el Reglamento y la Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se envía el extracto de la solicitud a la Oficina de Comunicaciones para efecto de su publicación en la Gaceta de Propiedad Industrial.

Cúmplase
Dado en Bogotá DC,

8 MAR. 2010

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

adpall